

◎マイスリー錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ゾルピデム酒石酸塩 (U) Zolpidem Tartrate 【分類】睡眠導入剤 [非BZ系・超短時間型]

【単位】 ◎5mg・△10mg/錠

【常用量】 1回 5~10mg [高齢者には 5mg から投与を開始]

■特に女性では 5mg/日とする [FDA2013]

【用法】 1日 1回眠前 (特に就寝直前に服用すること)

【透析患者への投与方法】 常用量 (11) 5mg/日から開始 (5)

【その他の報告】 血中への蓄積は認められなかった (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 常用量 (11) 5mg/日から開始 (5)

【特徴】 非ベンゾジアゼピン構造の超短期間型睡眠薬。 α_1 受容体 (α_1 サブユニット) に選択的な親和性を示し GABA-A 系の抑制機能を増強して催眠鎮静作用を有す。筋緊張に関与する脊髄や記憶に関与する海馬に多い α_2 受容体への親和性は相対的に低く、それらの有害作用が少ない可能性がある。生理的睡眠パターンに近い睡眠をもたらすらしい。

【主な副作用・毒性】 依存性、離脱症状、精神症状、意識障害、一過性前向性健忘、転倒、呼吸抑制、ふらつき、頭痛、残眠感、しひれ感、視力障害、頭重感、めまい、気分高揚、蛋白尿、消化器症状、動悸、発疹、倦怠感、下肢脱力感、口渴、不快感など。もうろう状態の発現は 10mg 投与例で多い。高齢者が転倒により骨折する例が報告されている。

【安全性に関する情報】 自動車事故に関連 [HR2.20] (Hansen RN, et al: Am J Public Health 2015 PMID: 26066943) 前日の服用が自動車事故に関連 (Yang BR, et al: CNS Drugs 32: 593-600, 2018 PMID: 29796977) 高齢者の自動車事故に関連し、開始後 2 週間以内が最大リスク (Nevriana A, et al: CNS Drugs 31: 711-722, 2017 PMID: 28669021) SAS 悪化に関連しなかった (Carberry JC, et al: J Sleep Res 2019 PMID: 30968498) 本剤で夢遊病の既往歴あれば使用不可 (1)

非BZ系でも転倒に関連 (Westerlind B, et al: Aging Clin Exp Res 2019 PMID: 30341643)

【吸収】 上部消化管で 95%以上吸収される (1,11) 食事の影響を受けない (1)

【F】 初回通過効果を受けて 66.6% (1) 全身循環までに代謝され 70% (U,11) 72% (13)

【tmax】 0.8±0.3hr (1) 食事により延長 (U) 1.0~2.6hr、食事により延長 (13)

【代謝】 肝：主に CYP3A4 で代謝され、一部 2C9, 1A2 で代謝される (1) 活性代謝物は認められていない (U,11)

【排泄】 代謝物として尿中へ 55.8%，糞中へ 36.5% 回収 [po, 120hr まで] (1) 尿中未変化体排泄率 1%以下 (1,11,13)

【CL】 0.26±0.03L/hr/kg (1) 4.5mL/min/kg, 肝硬変・加齢で低下 (13)

【t1/2】 1.78~2.3hr (1) 2.6hr (1.4~4.5hr) (U) 2.4hr (2~4hr) (11) 1.9hr, 加齢・肝硬変で延長 (13)

【蛋白結合率】 94.5~96.0% (1) 92%，アルブミンと AAG に対する結合親和性はほぼ同等 (U,11) 92%，腎障害・肝硬変で低下 (13)

【Vd】 0.54±0.02L/kg (1,11) 0.68L/kg 腎障害で上昇 (13)

【MW】 764.8

【透析性】 除去されない (1,U,11)

【薬物動態】 高齢女性では男性に比べ Cmax が 63% 上昇する (Brodeur MR, et al: Ann Pharmacother 2001 PMID: 11793620) 高齢者では Cmax が 2 倍程度に上昇することがある (1)

【pKa】 6.16 【O/W 係数】 2.1 (11) 309 [1-オクタノール/水系, pH7] (1)

【相互作用】 リファンピシンとの併用により本剤の作用が减弱するおそれがある (CYP3A4 が誘導されるため) リファンピシンとの併用で AUC が 73% 低下し、Cmax が 58% 低下 (Villikka K, et al: Clin Pharmacol Ther 62: 629-34, 1997)

【小児における報告】 0.25mg/kg を提案 (Blumer JL, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 551-8, 2008)

【効果発現】 30 分程度。吸收は食事の影響で遅延する (U)

【備考】 乳汁中への移行率は投与量の 0.02% 以下であり服用後 3 時間の授乳を避けるのみでよい (Eur J Clin Pharmacol 37: 245-8, 1989) 翌朝への持ち越し効果が少ないとされているが、症例によっては長時間鎮静が持続する場合があるため注意 (5)

【更新日】 20250524

※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、適切性についてかかる責任も負わず、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、それを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の損害について、当院ではかか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ーネットフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断複数・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。