

## ◎レペタン坐剤 [外], ○レペタン注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 プブレノルフィン塩酸塩 (U) buprenorphine hydrochloride 【分類】 鎮痛剤

【単位】 ◎0.2mg・○0.4mg/個 ○0.2mg/A [1mL]

【常用量】 ■注射：1回0.2～0.3mg

■坐薬：1回0.2～0.4mg

【用法】 ■注射：必要に応じて6～8時間おきに筋注もしくは静注（筋注後5～10分で静注10分後の血漿濃度と同等になる）

■坐薬：術後疼痛に1回0.4mg、各種癌性疼痛に1回0.2又は0.4mgを直腸内投与。必要に応じて約8～12hr毎に投与

■レペタン坐薬から経口モルヒネへの転換はレペタン坐薬1日投与量×60～80倍の経口モルヒネ1日量とする。ただしレペタン坐薬で効果不十分な場合には×100倍の経口モルヒネ量を投与する (1)

【透析患者への投与方法】腎障害者では半減期は変わらない。活性代謝物ノルブプレノルフィンが健常者の4倍上昇するため作用が延長するが、活性が1/40と低いいため通常用量と同じでよいと思われる (Br J Anaesthesia 64: 276-82,1990)

【その他の報告】通常用量と同じ (腎と透析 42:411-413,1997)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】鎮痛効果が強く、持続時間が長い。多幸感があり、呼吸抑制が強く、悪心が強い。1回投与量が2～4mgで有効限界 (ceiling effect) に達する。注射剤は鎮痛効果持続時間が長く、依存性は同種鎮痛薬に比し弱い。循環動態への影響は軽微。ベンタジンに比し呼吸抑制、悪心・嘔吐は強く、依存性は弱く幻覚性はほとんどない。

【主な副作用・毒性】呼吸抑制が強い、悪心・嘔吐、低血圧、徐脈、発汗、舌根沈下、せん妄、幻覚、依存性は少ないが多幸感あり

【F】坐薬55% (14)

【tmax】5min [im] (13) 約1～2hr [坐] (1) 【Cmax】0.3mg筋注後3.6ng/mL (13)

【代謝】肝 (U) CYP3A4 によって N-脱アルキル化され代謝 (9) 初回通過効果を受けてほとんど消失するため経口剤としては用いられない。グルクロン酸抱合体と脱アルキル体になる。代謝物のノルブプレノルフィンは親化合物の1/40以下の活性がある (Clin Pharmacokinet 31: 410-22,1996) 腎障害患者では活性代謝物ノルブプレノルフィン血漿濃度は健常者の4倍上昇し、グルクロン酸抱合体は健常者の15倍に上昇 (Hand CW, et al: Br J Anaesthesia 64: 276-82,1990)

【排泄】尿中未変化体排泄率15% (14) 無視できる (13) 肝で代謝され、抱合体が胆汁排泄され、腸肝循環する。胆汁、糞中排泄は68 [50～71] %、筋注後、最大27%が抱合体及び脱アルキル体として尿中排泄 (U)

【CL】腎機能正常者651mL/min、透析988mL/minであるが有意差なし (Hand CW, et al: Br J Anaesthesia 64: 276-82, 1990) 70L/hr (10) 13.3mL/min/kg (13)

【非腎CL/総CL】100% (10)

【t1/2】t1/2α: 2min, 再分布t1/2: 18min, t1/2β: 平均2～3 [1.2～7.2] hr (U) 2.5hr (10) 4～6hr (11) 3hr (14) 2.33hr (13) 【透析患者のt1/2】短縮するものの有意差なし [正常398min, 透析239min] (Hand CW, et al: Br J Anaesthesia 64: 276-82, 1990)

【蛋白結合率】約96% [主にα, βグロブリン分画と結合] (U,13)

【Vd】腎機能正常者313L/man、透析201L/manであるが有意差なし (Hand CW, et al: Br J Anaesthesia 64: 276-82, 1990) 2L/kg (10) 2.5L/kg (11) 2.7L/kg (14) 1.44L/kg (13)

【MW】504.10

【透析性】蛋白結合率が高くVdも大きいので、透析で除去されにくいと思われる (5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない。有効治療域1～125μg/mL (14)

【相互作用】CYP3A4阻害剤・誘導剤との併用注意 (1)

【効果発現時間】注射：鎮痛作用：15min (筋注)、静注ではもっと速い。呼吸抑制：1～3hr 【最大効果発現時間】注射：鎮痛作用：1hr (筋注)、静注ではもっと速い

【効果持続時間】注射：筋注ではほとんどの症例で6hr以内だが、中には10hr以上になる症例もある。硬膜外では1.5A投与で12hr、3/4A投与で6hr (濃度依存性に作用時間が延長する)

【備考】呼吸抑制は軽度だがベンゾジアゼピン系鎮静剤と併用すると、その相乗作用が問題となる。高用量のレペタンはモルヒネに拮抗することがあるので併用を避けることとなっているが、8mg皮下注でモルヒネと拮抗したという報告を引用しており、実際に使用している用量ではモルヒネに拮抗することはあり得ない (柳田知司: レペタン坐薬シンポジウム, 1990)

【更新日】20151207

※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・写真などの無断複製・転載を禁じます。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。