

◎ワゴスチグミン注 [注], ▼ワゴスチグミン散 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】ネオスチグミンメチル硫酸塩 (U) Neostigmine Methylsulfate 【分類】副交感神経興奮剤

【単位】◎0.5mg/A [1mL], ▼0.5%散

【常用量】■注射：1回 0.25～0.5mg ■経口：1回 5～30mg

Ogilvie 症候群に 0.25mg を 1 日 4 回皮下注にて中央値 5 回投与が試みられ最初の腸管運動まで 29 時間かかり、徐脈、心ブロックに注意 (Kram B, et al: Ann Pharmacother 2018 PMID: 29359574)

【用法】■注射：1 日 1～3 回筋注、皮下注 (静注は血中濃度の急上昇による心停止等の報告が多いため禁忌) ■経口：1 日 1～3 回

【透析患者への投与方法】1/3 に減量するか投与間隔を 3 倍に延長する (5)

【その他の報告】25%に減量 (17) 25%に減量するという総説 (3) があるが、ベクロリウムのリバースには正常腎機能者と同じ量、同じ投与間隔で使用できるという報告もある (Dhonner G, et al: Anesth Analg 1996 PMID: 8712389) 投与間隔を 6～8hr に延長 [米国での通常投与間隔は 1～2hr とき] (4,10)

【PD】PD 患者への腹腔内投与は下痢、腹部痙攣、嘔気・嘔吐などの副作用を引き起こすが、腹膜を介しての物質移動には変化がない (Hasbargen JA, et al: Kidney Int 1992 PMID: 1474771) 25%に減量 (17)

【CRRT】50%に減量 (17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】GFR > 50mL/min : 2/3～100%, GFR 10～50mL/min : 50%に減量、GFR < 10mL/min : 25%に減量 (12,17)

【その他の報告】Ccr > 50mL/min : 常用量を 2hr とき、Ccr 10～50mL/min : 常用量を 2hr とき、Ccr < 10mL/min : 常用量を 6～8hr とき (10)

GFR 10～50mL/min : 50%に減量、GFR < 10mL/min : 25%に減量 (3)

【特徴】骨格筋に対しては直接的な筋刺激作用、消化管に対しては運動を亢進し酸分泌を高める。泌尿器に対しては尿路の平滑筋を刺激する。

【主な副作用・毒性】コリン作動性クリーゼ、血圧下落、頻脈、気管支痙攣、喘息発作、腹痛、下痢、めまい、締瞼、過敏症など

【F】1～2% [po] (U) 経口投与量の方が注射薬投与量よりも大量を必要とすることから F は低いと考えられる。鼻腔内投与の方が経口投与よりも吸収はよい (13)

【tmax】0.5hr (U)

【代謝】コリンエステラーゼにより加水分解され、水酸化及びグルクロン酸抱合される (1) 代謝物の 3-hydroxyphenyltrimethylammonium には活性がある (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 75% (10) 67% (12,13) 50% (1,U) 5%未満 [po, 24hr まで] (1) 尿中回収率 82% [24hr まで] (1) 尿中に活性代謝物 3-hydroxyphenyltrimethylammonium 15%, そのグルクロン酸抱合体 0.7% が排泄 (1)

【CL】0.24～1.0L/hr/kg (U) 467mL/min (10) 16.7mL/min/kg、腎障害で低下 (13) 【非腎 CL/総 CL】45% (10)

【t1/2】筋注：α 相 3.6min β 相 77.4min, 静注：α 相 5.4min, β 相 : 24～79min (U) 0.5～2hr (2) 1.3hr, 腎障害で延長 (10,12,13) 【透析患者の t1/2】延長 (活性代謝物が蓄積) 3.0hr (12)

【蛋白結合率】15～25% (1,U)

【Vd】0.7L/kg (10) 0.74 [0.37～1.08] L/kg (U) 1.4L/kg (13) 0.5～1.0L/kg (12)

【MW】334.4

【透析性】除去されると思われる (5)

【TDM のポイント】有効治療域 50～100ng/mL (16) 【O/W 係数】低い (11) 【pKa】12.0 (1)

【相互作用】コリン作動薬：作用増強 (1) 副交感神経抑制剤：コリン作動性クリーゼの初期症状を不顕性化し、本剤の過剰投与を招くおそれがあるので、副交感神経抑制剤の常用には避ける (1)

【主な臨床報告】AKI 患者の術後偽性結腸閉塞の治療に有効であった症例 (Pyo JH, et al: Korean J Gastroenterol 67: 103-6, 2016 PMID: 26907487)

急性の大腸偽閉塞に関する静注と点滴投与の比較では、臨床効果に差はないが、腸管径の収縮度や減圧の必要性に特性がありそう (Smedley LW, et al: J Intensive Care Med 2020 PMID: 30373445)

【効果発現時間】筋注 20～30min (U) 【最大効果発現時間】30min (U)

【効果持続時間】2～4hr (U)

【更新日】20250602

※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、適切性についての責任も負わず、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損害について、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ーネットフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断複数・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。