

◎マイスリー錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ゾルピデム酒石酸塩 (U) Zolpidem Tartrate 【分類】睡眠導入剤 [非 BZ 系・超短時間型]

【単位】◎5mg・△10mg/錠

【常用量】1回5～10mg [高齢者には5mgから投与を開始] ■特に女性では5mg/日とする [FDA2013]

【用法】1日1回眠前 (特に就寝直前に服用すること)

【透析患者への投与方法】尿中未変化体排泄率が低いため減量の必要なし (5) 【その他の報告】血中への蓄積は認められなかった (1) 減量の必要なし (11)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】非ベンゾジアゼピン構造の超短時間型睡眠薬。ω1 受容体に選択的な親和性を示し GABA-A 系の抑制機能を増強して催眠鎮静作用を有す。筋緊張に関与する脊髄や記憶に関与する海馬に多い ω2 受容体への親和性は相対的に低く、それらの有害作用が少ない可能性がある。生理的睡眠パターンに近い睡眠をもたらすらしい。

【主な副作用・毒性】依存性、離脱症状、精神症状、意識障害、一過性前向き健忘、転倒、呼吸抑制、ふらつき、頭痛、残眠感、しびれ感、視力障害、頭重感、めまい、気分高揚、蛋白尿、消化器症状、動悸、発疹、倦怠感、下肢脱力感、口渇、不快感など。もうろう状態の発現は 10mg 投与例で多い。高齢者が転倒により骨折する例が報告されている。

【安全性に関する情報】自動車事故に関連 [HR2.20] (Hansen RN, et al: Am J Public Health 105: e64-9, 2015 PMID: 26066943) 前日の服用が自動車事故に関連 (Yang BR, et al: CNS Drugs 32 593-600, 2018 PMID: 29796977) 高齢者の自動車事故に関連し、開始後 2 週間以内が最大リスク (Nevriana A, et al: CNS Drugs 31: 711-722, 2017 PMID: 28669021) SAS 悪化に関連しなかった (Carberry JC, et al: J Sleep Res 2019 PMID: 30968498) 本剤で夢遊病の既往歴あれば使用不可 (1)

【吸収】上部消化管で 95%以上吸収される (1,11) 食事の影響を受けない (1)

【F】初回通過効果を受けて 66.6% (1) 全身循環までに代謝され 70% (U,11) 72% (13)

【tmax】0.8±0.3hr (1) 食事により延長 (U) 1.0～2.6hr、食事により延長 (13) 【Cmax】健康青年に 10mg 単回経口投与後の Cmax は 76～139ng/mL。1日1回の投与では蓄積しない (13) 高齢者では Cmax が 2 倍程度に上昇することがある (1)

【代謝】肝：主に CYP3A4 で代謝され、一部 2C9, 1A2 で代謝される (1) 活性代謝物は認められていない (U,11) (Clin Pharmacokinet 29: 142-53,1995)

【排泄】代謝物として尿中へ 55.8%、糞中へ 36.5%回収 [po, 120hr まで] (1) 尿中未変化体排泄率 1%以下 (1,11,13) 【CL】0.26±0.03L/hr/kg (1) 4.5mL/min/kg、肝硬変・加齢で低下 (13)

【t1/2】1.78～2.3hr (1) 2.6hr (1.4～4.5hr) (U) 2.4hr (2～4hr) (11) 1.9hr、加齢・肝硬変で延長 (13)

【蛋白結合率】94.5～96.0% (1) 92%、アルブミンと AAG に対する結合親和性はほぼ同等 (U,11) 92%、腎障害・肝硬変で低下 (13)

【Vd】0.54±0.02L/kg (1,11) 0.68L/kg 腎障害で上昇 (13)

【MW】764.8

【透析性】除去されない (1,U,11)

【TDM のポイント】TDM の対象にならない 【pKa】6.16 【O/W 係数】2.1 (11) 309 [1-オクタノール/水系, pH7] (1)

【相互作用】リファンピシンの併用により本剤の作用が減弱するおそれがある (CYP3A4 が誘導されるため) リファンピシンの併用で AUC が 73%低下し、Cmax が 58%低下 (Villikka K, et al: Clin Pharmacol Ther 62: 629-34, 1997)

【小児における報告】0.25mg/kg を提案 (Blumer JL, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 551-8, 2008)

【効果発現】30 分程度。吸収は食事の影響で遅延する (U)

【備考】高齢女性では男性に比べ Cmax が 63%上昇するという報告がある (Ann Pharmacother 35: 1562-4, 2001) 乳汁中への移行率は投与量の 0.02%以下であり服用後 3 時間の授乳を避けるのみでよい (Eur J Clin Pharmacol 37: 245-8, 1989) 翌朝への持ち越し効果が少ないとされているが、症例によっては長時間鎮静が持続する可能性があるため注意 (5)

【更新日】20220721

※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・配付を禁じます。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。