○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歇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高く経皮投与に適している．
【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．
【安全性に関する情報】日中の眠気を起こしにくい（太田晃一，他: 臨床薬理 45: S248, 2014）
【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）吸収量に対しての尿中回収率は 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 PMID: 24178238）
【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）
【O/W 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 2015 PMID: 25966655）
早期の運動機能障害を有するパーキンソン病患者における運動機能および夜間睡眠障害の改善に効果を認めた［RECOVER］（Trenkwalder C, et al: Mov Disord 2011PMID: 21322021）
パーキンソン病患者の運動症状，睡眠障害，日中の眠気を改善することで，認知機能を改善する可能性（Suzuki K, et al: Clin Neuropharmacol 2022 PMID: 35579485）
【備考】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】20230501

※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。