

## ▼ノウリアスト錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 イストラデフィリン Istradefylline 【分類】 パーキンソン病治療薬 [アデノシン A2A 受容体拮抗薬]

【単位】 ▼20mg/錠

【常用量】 20mg/日 [最大 40mg/日] ■CYP3A を強く阻害する薬剤併用時には最大 20mg/日 (1)

【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】 アデノシン A (2A) 受容体拮抗薬で、レボドパ含有製剤の投与量及び投与回数調節を行ってもウェアリングオフ現象が認められる患者に対して使用される。淡蒼球外節における中型有棘神経細胞からの GABA 遊離を抑制し、大脳基底核回路のバランスを整えて運動症状を改善。

【主な副作用・毒性】 精神障害 (幻視, 幻覚, 妄想, せん妄, 不安, 幻聴, 激越など), 心室性期外収縮, 心房細動, 便秘, 悪心, 胃炎, 腹部膨満, 嘔気, 肝機能異常, 末梢性浮腫, 気管支炎, 体重減少, 傾眠, 振戦, 不眠など

【安全性に関する情報】 悪心は用量依存的に発現 (Knebel W, et al: J Clin Pharmacol 52: 1468-81, 2012) 過量投与による急性症状としてジスキネジー, 幻覚が予想 (1)

【吸収】  $ka=0.464/hr$  (Knebel W, et al: J Clin Pharmacol 51: 40-52, 2011)  $ka=0.254/hr$  (1) 90%以上が吸収される (1)

【F】 34.3% [ラット], 30.5% [イヌ] (1)

【 $t_{max}$ ] 2~3hr (1)

【代謝】主に CYP1A1, 3A4/5 が関与 (1) AUC は CYP3A4 阻害剤併用時に平均 35%上昇し, 喫煙者で平均 38%低下する (Knebel W, et al: J Clin Pharmacol 2011 PMID: 20200269)

【排泄】尿中に未変化体は排泄されない (1) 尿中回収率 39% (1)

【CL/F】 5.5L/hr (1) 5.76L/hr (Knebel W, et al: J Clin Pharmacol 2011 PMID: 20200269)

【 $t_{1/2}$ ] 55~75hr (1)  $ke=0.0141/hr$  (1)

【蛋白結合率】 95~97% [Alb] (1)

【Vd/F】 450L/man (1)  $V_c=198L/man$ ,  $V_t=307L/man$  (Knebel W, et al: J Clin Pharmacol 2011 PMID: 20200269)

【MW】 384.43

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【OW 係数】  $LogP=3.5$  [1-オクタノール/水系] (1) 【薬物動態】 2-コンパートメントモデルに適合 (Knebel W, et al: J Clin Pharmacol 51: 40-52, 2011)

【相互作用】 CYP3A, P-gp を阻害する (1) アトルバスタチン, ジゴキシンなどの血中濃度上昇 (1) アトバスタチン血中濃度上昇機序は P-gp 阻害による (Rao N, et al: J Clin Pharmacol 48: 1092-8, 2008) リファンピシム併用により経ロクリアランスが 5 倍に上昇 (Mukai M, et al: J Clin Pharmacol 2018 PMID: 28881378)

【更新日】 20231130

※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。