

△ワイパックス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ロラゼパム (U) Lorazepam 【分類】 マイナートランキライザー

【単位】 △0.5mg・▼1mg/錠

【常用量】 1～3mg/日

【用法】 分2～3

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3)

グルクロン酸抱合体の血中濃度は高くなるがある程度透析で除去できる (Verbeeck R, et al: Br J Clin Pharmacol 3: 1033-1039, 1976 PMID: 22216526)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,12) 【その他の報告】 Ccr10mL/min 以上: 減量の必要なし, Ccr<10mL/min: 50%に減量 (10)

【特徴】 ジアゼパムより不安緊張症状, 抑鬱症状に対し優れた効果を有する。グルクロン酸抱合により代謝されるため相互作用が発現しにくく, 高齢者に比較的使いやすい薬剤とされている。

【主な副作用・毒性】 依存性, 興奮, 錯乱, 呼吸抑制, 眠気, ふらつき, めまい, 複視, 血圧低下, 肝機能異常, 消化器症状, 皮膚症状, 浮腫・血管性浮腫, 呼吸困難など

【F】 90% (11) 93% (13)

【tmax】 2hr (1, 11) 筋注で1.2hr, 経口で1.2～2.6hr (13) 【Cmax】 健常者に2mgを単回 bolus 静注でCmaxは75ng/mL以下, 同量を筋注したときのCmaxは4.1ng/mL以下, 同量を皮下注したときのCmaxは28ng/mL以下, 加齢により上昇する (13)

【代謝】 肝で主に3-グルクロン酸抱合体となる, 他のベンゾジアゼピン類とは異なり代謝物の活性はない (11) 直接グルクロン酸抱合される (U) UGT2B15*2 多型がPK, PDの個人差の主要因 (Chung JY, et al: Clin Pharmacol Ther 77: 486-94, 2005)

【排泄】 尿中未変化体排泄率1%以下 (13) 代謝物の尿中排泄75%以内 (11) 【CL】 37mL/min (1) 1.1mL/min/kg (13)

【t1/2】 8～25hr, 腎不全で半減期は延長しない (11) 10～20hr (U) 12hr (1) 14hr, 肝硬変・腎障害で延長, 熱症で短縮 (13) 5～10hr (12) 【腎不全患者のt1/2】 32～70hr (12)

【蛋白結合率】 90% (11) 91% (1,13) 肝硬変・腎障害で低下 (13) 87% (12) 85% (U) 未変化体70%以上, グルクロン酸抱合体65%程度 (Verbeeck R, et al: Br J Clin Pharmacol 3: 1033-1039, 1976 PMID: 22216526)

【Vd】 1～2L/kg (11) 1.3L/kg (1) 1.3L/kg, 肝硬変・熱傷・腎障害で上昇 (13) 0.9～1.3L/kg (12)

【MW】 321.16

【透析性】 蛋白結合率が高いため透析で除去されにくい (5) 除去されない (Verbeeck R, et al: Br J Clin Pharmacol 3: 1033-1039, 1976 PMID: 22216526)

【O/W係数】 73 (11)

【相互作用】 中枢神経抑制剤と併用注意 (1) プレガバリン: 認知機能障害及び粗大運動機能障害に対する相加的作用のおそれ (1)

【更新日】 20211228

※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。