

○レスリン錠, ○トラゾドン塩酸塩錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】トラゾドン塩酸塩 (U) Trazodone Hydrochloride 【分類】抗うつ剤

【単位】○25mg・▼50mg/錠

【常用量】初期用量75~100mg/日, 維持用量200mg/日

【用法】分割投与

【透析患者への投与方法】常用量 (1)

【その他の報告】避けるか50%に減量 (3) 未変化体の消失には影響しないが, 代謝物に関する情報は不明 (Crone CC, et al: Clin Pharmacokinetics 2004 PMID: 15086275)
透析患者の不眠症にはプラセボと同等の効果が, 心血管イベントが増えるかもしれない (Mehrotra R, et al: Ann Intern Med 2024 PMID: 38224591)

【PD】減量の必要なし (12)

【CRRT】減量の必要なし (12)

【保存期CKD患者への投与方法】常用量 (1)

【その他の報告】GFR 10mL/min未満では避けるか50%に減量 (3)

【特徴】トリアゾピロジン誘導体の抗うつ薬。セロトニン再取り込み阻害作用が強く, ノルアドレナリン系にはほとんど影響しないが, α 受容体遮断作用は有する。5-HT_{2A/2C}受容体拮抗作用, 5-HT再取り込み阻害作用を併せ持ち, 抗うつ作用, 抗不安作用, 睡眠促進作用などを有する。低用量ではセロトニン2A受容体阻害作用による睡眠改善効果を期待して低用量で用いられることがある。

【主な副作用・毒性】QT延長, PVC, 悪性症候群, セロトニン症候群, 麻痺性イレウス, 無顆粒球症, 血圧低下, 消化器症状, 自殺企図など

【F】吸収率は高い (U) 82% (1)

【t_{max}】3~4hr (1) 2hr, 空腹時1hr (U)

【代謝】CYP3A4, 2D6で代謝 (1) 主に水酸化される (U) 代謝物のm-クロロフェニルピペラジンには活性がある (1)

【排泄】尿中回収率40%であり, 未変化体はごくわずかで, 代謝物のキソトリアゾピロジンプロピオン酸 (TPA) が最も多く, 4-ヒドロキシ体のグルクロン酸抱合体, ジヒドロジオール体等が排泄される (1) 75%が尿中に回収され, そのほとんどが代謝物 (U) 尿中回収率66~70% (1) 胆汁排泄は20% (U)

【CL】2.31mL/min/kg [iv] (1)

【t_{1/2}】 α 相3~6hr, β 相5~9hr (U) 6~11hr (12) 4~11hr (Cohen LM, et al: Psychosomatics 2004 PMID: 14709759)

【蛋白結合率】89~95% (U) 94% (1)

【V_d】0.89L/kg (1)

【MW】408.32

【透析性】蛋白結合率が高く, 透析性は低いと思われる (5) 除去されない (Crone CC, Gabriel GM: Clin Pharmacokinetics 43: 361-94, 2004) 資料なし (1)

【O/W係数】7050 [クロロホルム/水系, pH5.11] (1)

【相互作用】CYP3A4阻害剤の影響を受ける (1)

【主な臨床報告】低用量適用で緩和ケアにおけるせん妄に有用 (Maeda I, et al: J Palliat Med 2021 PMID: 33577386)

【更新日】20240530

※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。