

▼マクスルト錠・▼RPD錠 [内]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】リザトリプタン安息香酸塩 (U) Rizatriptan Benzoate 【分類】5-HT_{1B/1D} 受容体作動型片頭痛治療剤

【単位】▼10mg/錠

【常用量】10mg/回 [最大 20mg/日]

【用法】片頭痛発現時に1回10mg。効果不十分な場合は2hr以上あけて10mg追加投与可能 (1)

【透析患者への投与方法】AUCが44%増加するので禁忌 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【その他の報告】高齢者でもPKの変化は認められない (Musson DG, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 39:447-52, 2001)

【特徴】脂溶性で中枢移行に優れる。偏頭痛治療においてスマトリプタンよりも優れた効果を有するが副作用 (短時間のめまいや眠気) の頻度は高い (Visser WH, et al: Arch Neurol 53:1132-7, 1996)

【主な副作用・毒性】ショック, 心血管系の障害, てんかん, めまい, 倦怠感, 消化器症状など

【吸収】食事の影響を受けない (1) 吸収率は90% (1) RPDでも口腔粘膜からの吸収はほとんどない (1)

【F】45~48% (1) 45% (U)

【tmax】RPD錠 (1.3hr) より普通錠 (1.0hr) の方が早い (1)

【代謝】活性化代謝物 N-脱メチル化体 (未変化体と同程度の活性がある)。肝障害時には未変化体の AUC が30%上昇 (1) MAO-A により不活性化代謝 (U) 活性化代謝物 N-脱メチル化体は血中では未変化体の14%存在 (U) 血中の代謝物は N-脱メチル体, インドール酢酸体, 6-水酸化体およびその硫酸塩体, N-酸化体が認められ, 主要代謝物は MAO-A が触媒する酸化的脱アミノによるインドール酢酸体 (1) CYP2D6 に対して競合阻害する (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率14% [経口] (1) 尿中に N-脱メチル化体として1.3%回収 (1) 尿中回収率82.4%で未変化体として14% [経口, 5日まで] (1) 尿中回収率82%で未変化体として14%, インドール酢酸代謝物として51% (U)

【CL】1062mL/min (1) 【腎 CL】349mL/min : 尿細管分泌される (1)

【t_{1/2}】1.6~1.7hr (1) 2~3hr (U) 腎障害時2.1~2.6hr (1) ke=0.43/hr (1)

【蛋白結合率】約14% (1,U)

【Vd】127L/man (1)

【MW】269.4

【透析性】透析されるが, Vd が大きいため効率的ではないと推測される (5) 不明 (1)

【O/W 係数】0.142 [1-オクタノール/水系, pH7.4] (1) 【TDM のポイント】TDM の対象にならない

【相互作用】エルゴタミン製剤との併用禁忌 (1) プロプラノロール投与後, 錠剤24時間, 徐放製剤48時間以上経過していなければ併用禁忌 [プロプラノロールの代謝には MAO-A が関与するため代謝拮抗する] (1) プロプラノロール以外のβ-blocker との相互作用は認められない [プロプラノロール併用時の投与量は5mgとする] (Goldberg MR, et al: Br J Clin Pharmacol 52: 69-76, 2001) CYP2D6 を競合阻害 (1)

【更新日】20220623

※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。