

◎デフェビゴ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 レンボレキサント Lemborexant 【分類】 睡眠導入剤 [オレキシン受容体阻害薬 DORA]

【単位】 Δ 2.5mg・ \odot 5mg・ Δ 10mg/錠

【常用量】 ■5mg/日 (適宜増減) ■最大 10mg/日

CYP3A4 阻害剤との併用では 2.5mg/日

【用法】 就寝直前 [効果減弱のおそれあり食後を避ける]

【透析患者への投与方法】 常用量 [腎障害患者では血中濃度上昇の可能性があり慎重投与] (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 常用量 [腎障害患者では血中濃度上昇の可能性があり慎重投与] (1) CKDG4 患者で Cmax 5%, AUC 50%上昇 [free 体濃度は同程度で有害事象も変わらないので減量設定はなされていない] (1)

【その他の報告】 CKD G4 での PK 変化なし (Landry I, et al: Pharmacol Res Perspect 2021 PMID: 33689224)

【特徴】 オレキシン受容体の 2 種のサブタイプ (オレキシン 1 および 2 受容体) に対し、オレキシンと競合的に結合する拮抗剤。入眠障害、中途覚醒、早朝覚醒にも効果がある。

【主な副作用・毒性】 傾眠、頭痛、倦怠感、めまい、注意力障害、幻覚、動悸、悪心、眼痛、体重増加、食欲亢進など。

睡眠時麻痺：いわゆる金縛り。睡眠時随伴症状：悪夢、異常な夢、レム睡眠異常など。

【安全性に関する情報】 自動車運転禁止 (1) 10mg を超えた場合の症状は、筋緊張低下、光視症、低酸素症、初期不眠症、冷感等 (1) 健常人での睡眠時低酸素をもたらさない (Cheng JY, et al: Clin Drug Investig 2021 PMID: 33723806) OSAS でも AHI はプラセボと変わらず (Cheng JY, et al: J Sleep Res 2020 PMID: 32187781) 10mg は効果は強いが眠気も残りやすい (Kishi T, et al: J Psychiatr Res 2020 PMID: 32531478) 中止後の反跳性不眠をもたらさないとされる [二次解析] (Takaesu Y, et al: Clin Transl Sci 2022 PMID: 36564964) 入院患者のせん妄リスクを下げるという解析 (Henmi R, et al: J Clin Psychopharmacol 2024 PMID: 38820374)

【吸収】 食後投与で Cmax 低下の可能性 (1)

【F】

【tmax】

【代謝】 CYP3A で代謝 (1) 主代謝物 M10 (N-オキシド体) の薬理作用への寄与は小さい (1) 代謝物は M10 が全曝露量の 10% の寄与で最も大きい (Ueno T, et al: Drug Metab Dispos 2021 PMID: 33144331)

【排泄】 尿中回収率 29% [po] (1) 尿中に未変化体は検出されない [po] (1, Ueno T, et al: Drug Metab Dispos 2021 PMID: 33144331)

【CL】 経口クリアランスが 65 歳以上で 26% 低下、BMI と負の相関 (Lalovic B, et al: J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32666570)

【t1/2】 31~56hr [β ・ γ 相を含む] (1) 17~19hr (Landry I, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2020 PMID: 32468649) 多コンパートメントに適合 (Lalovic B, et al: J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32666570)

【蛋白結合率】 87.4~88.7% (1)

【Vd/F】 1650 \pm 389L/man (1)

【MW】 410.42

【透析性】 低い (5)

【OW 係数】 LogP=3.7 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】 CYP3A 阻害剤・誘導剤との併用注意 (1) CYP3A4 阻害剤との併用時で投与が必要な場合は 2.5mg [この場合も AUC が 4 倍になり最大用量に匹敵] (1) 経口避妊薬との相互作用を認めない (Landry I, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2021 PMID: 34107159)

CYP2B6 を誘導する可能性 (Landry I, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2021 PMID: 33455055) フルコナゾール併用時は 2.5mg まで (1)

CYP3A4 阻害剤併用時の相互作用強度の解析 (Ueno T, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2021 PMID: 33704920)

【肝障害患者への投与方法】 中等度肝機能障害：最大 5mg、重度の肝機能障害患者に禁忌 (1) 中等度肝障害では最大 5mg (Dayal S, et al: Pharmacol Res Perspect 2021 PMID: 33822479)

【妊婦・授乳婦への投薬】 妊婦は有益性投与、授乳は避ける (1)

【主な臨床報告】 入眠、睡眠の維持に関してゾルピデム (徐放) より優れる可能性 (Rosenberg R, et al: JAMA Netw Open 2019 PMID: 31880796)

明らかな翌日への持ち越し効果を認めない (Moline M, et al: Postgrad Med 2020 PMID: 33119423)

12 か月の長期でも治療効果維持 (Yardley J, et al: Sleep Med 2021 PMID: 33636648)

精神科クリニックで他の睡眠導入剤から切り替えて BZD 系薬のデメリットが軽減できた (Horikoshi S, et al: J Clin Sleep Med 2023 PMID: 37243798)

【備考】 半割のデータはない。データからは粉砕は可と思われる。簡易懸濁も可と思われる (5)

【更新日】 20241010

※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。