

◎リバスタッチパッチ・▼イクセロンパッチ [外]

【重要度】 【一般製剤名】 リバスタグミン (U) rivastigmine 【分類】 アルツハイマー型認知症治療剤 [コリンエステラーゼ阻害薬]

【単位】 ◎4.5mg・◎9mg・◎13.5mg・◎18mg/枚

【常用量】 1日1回4.5mgから開始して原則として4週毎に4.5mgずつ増量し維持量18mgまで増量

■消化器症状に認容性があれば、1日1回9mgを開始用量とし、原則として4週後に18mgに増量することもできる

【用法】 24hr毎に貼り替え [背部, 上腕, 胸部の健全な皮膚部位に貼付し貼付部位は毎回変更する]

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【保存期 CKD患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【特徴】 軽症～中等症のアルツハイマー型認知症に用いられる (U) 経口剤よりも血中濃度変動が緩やかで副作用の軽減と効果の持続を図った製剤。末梢よりも比較的選択的に中枢AChEを阻害し、アルツハイマー病患者の脳に認められるAChEのG1型を阻害する (Polinsky RJ, et al: Clin Ther 20:634-47, 1998)

【主な副作用・毒性】 狭心症, 心筋梗塞, 徐脈, 心ブロック, SSS, 脳血管発作, TIA, 痙攣発作, 消化性潰瘍, 肝炎, 失神, 幻覚, せん妄, 錯乱, 不安, 脱水, 適用部位皮膚異常, 下痢, 腹痛, 悪心, 嘔吐など。経皮吸収剤にすることで消化器症状の発現率は低下しているものの, 5%以上の頻度で発現する。自動車の運転等はしない。

【安全性に関する情報】 低体重の患者では悪心, 嘔吐が出現しやすい (1)

【F】 40% [経口剤] (U) 96%以上であるが飽和してFは35% [経口剤] (Polinsky RJ, et al: Clin Ther 20: 634-47, 1998) 60.2% [経口剤6mgと静注2mgのミカエリス・メンテン解析による] (Hossain M, et al: Clin Pharmacokinet 41: 225-34, 2002) はがされたパッチには50%程度が残存しており, 約50%が吸収 (1)

【tmax】 1hr [経口剤] (U) 8～16hr [貼付剤] (1)

【代謝】 エステラーゼで加水分解され, その後硫酸抱合される (1) CYPの寄与はわずか (1) 代謝物の活性は1/10以下 (Polinsky RJ, et al: Clin Ther 20: 634-47, 1998)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 4.3%～7.4% [放出量に対して] (1) 主に代謝物として尿中に回収 (1) 尿中回収率 97% [120hrまで] (U) 硫酸抱合体として40%尿中排泄される (U) 【CL】 1.4L/hr/kg [iv] (1)

【t1/2】 1.4～1.7 [iv] (Hossain M, et al: Clin Pharmacokinet 41: 225-34, 2002) 剥離後 3.3hr (1)

【蛋白結合率】 40% (U) 36～59% (1)

【Vd】 1.8～2.7L/kg (U) BBBを通過する (U) 中枢には投与後1～2hrで移行 (Polinsky RJ, et al: Clin Ther 20: 634-47, 1998) 1.5L/kg (1)

【MW】 250.34

【透析性】 効率的な除去はできないと思われる (5) 持続的に吸収されていること, 剥離後も消失が速いことから透析性は考慮しなくてよいと思われる (5) 資料なし (1)

【O/W係数】 100以上 [1-オクタノール水系] (1) 【中毒】 速やかに除去し, 対症療法を行う。大量過量投与時にはアトロピンが解毒剤となる (1) 低体重患者では血中濃度が高くなる可能性 (Lefevre G, et al: J Clin Pharmacol 49: 430-443, 2009)

【相互作用】 コリンエステラーゼ阻害薬, 抗コリン薬との併用注意 (1) メマンチン併用によるPKへの影響なし (Shua-Haim J, et al: Clin Drug Investig 28: 361-74, 2008)

【主な臨床報告】 パーキンソン病患者の歩行時の安定性を改善 [消化器症状は増加] (Henderson EJ, et al: Lancet Neurol 2016 PMID: 26795874)

【備考】 他のコリンエステラーゼ阻害薬と併用不可 (1) 扱った後は眼に触れず, 手を洗う。皮膚症状があれば保湿剤 (土ステロイド外用剤) で対応。同じ場所に続けて貼らない。切って使えない。4日以上貼付していない期間があれば減量再開を考慮。

ドネパジルからの切り替えであっても初期量から開始 (1)

【更新日】 20220310

※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。