

## ▼スインブロイク錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ナルデメジン トシル酸塩 Naldemedine Tosilate 【分類】オピオイド誘発性便秘症治療薬 [末梢性 $\mu$ オピオイド受容体拮抗薬]

【単位】▼0.2mg/錠

【常用量】0.2mg/日

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (1) 高度腎障害患者でわずかに AUC が増大 (1)

【特徴】末梢性 $\mu$ オピオイド受容体拮抗薬 (peripherally-acting mu-opioid receptor antagonist : PAMORA)。消化管のオピオイド受容体に結合し、オピオイド鎮痛薬に拮抗することによりオピオイド誘発性便秘を改善する。モルヒナン骨格を有する化合物であり、血液脳関門の透過性を低下させること等を目的として側鎖が追加されている。

【主な副作用・毒性】下痢、腹痛、悪心、食欲不振、倦怠感など

【安全性に関する情報】BBB が傷害されている場合には中枢移行する可能性がある (1)

【F】25~37% [ラット] (1)

【tmax】0.5hr (1) 食後投与で 2.5hr (1)

【代謝】CYP3A4 でノルナルデメジンに代謝され、UGT1A3 によってナルデメジン 3-G および 6-G へと代謝 (1) 血中では主に未変化体で存在 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 20%、尿中回収率 57.3% [oxadiazole 体]、20.4% [carbonyl 体] (1) P-gp の基質 (1)

【CL/F】7.46~9.35L/hr (1)

【t1/2】5~9hr (1)

【蛋白結合率】93.2~94.2% (1)

【Vd/F】155L/man (1) BBB を通過しない (1)

【MW】742.84 [メシル酸塩]

【透析性】ほとんど除去されない (1)

【O/W 係数】1.02 [1-オクタノール水系] (1)

【相互作用】CYP3A4 関連の相互作用に注意 (1) P-gp 阻害剤併用で中枢移行性が増大してオピオイドの鎮痛効果が減弱する可能性がある (1)

【主な臨床報告】0.2mg/日が臨床有効量 (Webster LR, et al: Pain Med 2017 PMID: 28371937) 0.2mg/日が臨床有効量で最も高頻度な有害作用は下痢 (Katakami N, et al: J Clin Oncol 35: 1921-8, 2017 PMID: 28445097) がん患者オピオイド誘発便秘に有効でオピオイド離脱を起こさない (Katakami N, et al: J Clin Oncol 35: 3859-66, 2017 PMID: 28968171)

【備考】短期間保管なら粉碎可と思われる (5)

【更新日】20210720

※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。