

▼アジレクト錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ラサギリンメシル酸塩 Rasagiline Mesilate 【分類】パーキンソン病治療剤 [選択的MAO-B阻害剤]

【単位】▼0.5mg・▼1mg/錠

【常用量】1mg/日

■肝障害、低体重、高齢者などは低用量も考慮

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】常用量(1)

【保存期CKD患者への投与方法】常用量(1)

【特徴】選択的MAO-B阻害剤。線条体における細胞外ドパミン濃度を増加させる。

【主な副作用・毒性】起立性低血圧、特発性睡眠、傾眠、衝動制御障害、幻覚、横紋筋融解症、悪性症候群、ジスキネジア、頭痛、めまい、消化器症状、狭心症、鼻炎、アレルギー等

【安全性に関する情報】過量投与でMAO-A阻害作用が出現する可能性(1) 特異的解毒剤なし(1) QT延長および心拍数や血圧変化に関与しない(Mendzelevski B, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2014 PMID: 24447649)

【吸収】空腹時投与に比べ、食後投与でAUC22%低下(1)

【F】約35%(1)

【tmax】0.5hr(1)

【代謝】CYP1A2で代謝(1)喫煙の影響が一貫していない(Bilal R, et al: Pak J Med Sci 2022 PMID: 35480532) PKの個人差は代謝酵素ではなくトランスポータ変異の影響が大きい(Zubiaur P, et al: Pharmaceutics 2022 PMID: 36297437)

【排泄】中に未変化体としてほとんど排泄されない(1)未変化体の抱合体や代謝物の抱合体として尿中に排泄(1)P-gp, BCRPの基質ではない(1)

【CL/F】98.8L/hr (Elgart A, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2019 PMID: 30218626)

【t1/2】1.8hr(1)反復投与時5.85hr (Elgart A, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2019 PMID: 30218626)

【蛋白結合率】90%程度(1)

【Vd】86.7±39.0L/body(1) Vss/F 762L/body (Elgart A, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2019 PMID: 30218626)

【MW】267.34

【透析性】除去されにくいと思われる(5)

【O/W係数】

【相互作用】併用禁忌薬多数あり(1)フルボキサミン使用時には切り替え間隔をあける規定あり(1)セロトニン症候群に関する注意(1)

【主な臨床報告】レボドパ製剤使用時のwearing-offを改善し、エンタカポンの代替となるかもしれない(Muller T: Expert Opin Drug Metab Toxicol 2014 PMID: 25196265)

【更新日】20240723

※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。