◎ハルシオン錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】トリアゾラム（U）　Triazolam　【分類】睡眠導入剤［超短時間型］
【単位】◎0.125mg・◎0.25mg/錠
【常用量】0.125～0.5mg/日
【用法】分１眠前
【透析患者への投与方法】Cmax は上昇するものの、他のパラメーターには変化ないため正常者と同じ（Kroboth PD, et al: Br J Clin Pharmacol 19: 839-842, 1985 PMID: 2862896）
【その他の報告】減量の必要なし（3）
【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし（3,10,12）

【特徴】BZ 系超短時間型睡眠導入剤．連続投与による蓄積が少ない．
【主な副作用・毒性】依存性，禁断症状，奇異反応，もうろう状態，一過性健忘，運動失調，炭酸ガスナルコーシス，嘔吐，血圧低下，過敏症，味覚異常など
【吸収】85%（1,11）
【F】61%（11）44%，初回通過効果を受けやすい（13）
【tmax】1.2hr（1）1.3hr，食物と同時摂取で延長（13）0.75～2.5hr（11）【Cmax】健常者に 0.5mg を単回経口投与した時 4.4 ng/mL（13）
【代謝】CYP3A4 によって代謝（α-位、4-位が水酸化）される（9）肝代謝（初回通過効果を受ける）非活性代謝物はほとんどグルクロン酸抱合体（U）α-hydroxy triazolam は未変化体の 50～100%の活性を有する（1）
【排泄】ほとんどが肝で代謝され 90%が代謝物として尿中排泄，10%が糞便中に排泄（13）尿中未変化体排泄率 2%（13）低い（11,12）尿中回収率 81%（1）【CL】3.6mL/min/kg（1）6.2～8.8mL/min/kg（11）5.6mL/min/kg、肥満・加齢（男性のみ）で低下（13）CL は加齢により低下して AUC が増大するが個人差も大きい（Greenblatt DJ, et al: Clin Pharmacok Ther 76: 467-79, 2004）【非腎 CL/総 CL】100%10）
【t1/2】2.9hr（1,11）1.5～5.5hr（U）2.3～3.7hr（11）肥満・加齢により延長（13）2～4hr（12）【透析患者の t1/2】腎機能正常者と同じ（12）
【蛋白結合率】89%（1,U）蛋白結合率はα1-酸性糖蛋白濃度に相関する（2）ため、腎不全患者では蛋白結合率が上昇するかもしれない（5）in vitro では 89%だが平衡透析法による in vivo 蛋白結合率は 10～25%で半分はアルブミンと残りはα1 酸性糖蛋白と結合している（11）90.1%で肝硬変で低下（13）85～95%（12）
【Vd】1.0L/kg（11）1.1L/kg（13）0.8～1.0L/kg（1）
【MW】343.21
【透析性】蛋白結合率が高いため透析で除去されにくいと思われる（5）
【TDM のポイント】TDM の対象にならない【O/W 係数】237（11）資料なし（1）【pKa】2.0（1）
【相互作用】強い CYP3A4 阻害剤［アゾール系抗真菌薬，HIV プロテアーゼ阻害薬等］との併用禁忌（1）マクロライド系抗生物質との併用注意（1）リファンピシンとの併用でトリアゾラムの Cmax は 1/8 に，AUC は 1/20 に低下するため効果が得られない（Villikka K, et al：Clin Pharmacol Ther 61:8-14,1997）クレメジンとは 30～60 分空けて服用する（森田 元, 他: 臨床薬理 41:S251,2010）
【警告】一過性健忘を生じることがあるので注意すること
【更新日】20220908

※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。