▼コムタン錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】エンタカポン（U）　Entacapone　【分類】パーキンソン病用剤［末梢 COMT 阻害剤］
【単位】▼100mg/錠
【常用量】100mg/回［最大 200mg/回，1600mg/日］
【用法】レボドパと併用し１日８回を超えない回数で分割投与
半減期が短いのたレボドパ配合剤と同時服用
【透析患者への投与方法】減量の必要なし［腎機能によって体内動態は変化しない］（1）
【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし［腎機能によって体内動態は変化しない］（1）
【特徴】進行性パーキンソン病のレボドパ療法における症状の日内変動（wearing-off 現象）の改善を目的とした末梢カテコール-O-メチルトランスフェラーゼの可逆的阻害剤［レボドパの分解を抑制し，血中での作用時間を長くする］．レボドパは末梢性ドパ脱炭酸酵素以外にも COMT による水酸基のメチル化も受けており、レボドパの代謝を阻害することで脳内への移行性を向上させ、作用発現時間を延長させる（1）レボドパの AUC を 35%増加させ、消失半減期を 1.3hr から 2.4hr に延長させるが、Tmax や Cmax には影響しない（U）
【主な副作用･毒性】ジスキネジー、便秘、着色尿、幻覚、悪心、便秘、不眠など
【F】約 35%（1,U）初回通過効果を受ける（1）肝障害患者で 55.5%（1）30～46%（Keranen T, et al: Eur J Clin Pharmacol 46:151-157, 1994）
【tmax】1.1～1.3hr（1）約 1hr（U）0.4～0.9hr（Keranen T, et al: Eur J Clin Pharmacol 46:151-157, 1994）【Cmax】200mg 投与時 1.2μg/mL（U）
【代謝】Z 体へ異性化されるがその寄与は 3～8%（1）未変化体および Z 体はグルクロン酸抱合を受ける（1）CYP は関与しない（1）異性化されその後グルクロン酸抱合される．グルクロン酸抱合体には活性がない（U）肝障害患者では Cmax，AUC が 2 倍高値（1）各種 CYP を阻害するが、臨床用量以上の濃度（U）
【排泄】尿中未変化体排泄率 0.2%未満（1,U）尿中回収率 10%（U）未変化体のグルクロン酸抱合体：4.6～7.2%、Z 体のグルクロン酸抱合体：1.5～2.1%が尿中排泄（1）尿中回収物の主体はグルクロン酸抱合体（Wikberg T, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 18: 359-67, 1993）静注時の尿中回収率 38.1±7.2%［48hr まで］（Heikkinen H, et al: Eur J Clin Pharmacol 56: 821-6, 2001）【CL】864mL/min（1）11.7±1.9mL/min/kg（Heikkinen H, et al: Eur J Clin Pharmacol 56: 821-6, 2001）
【t1/2】0.75～0.85hr（1）β相 0.4～0.7hr、γ相 2.4hr（U）α相 0.27-0.37hr，β相 1.59-3.44hr（Keranen T, et al: Eur J Clin Pharmacol 46:151-7, 1994）【ke】1.14～1.16/hr（1）
【蛋白結合率】98%［Alb］（1,U）
【Vd】19.9L/man（1）20L/man で組織移行性は低い（U）
【MW】305.29
【透析性】蛋白結合率が高いため透析されない（5,U）
【O/W 係数】logP：-0.22～-0.26［1-オクタノール/リン酸 buffer，pH7.4］（1）【薬物動態】線形動態（Keranen T, et al: Eur J Clin Pharmacol 46:151-7, 1994）
【相互作用】CYP2C9 を阻害する［vitro］（1）COMT により代謝されるカテコールアミンとの併用注意。MAO-B 阻害剤（セレギリン）：血圧上昇のおそれ．ワルファリンの作用増強［PT-INR13%上昇、R-体の AUC 増加による］（Dingemanse J, et al: Br J Clin Pharmacol 53: 485-91, 2002）　鉄剤：消化管内でキレートを形成し鉄剤の作用が減弱（1）
【備考】投与回数が多くなると L-ドパ濃度が上昇してジスキネジアを発現することがあり，この場合は投与間隔をあけるか，ジスキネジアを出現する時間帯の直前のエンタカポン投与をスキップする．
【更新日】20230830

※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。