

## △レキップ錠・▼CR錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ロピニロール塩酸塩 (U) Ropinirole Hydrochloride 【分類】ドパミンD2受容体作動薬

【単位】△0.25mg・▼1mg・▼2mg/錠, ▼2mg/CR錠, ▼8mg/CR錠

【常用量】0.25mg/回1日3回から開始し, 1週毎に0.75mgずつ増量し4週目に3mg/日とする。以後必要に応じ1.5mg/日ずつ1週間以上の間隔で増量し維持量3~9mg/日。[最大15mg/日]

【用法】1日3回(食後投与が望ましい)(空腹時では消化器症状が発現しやすい)

【透析患者への投与方法】減量の必要はないが, 安全性データがないため慎重投与(1)

【保存期CKD患者への投与方法】Cr 30mL/minの患者には使用経験がなく安全性が確立していない(1) 【その他の報告】Cr 30~50mL/minでは体内動態に変化は認められない(Chirmis S: Expert Opin Drug Toxicol 4: 655-64, 2008)

【特徴】非麦角系のD2刺激薬。D2, D3, D4受容体に作用し(D3への親和性が最も高い), D1, D5および他の受容体には親和性が極めて低い(1) Restless legs syndromeへの有用性が示されている(Trenkwalder C, et al: J Neurosurg Psychiatry 75:92-97,2004)

【主な副作用・毒性】消化器症状(初期投与時、空腹時投与時に多い)、傾眠、起立性低血圧、心拍数低下、悪性症候群など。前兆のない突発的睡眠及び傾眠等がみられることがあり、自動車の運転、機械の操作、高所作業等危険を伴う作業に従事させないように注意。

【吸収】腸肝循環する(ラット)(1) 食事の影響を受けCmaxが25%低下するがAUCにはほとんど影響しない(1) 初回通過効果を受ける(1) CR錠は、腸切除の既往や人工肛門造設、下痢等の影響などで薬剤の消化管内滞留時間が短くなった場合、効果が十分に得られない恐れがある(1)

【F】50%以上(1) 55%(U) (Chirmis S: Expert Opin Drug Toxicol 4:655-664,2008) 初回通過効果を受け約50% (Kaye CM, et al: Clin Pharmacokinetics 2000 PMID: 11069211)

【tmax】1.6±0.5hr(1) 1.5hr(1,U) 食事により2.5hr(U)

【代謝】主にCYP1A2により代謝。初回通過効果が大きい(1) 主としてCYP1A2によりN-脱プロピル化および水酸化されて不活性代謝物に変換(U)

【排泄】主として腎排泄される(1) 尿中回収率88%以上で未変化体として10%未満(U) 尿中未変化体排泄率10%未満(Chirmis S: Expert Opin Drug Toxicol 4: 655-64,2008) 代謝物として40%が尿中に回収(1)

【CL/F】2669.8±1649.6mL/min(1) 65歳以上の高齢者では全身CLが30%低下する(Chirmis S: Expert Opin Drug Toxicol 4: 655-64, 2008)

【t1/2】約5hr(1) 約6hr(U)

【蛋白結合率】35~42%(1) 40%(U)

【Vd/F】1064.3±563.6L/man(1) 7.5L/kg(U)

【MW】260.38(本体)

【透析性】Vdが大きいため効率的ではないと思われる(5) 資料なし(1)

【OW係数】0.266 [1-オクタノール水系, pH7.4](1)

【相互作用】禁煙によりCYP1A2の誘導が抑制され、夜間の発汗や覚醒を来した症例がある(Juergens TM: J Clin Sleep Med 4:371-372,2008) ワルファリンの作用を増強する可能性がある(Bair JD, Oppelt TF: Ann Pharmacother 35:1202-1204, 2001) CYP1A2阻害作用をするシプロフロキサシン併用ではロピニロールのAUCが84%上昇(Kvermo T et al: Clin Ther 28:1065-1078, 2006)

【備考】普通錠は粉砕可能(1) 本剤9mgはレボドパ100mgに相当(村田美穂: Medical Practice 26: 2071-6, 2009)

【更新日】20230410

※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。