

▼エスクレ坐剤 [外]

【重要度】 【一般製剤名】 抱水クロラール chloral hydrate 【分類】 催眠・抗けいれん剤

【単位】 ▼250mg・▼500mg/個

【常用量】 小児に30～50mg/kg [総量最大1.5g]

【用法】 直腸内投与

【透析患者への投与方法】 データなし (17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 慎重投与 (1) 【その他の報告】 データなし (17) 高度腎障害患者には禁忌 (FDA)

【特徴】 主に熱性痙攣に用いられる。理学検査時における鎮静・催眠や静脈注射が困難なけいれん重積状態にも用いられる。大脳皮質に作用して、中枢抑制・催眠作用ならびに抗けいれん作用をあらわす。生体内では活性体のトリクロロエタノールとなり作用するが、未変化体にも活性がある。ゼラチンアレルギー例に禁忌。

【主な副作用・毒性】 ショック, 呼吸抑制, 下痢, 食欲不振, 過敏症など

【吸収】 経皮吸収される可能性 (Trabaris M, et al: J Appl Toxicol 32: 387-94, 2012 PMID: 21365670)

【F】 資料なし (1)

【tmax】 抱水クロラール: 30min, トリクロロエタノール: 60min (1)

【代謝】 全血, 肝臓, その他の組織でアルコール脱水素酵素により還元されて活性代謝物トリクロロエタノールとなる。トリクロロエタノールの一部は抱合・不活性化されグルクロニドとして尿中に排泄される (1) 抱水クロラールの一部は肝臓や腎臓で NAD 依存の酵素系によって酸化され, 不活性代謝物トリクロロ酢酸になる (1) トリクロロエタノールの一部もまたトリクロロ酢酸に変化する (1) 主代謝物トリクロロエタノール (Lipscomb JC, et al: Biochem Biophys Res Commun 227: 340-50, 1996 PMID: 8878519) CYP2E1 の活性上昇はトリクロロエチレンの毒性を増加させる可能性 (Lipscomb JC, et al: Toxicol Appl Pharmacol 142: 311-8, 1997 PMID: 9070354) グルクロン抱合能の低下はトリクロロエタノールの中枢作用を増強する可能性 (Merdink JL, et al: Toxicology 245: 130-40, 2008 PMID: 18243465)

【排泄】 大部分はトリクロロエタノールおよびそのグルクロニド, トリクロロ酢酸として尿中に排泄される。トリクロロエタノールグルクロニドの一部は濃縮されて胆汁中に排泄される (1)

【CL】 資料なし (1)

【t1/2】 未変化体は速やかに消失, 活性代謝物は半減期 8hr 程度 (1) 小児では 9hr 程度で成人と同程度であるが, 乳児 28hr, 新生児 40hr と延長する (Mayers DJ, et al: Dev Pharmacol Ther 16: 71-7, 1991 PMID: 1914781) トリクロロエタノールとして 9～10hr (Zimmermann T, et al: Arzneimittelforschung 48: 5-12, 1998 PMID: 9522024 [abstract])

【蛋白結合率】 資料なし (1)

【Vd】 資料なし (1)

【MW】 165.40

【透析性】 資料なし (1) HD, DHP で除去されるので中毒治療に適用 (Buur T, et al: Acta Med Scand 223: 269-74, 1988 PMID: 3354353)

【O/W 係数】 資料なし (1) 【pKa】 10.04

【相互作用】 ジクロロ酢酸のクリアランスを低下させる可能性 (Henderson GN, et al: Biochem Biophys Res Commun 235: 695-8, 1997 PMID: 9207222) アニオン代謝物が MTX の尿細管分泌を競合阻害する可能性 (Dao K, et al: Pediatr Blood Cancer 60: 518-20, 2013 PMID: 23151940)

【作用発現時間】 10～30min (1)

【作用持続時間】 40～70min (1)

【更新日】 20151221

※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。