

◎ウブレチド錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】ジスチグミン臭化物 Distigmine Bromide 【分類】重症筋無力症・排尿障害治療剤

【単位】◎5mg/錠

【常用量】■排尿障害 5mg/日 ■重症筋無力症 5~20mg/日

【用法】分1~4

【透析患者への投与方法】尿中未変化体排泄率が高いため2.5mg/日に減量 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr>50mL/min : 減量の必要なし, Ccr 50mL/min 以下 : 2.5~5mg/日 (5)

【特徴】抗コリンエステラーゼ剤。排尿筋の緊張を高め、手術後、神経因性膀胱などの低緊張性膀胱による排尿困難を改善。その他抗クラール作用、胃運動亢進作用、縮瞳作用がある。他のコリンエステラーゼ阻害薬に比べてアセチルコリンエステラーゼからの解離が40~120倍遅いため、効果が持続しやすい (Obara K, et al: Biol Pharm Bull 2017 PMID: 28966245)

【主な副作用・毒性】コリン作動性クリーゼ (投与開始2週間以内に発現しやすい)、狭心症、不整脈、下痢、血清コリンエステラーゼ値低下、腹痛、悪心、不快感、嘔気・嘔吐、尿失禁、発汗、胃腸症状、めまい、頭痛など。

【安全性に関する情報】おそらく腎障害はコリン作動性クリーゼの危険因子である (5)

【モニターすべき項目】コリン作動性クリーゼ：投与後2週間以内に発現しやすく、10mg/日以上で多くなる傾向にある。初期症状は、徐脈、腹痛、下痢、発汗、唾液分泌過多、縮瞳、呼吸困難、血清ChE値低下、線維束れん縮など。ただし、血清ChE値だけで副作用は予測できないとされるが、AChE (G4)、ブチリルChEが指標となる報告もある (古賀聖名子, 他: 日本神経精神薬理学雑誌 17:143-1997)

【吸収】吸収されにくい、空腹時に服用すると2~5倍吸収率が上昇する (11) 普段食後に服用している患者が空腹時に服用した場合に血中濃度が通常より高くなることがあるので注意 (1)

【F】4級アミンで水溶性が高いため4.65%と低い (Vree TB, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 1999 PMID: 10475142) 2.2% (Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 31: 230-5,1993)

【tmax】1.58hr (1) 【Cmax】5mg投与時4.40ng/mL (1)

【代謝】血漿エステラーゼによって加水分解される。代謝物および親化合物は尿中に排泄される (11)

【排泄】尿中未変化体排泄率85.3%、糞中には4%排泄される (1, Vree TB, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 1999 PMID: 10475142) 主に腎;尿中排泄率85.3% [iv] 経口投与量の88%は吸収されずに糞中に排泄される (1)

【CL】1.08±0.30 L/hr (1) 全身CL 1.5L/hr, 腎CL 24.8mL/min (Vree TB, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 1999 PMID: 10475142)

【t1/2】α相: 4.47hr, β相: 69.5hr (1, Vree TB, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 1999 PMID: 10475142) 二相性に消失し薬理作用が消失するまでには1週間程度かかる (1)

【蛋白結合率】15% (1)

【分布】細胞膜透過速度が遅いため、大量投与しない限り血液脳関門は通過しない (11)

【Vd】45.9L/body (Vree TB, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 1999 PMID: 10475142) Vss=99L (1)

【MW】576.32

【透析性】データなし (1) おそらくある程度は除去される (5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない【O/W係数】低い (11)

【相互作用】抗コリン剤と拮抗、他のコリンエステラーゼ阻害剤の作用増強 (1)

【効果発現時間】重症筋無力症の四肢挙上時間およびChEを指標としたとき1時間 (1)

【効果持続時間】重症筋無力症の四肢挙上時間およびChEを指標としたとき72時間 (1)

【更新日】20230904

※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。