

▼エバミール錠・▼ロラメット錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ロルメタゼパム Lormetazepam 【分類】 睡眠導入剤 [BZ系・短時間型]

【単位】 ▼1mg/錠

【常用量】 1～2mg/日

【用法】 寝る前

【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)

【特徴】 BZ系睡眠導入剤で ω 1受容体への選択性が高く、筋弛緩作用が弱いとされている。また、肝 CYP による代謝を受けずグルクロン酸抱合により代謝消失するため、薬物相互作用の影響を受けにくい。

【主な副作用・毒性】 眠気、ふらつき、倦怠感、頭重感、依存性、錯乱、意識レベル低下、呼吸抑制、肝障害、血球減少、味覚障害など

【吸収】 $k_a=3.19/hr$ (1)

【F】 73% (1) 20%が初回通過効果を受ける (1, Humpel M, et al: Clin Pharmacol Ther 28: 673-679, 1980) 52～84% (Hildebrand M, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 15: 19-26, 1990)

【 t_{max} 】 1～2hr (1) 2hr と 5hr にピークがあり腸肝循環を示唆 (Humpel M, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 4: 237-243, 1979)

【代謝】 主代謝物はグルクロン酸抱合体 (1) 一部はN-脱メチル体のグルクロン酸抱合体 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率0% (1) 尿中回収率68% [24hr まで] で、活性代謝物はない (1) 尿中回収物は未変化体とN-脱メチル体 (Humpel M, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 4: 237-243, 1979) 尿中よりグルクロン酸抱合体として70～80%回収 [iv] (Humpel M, et al: Clin Pharmacol Ther 28: 673-9, 1980)

【CL】 $CL/F=311 mL/min$ [po] (1) 全身 $CL 200mL/min$, 腎 $CL 30\sim 40mL/min$ (Humpel M, et al: Clin Pharmacol Ther 28: 673-9, 1980) $4mL/min/kg$ (Hildebrand M, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 15: 19-26, 1990)

【 $t_{1/2}$ 】 10hr (1) 13hr (Luscombe DK: Psychopharmacology Suppl 1: 99-104, 1984)

【蛋白結合率】 91.4% (1)

【Vd】 $4.75L/kg$ [iv] (1)

【MW】 335.18

【透析性】 グルクロン酸抱合体は除去されるが、未変化体は除去されない (1)

【OW 係数】 2.8 [1-ヘプタン/水系, pH7.1] (1)

【薬物動態】 肝硬変患者でも PK に大きな影響はない (Hildebrand M, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 15: 19-26, 1990)

【更新日】 20220830

※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。