

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
クロナゼパム	リボトリール、ランドセン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
<ul style="list-style-type: none"> ・小型(運動)発作[ミオクローニー発作、失立(無動)発作、點頭てんかん(幼児けい縮発作、BNSIけいれん等)] ・精神運動発作 ・自律神経発作 	<p>成人・小児は、初回量1日0.5～1mgを1～3回に分けて経口投与する。以後、症状に応じて至適効果が得られるまで徐々に増量する。通常、維持量は1日2～6mgを1～3回に分けて経口投与する。</p> <p>乳・幼児は、初回量1日体重1kgあたり0.025mgを1～3回に分けて経口投与する。以後、症状に応じて至適効果が得られるまで徐々に増量する。通常、維持量は1日体重1kgあたり0.1mgを1～3回に分けて経口投与する。</p> <p>年齢・症状に応じて適宜増減。</p>	運動失調等の副作用があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。	
薬物動態				
尿中代謝物として、7-amino 体、7-cetylamino体が検出されている。なお、各種の文献報告によると本剤の臨床用量における血中濃度は20～70ng/mLである。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
1mg：約2hr (n=6, 健康成人男子)	1mg：6.5 ng/mL (n=6, 健康成人男子)	1mg：約27hr (n=6, 健康成人男子)	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	抗てんかん剤(ヒダントイン誘導体)	作用↑or作用↓ フェニトインの血中濃度をモニタリングすることが望ましい。	機序不明だが、血中濃度↑と血中濃度↓の両方の報告がある
注意	抗てんかん剤(バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体等)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	MAO阻害剤	クロルジアゼパキシルで舞踏病が発現したとの報告がある。 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与すること。	機序不明。
注意	バルプロ酸ナトリウム	アブサンス重積(欠伸発作重積)があらわれたとの報告がある。	機序不明。

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
エスタゾラム	ユーロジン、アメル	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
・不眠症 ・麻酔前投薬	本剤の用量は、年齢、症状、疾患などを考慮して適宜増減。 ・不眠症： 1回1～4mgを就寝前に経口投与する。 ・麻酔前投薬： 手術前夜：1回1～2mgを就寝前に経口投与する。 ・麻酔前： 1回2～4mgを経口投与する。	副作用が発現しやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
エスタゾラム錠1mg「アメル」： 2.19±1.70 hr エスタゾラム錠2mg「アメル」： 2.33±2.11 hr (健康成人男子)	エスタゾラム錠1mg「アメル」： 60.3±9.9 ng/mL エスタゾラム錠2mg「アメル」： 109.4±18.6 ng/mL (健康成人男子)	エスタゾラム錠1mg「アメル」： 21.16±4.42 hr エスタゾラム錠2mg「アメル」： 22.77±6.85 hr (健康成人男子)	エスタゾラム錠1mg「アメル」： 1624.9±251.8 ng·hr/mL エスタゾラム錠2mg「アメル」： 3405.0±1023.3 ng·hr/mL (健康成人男子)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	リトナビル(ノービア®)	過度の鎮静や呼吸抑制等	CYP1に対する競合的阻害により、本剤の血中濃度↑
注意	中枢神経抑制剤(催眠・鎮静剤、フェノチアジン誘導体等)	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等↓	相加作用
注意	抗うつ剤	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等↓	相加作用
注意	MAO阻害剤	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等↓	相加作用
注意	アルコール((飲酒))	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等↓	相加作用
注意	マプロチリン塩酸塩	1) 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等↓ 2) 併用中の本剤を急速に減量又は中止すると痙攣発作がおこる可能性がある。	1) 相加作用 2) 本剤の抗痙攣作用により抑制されていたマプロチリン塩酸塩の痙攣誘発作用が本剤の減量・中止によりあらわれることが考えられている。
注意	ダントロンナトリウム水和物	筋弛緩作用↑	相加作用

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
エチゾラム	デパス、アロファルム、エチセダン、エチゾラム、エチゾラン、カブセーフ、グベリース、サイラゼパム、セデコパン、デゾラム、デムナット、ノンネルブ、バルギン、メディピース、モーズン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
<ul style="list-style-type: none"> ・神経症における不安・緊張・抑うつ・神経衰弱症状・睡眠障害 ・うつ病における不安・緊張・睡眠障害 ・心身症(高血圧症、胃・十二指腸潰瘍)における身体症状候ならびに不安・緊張・抑うつ・睡眠障害 ・統合失調症における睡眠障害 ・下記疾患における不安・緊張・抑うつおよび筋緊張頸椎症、腰痛症、筋収縮性頭痛 	<ul style="list-style-type: none"> ・神経症、うつ病：1日3mgを3回に分けて経口投与する。 ・心身症、頸椎症、腰痛症、筋収縮性頭痛：1日1.5mgを3回に分けて経口投与する。 ・睡眠障害：1日1～3mgを就寝前に1回経口投与する。 年齢・症状により適宜増減するが、高齢者には、1日1.5mgまでとする。	運動失調等の副作用が出現しやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	
薬物動態				
神経症の例にデパス1mg錠を1日3回食後30分から1時間に反復経口投与した場合、投与開始後7日、14日及び28日目の血漿中濃度はほぼ等しかった。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
2mg : 3.3±0.3 hr (mean±SE, n=10, 健康成人) (食後30分単回投与)	2mg : 25±1.5 ng/mL (mean±SE, n=10, 健康成人) (食後30分単回投与)	2mg : 6.3±0.8 hr (mean±SE, n=10, 健康成人) (食後30分単回投与)	2mg : 284.3±40.4 ng·h/mL AUC0～36h (mean±SE, n=10, 健康成人) (食後30分単回投与)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	中枢神経抑制剤((フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等))	眠気、血圧低下、運動失調、意識障害など	相加作用
注意	MAO阻害剤	過鎮静、昏睡、痙攣発作、興奮など	本剤の代謝↓により半減期↑、血中濃度↑
注意	フルボキサミン(マレイン酸塩)	本剤の作用↑ 本剤の用量を減量するなど、注意して投与する。	本剤の代謝↓、血中濃度↑
注意	アルコール((飲酒))	精神機能、知覚・運動機能の低下	相加作用

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
フルニトラゼパム	ロヒプノール、サイレース、ビビットエース、フルトラス、	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
・不眠症 ・麻酔前投薬	1回0.5～2mgを就寝前又は手術前に経口投与する。 年齢・症状により適宜増減するが、高齢者には1回1mgまでとする。		運動失調、意識障害等の中枢神経抑制症状があらわれやすい。 高齢者では特に、うとうと状態から昏睡等の意識障害があらわれやすい。	高齢者へ投与する場合には、慎重に投与すること。高齢者には1回1mgまでとする。
薬物動態				
2mgを7日間連続経口投与した時、3～5日間後で定常状態に達し、その最高血中濃度は単回経口投与時の約1.3倍であった。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
2 mg : 1.3±0.3 hr (Mean±SE, n=5, 健康成人)	2 mg : 11.5±1.2 ng/mL (Mean±SE, n=5, 健康成人)	2 mg : 6.8±0.6 hr (Mean±SE, n=5, 健康成人)	2 mg : 116.7±10.6 ng·hr/mL (Mean±SE, n=5, 健康成人)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用 アルコールとの併用は避けることが望ましい。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体、鎮痛薬、麻酔薬等)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	MAO阻害剤	クロルジアゼポキシルで舞踏病が発現したとの報告がある。	機序不明
注意	シメチジン	中枢神経抑制作用↑	CYP阻害により、本剤の排泄↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
フルラゼパム	ダルメート、ベンゾール、ネルガート	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症 麻酔前投薬	1回、1～2カプセルを就寝前または手術前に経口投与する。 ただし、として、10～30mgとする。 年齢・症状により、適宜増減。		運動失調等の副作用が発現しやすい。	高齢者へ投与する場合には、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
30mg : フルラゼパム塩酸塩未変化体 : 1 hr (n=5, 1例は3hr) N-デスアルキルフルラゼパム : 1～8 hr (n=6, 健常成人, 単回投与)	30mg : フルラゼパム塩酸塩未変化体 : 0.82～1.7 ng/mL N-デスアルキルフルラゼパム : 11～25 ng/mL (n=6, 健常成人, 単回投与)	30mg : フルラゼパム塩酸塩未変化体 : 5.9 (2.3～12) hr N-デスアルキルフルラゼパム : 23.6 (14.5～42.0) hr (n=6, 健常成人, 単回投与)	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	リトナビル((ノービア))	過度の鎮静や呼吸抑制	CYPに対する競合的阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	アルコール((飲酒),)	中枢神経抑制作用↑ アルコールとの併用は避けることが望ましい。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体, パルビツール酸誘導体, 鎮痛薬, 麻酔薬等)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	MAO阻害剤	クロルジアゼポキシドで舞踏病が発現したとの報告がある。	機序不明
注意	シメチジン	本剤の作用↑	CYP阻害により本剤の代謝↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ハロキサゾラム	ソメリン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症	1回5～10mgを就寝前に経口投与する。年齢、症状により適宜増減。		高齢者では、運動失調等の副作用が発現しやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。
薬物動態				
健康成人7例を対象とした第1相試験において1回経口投与(ハロキサゾラム5～20mg)後の血中ならびに尿中代謝物をガスクロマトグラフにより検索・定量した。その結果は、血漿中にはハロキサゾラムの未変化体は検出されず、主代謝物としてOxazolidine環のはずれたNo.574注1)が検出され、15mg以上の投与例ではその水酸化体であるNo.609注2)が検出されている。また、尿中主代謝物はNo.609ならびにbenzophenone誘導体であるBFBP-OH注3) (ともに抱合体)である3)。 注1): 7-bromo-1,3-dihydro-5-(2-fluorophenyl)-2H-1,4-benzodiazepin-2-one 注2): 7-bromo-5-(2-fluorophenyl)-1,3-dihydro-3-hydroxy-2H-1,4-benzodiazepin-2-one 注3): 2-amino-5-bromo-2-fluoro-3-hydroxybenzophenone				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
-	-	-	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	併用によりその作用が増強されることがあるので、投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与すること。	相加的な中枢神経抑制作用の増強
注意	アルコール	併用によりその作用が増強されることがあるので、投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与すること。	相加的な中枢神経抑制作用の増強
注意	MAO阻害剤	併用によりその作用が増強されることがあるので、投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与すること。	本剤の代謝が抑制される。

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ロルメタゼパム	ロラメット、エバミール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症	1回1~2mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状により適宜増減するが、高齢者には1回2mgを超えないこと。	運動失調等の副作用が出現しやすい。	少量から投与を開始し、経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。	
薬物動態				
健常成人に本剤を経口投与したときの主代謝物は、ロルメタゼパムのグルクロン酸抱合体で、投与24時間後には投与量の約70%が尿中に排泄された。また、海外での試験では、グルクロン酸抱合体以外に僅かに脱メチル化体(ロラゼパム)のグルクロン酸抱合体も認められた。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
1mg : 1~2 hr1) (n=8, 健常成人)	-	1mg : 約 10 hr1) (n=8, 健常成人)	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体, バルビツール酸誘導体等)	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下	相加作用
注意	MAO阻害剤	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下	相加作用
注意	マプロチリン塩酸塩	1) 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等↓	1) 相加作用 2) 本剤の抗痙攣作用により抑制されていたマ
注意	ダントロレンナトリウム水和物	筋弛緩作用↑	相加作用

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ミダゾラム	ドルミカム、ミダゾラム	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
・麻酔前投薬 ・全身麻酔の導入及び維持 ・集中治療における人工呼吸中の鎮静	麻酔前投薬： 0.08～0.10mg/kgを手術前30分～1時間に筋肉内に注射する。 全身麻酔の導入及び維持： 0.15～0.30mg/kgを静脈内に注射し、必要に応じて初回量の半量ないし同量を追加投与する。静脈内に注射する場合には、なるべく太い静脈を選んで、できるだけ緩徐に(1分間以上の時間をかけて)注射する。 集中治療における人工呼吸中の鎮静： 導入：初回投与は、0.03mg/kgを少なくとも1分以上かけて静脈内に注射する。より確実な鎮静導入が必要とされる場合の初回投与量は0.06mg/kgまでとする。必要に応じて、0.03mg/kgを少なくとも5分以上の間隔を空けて追加投与する。但し、初回投与及び追加投与の総量は0.30mg/kgまでとする。 維持：0.03～0.06mg/kg/hより持続静脈内投与を開始し、患者の鎮静状態をみながら適宜増減する。(0.03～0.18mg/kg/hの範囲が推奨される) 患者の年齢・感受性・全身状態・手術術式・麻酔方法等に応じて適宜増減。	1. 作用が強く又は長くあらわれやすい。 2. 低換気、気道閉塞、無呼吸等の危険性が高い。また、作用の発現が遅延することがある。	1. 慎重に投与すること。 2. 少量ずつ分けて投与するか、又は投与速度を減じること。	

薬物動態			
1健康被験者(外国人データ) ミダゾラムを健康被験者に静脈内投与したときの薬物動態は、0.1～0.3mg/kgの範囲で線形であり、クリアランス(CL)、分布容積(Vd)、消失半減期(t1/2)はそれぞれ4.2～9.0mL/min/kg、1.0～3.1L/kg、1.8～6.4時間であった。 また、健康被験者へ7.5mgを筋肉内投与時のバイオアベイラビリティは90%以上、最高血漿中濃度(Cmax)は90ng/mL、最高血漿中濃度到達時間(Tmax)は0.5時間、1-ヒドロキシ体のCmaxは8ng/mL、Tmaxは1時間であった。 静脈内持続投与時の薬物動態パラメータは、CL:6.1～9.7mL/min/kg、Vd:1.0～2.7L/kg、半減期:1.9～3.2時間であり、静脈内投与時の薬物動態パラメータと差は認められなかった。			
2高齢被験者(外国人データ) ミダゾラムを高齢者群に静脈内投与又は筋肉内投与したとき、高齢者群の半減期は非高齢者群の約2倍(3.3～5.6vs1.4～2.6時間)まで延長、分布容積にはほとんど差はなく(0.38～1.9vs0.5～1.5L/kg)、CLはやや減少(3.88～7.50vs5.74～9.39mL/min/kg)した。			
3心不全患者(外国人データ) うっ血性心不全患者にミダゾラムを静脈内投与したときの半減期は健康被験者群の約2倍(6.5vs2.8時間)に延長し、CLは25%減少(6.17vs8.00mL/min/kg)した。			
4肝障害患者(外国人データ) ミダゾラムを7名のアルコール性肝硬変患者に0.075mg/kg静脈内投与したとき、8名の健康被験者群に対して、半減期は約2.5倍に延長、CLは50%減少し、Vdは20%増加した。			
5慢性腎不全患者(外国人データ) ミダゾラムを15名の慢性腎不全患者に静脈内投与したとき、健康被験者群に対してCL及びVdは2倍に増加したが、半減期に変化は認められなかった。			
6小児及び新生児患者(外国人データ) 生後1年以上の小児術後患者のCLは健康成人被験者と同様又は高値、半減期は健康成人被験者と同様又は低値であったが15)、新生児救命救急患者では半減期が顕著に延長(6.5～12.0時間)、CLが減少(1.2～2.0mL/min/kg)したが、この原因が代謝能又は器官機能の未成熟、疾患又は衰弱のいずれにあるのかは特定されていない。			
Tmax	Cmax	T1/2	AUC
-	-	-	-

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	HIVプロテアーゼ阻害剤(リトナビル(ノービア)、サキナビル(フォートベイス)、アンプレナビル(プローゼ)等)	過度の鎮静や呼吸抑制	CYP3A4阻害により、本剤の血中濃度↑
禁忌	HIV逆転写酵素阻害剤(エファビレンツ(ストックリンカプセル)等)	不整脈、持続的な鎮静や呼吸抑制	CYP3A4阻害により、本剤の血中濃度↑
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体、麻薬性鎮痛剤等)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	MAO阻害剤	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	カルシウム拮抗剤(塩酸ベラパミル、塩酸ジルチアゼム)	中枢神経抑制作用↑	CYP3A4阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	シメチジン	中枢神経抑制作用↑	CYP3A4阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	エリスロマイシン	中枢神経抑制作用↑	CYP3A4阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	クラリスロマイシン	中枢神経抑制作用↑	CYP3A4阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	テリスロマイシン	中枢神経抑制作用↑	CYP3A4阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	キヌプリスチン・ダルホプリスチン	中枢神経抑制作用↑	CYP3A4阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	アゾール系抗真菌剤(ケトコナゾール、フルコナゾール、イトラコナゾール等)	中枢神経抑制作用↑	CYP3A4阻害作用により、本剤の血中濃度↑
注意	抗悪性腫瘍剤(酒石酸ビンレルビン、パクリタキセル等)	骨髄抑制等の副作用↑	CYP阻害により、抗悪性腫瘍剤の代謝↓血中濃度↑
注意	プロポフォール	麻酔・鎮静作用↑、収縮期血圧↓、拡張期血圧↓、平均動脈圧↓心拍出量↓	相加作用 CYP3A4阻害により、本剤の血中濃度↑
注意	リファンピシン	本剤の作用↓	酵素誘導により、本剤の代謝↑

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ニメタゼパム	エミリン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症	1回3～5mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状により適宜増減。		運動失調等の副作用があらわれやすい。	高齢者へ投与する場合は、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。
薬物動態				
経口投与した場合、投薬後1時間の血中濃度は0.4ng/mLで、ピークとなる2～4時間後の濃度(13.4ng/mL)と同程度であり、ニトラゼパムに比べて高い初期血中濃度を示す。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
5mg : 2～4 hr (健常成人)	5mg : 13.4ng/mL (健常成人)	-	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体, バルビツール酸誘導体, 等)	作用↑ 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	アルコール((飲酒),)	作用↑ 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	MAO阻害剤	作用↑ 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	機序不明

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ニトラゼパム	ネルボン、ベンザリン、チスボン、ネルロレン、ノイクロニック、ヒルスカミン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
1.不眠症 2.麻酔前投薬 3.異型小発作群 點頭てんかん、ミオクロナス発作、失立発作等 焦点性発作 焦点性けいれん発作、精神運動発作、自律神経発作等	<ul style="list-style-type: none"> ・不眠症：1回5～10mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 ・麻酔前投薬：1回5～10mgを就寝前または手術前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減。 ・抗てんかん剤として用いる場合：1日5～15mgを適宜分割投与する。年齢・症状により適宜増減。 	高齢者では運動失調等の副作用が発現しやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	
薬物動態				
海外における検討では、健康成人6例にニトラゼパム10mgを経口投与した場合、速やかに吸収(53～94%)され、未変化ニトラゼパムの血漿中濃度は投与後約2時間後に最高に達し、その時の血漿中濃度は、平均84ng/mL(68～108ng/mL)である。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
5mg : 1.6 ± 1.2 hr (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	5mg : 75.8 ± 28.9 ng/mL (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	5mg : 27.1 ± 6.1 hr (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	5mg : 929.3 ± 263.6 ng・hr/mL (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等、クロルプロマジン、フェノバルビタール等)	作用↑ 投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	アルコール	作用↑ 投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	MAO阻害剤	作用↑	本剤の代謝↓
注意	シメチジン	作用↑	代謝酵素阻害作用により、本剤の代謝↓ 血漿中濃度↑

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
パシフロラ エキス	パシフラミン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
神経症における不安・緊張・ 焦燥・抑うつ・睡眠障害 心身症(自律神経失調症、 過敏性腸症候群、本態性高 血圧症、消化性潰瘍)にお ける身体症候並びに不安・ 緊張・抑うつ・睡眠障害	1回30mgを1日3回食後に経口投与する。年齢、症状により適 宜増減。	-	一般に高齢者では生理機 能が低下しているので注意 すること。	
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
-	-	-	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
-	-	-	-

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ペントバルビタール	ラボナ	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症、麻酔前投薬、不安緊張状態の鎮静、持続睡眠療法における睡眠調節	<ul style="list-style-type: none"> ・不眠症： 1回50～100mgを就寝前に経口投与する。年齢、症状により適宜増減。 ・麻酔前投薬： 手術前夜100～200mg、手術前1～2時間に100mgを経口投与する。年齢、症状により適宜増減。 ・不安緊張状態の鎮静： 1回25～50mgを1日2～3回経口投与する。年齢、症状により適宜増減。 		一般に高齢者では、めまい、運動失調、呼吸抑制等の副作用があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど、慎重に投与すること。
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
100mg : 1 hr (n=10, 健康成人男子(外国人))	100mg : 1.37 ± 0.06 μg/mL1) (n=10, 健康成人男子(外国人))	100mg : 15～48 hr2) (n=10, 健康成人男子(外国人))	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	抗ヒスタミン剤((ジフェンヒドラミン、塩酸プロメタジン等))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	フェノチアジン系薬剤((クロルプロマジン、ハロペリドール等))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	催眠・鎮静剤((アモバルビタール、トリクロホスナトリウム等))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	三環系抗うつ剤((塩酸イミプラミン、塩酸アミトリプチリン、塩酸ノルトリプチリン))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	抗不安剤((ジアゼパム、ニトラゼパム))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	解熱・鎮痛剤((イブプロフェン、ジクロフェナクナトリウム、アセトアミノフェン))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	チアジド系薬物((シクロベンチアジド、トリクロルメチアジド等))	起立性低血圧があらわれることがある。 異常が認められた場合には、本剤を減量するなど適切な処置を行う。	機序不明
注意	ジスルフィラム	起立性低血圧があらわれることがある。	ジスルフィラムが本剤の代謝を阻害する。
注意	クラーレ様物質((ツボクラリン、パンクロニウム))	筋弛緩作用、呼吸抑制作用↑ 異常が認められた場合には、本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	ワルファリンカリウム	抗凝血作用↓ 頻回にプロトロンビン値の測定を行い、ワルファリンカリウムの用量を調節する。	ワルファリンカリウムの代謝↑、半減期↓、クリアランス↑
注意	ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの抗菌作用↓ 併用する場合には、用量に注意する。	ドキシサイクリンの代謝↑、半減期↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
フェノバルビタール	フェノバル、フェノバルビ タール、ベゲタミン、ルピ アール、ワコビタール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 不安緊張状態の鎮静 てんかんのけいれん発作 強直間代発作(全般けい れん発作、大発作)、 焦点発作(ジャクソン型発 作を含む) 自律神経発作、精神運動発 作	1日30～200mgを1～4回に分割経口投与する。 不眠症の場合は、1回30～200mgを就寝前に経口投与する。 年齢、症状により適宜増減。 (用法及び用量に関連する使用上の注意) 不眠症には、就寝の直前に服用させること。また、服用して就 寝した後、睡眠途中において一時的に起床して仕事等をする 可能性があるときは服用させないこと。	呼吸抑制、興奮、抑うつ、錯 乱等があらわれやすい。 高齢者では離脱症状として 起こるてんかん重積状態に 特に注意すること。	少量から投与を開始するな ど慎重に投与すること。な お、投与を中止する場合に は、徐々に減量するなど慎 重に行うこと。	
薬物動態				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
末120mg：2.4±0.9 hr 散10%120mg：2.4±0.9 hr 錠30mg×4錠：1.4±0.5 hr エリキシル0.4%120mg：1.0±0.0 hr (n=5, 健康成人男子)	末120mg：4.6±0.4 ng/mL 散10%120mg：4.8±0.2 ng/mL 錠30mg×4錠：5.0±0.5 ng/mL エリキシル0.4%120mg：4.9±0.7 ng/mL (n=5, 健康成人男子)	末120mg：131.1±34.0 hr 散10%120mg：105.9±15.4 hr 錠30mg×4錠：119.0±18.6 hr エリキシル0.4%120mg：94.5±17.7 hr (n=5, 健康成人男子)	末120mg：175.2±17.6 ng・hr/mL 散10%120mg：177.4±12.7 ng・ hr/mL 錠30mg×4錠：186.6±20.4 ng・ hr/mL エリキシル0.4%120mg：176.0±17.7 ng・hr/mL (n=5, 健康成人男子)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	ポリコナゾール(〔末、散、錠〕、(ブイフェンド))	ポリコナゾールの代謝↓、血中濃度↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用による。
禁忌	ポリコナゾール(〔エリキシル〕、(ブイフェンド))	ポリコナゾールの代謝↑、血中濃度↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用による。
禁忌	ジスルフィラム(〔ノックピン〕、シアナミド、シア	これらの薬剤とのアルコール反応(顔面潮紅、血	エリキシル剤はエタノールを含有しているため。
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、)	相互に作用↑	相加作用
注意	抗ヒスタミン剤(ジフェンヒドラミン等)	相互に作用↑	相加作用
注意	アルコール	相互に作用↑	相加作用
注意	MAO阻害剤	相互に作用↑	機序不明
注意	三環系抗うつ剤(イミプラミン等)	(1)相互に作用↑	(1)相加作用
注意	四環系抗うつ剤(マプロチリン等)	(1)相互に作用↑	(1)相加作用
注意	メチルフェニデート	本剤の血中濃度↑	メチルフェニデートが肝代謝を抑制すると考え
注意	バルプロ酸	(1)作用↑	(1)バルプロ酸により本剤の肝代謝↓、血中濃
注意	クロバザム	(1)本剤の血中濃度↑	(1)機序不明
注意	イリノテカン	イリノテカン作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、イレノ
注意	副腎皮質ホルモン剤(デキサメタゾン等)	これらの薬剤の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、これら
注意	カルバマゼピン	カルバマゼピンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、カル
注意	シクロスポリン	シクロスポリンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、シクロ
注意	テオフィリン	テオフィリンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、テオ
注意	アミノフィリン水和物	これらの薬剤の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、これら
注意	卵胞ホルモン剤(黄体ホルモン剤、ノルゲス	これらの薬剤の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、これら
注意	ベラパミル	ベラパミルの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、ベラ
注意	フェロジピン	フェロジピンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、フェロ
注意	クロラムフェニコール	クロラムフェニコールの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、クロラ
注意	フレカイニド	フレカイニドの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、フレカ
注意	パロキセチン	パロキセチンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、パロキ
注意	グリセオフルビン	グリセオフルビンの作用↓	本剤の消化管ぜん動運動亢進作用によるグリ
注意	ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、ドキシ
注意	タクロリムス	タクロリムスの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、タクロ
注意	サキナビル	サキナビルの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、サキ
注意	インジナビル	インジナビルの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、インジ
注意	トロピセトロン	トロピセトロンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、トロピ
注意	イマチニブ	イマチニブの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、イマ
注意	アゼルニジピン	アゼルニジピンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、アゼ
注意	クマリン系抗凝血剤(ワルファリン)	クマリン系抗凝血剤の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用による。
注意	利尿剤(チアジド系降圧利尿剤等)	起立性低血圧が増強されることがある。	機序は不明であるが、高用量の本剤は血圧を
注意	アセタゾラミド	クル病、骨軟化症があらわれやすい。	本剤によるビタミンDの不活性化促進、又はア
注意	セイヨウオトギリソウ(St. John's Wort、セント・	本剤の作用↓	セイヨウオトギリソウの肝薬物代謝酵素誘導作

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
クアゼパム	ドロール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 麻酔前投薬	不眠症 1回20mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、1日最高量は30mgとする。 麻酔前投薬 手術前夜：1回15～30mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、1日最高量は30mgとする。	運動失調等の副作用が現れやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	

薬物動態

本剤の吸収は食事の影響を受け、そのバイオアベイラビリティは増大する。

Tmax	Cmax	T1/2	AUC
絶食時投与15mg： 3.42±1.63 hr 食後30分後投与15mg： 3.67±0.52 hr (mean±SD, n=6, 健常成人男子)	絶食時投与15mg： 15.36±6.07 ng/mL 食後30分後投与15mg： 47.90±17.49* ng/mL (mean±SD, n=6, 健常成人男子)	絶食時投与15mg： 36.60±7.26 hr 食後30分後投与15mg： 31.91±7.10 hr (mean±SD, n=6, 健常成人男子)	絶食時投与15mg： 287.91±79.59 ng·hr/mL 食後30分後投与15mg：※ 621.99±263.54 ng·hr/mL (mean±SD, n=6, 健常成人男子)

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	食物	過度の鎮静や呼吸抑制	難溶性薬物である本剤は、胃内容物の残留によって吸収性が向上し、未変化体及びその代謝物の血漿中濃度↑(空腹時の2～3倍)
禁忌	リトナビル(ノープア)	過度の鎮静や呼吸抑制	リトナビルのチトクロームP450に対する競合的阻害作用により、併用した場合、本剤の血中濃度が大幅に上昇することが予測される。
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↑を増強することがある。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑を増強することがある。	相加作用
注意	MAO阻害剤	中枢神経抑制作用↑を増強することがある。	相加作用
注意	シメチジン	本剤の作用↑	シメチジンのCYP阻害作用により、本剤の代謝↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
リルマザホン	リスミー、塩酸リルマザホン錠「MEEK」	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 麻酔前投薬	<ul style="list-style-type: none"> ・不眠症：1回1～2mgを就寝前に経口投与する。年齢・疾患・症状により適宜増減するが、高齢者には1回2mgまでとする。 ・麻酔前投薬：1回2mgを就寝前又は手術前に経口投与する。年齢・疾患・症状により適宜増減するが、高齢者には1回2mgまでとする。 	運動失調等の副作用が発現しやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	
薬物動態				
血漿中濃度(総活性代謝物の薬物動態パラメータ(測定法:HPLC)) (1)単回投与 健康成人男性4例にリルマザホン塩酸塩錠2mgを空腹時経口投与したとき、血漿中に未変化体は認められず、4種の活性代謝物(「3.代謝」の項参照)が認められた。 (2)腎不全患者における血漿中濃度 健康成人男性4例にリルマザホン塩酸塩錠2mgを投与した群と腎不全患者5例にリルマザホン塩酸塩錠1mgを投与した群の、血漿中濃度シミュレーションはほぼ同等であった。 (3)反復投与 健康成人男性にリルマザホン塩酸塩錠2mg反復投与(22日間)後の血漿中活性代謝物濃度は、初回投与後の測定値より求めた薬物動態パラメータから予測された血漿中濃度とほぼ等しく、反復投与による薬物動態の変動は認められなかった。活性代謝物のうち、最も遅く生成するM-3の血漿中濃度は投与後3日目に定常状態となり、投与中止後3日目には消失した。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
2mg : 3.0 ± 0.0 hr (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)	2mg : 7.6 ± 2.5 ng/mL (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)	2mg : 10.5 ± 2.6 hr (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)	2mg : 122.8 ± 42.0 ng·hr/mL (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましい。やむを得ず併用する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましい。やむを得ず併用する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	MAO阻害剤	中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましい。やむを得ず併用する場合には慎重に投与する。	本剤の代謝↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
セコバルピタール	アイオナール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症、麻酔前投薬、全身麻酔の導入、不安緊張状態の鎮静	1回100～200mg(5%溶液※2～4mL)を徐々に静脈内注射するか、又は筋肉内注射する。年齢・症状により適宜増減するが、総量500mgを超えないことが望ましい。	-	一般に高齢者では生理機能が低下しているため減量するなど注意すること。	
薬物動態				
麻酔前投薬として上腕筋肉内に投与した結果、60分後の血中濃度は2mg/kg : 3.1mg/L, 3mg/kg : 5.4 mg/L, 4mg/kg : 10.2 mg/L。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
2mg/kg : 30～40分 3mg/kg : 30～40分 4mg/kg : 30～40分 (成人患者)	2mg/kg : 5.8 mg/L 3mg/kg : 10.3 mg/L 4mg/kg : 17.6 mg/L (成人患者)	-	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗不安薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗精神病薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	催眠鎮静薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗うつ薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗ヒスタミン薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗パーキンソン薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	解熱鎮痛薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	チアジド系薬物	起立性低血圧↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	クラレ様物質	筋弛緩作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	ジスルフィラム	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	薬物代謝酵素抑制によりバルビツール酸系薬剤の代謝↓
注意	クマリン系抗凝血薬	クマリン系抗凝血薬の作用↓ 通常より頻回にプロトロンビン値の測定を行い、クマリン系抗凝血薬の用量を調節する。	薬物代謝酵素誘導により、クマリン系抗凝血薬の代謝↑
注意	ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの作用↓	薬物代謝酵素誘導により、ドキシサイクリンの代謝↑血中濃度半減期↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
トリアゾラム	ハルシオン、アサシオン、アスコマーナ、カムリト、トリアゾラム、「EMEC」、トリアラム、ネスゲン、ハルラック、パルレオン、ミンザイン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 麻酔前投薬	<ul style="list-style-type: none"> ・不眠症：1回0.25 mgを就寝前に経口投与する。高度な不眠症には0.5 mgを投与することができる。年齢・症状・疾患などを考慮して適宜増減するが、高齢者には1回0.125 mg～0.25 mgまでとする。 ・麻酔前投薬：手術前夜：1回0.25mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状・疾患などを考慮し、必要に応じ0.5 mgを投与することができる。 	運動失調等の副作用が発現しやすい。	少量から投与を開始すること。	
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 0.89±0.37 hr (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 1.66±0.51 ng/mL (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 3.55±0.95 hr (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 8.82±2.43 ng·hr/mL (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	イトラコナゾール((イトリゾール))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	フルコナゾール((ジフルカン))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	ホスフルコナゾール((プロジフ))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	ポリコナゾール((ブイフェンド))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	ミコナゾール(フロリード)	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	HIV プロテアーゼ阻害剤(インジナビル(クリキシバン)、リトナビル(ノービア)等。)	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	エファビレンツ((ストックリン))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	アルコール	中枢神経抑制作用が増強される。できるだけ飲酒は避けさせること。	相加作用?
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用が増強される。	相加作用?
注意	エリスロマイシン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	クラリスロマイシン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	ジヨサマイシン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	シメチジン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	ジルチアゼム	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	メシル酸イマチニブ	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	キヌプリスチン・(ダルホプリスチン)	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	リファンピシシ	本剤の作用↓	本剤の代謝↑
注意	MAO阻害剤	多汗、起立性低血圧等のがあらわれる	機序不明

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
トリクロホスナトリウム	トリクロロール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症 脳波・心電図検査等における睡眠	1回1～2g(シロップとして10～20mL)を就寝前又は検査前に経口投与する。幼小児は年齢により適宜減量する。患者の年齢及び状態、目的等を考慮して、20～80mg/kg(シロップとして0.2～0.8mL/kg)を標準とし、総量2g(シロップとして20mL)を超えないようにする。		呼吸抑制を起こすおそれがある。また、一般に副作用があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
22.5mg/kg : 22.5mg/kg : 1 hr (n=7, 健康成人(外国人))	22.5mg/kg : 8.2±0.6 µg/mL (n=7, 健康成人(外国人))	22.5mg/kg : 8.2 hr (n=7, 健康成人(外国人)) (T1/2 β)	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	アルコールの作用↑(中枢神経抑制作用↑もある?) やむを得ず投与する場合には減量するなど慎重	アルコール脱水素酵素を競合的に阻害し、アルコールの血中濃度↑
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体, バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑ やむを得ず投与する場合には減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	MAO阻害剤	中枢神経抑制作用↑ やむを得ず投与する場合には減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	クマリン系抗凝血剤(ワルファリン等)	クマリン系抗凝血剤の作用↑ 通常より頻回にプロトロンビン値の測定を行うなど慎重に投与する。	トリクロホスナトリウムの主代謝産物であるトリクロル酢酸が血漿蛋白結合部位からワルファリンを遊離置換し、遊離型ワルファリン濃度を増加させる。

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ゾルピデム	マイスリー	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症 (統合失調症及び躁うつ病に伴う不眠症は除く)	1回5～10mgを就寝直前に経口投与する。高齢者には1回5mgから投与を開始する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、1日10mgを超えないこととする。		運動失調が起こりやすい。また、副作用が発現しやすい。	少量(1回5mg)から投与を開始し、1回10mgを超えないこと。

薬物動態

・健康成人
健康成人6例に酒石酸ゾルピデム錠2.5～10mgを空腹時に単回経口投与したところ、ゾルピデムは速やかに吸収され、投与後0.7～0.9時間に最高血漿中濃度(Cmax)に達した後、消失半減期(t1/2)1.78～2.30時間で速やかに減少した。Cmax及び血漿中濃度-時間曲線下面積(AUC)は投与量に比例して増加した1)。また、健康成人6例に酒石酸ゾルピデム錠10mgを1日1回7日間朝食後に経口投与したところ、血漿中濃度推移は1日目と7日目ではほぼ同じであった。

・高齢患者
高齢患者7例(67～80歳、平均75歳)に酒石酸ゾルピデム錠5mgを就寝直前に経口投与したところ、高齢患者の方が健康成人に比べてCmaxで2.1倍、最高血漿中濃度到達時間(tmax)で1.8倍、AUCで5.1倍、t1/2で2.2倍大きかった。

・肝機能障害患者(外国人データ)
肝硬変患者8例に酒石酸ゾルピデム錠20mgを経口投与したところ、同年齢の健康成人に比べてCmaxは2.0倍、AUCは5.3倍大きかった。

・腎機能障害患者(外国人データ)
慢性腎障害を有する患者16例(Ccr:0～47mL/min)に酒石酸ゾルピデム10mgを20分間静脈内持続注入したところ、健康成人に比べβ相での分布容量(Vdβ)のみ有意に大きかった。また、透析を受けている慢性腎障害患者9例に酒石酸ゾルピデム錠10mgを1日1回13～18日間経口投与したときの血漿中濃度は単回投与時とほぼ同じであり、血中での蓄積は認められなかった。

Tmax	Cmax	T1/2	AUC
2.5 mg : 0.7 ± 0.3 hr 5.0 mg : 0.8 ± 0.3 hr 7.5 mg : 0.9 ± 0.6 hr 10.0 mg : 0.8 ± 0.3 hr (Mean ± SD, n=6, 健康成人)	2.5 mg : 32.6 ± 9.6 ng/mL 5.0 mg : 76.2 ± 29.7 ng/mL 7.5 mg : 102 ± 42 ng/mL 10.0 mg : 120 ± 73 ng/mL (Mean ± SD, n=6, 健康成人)	2.5 mg : 1.78 ± 0.48 hr 5.0 mg : 2.06 ± 1.18 hr 7.5 mg : 1.86 ± 0.47 hr 10.0 mg : 2.30 ± 1.48 hr (Mean ± SD, n=6, 健康成人)	2.5 mg : 96 ± 58 ng·hr/mL 5.0 mg : 259 ± 218 ng·hr/mL 7.5 mg : 330 ± 163 ng·hr/mL 10.0 mg : 491 ± 474 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=6, 健康成人)
20mg : 0.69 ± 0.54 hr (Mean ± SD, n=8, 肝硬変患者) 20mg : 0.72 ± 0.42 hr (Mean ± SD, 健康成人)	肝硬変患者20mg : 499 ± 215 ng/mL (Mean ± SD, n=8, 肝硬変患者) 健康成人20mg : 250 ± 57 ng/mL (Mean ± SD, 健康成人)	20mg : 9.91 ± 7.57 hr (Mean ± SD, n=7, 肝硬変患者) 健康成人20mg : 2.15 ± 0.25 hr (Mean ± SD, 健康成人)	20mg : 4203 ± 3773 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=8, 肝硬変患者) 健康成人20mg : 788 ± 279 ng·hr/mL (Mean ± SD, 健康成人)
透析患者単回投与10mg : 1.7 ± 1.0 hr (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 0.8 ± 0.6 hr (Mean ± SD, n=9, 透析患者)	透析患者単回投与10mg : 172 ± 96 ng/mL (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 203 ± 96 ng/mL (Mean ± SD, n=9, 透析患者)	透析患者単回投与10mg : 2.4 ± 1.3 hr (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 2.5 ± 1.2 hr (Mean ± SD, n=9, 透析患者)	透析患者単回投与10mg : 796 ± 527 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 930 ± 651 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=9, 透析患者)

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	麻酔剤	呼吸抑制 慎重に投与する。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑ 慎重に投与する。	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	精神機能・知覚・運動機能等↓ (中枢神経抑制作用↑)	相加作用
注意	リファンピシン	本剤の作用↓	CYP3A4の誘導により本剤の代謝↑、血中濃度↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ゾピクロン	アモバン、アモバンテス、アントマイリン、スローハイム、ゾピクール、ゾピクロン、ゾピバン、ドバリアル、メトローム	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 麻酔前投薬	不眠症： 1回7.5～10mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状により適宜増減するが、10mgを超えないこと。 麻酔前投薬： 1回7.5～10mgを就寝前または手術前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、10mgを超えないこと。	運動失調が起こりやすい。また、副作用が発現しやすい。	少量(1回3.75mg)から投与を開始すること。	
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
ゾピクール7.5mg : 1.0±0.5 hr ゾピクール10mg : 0.9±0.5 hr (健康成人男子)	ゾピクール7.5mg : 70.4±16.8 ng/mL ゾピクール10mg : 76.6±24.6 ng/mL (健康成人男子)	ゾピクール7.5mg : 4.6±1.3 hr ゾピクール10mg : 5.1±1.0 hr (健康成人男子)	ゾピクール7.5mg : 375.3±79.7 ng・hr/mL ゾピクール10mg : 510.1±114.4 ng・hr/mL (健康成人男子)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	筋弛緩薬((スキサトニウム塩化物水和物、ツボクラリン塩化物塩酸塩水和物、バンクロニウム臭化物))	抗痙攣作用・中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤((フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等))	抗痙攣作用・中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	麻酔時	呼吸抑制 慎重に投与する。	相加作用
注意	CYP3A4を誘導する薬剤(リファンピシン等)	本剤の作用↓	CPY3A4誘導により、本剤の代謝↑
注意	CYP3A4を阻害する薬剤(エリスロマイシン、イトラコナゾール等)	本剤の作用↑	CPY3A4阻害により、本剤の代謝↑