

◎ルネスタ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】エスゾピクロン Eszopiclone 【分類】睡眠導入剤 [非BZ系・超短時間型]

【単位】◎1mg・▼2mg・▼3mg/錠

【常用量】1回2mg [最大3mg] 高齢者には1回1mg [最大2mg]

■翌日への効果の持ち越しがあり、1mgから開始した方がよい (FDA 2014)

【用法】1日1回 寝る前

【透析患者への投与方法】1mg, 最大2mg (1)

【保存期CKD患者への投与方法】1mgから開始, 最大2mg (1) 腎機能低下によるCmax, AUC上昇, t1/2延長が認められている (1)

【特徴】非ベンゾジアゼピン系のGABA-A受容体作動薬。ラセミドゾピクロン (アモバン) のS体。GABA-A受容体に結合する。

【主な副作用・毒性】ショック, 依存性, 呼吸抑制, 肝障害, 精神症状, 一過性前向き健忘, もうろう状態, 頭痛, 過敏症, 消化器症状など。最も多い副作用は口の苦み (Wu F, et al: *Arzneimittelforschung* 62: 561-5, 2012)

【吸収】食後服用で吸収率低下の可能性 (1)

【F】資料なし (1)

【tmax】1~1.5hr (1)

【代謝】肝でCYP3A4, 2E1によりゾピクロンN-オキシド, N-脱メチルエスゾピクロンに代謝 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率5.5~10.7% [高齢者] (1) 尿中回収率74.8% [po, 120hrまで] (1)

【CL】13.86±2.77L/hr [po] (1) 腎CL=0.61~1.10L/hr (1)

【t1/2】4~5hr (1) 通常6.1hrだが, 高齢者や肝障害患者, CYP3A4阻害剤併用で延長 (Greenblatt DJ and Zammit GK: *Expert Opin Drug Metab Toxicol* 2012 PMID: 23126273)

【蛋白結合率】52.2~58.9% (1)

【Vd/F】108.17±15.14L/man (1)

【MW】388.81

【透析性】資料なし (1)

【薬物動態】線形動態 (Wu F, et al: *Arzneimittelforschung* 2012 PMID: 23038043)

【OW係数】1.38 [1-オクタノール/水系, pH7.4] (1)

【相互作用】筋弛緩薬, 中枢神経抑制剤と併用注意 (1) CYP3A4の誘導剤, 阻害剤と併用注意 (1)

【禁忌】重症筋無力症, 急性狭隅角緑内障の患者には禁忌 (1) 苦味はゾピクロンより軽度 (宇田篤史, 他: *日病薬誌* 52: 529-32, 2016)

【更新日】20231219

※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。