

## △ステープラ OD 錠, ▼ウリトス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 イミダフェナシン imidafenacin 【分類】 過活動膀胱治療剤 (抗コリン剤)

【単位】  $\Delta 0.1\text{mg/錠}$

【常用量】  $0.2\text{mg/日}$  [最大  $0.4\text{mg}$ ]

【用法】 1日2回 朝・夕食後

【透析患者への投与方法】 重度の腎障害患者は1回  $0.1\text{mg}$  1日2回投与 [通常量] (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 重度の腎障害患者は1回  $0.1\text{mg}$  1日2回投与 [通常量] (1)

【特徴】 ムスカリン受容体サブタイプの M3 及び M1 受容体に対して選択的に作用し、膀胱平滑筋収縮抑制作用とアセチルコリン遊離抑制作用を示す。唾液腺に比べ膀胱に選択的な作用を示すが、口渇の副作用は約3割に出現している (1)

【主な副作用・毒性】 急性緑内障、口渇、便秘、羞明、霧視、眠気、胃不快感、不整脈など

【安全性に関する情報】 認知機能障害に関連した2症例 (Shiota T, et al: BMC Res Notes 7:672, 2014 PMID: 25252702)

【吸収】 約40%が初回通過効果を受ける (1)

【F】 はほぼ完全に吸収されるが初回通過効果により F は 57.8% (1)

【tmax】 1.5hr (1)

【代謝】 肝の薬物代謝酵素 CYP3A4 及び UGT1A4 により代謝 (1) メチルイミダゾール基が酸化された M-2、また M-2 のメチルイミダゾール基が環開裂を受けた M-4 及び未変化体の N-グルクロン酸抱合体である M-9 で、M-2 及び M-4 への代謝には主として CYP3A4 が、M-9 への代謝には主として UGT1A4 が関与 (1) M-2 と N-グルクロニド (M-9) は初回通過効果により生成する (Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 10%未満 (1) 回収率: 尿中 65.6%、糞中 29% [192hr まで] (Ohmori S, et al: Drug Metab Dispos 35:1624-33, 2007)

【CL/F】  $35.5\text{L/hr}$  (1)  $29.5 \pm 6.3\text{L/hr}$  [iv] (Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008) CL/F は加齢により低下する (Ohno T, et al: Drug Metab Pharmacokinet 23: 456-63, 2008) 【腎 CL】  $3.44 \pm 1.08\text{L/hr}$  (Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008)

【t1/2】 約 3hr (1) 生体内半減期は 72hr (Ohmori S, et al: Drug Metab Dispos 35:1624-33, 2007)

【蛋白結合率】 87.1~88.8% (アルブミン, AAG) (1)

【Vd】  $147\text{L/man}$  (1)  $V_{ss} : 122 \pm 28\text{L/man}$  (Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008)

【MW】 319.40

【透析性】 データなし (1) 蛋白結合率が高く、Vd がやや大きいため透析されにくいと思われる (5)

【O/W 係数】 4.47 [1-オクタノール/buffer, pH6.08] (1)

【相互作用】 CYP3A4 阻害剤による代謝阻害に注意 (1) イトラコナゾール併用により未変化体の Cmax が 1.3 倍、AUC が 1.8 倍に上昇する (Ohno T, et al: J Clin Pharmacol 48: 330-4, 2008) 未変化体や代謝物は CYP を阻害しない (Kanayama N, et al: Xenobiotica 37: 139-54, 2007)

【更新日】 20211108

※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。