△ベタニス錠　［内］

【重要度】★★　【一般製剤名】ミラベグロン　Mirabegron　【分類】β3受容体刺激性過活動膀胱治療薬

【単位】△25mg・△50mg/錠

【常用量】50mg/日

【用法】1日1回食後

【透析患者への投与方法】設定されていない（1）

【その他の報告】12.5～25mg/日から開始（5）

【保存期CKD患者への投与方法】CKD G4［eGFR 15～29mL/min/1.73m^2]では25mg/日から開始［AUCが約2倍に上昇するため］（1）

【その他の報告】高度腎障害患者ではAUCが118%，Cmaxが92%上昇するが個人差は大きい（Dickinson J, et al: Clin Drug Investig 2013 PMID: 23208320）

【特徴】β3受容体刺激薬で膀胱容量を増大（蓄尿機能の増大）させる．過活動膀胱における尿意切迫感，頻尿および切迫性尿失禁に適用．下部尿路閉塞を合併していればその治療を優先させる．膀胱のβ受容体はβ3が97%を占める．

【主な副作用・毒性】消化器症状，便秘，尿閉，頭痛，白血球減少，口内乾燥，動悸，心室性期外収縮，回転性めまい，倦怠感，浮腫，肝機能検査値異常，CK上昇，発疹，高血圧，霧視，振戦，傾眠など

【安全性に関する情報】緑内障患者では定期的に眼科を受診（1）生殖可能年齢の患者への投与は原則不可（1）血圧の上昇および脳・心血管系イベントとの関連が報告（UK安全性情報2015）血圧上昇が発現することがあるため，定期的に血圧測定を行う（1）便秘誘発リスクはなさそうである（Ito H, et al: In Vivo 2022 PMID: 35738641）抗コリン薬に比べ心血管イベントリスクを増大させない（Hoffman V, et al: Drug Saf 2021 PMID: 34236595）

【吸収】高脂肪食摂取後には空腹時に比べCmaxが約2倍に上昇（1）

【F】25mg：28.9%，50mg：35.4%，100mg：45.0%と用量依存的に上昇（1）

【tmax】3～4hr（1）

【代謝】エステラーゼによる加水分解，CYPによる酸化的代謝，グルクロン酸抱合などで代謝（1）代謝物の血中存在率は未変化体に比べ低値で活性も弱い（1）一部がCYP3A4で代謝され，2D6，P-gpを阻害する（1）

【排泄】尿中未変化体排泄率25%［160mg，po］（1）尿中回収率55%，糞便中回収率34%（1）

【CL/F】191L/hr（1）腎機能低下によりCL/Fは低下（1）

【t1/2】28～36hr（1）腎障害時にも変化なし（1）

【蛋白結合率】76.3～76.9%［主にAlb］（1）

【Vd】1643L/man［iv］（1）

【MW】396.51

【透析性】低いと思われる（5）

【O/W係数】logP=0.4［オクタノール/水系，pH6.9］（1）

【薬物動態】吸収は非線形でCmaxおよびAUC比は用量比を越えて上昇（1）男性に比べ女性では反復投与時に曝露量が高くなる（1）

【相互作用】CYP2D6，P-gpを阻害する（1）フレカイニド，プロパフェノンと併用禁忌［ともに催不整脈作用がありさらにCYP2D6阻害による抗不整脈薬の血中濃度上昇の可能性］（1）CYP2D6の基質薬物の血中濃度が上昇（1）ジゴキシンの血中濃度が1.27倍上昇［100mg投与時］（1）CYP3A4阻害剤や誘導剤の影響を受ける（1）

【肝障害患者への投与方法】重度の肝障害患者には禁忌，中等度の肝障害患者には25mg/日から開始（1）

【備考】徐放性製剤であり粉砕・分割不可，かまずに服用する（1）

【更新日】20230606

※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。