▼オンジェンティス錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】オピカポン　Opicapone　【分類】パーキンソン病治療薬［末梢 COMT 阻害剤］
【単位】▼25mg/錠
【常用量】■25mg/日，1日1回■レボドパ配合剤と併用（同時服用ではない）
【用法】1日1回，レボドパ配合剤の投与前後および食事の前後1時間以上あけて内服
※半減期が長く1日1回でよいが，服用タイミング注意
【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）PK は腎機能低下の影響を受けない（Svetel M, et al: Expert Opin Drug Metab Toxicol 2018 PMID: 29345156）
【特徴】レボドパ配合錠との併用によるパーキンソン病における症状の日内変更（wearing-off 現象）の改善に用いる末梢長時間作用型 COMT 阻害剤．血中のレボドパの 3-O-メチルドパ（3-OMD）への代謝を持続的に阻害し，3-OMD 濃度が低下して BBB の LAT の共基質であるレボドパの脳内移行を向上．レボドパカルビドパおよびレボドパベンセラジドの AUC を増大させる（Rocha JF, et al: Br J Clin Pharmacol 2017 PMID: 27763682）

【主な副作用・毒性】ジスキネジア，幻覚，傾眠，突発性睡眠，めまい，不眠，便秘など多数
【安全性に関する情報 QT 延長には関与しない（Pinto R, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2015 PMID: 27137718）
【吸収】食後投与で吸収が低下（AUC 比で 57%に低下）（1）高脂肪食で吸収低下（Almeida L, et al: Clin Pharmacokinet 2013 PMID: 23248072）
【F】不明（1）
【tmax】2hr（1）
【代謝】肝代謝にてグルクロン酸抱合，硫酸抱合，還元，メチル化などを受ける（1）硫酸抱合がメインの代謝経路（Almeida L, et al: Clin Pharmacokinet 2013 PMID: 23248072）ニトロカテコール部分の O-グルクロン酸抱合，硫酸化，メチル化が主な代謝経路［ラット］（Loureiro AI, et al: Pharmacol Res Perspect 2022 PMID: 34939338）
【排泄】尿中回収率 5.3%［po，504hr まで］（1）OATP1B3 ，BCRP，P gp の基質（1）未変化体と硫酸抱合体は胆汁中に排泄（Almeida L, et al: Clin Pharmacokinet 2013 PMID: 23248072）尿中回収率 3%未満（Rocha JF, et al: Br J Clin Pharmacol 2013 PMID: 23336248）
尿中回収率 5%で，糞便中排泄が 70%と主経路（Loureiro AI, et al: Br J Clin Pharmacol 2022 PMID: 35508762）
【t1/2】0.7～1.4hr（1）血中 0.8～3.2hr，赤血球 COMT 阻害能として 61.6hr（Almeida L, et al: Clin Pharmacokinet 2013 PMID: 23248072）赤血球 COMT 阻害能として 100hr 超（Rocha JF, et al: Br J Clin Pharmacol 2013 PMID: 23336248）
【蛋白結合率】99.9%（1）
【Vd/F】14.5L/man（1）
【MW】413.17
【透析性】資料なし（1）除去されないと思われる（5）
【薬物動態】線形（Almeida L, et al: Clin Pharmacokinet 2013 PMID: 23248072）
【O/W 係数】
【相互作用】鉄剤とキレート形成（1）
【肝障害時の情報】初回通過効果が低下して AUC が増大する可能性（Rocha JF, et al: Eur J Clin Pharmacol 2014 PMID: 24271646）
【主な臨床報告】50mg にてプラセボより有意に，エンタカポンより非劣勢に off 時間を減らす（St Onge E, et al: Ann Pharmacother 2020 PMID: 33233916）
PK/PD に人種差はないと思われる（Falcao A, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2016 PMID: 27138028）
日本人において 25mg 以上ではレボドパ AUC の増大は頭打ち傾向（Nomoto M, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2020 PMID: 32416054）
1日1回投与で併用されたレボドパ（カルビドパ）血中濃度の日内変動を小さくする（LeWitt P, et al: Clin Neuropharmacol 2023 PMID: 36688497）
1日1回併用によりレボドパの半減期が延長してトラフが上昇し，オン時間の延長とオフ時間の短縮が確認（Ferreira JJ, et al: Mov Disord 2022 PMID: 36054562）
【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、適切性については何なる責任も負わず、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。