

△メイラックス錠・▼細粒 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ロフラゼパ酸エチル ethyl loflazepate 【分類】 持続性心身安定剤

【単位】 △1mg・▼2mg/錠、▼細粒 1%

【常用量】 2mg/日

【用法】 分 1～2

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

腎機能は PK に影響しない (Ba BB, et al: Fundam Clin Pharmacol 1989 PMID: 2714728)

【特徴】 他のベンゾジアゼピン系薬剤に比べ抗不安作用が強い。筋弛緩作用はジアゼパムと同等。

【主な副作用・毒性】 眠気、ふらつき、めまい、肝障害、言語障害、消化器障害、脱力感など (1)

【吸収】 消化管および腸によって初回通過効果を受ける (1) $ka=3.3/hr$ (1)

【BA】 $69\pm 8\%$ (1)

【 t_{max}] 0.8hr (1)

【代謝】 初回通過効果により代謝され、未変化体は血中から検出されず、活性代謝物 M-1 (エステル加水分解後のカルボン酸体)、M-2 (M-1 の脱炭酸体) として存在

(1) 代謝物 M-2 の GABA 受容体への結合は親化合物より強く、ジアゼパムと同等 (1) CYP3A4 が関与して代謝 (1)

【排泄】 主として胆汁排泄 (1) 投与量の 50%が M-3 (M-2 の 3-水酸化体) の抱合体として尿中排泄 (1) 胆汁排泄後には 50%が腸肝循環 (1) 尿中回収率 29% [ラット, 120hr まで] (1) 【CL/F】 $0.34L/hr/man$ (1)

【 $t_{1/2}$] 122hr (1) 【 k_e] α 相 $0.55/hr$ 、 β 相 $0.0072/hr$ (1)

【蛋白結合率】 95～99% (1) 代謝物も 90%以上 (1)

【Vd/F】 $47.2L/man$ (1) BBB 透過性：血中の 40%移行 (1)

【MW】 360.77

【透析性】 透析されない (5) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象とならない 【O/W 係数】 $\log P=3$ 以上 [1-オクタノール/水系, pH2～10] (1) 【pKa】 0.5, 11.2

【更新日】 20200806

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。