

▼オンジエンティス錠 [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】 レボドパ配合剤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 Pharmacokinetics 2013 PMID: 23248072)

【E】 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 Pharmacokinetics 2013 PMID: 23248072)

【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 Pharmacokinetics 2013 PMID: 23248072) 尿中回収率 3%未満 (Rocha JF, et al: Br J Clin Pharmacol 2013 PMID: 23336248)

【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 Pharmacokinetics 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 Pharmacokinetics 2013 PMID: 23248072)

【OW 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的に 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)

【更新日】 20231129

※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。