

◎ベシケア OD 錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ソリフェナシン コハク酸塩 (U) Solifenacin Succinate 【分類】 過活動膀胱治療剤

【単位】 Δ 2.5mg・◎5mg/OD 錠

【常用量】 5mg/日(最大 10mg). 肝障害時および Ccr30mL/min 未満の腎障害時には 2.5mg より開始 [最大 5mg/日]

【用法】 分 1

【透析患者への投与方法】 2.5mg/日より開始し最大 5mg/日 (5)

【その他の報告】 腎障害により消失が遅延して AUC が増大するので, 最大 5mg/日 (Smulders RA, et al: J Pharmacol Sci 103:67-74, 2007)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 Ccr 30~80mL/min : 5mg より開始, Ccr 30mL/min 未満 : 2.5mg より開始, 最大 5mg (1)

【その他の報告】 腎機能正常者の AUC に比べ, 軽度~中等度腎障害 1.5 倍, 高度腎障害 2 倍高値になり, 高度腎障害患者では最大 5mg/日 (Smulders RA, et al: J Pharmacol Sci 103:67-74, 2007) Ccr 30mL/min 未満では 50%に減量 (FDA)

中等度以上の肝障害, Ccr 30 未満の腎障害, CYP3A4 阻害剤併用者では最大 5mg/日 (Doroshenko O, et al: Clin Pharmacokinet 2009 PMID: 19566112)

高齢者, 腎障害例でも減量の必要なし (Morales-Olivas FJ, et al: Arch Esp Urol 2010 PMID: 20157218)

) Ccr 30mL/min 未満の高度腎障害者で AUC 2.1 倍, Cmax 1.3 倍, 半減期 1.6 倍 (1)

【特徴】 唾液腺に比べ膀胱 (M3) に選択性の高い抗コリン剤 (1) イソキノリン誘導体で, M3 に親和性が高く, M1, M2 にも親和性がある [親和性は M3>M1>M2 の順]. 唾液腺分泌抑制作用はオキニプチンの 1/12. 尿意切迫感も改善する. 半減期が長い.

吸収, 消失ともに遅く, 作用の持続性と副作用の回避に関連していると考えられる. 女性の過活動膀胱 (OAB) には直ちに抗コリン薬を投与してよいが, 男性 (特に 50 歳以上) の場合は前立腺肥大による OAB の可能性が高く, α 1-blocker の投与を最優先させ症状が改善しない場合には選択してもよい (過活動膀胱診療ガイドライン 2008)

【主な副作用・毒性】 ショック, 肝機能障害, 尿閉, 口内乾燥, 便秘, 霧視, QT 延長, 徐脈, 心房細動, 頻脈, 動悸, 口の感覚鈍麻, 筋力低下, 認知機能障害, せん妄, 麻痺性イレウスなど

【安全性に関する情報】 フェンテロジンよりも便秘を起こしやすいかもしれない (Ito H, et al: In Vivo 2022 PMID: 35738641) トルテロジンよりも便秘や霧視が多いかもしれない (Luo D, et al: Int Urogynecol J 2012 PMID: 22310924) 中枢 M1 受容体にも作用し, 認知機能への影響は未評価 (Dantas LP, et al: Braz J Med Biol Res 2022 PMID: 35320336) 10mg/日で精神症状を認めた 1 例 (Kirsavoglu B, et al: Gen Psychiatr 2021 PMID: 34723090)

【F】 88% (1) 90% (U, 宮田桂司: 日薬理誌 126:341~345,2005)

【tmax】 10mg 単回服用時 5.67hr (1) 3~8hr (U)

【代謝】 主として CYP3A4 で代謝 (1) 酸化, 水酸化により活性を有する代謝物と 3 つの不活性代謝物に変換される (U) 代謝物 M3 [4R-水酸化体] の活性は未変化体の 40% (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 15%未満 (U) 10%未満 (1) 尿中回収率 69.2% (U) 70% (1) 代謝物 M3 の尿中回収率は 8% (1) 【CL/F】 男性 6.95L/hr, 女性 5.76L/hr (1) CL/F は α 1-AGP, 年齢, Scr の上昇により低下 (1)

【t1/2】 40hr (1) 45~68hr (U) 健康人 68.2 \pm 27.2hr, 軽度腎障害 89.1 \pm 34.5hr, 中等度腎障害 90.6 \pm 27.3hr, 高度腎障害 111 \pm 38.3hr (Smulders RA, et al: J Pharmacol Sci 103:67-74, 2007)

【蛋白結合率】 96.1% [主に AAG] (1) 98% (U)

【Vd】 600L/man [iv] (1,U)

【MW】 480.55

【透析性】 データなし (1) 除去されないと思われる (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない

【薬物動態】 肝機能障害者で AUC1.6 倍, t1/2 は 2 倍 (1) 【pKa】 8.5 (1)

【主な臨床報告】 OAB に対するミラベグロンとの併用治療成績 (Gratzke C, et al: Eur Urol 2018 PMID: 29866467)

プロピペリンよりも女性の OAB に有効 (Wada N, et al: Low Urin Tract Symptoms 2011 PMID: 26676350)

【備考】 霧視等の眼調節障害, 傾眠が起こることがあるため, 危険を伴う作業に従事する場合には注意 (1)

【更新日】 20230504

※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。