

△トビエース錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】フェソテロジン フマル酸塩 Fesoterodine Fumarate 【分類】過活動膀胱治療薬

【単位】△4mg・△8mg/錠

【常用量】

■OABにおける尿意切迫感・頻尿及び切迫性尿失禁

4mg/日 [最大8mg]

※トルテロジン2mgからの切り替えでも通常4mg/日からの開始でよい(1)

■神経経因性膀胱における排尿管理

体重25kg超の小児に4mg/日 [最大8mg] 増量には1週間以上あける

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】最大4mg/日(1)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 30mL/min未満:最大4mg/日 [活性代謝物トルテロジン5-ヒドロキシメチル体(5-HMT)の血漿中濃度が上昇する可能性](1)

【特徴】OAB, 神経因性膀胱治療薬。トルテロジンの活性代謝物のプロドラックで、活性体が膀胱選択性の高いムスカリン受容体拮抗作用を有する。フェソテロジンには抗コリン活性がなく、非特異的エステラーゼにより代謝され、活性体の5-HMTに変換される。トルテロジンは増量できないが、本剤は8mgまで増量できる。

【主な副作用・毒性】尿閉, 膀胱炎, 血管浮腫, 眼乾燥, 霧視, 頭痛, 傾眠, 味覚障害, 頻脈, 高血圧, 口内乾燥, 便秘, 下痢, 皮膚障害など

【安全性に関する情報】便秘に関連する (Ito H, et al: In Vivo 2022 PMID: 35738641) 眼調節障害, めまい, 眠気等のため自動車の運転等注意(1)

【吸収】食事の影響を受けない(1) ka=0.0935/hr(1)

【F】活性体として52%(1)

【tmax】4~5hr(1)

【代謝】エステラーゼにより活性体であるトルテロジン5-ヒドロキシメチル体(5-HMT)に代謝される(1)5-HMTは主にCYP2D6によりカルボキシン体に, 主にCYP3A4によりN-脱アルキル化体で代謝(1)CYP2D6のPMではEMに比べて5-HMTのAUCが2倍に上昇(1)

【排泄】尿中活性体[5-HMT]排泄率16% [po, 96hrまで](1)尿中回収率70% [po](1)5-HMTはP-gpの基質(1)

【CL/F】145L/hr(1)Ccrが80mL/minから20mL/minに低下するとCL/Fは34%低下する(1)活性体の腎CL250mL/mi (Malhotra B, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2008 PMID: 19000553)

【t1/2】8~9hr(1)静注では4hrであり, フリップフロップの関与あり(1)

【蛋白結合率】50% [Alb, AAG](1)

【Vd】Vd/F 222L/man(1)169L/man [5-HMT, iv](1)

【分布】活性体はP-gpの基質であり, 中枢移行が制限されている (Heesakkers J, et al: Can Geriatr J 2022 PMID: 35310472)

【MW】527.65

【透析性】資料なし(1)トルテロジンのデータよりおそらく低い(5)

【OW係数】LogP=1.42 [1-オクタノール水系, pH7.4](1)

【薬物動態】いくつかのファクターでPKは変化し, 状態に応じて4mgから8mgに増量できるが, 4mg上限が望ましいケースもある (Simon HU, et al: Swiss Med Wkly 2009 PMID: 19145494)

トルテロジンよりもPKの個人差が小さい (Malhotra B, et al: Br J Clin Pharmacol 2011 PMID: 21352267)

【相互作用】ワルファリンとの相互作用を認めない (Malhotra B, et al: Br J Clin Pharmacol 72: 257-62, 2011)

【主な臨床報告】4~8mg/日でOABに有効 [phase2] (Yamaguchi O, et al: Low Urin Tract Symptoms 2011 PMID: 26676351)

高齢者のOABにも有効で安全であろう (Chapple C, et al: Curr Med Res Opin 2015 PMID: 25798911)

4~8mg/日でOABに有効 (Dell' Utri C, et al: Int Urogynecol J 2012 PMID: 22411206)

高齢者での認知機能低下との関連は示されていない (Wagg A, et al: Drugs Aging 2015 PMID: 25673122)

女性のOABでの有効性あり (Yokoyama O, et al: Int J Urol 2018 PMID: 29224251)

【備考】徐放性製剤のため粉碎不可(1)

【更新日】20230502

※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。