

▼コレアジン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 テトラベナジン tetrabenzazine 【分類】 非律動性不随意運動治療薬

【単位】 ▼12.5mg/錠

【常用量】 1日1回12.5mgから開始、症状を観察しながら1週毎に12.5mg/日 [最大100mg/日, 最大1回量37.5mg] ■抑うつ症状、アカシジア及びパーキンソニズム等の発現について観察を十分に行い、忍容性をみながら慎重に増量■CYP2D6のPMでは活性代謝物濃度の上昇により副作用が発現しやすい]

【用法】 12.5mg/日は分1, 25mg/日は分2, 37.5mg/日以上は分3

【透析患者への投与方法】 重篤な腎機能障害のある患者には排泄が遅延するおそれがあるため慎重投与 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 重篤な腎機能障害のある患者には排泄が遅延するおそれがあるため慎重投与 (1) 腎障害時のPKは検討されていない (1)

【特徴】 中枢神経系におけるモノアミン小胞トランスポーター2 (VMAT2) の特異的阻害剤で、モノアミン (ドパミン、ノルアドレナリン、セロトニン等) のシナプス前小胞への取り込みを阻害することにより、神経終末のモノアミンを溜渇させ、ハンチントン病に伴う舞踏運動の改善に適用される。

【主な副作用・毒性】 傾眠、パーキンソニズム、アカシジア、不眠、頭痛、便秘、下痢、口渇、CK上昇など。過量投与により急性ジストニー、眼球回転発作、悪心・嘔吐、発汗、鎮静、低血圧、錯乱、下痢、幻覚、発赤及び振戦が報告されている (1)

【吸収】 尿中回収率より75%以上 (1)

【F】 FPEを受け未変化体のFは5%程度と低いが、水酸化体としては約80% (Roberts MS, et al: Eur J Clin Pharmacol 29: 703-8, 1986 PMID: 3709613) 未変化体は平均6% (Mehvar R, et al: Drug Metab Dispos 15: 250-5, 1987 PMID: 2882986)

【tmax】 未変化体0.6~0.7hr, α -HTBZ0.8~1.3hr, β -HTBZ1.1~1.3hr, 9-デスマチル β -HTBZ1.3~1.7hr (1)

【代謝】 主に肝臓で速やかに活性代謝物である α -HTBZ, β -HTBZに代謝され、その後9-デスマチル α -HTBZ, 10-デスマチル α -HTBZ, 9-デスマチル β -HTBZ, 10-デスマチル β -HTBZへ代謝されると推定 (1) α 体, β 体への変換はカルボニル還元酵素, デスマチル体への変換はCYP2D6, 1A2が関与 (1) 一部はCYP3A4も関与し, 第2相反応として硫酸結合やグルクロン酸結合も関与する (1) 臨床効果はCYP2D6の多型の影響を受けない (Mehanna R, et al: Mov Disord 28: 210-5, 2013 PMID: 23280482)

【排泄】 尿中未変化体排泄率0%, 尿中回収率75.4% [216hrまで] (1) 尿中に α 体として0.6~1.1%, β 体として0.3~0.7%, 9-デスマチル体として1.8~2.1%排泄 [po, 24hrまで] (1) β 体はP-gpの基質 (1) 尿中に未変化体は検出されない (Mehvar R, et al: Drug Metab Dispos 15: 250-5, 1987 PMID: 2882986)

【CL】 全身クリアランス肝血流量と同程度 [ラット] (Mehvar R, et al: Drug Metab Dispos 15: 250-5, 1987 PMID: 2882986)

【腎CL】 α 体1.05~1.37L/hr, β 体1.44~2.04L/hr (1) 9-デスマチル体2.5L/hr (1)

【t1/2】 未変化体0.7hr, α 体5hr, β 体4hr, 9-デスマチル体10~12hr (1)

【蛋白結合率】 TBZ 82~85%, α -HTBZ: 60~68%, β -HTBZ: 59~63% (1)

【Vd】 資料なし (1)

【MW】 317.42

【透析性】 資料なし (1)

【O/W係数】 3.187 [条件不明] (1)

【相互作用】 MAO阻害剤, レセルピンとの併用禁忌 (1) CYP2D6阻害剤との併用注意 (1)

【更新日】 20160109

※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。