

◎コンスタン錠, ▼ソラナックス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 アルプラゾラム (U) Alprazolam 【分類】 マイナートランキライザー

【単位】 ◎0.4mg・▼0.8mg/錠

【常用量】 0.4~2.4mg/日 [高齢者では0.4~1.2mg]

【用法】 分3

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

総アルプラゾラム濃度はHD患者においても変化がなく、遊離型分率はHD患者で高い (Schmith VD, et al: J Clin Pharmacol 1991 PMID: 1880224)

【その他の報告】 減量の必要なし (10) 不明 (3)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10,12)

【特徴】 葛藤行動緩解作用、馴化作用がジアゼパムの 2~7 倍と高く、筋弛緩作用が弱く、ふらつきが比較的少ない。半減期が短時間~中等度のベンゾジアゼピンのため反復投与による蓄積が少なく、血漿濃度の定常状態は 2~3 日で到達する。

【主な副作用・毒性】 依存性、禁断症状、せん妄、不眠、頻脈、下痢、過敏症、躁状態など

【吸収】 吸収率 92% (11) 初回通過効果を受けない (11)

【F】 95%以上 (14) 88% (13) 92% (1,11)

【tmax】 1~2hr (U) 1.5hr, 1mg 単回投与時の Cmax は 21ng/mL (13)

【代謝】 肝で酸化され、活性代謝物 α -hydroxyalprazolam に代謝されグルクロン酸抱合される (U) 一部の代謝物には未変化体の 1/2 の活性があるが、存在率は低い (U) CYP3A4 によって代謝 (α , 4-が水酸化) される (1,9) CYP3A5*3 遺伝子型では CL の低下が認められる (Park JY, et al: Clin Pharmacol Ther 79: 590-9, 2006)

【排泄】 グルクロン酸抱合され、腎で排泄 (U) 尿中未変化体排泄率 20% (10,11,13) 10% (14) 16.9% (1) 【CL】 66.7mL/min (10) 0.72mL/min/kg (13) CL/F=41.6mL/min (1) 【非腎 CL/総 CL】 90% (10)

【t1/2】 11 [6.3~26.9] hr (U) 10~19hr (10) 16hr (14) 12hr (13) 9.5~19.0hr (12) 6~16hr (11) 【透析患者の t1/2】 不明だが HD 患者・健常者に比し CAPD 患者ではクリアランスが低く、t1/2 も長い (J Clin Pharmacol 31:571-579,1991) 10~19hr (10) 腎機能正常者と同じ (12)

【蛋白結合率】 80% (U) 70% (10) 71% (13) 70~80% (11,12)

【Vd】 1.0L/kg (10) 0.7~1.4L/kg (11) 0.9~1.3L/kg (12) Vd/F=58L/man (1)

【MW】 308.76

【透析性】 効率的には除去できないと思われる (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない 【O/W 係数】 110 (11) 4100 [クロロホルム/水系, pH7] (1) 【pKa】 2.6 (1)

【相互作用】 リファンピシム 450mg×4 日間併用により AUC が 88%低下し、経ロクリアランスが 7.5 倍に増加する (Schmider J, et al: Pharmacogenetics 9:725-734,1999) フルボキサミン併用により半減期が 20hr から 34hr に延長し血中濃度が 2 倍に上昇 (Fleishaker JC and Hulst LK: Eur J Clin Pharmacol 46:35-39,1994) ジゴキシンの血中濃度上昇 [機序不明] (1) CYP3A4 関連の相互作用に注意 (1)

【更新日】 20201022

※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。