

## ◎ニュープロパッチ [外]

【重要度】 【一般製剤名】ロチゴチン rotigotine 【分類】ドパミン作動性パーキンソン病治療剤/RLS 治療剤

【単位】◎2.25mg・△4.5mg・◎9mg・○13.5mg・○18mg/枚

【常用量】■パーキンソン病：4.5mg/日から開始，1週間毎に4.5mg ずつ増量して，維持量9～36mg/日

■中等度から高度の特発性 RLS：2.25mg/日から開始，1週間以上の間隔で2.25mg ずつ増量し，標準維持量4.5～6.75mg/日

【用法】24hr 毎に貼り替え [貼付時は20～30秒間しっかり押さえ，貼付場所は毎回変更する] [貼付部位は，肩，上腕，肋骨より下の腹部，大腿，臀部，側腹部のいずれか]

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1, Cawello W, et al: Br J Clin Pharmacol 73: 46-54, 2012)

【その他の報告】HD 患者の RLS に有効 (Esteve V, et al: Nefrologia 38: 79-86, 2018 PMID: 29198453)

HD 患者の RLS に有効で減量せずに適用可能 [悪心・嘔吐に注意] (Dauvilliers Y, et al: Am J Kidney Dis 68: 434-43, 2016 PMID: 26851201)

【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】抱合体の血中濃度は腎機能低下により上昇するものの，減量の必要はない (Cawello W, et al: Br J Clin Pharmacol 73: 46-54, 2012)

【特徴】非麦角系のドパミン受容体作動薬で経皮吸収型製剤。ドパミン受容体の間断的刺激により不随意運動が発現するため，経皮吸収によって血中濃度を一定に保つ。経口投与では消化管や肝初回通過効果による影響を受けるが，皮膚からの吸収効率がよく経皮投与に適している。日中の眠気を起こしにくい (太田晃一, 他: 臨床薬理 45: S248, 2014)

【主な副作用・毒性】貼付部位異常，肝機能障害，横紋筋融解症，消化器症状，幻覚，ジスキネジア，傾眠，頭痛，突発的睡眠，めまい，意識障害，起立性低血圧，ドパミン調節障害症候群など多数

【吸収】食事に関係なく貼付できる (1)

【F】36.9% [経皮] (1) 24hr で含有量の46%が吸収 (1) 37% (Cawello W, et al: Drug Metab Dispos 37: 2055-60, 2009)

【tmax】8～16hr (1)

【代謝】肝で硫酸抱合，グルクロン酸抱合，脱アルキル化，水酸化を受ける (1) 硫酸抱合には SULT1A1, SULT1A2, SULT1A3, SULT1E が関与，グルクロン酸抱合には UGT1A9, UGT2B15 が関与，酸化反応には CYP2C19, 1A2 など複数の CYP 分子種が関与 (1) 活性代謝物はあるが存在率はごく低く，未変化体より高い血中濃度になる代謝物の活性は低い (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率1%未満 (Cawello W, et al: Drug Metab Dispos 37: 2055-60, 2009) 尿中回収率30% [24hr 貼付, 96hr まで] (1) 吸収量に対する尿中回収率は65% (1) 尿中回収率71%で未変化体はほとんど検出されない [iv, 216hr まで] (1, Cawello W, et al: Drug Metab Dispos 37: 2055-60, 2009) 脱プロピル体として尿中に8.2%回収 (Cawello W, et al: Clin Drug Investig 34: 95-105, 2014)

【CL/F】8.8～10.6L/hr/kg (1)

【t1/2】剥離後5～6hr (1) 5.3hr (Cawello W, et al: Clin Drug Investig 34: 95-105, 2014)

【蛋白結合率】91.6% (1)

【Vd】81L/kg [経皮] (1)

【MW】315.47

【透析性】透析されない (1)

【OW 係数】3.49 [1-オクタノールリン酸 buffer, pH7.4] (1)

【相互作用】ドパミン拮抗薬：作用の減弱 (1) 抗パーキンソン剤：ジスキネジア，幻覚，錯乱等の副作用の増強の可能性 (1) ドンペリドンとの PK での相互作用を認めない (Braun M, et al: Br J Clin Pharmacol 67: 209-15, 2009)

【主な臨床報告】パーキンソン病患者における嚥下機能改善効果 (Hirano M, et al: Dysphagia 30: 452-6, 2015 PMID: 25966655)

【備考】AED・MRI 使用時には剥がす。切断できない。貼ったまま入浴は可能。胸部に貼付した場合の PK が確認されていないので避ける [しかし，体毛がなければ貼付しても良い可能性あり] (1) 4.5mg はロピニロール2mg，プラミペキソール0.5mg に相当 (1)

【更新日】20200803

※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。