

▼インチュニブ錠 [内]

【重要度】

【一般製剤名】グアンファシン塩酸塩 Guanfacine Hydrochloride

【分類】注意欠陥／多動性障害治療剤 [選択的α2A アドレナリン受容体作動薬]

【単位】▼1mg・▼3mg/錠

【常用量】■18歳以上：2mg/日より開始，1週間以上の間隔をあけて1mgずつ，1日4～6mgの維持用量まで増量 [最大6mg/日]

【用法】1日1回（徐放錠）

【透析患者への投与方法】血中濃度上昇のおそれ（1）少量（1mg）から開始（5）

【保存期CKD患者への投与方法】血中濃度上昇のおそれ（1）高度腎障害時にCLが70%に低下（1, Kirch W, et al: Br J Clin Pharmacol 1980 PMID: 6994776）

少なくとも大幅な減量は不要だろう（Kiechel JR: Am J Cardiol 1986 PMID: 3513525）

腎不全時には半減期が延長する（Carchman SH, et al: Nephron 1989 PMID: 2674741）

高度腎障害：1mgから開始（1）

【特徴】ADHD治療薬で，交感神経系を抑制し，静穏作用を有する．選択的α2A アドレナリン受容体作動薬の徐放錠（粉砕不可）．前頭前皮質におけるシグナル伝達を増強させる．

【主な副作用・毒性】低血圧，徐脈，失神，房室ブロック

【安全性に関する情報】中枢性の徐脈作用あり（1）QTc延長におけるPK/PDモデル（Knebel W, et al: AAPS J 2014 PMID: 25135837）

【吸収】食事により吸収増大 [AUC～1.3倍]（1）ka=0.410/hr（1）

【F】100%（1）初回通過効果を受けない（Kiechel JR: Br J Clin Pharmacol 1980 PMID: 6994775）60%以上（Kirch W, et al: Br J Clin Pharmacol 1980 PMID: 6994776）81.1%（Carchman SH, et al: J Clin Pharmacol 1987 PMID: 3323255）

【tmax】5～8hr（1）

【代謝】水酸化され抱合を受ける（1）酸化的代謝にはCYP3A4/5が関与（1）グルクロン酸抱合はマイナー（Inoue Y, et al: Biopharm Drug Dispos 2019 PMID: 31313320）

【排泄】尿中未変化体排泄率36～41%（1）30% [iv]（Kiechel JR: Br J Clin Pharmacol 1980 PMID: 6994775）50%で腎CLは尿細管分泌による（Carchman SH, et al: J Clin Pharmacol 1987 PMID: 3323255）

【CL】CL/F=30～45L/hr（1）PPK解析より $24.5 \times (\text{体重}/35.6)^{0.739}$ L/hr（1）11L/hr [iv]で，腎CLは全身CLの1/3～1/4（Kiechel JR: Br J Clin Pharmacol 1980 PMID: 6994775）OCT1/2の基質（1）

【t1/2】18.4hr（1）17hr [iv]（Kiechel JR: Br J Clin Pharmacol 1980 PMID: 6994775）腎不全で24.4hr（Kiechel JR, et al: Nephrologie 1980 PMID: 7029332）13.8hr（Carchman SH, et al: J Clin Pharmacol 1987 PMID: 3323255）

【蛋白結合率】約70%（1）71.6%（Carchman SH, et al: J Clin Pharmacol 1987 PMID: 3323255）

【Vd】PPK解析より $609 \times (\text{体重}/35.6)^{0.900}$ L/body（1）300L/body（Kiechel JR: Br J Clin Pharmacol 1980 PMID: 6994775）6L/kg（Carchman SH, et al: J Clin Pharmacol 1987 PMID: 3323255）

【MW】282.56

【透析性】除去率2.4%（1, Kirch W, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 1982 PMID: 6762301）効率的には除去されない（Kiechel JR, et al: Nephrologie 1980 PMID: 7029332）

【薬物動態】2-コンパートメントモデルに適合し線形（Weiss YA, et al: Clin Pharmacol Ther 1979 PMID: 761440）徐放錠でも線形動態（Swearingen D, et al: Clin Ther 2007 PMID: 17617285）PKは体重に影響されている（Boellner SW, et al: Pharmacotherapy 2007 PMID: 17723079）1-コンパートメントモデルに適合（Tsuda Y, et al: Drug Metab Pharmacokinet 2019 PMID: 31563330）

【O/W係数】資料なし（1）

【pKa】7.64±0.21 および11.92±0.46

【相互作用】MATE-1を阻害（1）CYP3A4阻害剤・誘導剤の影響を受ける（1）フェノバルビタール併用による離脱症（Kiechel JR, et al: Eur J Clin Pharmacol 1983 PMID: 6360692）併用によるバルプロ酸血中濃度上昇（Ambrosini PJ, et al: J Child Adolesc Psychopharmacol 1998 PMID: 9730080）メチルフェニデートとのPKの相互作用を認めず（Roesch B, et al: Drugs R D 2013 PMID: 23519656）リスデキサンフェタミンとのPKの相互作用を認めず（Roesch B, et al: Drugs R D 2013 PMID: 23615868）OCT2阻害剤であるシメチジン併用で尿細管分泌が阻害される（Li X, et al: Xenobiotica 2015 PMID: 25115365）CYP3A4関連の相互作用解析モデル（Li A, Drugs 2018 PMID: 29282674）

【肝障害患者への投与方法】

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦禁忌（1）

【主な臨床報告】13～17歳でのPK/PD study（Martin P, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2014 PMID: 27128830）

6～17歳でのPPK解析（Knebel W, et al: Clin Pharmacokinet 2015 PMID: 25724291）

【備考】粉砕不可

【更新日】20231005

※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。