◎コンスタン錠，▼ソラナックス錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】アルプラゾラム（U）　Alprazolam　【分類】マイナートランキライザー

【単位】◎0.4mg・▼0.8mg/錠

【常用量】0.4～2.4mg/日［高齢者では0.4～1.2mg］

【用法】分3

【透析患者への投与方法】常用量（5）

総アルプラゾラム濃度はHD患者においても変化がなく，遊離型分率はHD患者で高い（Schmith VD, et al: J Clin Pharmacol 1991 PMID: 1880224）

【その他の報告】減量の必要なし（10）不明（3）

【保存期CKD患者への投与方法】常用量（3,10,12）

【特徴】葛藤行動緩解作用、馴化作用がジアゼパムの 2～7 倍と高く、筋弛緩作用が弱く、ふらつきが比較的少ない。半減期が短時間～中等度のベンゾジアゼピンのため反復投与による蓄積が少なく、血漿濃度の定常状態は2～3日で到達する。

【主な副作用・毒性】依存性，せん妄，不眠，頻脈，下痢，過敏症，躁状態など

【吸収】吸収率92%（11）初回通過効果を受けない（11）

【F】95%以上（14）88%（13）92%（1,11）

【tmax】1～2hr（U）1.5hr、1mg単回投与時のCmaxは21ng/mL（13）

【代謝】肝で酸化され，活性代謝物α-hydroxyalprazolamに代謝されグルクロン酸抱合される（U）一部の代謝物には未変化体の1/2の活性があるが，存在率は低い（U）CYP3A4によって代謝（α-，4-が水酸化）される（1,9）CYP3A5*3遺伝子型ではCLの低下が認められる（Park JY, et al: Clin Pharmacol Ther 79: 590-9, 2006）

【排泄】グルクロン酸抱合され、腎で排泄（U）尿中未変化体排泄率20%（10,11,13）10%（14）16.9%（1）【CL】66.7mL/min（10）0.72mL/min/kg（13）CL/F=41.6mL/min（1）【非腎CL/総CL】90%（10）

【t1/2】11［6.3～26.9］hr（U）10～19hr　（10）16hr（14）12hr（13）9.5～19.0hr（12）6～16hr（11）　【透析患者の t1/2】不明だが HD 患者・健常者に比しCAPD患者ではクリアランスが低く、t1/2も長い（J Clin Pharmacol 31:571-579,1991）10～19hr（10）腎機能正常者と同じ（12）

【蛋白結合率】80%（U）70%（10）71%（13）70～80%（11,12）

【Vd】1.0L/kg（10）0.7～1.4L/kg（11）0.9～1.3L/kg（12）Vd/F=58L/man（1）

【MW】308.76

【透析性】効率的には除去できないと思われる（5）

【TDMのポイント】TDMの対象にならない【O/W係数】110（11）4100［クロロホルム/水系，pH7］（1）【pKa】2.6（1）

【相互作用】CYP3A4関連の相互作用に注意（1）フルボキサミン併用により半減期が20hrから34hrに延長し血中濃度が2倍に上昇（Fleishaker JC and Hulst LK: Eur J Clin Pharmacol 46:35-39,1994）ジゴキシンの血中濃度上昇［機序不明］（1）

【更新日】20231106

※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。