

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

アデノシンA_{2A}受容体拮抗薬

処方箋医薬品^注

イストラデフィリン錠

イストラデフィリン錠20mg「ケミファ」 Istradefylline Tablets 20mg “Chemiphar”

剤形	フィルムコーティング錠	
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意・医師等の処方箋により使用すること）	
規格・含量	イストラデフィリン錠 20mg 「ケミファ」： 1 錠中イストラデフィリン 20.0mg	
一般名	和名：イストラデフィリン（JAN） 洋名：Istradefylline（JAN）	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日	2026 年 8 月 17 日
	薬価基準収載年月日	—
	販売開始年月日	—
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本ケミファ株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	日本ケミファ株式会社 くすり相談室 TEL.0120-47-9321 03-3863-1225／FAX.03-3861-9567 受付時間：9:00～17:30（土日、祝日及び当社休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.nc-medical.com/	

本 IF は 2026 年 8 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、I F記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたI Fは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I Fの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってI Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I Fの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I Fが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020 年 4 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	17
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	17
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	17
3. 製品の製剤学的特性	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	18
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	1. 警告内容とその理由	18
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	2. 禁忌内容とその理由	18
6. RMPの概要	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	18
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	18
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	18
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	18
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	19
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	20
5. 化学名（命名法）又は本質	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 過量投与	22
III. 有効成分に関する項目	3	11. 適用上の注意	22
1. 物理化学的性質	3	12. その他の注意	22
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	IX. 非臨床試験に関する項目	23
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 薬理試験	23
IV. 製剤に関する項目	4	2. 毒性試験	23
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	24
2. 製剤の組成	4	1. 規制区分	24
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	2. 有効期間	24
4. 力価	4	3. 包装状態での貯法	24
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	4. 取扱い上の注意	24
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	5. 患者向け資材	24
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	6. 同一成分・同効薬	24
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	5	7. 国際誕生年月日	24
9. 溶出性	5	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	24
10. 容器・包装	8	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	24
11. 別途提供される資材類	8	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	24
12. その他	8	11. 再審査期間	24
V. 治療に関する項目	9	12. 投薬期間制限に関する情報	24
1. 効能又は効果	9	13. 各種コード	25
2. 効能又は効果に関連する注意	9	14. 保険給付上の注意	25
3. 用法及び用量	9	X I. 文献	26
4. 用法及び用量に関連する注意	9	1. 引用文献	26
5. 臨床成績	9	2. その他の参考文献	27
VI. 薬効薬理に関する項目	12	X II. 参考資料	28
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12	1. 主な外国での発売状況	28
2. 薬理作用	12	2. 海外における臨床支援情報	28
VII. 薬物動態に関する項目	13	X III. 備考	29
1. 血中濃度の推移	13	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	29
2. 薬物速度論的パラメータ	15	2. その他の関連資料	29
3. 母集団（ポピュレーション）解析	15		
4. 吸収	15		
5. 分布	15		
6. 代謝	16		
7. 排泄	16		
8. トランスポーターに関する情報	17		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

イストラデフィリン製剤は、本邦では 2013 年 5 月に上市されている。イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」は、後発医薬品として、日本ケミファ株式会社が開発を実施し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験のデータをもとに承認申請し、2026 年 8 月に製造販売承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は「レボドパ含有製剤で治療中のパーキンソン病におけるウェアリングオフ現象」に対する効能又は効果を有する（「V.-1. 効能又は効果」の項参照）。
- (2) 本剤はアデノシン A_{2A} 受容体拮抗薬であり、線条体及び淡蒼球において当該受容体を遮断することによりパーキンソン病に対する治療効果を発現する。（「VI.-2. 薬理作用」の項参照）。
- (3) 重大な副作用として精神障害があらわれることがある。（「VIII.-8. 副作用」の項参照）。

3. 製品の製剤学的特性

- (1) 大きさが【直径 7.1mm、厚さ 3.3mm】の黄色のフィルムコーティング錠である。
- (2) 識別性を向上させるため、錠剤の表面に「イストラデフィリン」、裏面に「規格」、「ケミファ」をインクジェットで印字している。
- (3) PTP シートの表面は、薬剤の判別を容易にするため、1 錠単位で「イストラデフィリン」と「規格」を表記している。
- (4) PTP シート裏面は、視認性向上のため、2 錠単位で「製品名」、「規格」を大きく表記している。また、利便性向上のため 1 錠単位で GS1 コードを記載している。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

- (1) 承認条件
該当しない

- (2) 流通・使用上の制限事項
該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

イストラデフィリン錠 20mg 「ケミファ」

(2) 洋名

Istradefylline Tablets 20mg “Chemiphar”

(3) 名称の由来

「有効成分」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」より命名した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

イストラデフィリン（JAN）

(2) 洋名（命名法）

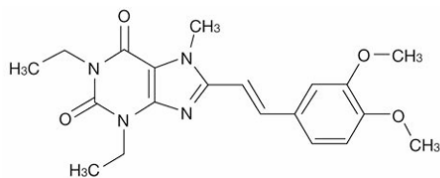
Istradefylline（JAN）

istradefylline（rINN）

(3) ステム

-fylline：N-methylated xanthine derivatives

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₀ H₂₄ N₄ O₄

分子量：384.43

5. 化学名（命名法）又は本質

(*E*)-8-(3,4-Dimethoxystyryl)-1,3-diethyl-7-methyl-3,7-dihydro-1*H*-purine-2,6-dione

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

淡黄緑色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

溶媒	日局の溶解度表記
アセトニトリル	溶けにくい
エタノール (99.5)	極めて溶けにくい
水	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験

- 1) 紫外可視吸光度測定法：本品のアセトニトリル溶液(1→100000)につき、本品のスペクトルと、本品の参照スペクトル又は標準品のスペクトルは、同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）：本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はイストラデフィリン標準物質のスペクトルとを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	表面	裏面	側面	性状
イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」				黄色のフィルムコーティング錠
直径：7.1 mm、厚さ：3.3 mm、重量：118.0mg				

(3) 識別コード

	イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」
識別コード	イストラデフィリン 20 ケミファ
記載場所	錠剤、PTP シート

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加物

	イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」
有効成分 (1 錠中)	イストラデフィリン 20.0mg
添加物	D-マンニトール、カルメロース、クロスポビドン、フマル酸ステアリルナトリウム、ポリビニルアルコール・ポリエチレングリコール・グラフトコポリマー、軽質無水ケイ酸、酸化チタン、黄色 4 号（タートラジン）、カルナウバロウ、その他 1 成分

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

製剤の分解物として類縁物質が混入する可能性があるが、「IV. -6. 製剤の各種条件下における安定性」の項に示したように、いずれも通常の市場流通下において品質に影響を与えない程度であった。

6. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

(1) イストラデフィリン錠 20mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40±2℃ 75±5%RH	6ヵ月	PTP包装（ピロー包装入り） バラ包装（ポリエチレン瓶）	規格内

測定項目：性状、確認試験、純度試験（類縁物質）、製剤均一性（含量均一性試験）、溶出性、定量法、質量試験*

*規格の設定されていない試験項目

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

9. 溶出性²⁾

(1) 溶出挙動における類似性

本剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号）に従い、標準製剤（ノウリアスト錠20mg）との溶出挙動の比較を行った。

（方法） 日局溶出試験法 パドル法

試験液：50rpm pH1.2、pH4.0、pH6.8、水、
pH1.2 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加、
pH4.0 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加、
pH6.8 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加、
100rpm pH6.8 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加

検体数：各製剤ともに12ベッセル判定基準：

判定基準：

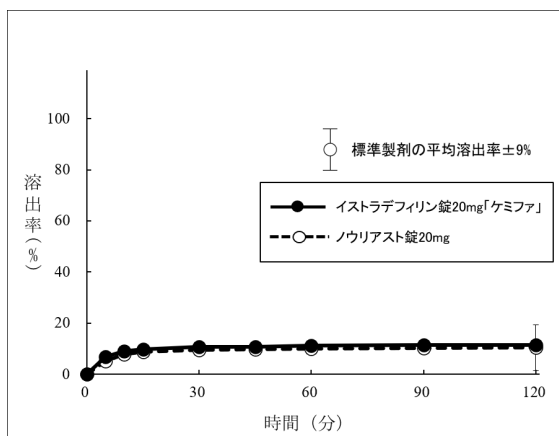
パドル 回転数	試験液	標準製剤の 平均溶出率結果	判定基準
50rpm	pH1.2	規定された試験時間において、平均溶出率が50%に達しなかった。	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又はf2関数の値が53以上である。
	pH4.0		
	pH6.8		
	水		
50rpm	pH1.2 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加	30分以内に平均85%以上溶出せず、規定された試験時間において平均溶出率が85%以上であった。	標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値は42以上である。
	pH4.0 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加		
	pH6.8 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加		
	pH6.8 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加		
100rpm	pH6.8 ポリソルベート80 1.0%（W/V）添加		

結果：

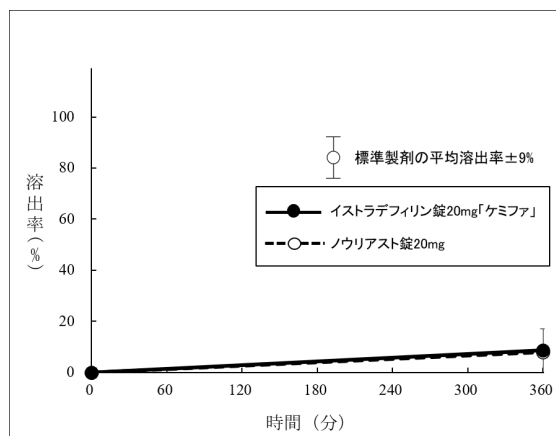
パドル 回転数	試験液	比較時点 (分)	平均溶出率 (%)		溶出率差 (%)	判定
			標準製剤	試験製剤		
50rpm	pH1.2	120	10.4	11.5	1.1	適合
	pH4.0	360	7.9	8.6	0.7	適合
	pH6.8	360	7.6	8.1	0.5	適合
	水	360	8.2	8.9	0.7	適合
	pH1.2 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加	10	36.7	40.0	3.3	適合
		120	85.3	83.8	-1.5	
	pH4.0 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加	10	37.7	38.1	0.4	適合
		120	85.7	87.4	1.7	
	pH6.8 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加	10	34.8	38.7	3.9	適合
		120	85.2	87.4	2.2	
100rpm	pH6.8 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加	10	45.9	46.8	0.9	適合
		90	85.6	85.7	0.1	

イストラデフィリン錠20mg「ケミファ」と標準製剤であるノウリアスト錠20mgについて、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従って溶出試験を実施した結果、両製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

pH1.2 (50rpm) における溶出曲線

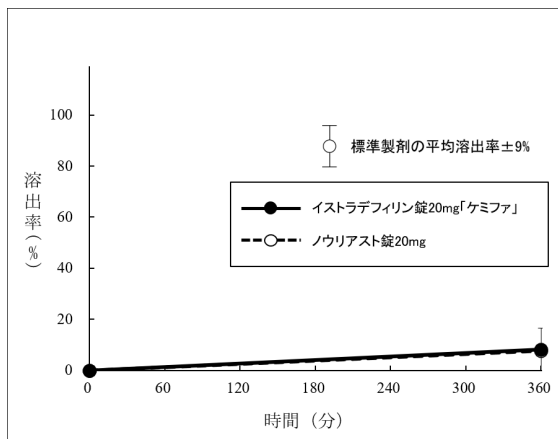


pH4.0 (50rpm) における溶出曲線

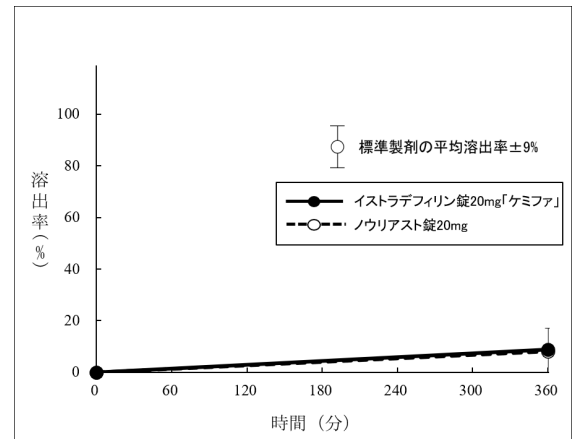


pH6.8 (50rpm) における溶出曲線

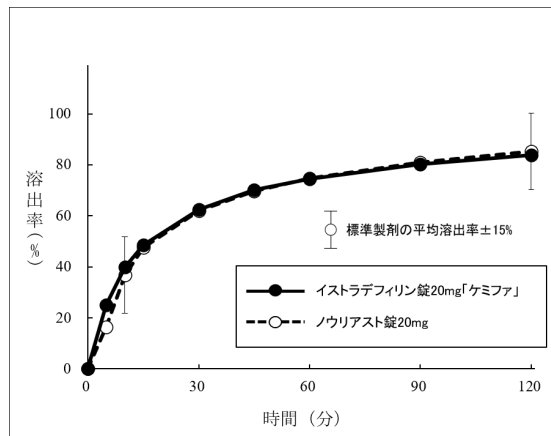
水 (50rpm) における溶出曲線



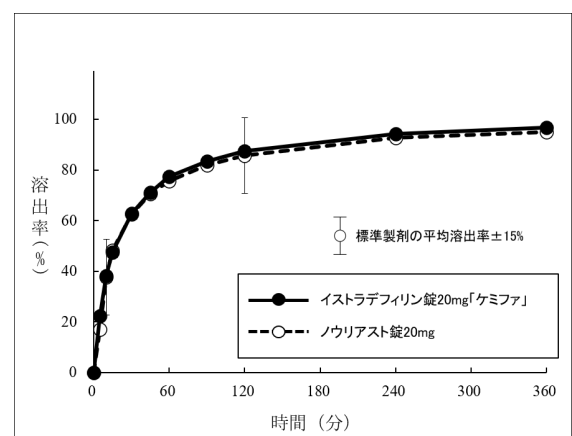
pH1.2 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加
(50rpm) における溶出曲線



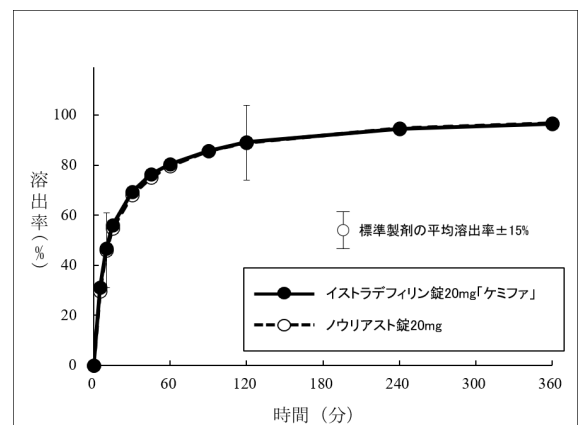
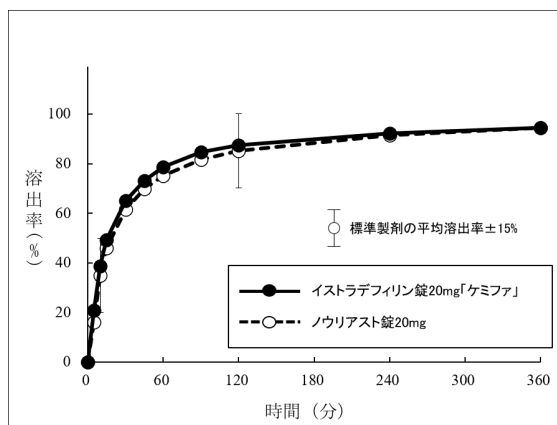
pH4.0 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加
(50rpm) における溶出曲線



pH6.8 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加
(50rpm) における溶出曲線



pH6.8 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加
(100rpm) における溶出曲線



(2) 公的溶出規格への適合
該当しない

10. 容器・包装

- (1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報
該当しない

(2) 包装

30 錠 [10 錠 (PTP) × 3]

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

100 錠 [ポリエチレンビン、バラ]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP 包装：ポリプロピレン、アルミニウム箔、アルミラミネート

バラ包装：ポリエチレンビン、ポリプロピレンキャップ

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

レボドパ含有製剤で治療中のパーキンソン病におけるウェアリングオフ現象の改善

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 用法及び用量に関連する注意

レボドパ含有製剤の投与量及び投与回数の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すること。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

本剤は、レボドパ含有製剤と併用する。通常、成人にはイストラデフィリンとして 20mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、症状により 40mg を 1 日 1 回経口投与できる。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 患者のオン時の運動機能の改善を期待する場合、40mg を 1 日 1 回経口投与できる。ただし、40mg では、20mg を上回るオフ時間の短縮効果は認められていない。
[17.1.1 参照]

7.2 以下の患者では本剤の血中濃度が上昇するおそれがあるため、1 日 1 回 20mg を上限とすること。

- ・ 中等度の肝障害のある患者 [9.3.2、16.6.2 参照]
- ・ CYP3A を強く阻害する薬剤を投与中の患者 [10.2、16.7.1 参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

国内第Ⅲ相試験

レボドパ含有製剤で治療中の運動合併症を併発しているパーキンソン病患者 373 例（イストラデフィリン錠 20mg 投与群 123 例、イストラデフィリン錠 40mg 投与群 124 例、プラセボ投与群 126 例）を対象として、イストラデフィリン錠を 12 週間投与した第Ⅲ相二重盲検試験を実施した結果、イストラデフィリン錠 20mg 投与群及び 40mg 投与群ではプラセボ投与群と比較して主要評価項目とした 1 日平均オフ時間を短縮させた。また、イストラデフィリン錠 40mg 投与群ではプラ

セボ投与群と比較して、副次評価項目としたオン時の UPDRS partⅢスコア（運動能力検査）を改善させた³⁾。

副作用発現頻度は、イストラデフィリン錠 20mg 投与群 36.6%（45/123 例）、イストラデフィリン錠 40mg 投与群 38.7%（48/124 例）、プラセボ投与群 28.6%（36/126 例）であった。主な副作用は、イストラデフィリン錠 20mg 投与群及び 40mg 投与群でそれぞれジスキネジー12.2%（15/123 例）及び 12.1%（15/124 例）、傾眠 6.5%（8/123 例）及び 1.6%（2/124 例）、便秘 3.3%（4/123 例）及び 3.2%（4/124 例）、幻視 0.8%（1/123 例）及び 4.0%（5/124 例）であった。

最終評価時（投与 12 週間後）における 1 日平均オフ時間の変化

単位：時間

第Ⅲ相二重盲検試験		プラセボ群	20mg 群	40mg 群
被験者数		123	120	123
ベースライン	平均値±標準偏差	6.31±2.47	6.55±2.72	5.97±2.45
最終評価時－ベースライン	最小二乗平均値	-0.23	-0.99	-0.96
	95%信頼区間	-0.62, 0.16	-1.38, -0.60	-1.35, -0.58
イストラデフィリン錠投与群－プラセボ投与群	最小二乗平均値	—	-0.76	-0.74
	95%信頼区間	—	-1.30, -0.22	-1.27, -0.20
	p 値 (Williams 検定)	—	0.003 ^{a)}	0.003 ^{a)}

a) $p < 0.025$

最終評価時（投与 12 週間後）におけるオン時の UPDRS partⅢスコアの変化

第Ⅲ相二重盲検試験		プラセボ群	20mg 群	40mg 群
被験者数		123	120	123
ベースライン	平均値±標準偏差	21.6±11.6	21.3±10.8	20.7±11.0
最終評価時－ベースライン	最小二乗平均値	-2.8	-3.7	-4.9
	95%信頼区間	-3.8, -1.8	-4.7, -2.8	-5.8, -3.9
イストラデフィリン錠投与群－プラセボ投与群	最小二乗平均値	—	-0.9	-2.0
	95%信頼区間	—	-2.3, 0.4	-3.4, -0.7
	p 値 (Williams 検定)	—	0.086 NS	0.001 ^{a)}

a) $p < 0.025$ NS：有意差なし

国内第Ⅱ/Ⅲ相試験における精神障害の有害事象発現割合

レボドパ含有製剤で治療中の運動合併症を併発しているパーキンソン病患者を対象として、イストラデフィリン錠を 12 週間投与した国内プラセボ対照比較試験（前期第Ⅱ相試験、後期第Ⅱ相試験及び第Ⅲ相試験）を実施した結果、「精神障害」（MedDRA/J の器官別大分類）の有害事象発現割合は、イストラデフィリン錠 20mg 投与群、40mg 投与群、プラセボ投与群でそれぞれ 5.5%（15/272 例）、10.1%（28/277 例）、3.6%（10/275 例）であった^{3)~5)}。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

アデノシン A_{2A} 受容体拮抗薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

- 1) イストラデフィリンはアデノシン A_{2A} 受容体拮抗薬であり、線条体及び淡蒼球において当該受容体を遮断することによりパーキンソン病に対する治療効果を発現する⁶⁾。
- 2) イストラデフィリンはヒト組換えアデノシン A_{2A} 受容体に対し、高い親和性を示すが、ヒト組換えアデノシン A₁, A₃ 受容体への親和性は低い⁷⁾ (*in vitro*)。
- 3) イストラデフィリンは PC-12 細胞においてアデノシン A_{2A} 作動薬 CGS21680 による cAMP 蓄積増加作用を阻害する⁸⁾ (*in vitro*)。
- 4) ラットのパーキンソン病モデルである黒質線条体片側破壊ラットにおいて、増加している淡蒼球ガンマアミノ酪酸 (GABA) 細胞外濃度を減少させる⁹⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

- 1) イストラデフィリンはレセルピン処置マウスの運動障害であるカタレプシー反応を改善した。イストラデフィリンをレボドパと併用すると、カタレプシー改善作用は増強された¹⁰⁾。
- 2) イストラデフィリンはパーキンソン病モデルである 1-Methyl-4-phenyl-1,2,3,6-tetrahydropyridine (MPTP) 処置マーモセットの自発運動量を増加させ、運動機能障害を改善した。イストラデフィリンをレボドパと併用すると、レボドパの作用は増強され、レボドパの作用持続時間が延長された^{11), 12)}。
- 3) イストラデフィリンは MPTP 処置マーモセットのレボドパによる不随意運動の強度に影響しなかった¹³⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 単回投与

健康成人男性にイストラデフィリン錠 20mg を絶食下又は食後に単回経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった（クロスオーバー試験）。

イストラデフィリン錠を食後投与したときの $C_{\max}$ 及び $AUC_{0-\infty}$ は、いずれも絶食下投与に比べ増加したが、臨床的には大きな影響は認められなかった¹⁴⁾。

健康成人男性に単回経口投与したときの薬物動態パラメータ

投与量 20mg	$t_{\max}^a)$ (h)	$C_{\max}$ (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・h/mL)	$t_{1/2}$ (h)
絶食下投与 (n=20)	2.00 0.50～4.00	112.9 ±24.1	4323 ^{b)} ±1991	57.09 ^{b)} ±31.51
食後投与 (n=20)	3.00 0.50～8.00	136.4 ±36.0	4591 ±1997	53.56 ±22.33

平均値±標準偏差 a) 中央値、最小値～最大値 b) n=19

2) 反復投与

健康成人男性にイストラデフィリン錠 20、40 又は 80mg/日^{注)} を 1 日 1 回 14 日間反復経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった。

イストラデフィリン錠を反復投与したときの $C_{\max}$ 及び AUC_{0-24} は、いずれも 20～80mg/日の投与量範囲で投与量に比例して増加した。14 日間の反復投与により、トラフ濃度 (C_{trough}) はおおむね定常状態に到達した¹⁵⁾。

注) 本剤の承認用量は、1 日 40mg までである。

健康成人男性に反復経口投与したときの薬物動態パラメータ

投与量	Day	$t_{\max}^a)$ (h)	$C_{\max}$ (ng/mL)	C_{trough} (ng/mL)	AUC_{0-24} (ng・h/mL)	$t_{1/2}$ (h)
20mg (n=9)	1	2.00 1.00～6.00	149.2 ±25.3	33.4 ±11.5	1319 ±335	—
	14	4.00 2.00～4.00	257.5 ±88.0	154.6 ±59.4	4406 ±1598	75.0 ^{b)} ±32.0
40mg (n=9)	1	2.00 1.00～4.00	257.3 ±38.7	67.2 ±20.3	2638 ±616	—
	14	2.00 0.50～4.00	458.7 ±117.4	284.7 ±66.6	7925 ±2047	59.1 ^{c)} ±27.0
80mg (n=9)	1	2.00 2.00～4.00	391.2 ±120.0	105.2 ±38.0	3966 ±1264	—
	14	2.00 2.00～4.00	857.3 ±180.5	502.1 ±136.2	14318 ±3023	51.1 ^{b)} ±25.0

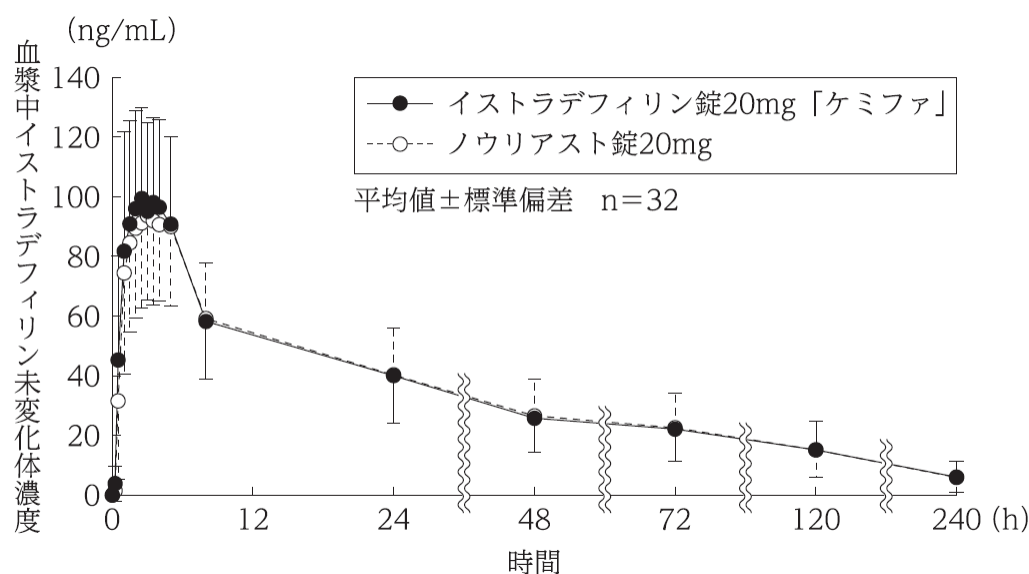
平均値±標準偏差 a) 中央値、最小値～最大値 b) n=7 c) n=8

3) 生物学的同等性試験

イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」とノウリアスト錠 20mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（イストラデフィリンとして 20mg）健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中イストラデフィリン未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁶⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄₀ (ng・h/mL)	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (h)	$t_{1/2}$ (h)
イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」	4919.500 ±2171.291	116.188 ±29.544	2.72 ±1.41	79.88 ±41.36
ノウリアスト錠 20mg	4932.145 ±2178.198	109.319 ±29.946	2.75 ±1.48	77.71 ±38.63

平均値±標準偏差 n=32



血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) ケトコナゾール

健康成人において、CYP3A4 の阻害剤であるケトコナゾール（200mg/回、1 日 2 回 4 日間、以降、1 日 1 回 7 日間反復投与）との併用により、イストラデフィリン錠（40mg 単回投与）の C_{max} は影響を受けなかったが、AUC_{0-∞} は 2.47 倍に増加し、 $t_{1/2}$ は 1.87 倍に延長した¹⁷⁾（外国人データ）。

2) ミダゾラム

健康成人において、イストラデフィリン錠（80mg/日^注、15 日間反復投与）との併用により、CYP3A4 の基質であるミダゾラム（10mg 単回投与）の C_{max} は 1.61 倍、AUC_{0-∞} は 2.41 倍に増加した¹⁷⁾（外国人データ）。

3) アトルバスタチン

健康成人において、イストラデフィリン錠（40mg/日、17 日間反復投与）との併用

により、CYP3A4 及び P 糖蛋白の基質であるアトルバスタチン（40mg 単回投与）の $C_{\max}$ は 1.53 倍、 $AUC_{0-\infty}$ は 1.54 倍に増加した¹⁸⁾（外国人データ）。

4) ジゴキシシン

健康成人において、イストラデフィリン錠（40mg/日、21 日間反復投与）との併用により、P 糖蛋白の基質であるジゴキシシン（0.4mg 単回投与）の $C_{\max}$ は 1.33 倍、 $AUC_{0-\infty}$ は 1.21 倍に増加した¹⁹⁾（外国人データ）。

5) 喫煙

喫煙健康成人でのイストラデフィリン錠（40mg/日、14 日間反復投与）の $C_{\max}$ 及び AUC_{0-24} は、非喫煙健康成人のそれぞれ 79.3% 及び 58.4% であった²⁰⁾（外国人データ）。

注）本剤の承認用量は、1 日 40mg までである。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

$0.0079 \pm 0.0114 \text{ hr}^{-1}$ （健康成人男性、イストラデフィリンとして 20mg、1 錠を絶食単回投与）
¹⁶⁾

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当しない

(2) パラメータ変動要因

該当資料しない

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

「Ⅷ.-6. 特定の背景を有する患者に関する注意 (5) 妊婦」の項参照

- (3) 乳汁への移行性
「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意 (6) 授乳婦」の項参照

- (4) 髄液への移行性
該当資料なし

- (5) その他の組織への移行性
該当資料なし

- (6) 血漿蛋白結合率
1) 蛋白結合率

In vitro での血清中蛋白結合率は 95～97%であり、血漿中の主結合蛋白はアルブミンであった。健康成人、肝機能低下患者及び腎機能低下患者での血漿中蛋白結合率は同等であり 97～98%であった²¹⁾ (外国人データ)。

- 2) 受容体占有率

イストラデフィリンの脳内結合部位は脳基底核を中心にアデノシン A_{2A} 受容体の分布によく一致し、イストラデフィリン 20 及び 40mg/日の反復投与によるアデノシン A_{2A} 受容体占有率は 90%以上を示した²²⁾ (外国人データ)。

6. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路

ヒト肝ミクロソーム及び CYP 発現ミクロソームを用いた試験から、イストラデフィリンの代謝には、主に CYP1A1、CYP3A4 及び CYP3A5 が関与し、わずかながら CYP1A2、CYP2B6、CYP2C8、CYP2C18 及び CYP2D6*1 の関与が示唆された。また、イストラデフィリンは CYP3A4/5 に対して不可逆阻害作用を示した^{23), 24)}。

健康成人 6 例に ¹⁴C-イストラデフィリン 40mg を単回経口投与したとき、投与後 2 時間の血漿中には総放射能の約 80%が未変化体として存在した。尿中には未変化体は認められず、イストラデフィリンの主消失経路は代謝と推定された²⁵⁾ (外国人データ)。

- (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率
「Ⅷ-6. 代謝 (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照

- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
該当資料なし

- (4) 代謝物の活性の有無及び活性化、存在比率
該当資料なし

7. 排泄

健康成人 6 例に ¹⁴C-イストラデフィリン 40mg を単回経口投与したとき、投与後 18 日までに、尿中及び糞中にそれぞれ投与放射能の 38.9%及び 48.0%が排泄された²⁵⁾ (外国人データ)。また、Caco-2 細胞単層膜を用いた試験で、イストラデフィリンは P 糖蛋白に対して阻害作用を示した²⁶⁾。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

腎機能障害患者

腎機能障害患者 6 例（Cockcroft-Gault 換算式によるクレアチニンクリアランス：30mL/min 未満）及び健康成人 6 例にイストラデフィリン錠 40mg を単回経口投与したとき、血漿中曝露に大きな違いは認められなかった²⁷⁾（外国人データ）。

肝機能障害患者

肝機能障害患者 7 例（Child-Pugh 分類による中等度の肝障害）及び健康成人 7 例にイストラデフィリン錠 40mg/日を反復経口投与したとき、定常状態での肝機能障害患者の C_{max} 及び AUC_{0-24} は、いずれも健康成人の約 3 倍と推定された²⁸⁾（外国人データ）。

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5 参照]

2.3 重度の肝障害のある患者 [9.3.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目」の項参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 前兆のない突発的睡眠、睡眠発作、起立性低血圧、傾眠、めまい、意識消失、失神等があらわれることがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転、機械の操作、高所作業等、危険を伴う作業に従事させないように注意すること。

8.2 非臨床試験においてマクロファージを主体とする肺の炎症性変化が認められている。本剤投与開始後は十分に観察し、息切れ・呼吸困難、乾性咳嗽が発現した場合には、胸部 X 線検査をはじめとする画像検査や適切な精密検査等を行い、必要に応じて減量、休薬又は投与中止等の適切な処置を行うこと。[15.2.1 参照]

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 虚血性心疾患のある患者

不整脈が悪化する可能性がある。

9.1.2 ジスキネジーのある患者

患者の状態を注意深く観察しながら投与すること。ジスキネジーを悪化させることがある。ジスキネジーが悪化した場合には必要に応じ、本剤の減量、休薬又は投与中止等の適切な処置を行うこと。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝障害のある患者

投与しないこと。本剤は主に肝臓で代謝されるため、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。また、これらの患者での使用経験はない。[2.3 参照]

9.3.2 肝障害のある患者（重度の肝障害のある患者を除く）

本剤は主に肝臓で代謝されるため、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。[7.2、16.6.2 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。動物実験（ラット又はウサギ）で受胎率及び着床率の低下、全児死亡した母動物の増加、催奇形性（骨格変異、骨格異常、小眼球及び欠指）並びに哺乳期の出生児の生存率低値等が認められている。また、本剤とレボドパ・カルビドパを併用した動物実験（ウサギ）では、胎児生存率の低値が認められ、催奇形性（内臓異常、骨格異常、無指、短指又は欠指）を含む胎児への影響が、本剤単独投与と比較して、併用投与ではより低用量から認められている。[2.2 参照]

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されており、また、出生児の生存率低下及び体重増加量低値が認められている。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能（腎機能、肝機能等）が低下している。

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は、主として CYP1A1 及び CYP3A（CYP3A4 及び CYP3A5）で代謝される。また、CYP3A 及び P 糖蛋白に対して阻害作用を示す。[16.4 参照]

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP3A を強く阻害する薬剤 イトラコナゾール クラリスロマイシン 等 [7.2、16.7.1 参照]	本剤の作用が増強される可能性がある。	CYP3A 阻害剤との併用により、本剤の代謝が阻害され血中濃度が増加する可能性がある。 ケトコナゾールと本剤を併用した際に、本剤の $AUC_{0-\infty}$ は増加し、 $t_{1/2}$ は延長した。
CYP3A を阻害する薬剤 エリスロマイシン フルコナゾール 等	本剤の作用が増強される可能性がある。	CYP3A 阻害剤との併用により、本剤の代謝が阻害され血中濃度が増加する可能性がある。
CYP3A を誘導する薬剤 リファンピシン カルバマゼピン 等 セイヨウオトギリソウ (St. John's Wort, セント・ジョーンズ・ワート) 含有食品	本剤の作用が減弱する可能性がある。	CYP3A 誘導剤との併用により、本剤の代謝が促進され血中濃度が低下する可能性がある。
CYP3A の基質となる薬剤 ミダゾラム アトルバスタチン ロミタピドメシル酸塩 等 [16.7.2、16.7.3 参照]	左記薬剤の作用が増強される可能性がある。	本剤との併用により、CYP3A の基質となる薬剤の代謝が阻害され血中濃度が増加する可能性がある。
P 糖蛋白の基質となる薬剤 ジゴキシン アトルバスタチン 等 [16.7.3、16.7.4 参照]	左記薬剤の作用が増強される可能性がある。	本剤との併用により、P 糖蛋白が阻害され、P 糖蛋白の基質となる薬剤の血中濃度が増加する可能性がある。
タバコ（喫煙） [16.7.5 参照]	本剤の作用が減弱する可能性がある。	喫煙による CYP1A1 及び CYP1A2 の誘導により、本剤の代謝が亢進し血中濃度が低下する可能性がある。
エンタカポン	エンタカポンとの併用によりジスキネジーの発現頻度の上昇が認められた。	機序は不明である。

8. 副作用

11. 副作用 次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
--

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 精神障害

幻視 (4.5%)、幻覚 (3.2%)、妄想 (0.8%)、せん妄 (0.6%)、不安障害 (0.5%)、うつ病の悪化・抑うつ (0.5%)、被害妄想 (0.3%)、幻聴 (0.2%)、体感幻覚 (0.2%)、躁病 (0.2%)、激越 (0.2%)、衝動制御障害 (0.2%) 等があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	0.5～1%未満	0.5%未満
心臓障害			上室性期外収縮、心房細動、動悸	心筋梗塞、心室性期外収縮
胃腸障害	便秘 (5.1%)	悪心、胃食道逆流性疾患	胃炎、胃潰瘍、消化不良	腹部膨満、嘔吐、上腹部痛
一般・全身障害および投与部位の状態			胸部不快感	倦怠感、末梢性浮腫、口渇、歩行障害
肝胆道系障害			肝機能異常	
感染症および寄生虫症				気管支炎
傷害、中毒および処置合併症			挫傷	
臨床検査		体重減少、血中CK増加、血中トリプシン増加、リパーゼ増加、尿中血陽性、尿中蛋白陽性	血中ブドウ糖増加、尿中ブドウ糖陽性、血中尿素増加、血中Al-P増加、血中アミラーゼ増加、AST増加、ALT増加、γ-GTP増加	LDH増加、血中ビリルビン増加、血圧上昇、心電図T波逆転、白血球数減少
代謝および栄養障害		食欲減退		
筋骨格系および結合組織障害			四肢痛	背部痛、変形性脊椎症、姿勢異常
神経系障害	ジスキネジー (16.9%)	傾眠、パーキンソン病増悪	体位性めまい、浮動性めまい、頭痛、失神	ジストニー、振戦
精神障害		不眠症	睡眠障害	不安
腎および尿路障害				頻尿、神経因性膀胱
呼吸器、胸郭および縦隔障害			咳嗽	
皮膚および皮下組織障害			じん麻疹	湿疹、発疹
血管障害		起立性低血圧		高血圧

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

急性症状としては、ジスキネジー、幻覚が予想される。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 マウス、ラット及びイヌを用いた反復投与毒性試験並びにマウス及びラットを用いたがん原性試験において、臨床曝露量（AUC₀₋₂₄ 換算）の 3 倍程度に相当する用量（ラットがん原性試験の 30mg/kg/日及びイヌ 4 週間の 100mg/kg/日）から、マクロファージを主体とする肺の炎症性変化（肺胞腔内へのマクロファージ/泡沫状マクロファージ/組織球/泡沫状組織球の発現、集簇又は増加並びにこれらの変化と関連した肺炎）が認められ、これらの変化は休薬により回復性を示した。また、ラットを用いた高用量短期反復投与毒性試験（2000mg/kg/日の 4 週間）及びがん原性試験（100mg/kg/日）では、肺の変化の増悪による死亡が認められている²⁹⁾。[8.2 参照]

15.2.2 アカゲザルを用いた静脈内自己投与による強化効果の検討試験において、強化効果が陽性であった³⁰⁾。

15.2.3 ラットを用いた 13 週間以上の反復投与毒性試験及びがん原性試験において、臨床曝露量（AUC₀₋₂₄ 換算）の 3 倍程度の曝露量に相当する用量（がん原性試験の 30mg/kg/日）から脳の細動脈壁及び毛細血管壁における鉍質沈着が認められている³¹⁾。

15.2.4 ヘアレスラットを用いた光毒性試験において、多量の UVA 照射（400mg/kg 単回投与時は 30J/cm² 以上及び同用量の 7 日間反復投与時は 20J/cm² 以上）により軽度の皮膚紅斑反応が認められている³²⁾。

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：該当しない

2. 有効期間

3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

本剤は光安定性の確保のためフィルムコーティングを施しているため、粉砕して使用しないこと。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：なし

その他の患者用資料：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ノウリアスト錠 20mg

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」	2026 年 8 月 17 日	30800AMX00225000	—	—

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別医薬品 コード (YJ コード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」	—	—	—	—

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 日本ケミファ株式会社：安定性に関する資料（社内資料）
- 2) 日本ケミファ株式会社：溶出に関する資料（社内資料）
- 3) 第Ⅲ相二重盲検試験（国内・パーキンソン病患者）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.20）
- 4) 前期第Ⅱ相二重盲検試験（国内・パーキンソン病患者）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.18）
- 5) 後期第Ⅱ相二重盲検試験（国内・パーキンソン病患者）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.19）
- 6) パーキンソン病モデルにおける作用機序（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.2.2）
- 7) アデノシン受容体に対する親和性（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.2.1.1）
- 8) アデノシン A_{2A} 受容体に対する機能試験（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.2.1.4）
- 9) 黒質線条体片側破壊ラットにおける淡蒼球ガンマアミノ酪酸濃度測定（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.2.2.2）
- 10) マウスにおけるレセルピン誘発カタレプシー改善作用（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.1.1）
- 11) MPTP 処置マーモセットに対する運動機能障害改善作用（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.1.2.1）
- 12) MPTP 処置マーモセットにおけるレボドパとの併用効果（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.1.2.3）
- 13) MPTP 処置マーモセットの不随意運動に対する作用（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.2.2.1.2）
- 14) 単回投与時の薬物動態試験（国内・健康成人）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.2）
- 15) 反復投与時の薬物動態試験（国内・健康成人）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.2）
- 16) 社内資料：生物学的同等性試験（イストラデフィリン錠 20mg「ケミファ」）
- 17) 相互作用試験（海外・ミダゾラム/ケトコナゾール）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.14）
- 18) 相互作用試験（海外・アトルバスタチン）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.15）
- 19) 相互作用試験（海外・ジゴキシン）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.16）
- 20) 薬物動態試験（海外・喫煙者）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.2.2.2.3）
- 21) 蛋白結合率（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.2.3.4.1）
- 22) Brooks DJ, et al. : Synapse. 2008 ; 62 : 671-681
- 23) 代謝酵素の同定（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.4.5.3.2）
- 24) CYP 阻害作用（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.4.5.4.2）
- 25) マスバランス試験（海外・健康成人）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.2.2.2.4、2.7.6.8）
- 26) Caco-2 を用いた検討（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.6.4.3.4）
- 27) 薬物動態試験（海外・腎機能低下患者）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.11）
- 28) 薬物動態試験（海外・肝機能低下患者）（ノウリアスト錠：2013年3月25日承認、申請資料概要 2.7.6.12）

料概要 2.7.2.2.2.2、2.7.6.12)

- 29) 長期反復投与毒性試験及びがん原性試験における肺の変化（ノウリアスト錠：2013 年 3 月 25 日承認、申請資料概要 2.6.6.9.2.1)
- 30) 静脈内自己投与による強化効果の検索に関する試験（ノウリアスト錠：2013 年 3 月 25 日承認、申請資料概要 2.6.6.8.3.2)
- 31) 長期反復投与毒性試験及びがん原性試験における脳の鉍質沈着（ノウリアスト錠：2013 年 3 月 25 日承認、申請資料概要 2.6.6.9.2.4)
- 32) ヘアレスラットを用いた光毒性試験（ノウリアスト錠：2013 年 3 月 25 日承認、申請資料概要 2.6.6.8.4.1.2)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
該当しない
2. 海外における臨床支援情報
該当しない

XⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報
該当資料なし
2. その他の関連資料
該当資料なし

