

◎ハルシオン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 トリアゾラム (U) Triazolam 【分類】 睡眠導入剤 [超短時間型]

【単位】 ◎0.125mg・◎0.25mg/錠

【常用量】 0.125～0.5mg/日

【用法】 分1 眼前

【透析患者への投与方法】 Cmax は上昇するものの、他のパラメーターには変化ないため正常者と同じ (Kroboth PD, et al: Br J Clin Pharmacol 19: 839-842, 1985 PMID: 2862896)

【その他の報告】 減量の必要なし (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】 BZ 系超短時間型睡眠導入剤。連続投与による蓄積が少ない。

【主な副作用・毒性】 依存性、禁断症状、奇異反応、もうろう状態、一過性健忘、運動失調、炭酸ガスナルコーシス、嘔吐、血圧低下、過敏症、味覚異常など

【吸収】 85% (1,11)

【F】 61% (11) 44%, 初回通過効果を受けやすい (13)

【tmax】 1.2hr (1) 1.3hr, 食物と同時に摂取で延長 (13) 0.75～2.5hr (11) 【Cmax】 健常者に 0.5mg を単回経口投与した時 4.4 ng/mL (13)

【代謝】 CYP3A4 によって代謝 (α -位、4-位が水酸化) される (9) 肝代謝 (初回通過効果を受ける) 非活性代謝物ほとんどグルクロン酸抱合体 (U) α -hydroxy triazolam は未変化体の 50～100%の活性を有する (1)

【排泄】 ほとんどが肝で代謝され 90%が代謝物として尿中排泄, 10%が糞便中に排泄 (13) 尿中未変化体排泄率 2% (13) 低い (11,12) 尿中回収率 81% (1) 【CL】 3.6mL/min/kg (1) 6.2～8.8mL/min/kg (11) 5.6mL/min/kg、肥満・加齢 (男性のみ) で低下 (13) CL は加齢により低下して AUC が增大するが個人差も大きい (Greenblatt DJ, et al: Clin Pharmacok Ther 76: 467-79, 2004) 【非腎 CL/総 CL】 100% (10)

【t1/2】 2.9hr (1,11) 1.5～5.5hr (U) 2.3～3.7hr (11) 肥満・加齢により延長 (13) 2～4hr (12) 【透析患者の t1/2】 腎機能正常者と同じ (12)

【蛋白結合率】 89% (1,U) 蛋白結合率は α 1-酸性糖蛋白濃度に相関する (2) ため、腎不全患者では蛋白結合率が上昇するかもしれない (5) in vitro では 89%だが平衡透析法による in vivo 蛋白結合率は 10～25%で半分はアルブミンと残り α 1-酸性糖蛋白と結合している (11) 90.1%で肝硬変で低下 (13) 85～95% (12)

【Vd】 1.0L/kg (11) 1.1L/kg (13) 0.8～1.0L/kg (1)

【MW】 343.21

【透析性】 蛋白結合率が高いため透析で除去されにくいと思われる (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない 【O/W 係数】 237 (11) 資料なし (1) 【pKa】 2.0 (1)

【併用禁忌】 アゾール系抗真菌剤 (イトラコナゾール、フルコナゾール、ミコナゾール等)、HIV プロテアーゼ阻害剤。併用により本剤の血中濃度が上昇する (1) 【相互作用】 マクロライド系抗生物質との併用注意 (1) グレープフルーツジュース飲用で血中濃度が上昇するという報告あり。リファンピシンの併用でトリアゾラムの Cmax は 1/8 に、AUC は 1/20 に低下するため効果が得られない (Villicka K, et al: Clin Pharmacol Ther 61:8-14,1997) ラニチジンにより AUC が 10～30%上昇するが、代謝・消失には影響しないため、胃の pH 上昇による吸収率上昇による (トリアゾラムは酸に不安定) ものと考えられている (Clin Pharmacol Ther 70:126-131,2001) クレメジンとは 30～60 分空けて服用する (森田 元, 他: 臨床薬理 41:S251,2010)

【警告】 一過性健忘を生じることがあるので注意すること

【更新日】 20220217

※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、当院では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。