

◎ブラダロン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 フラボキセート塩酸塩 (U) Flavoxate Hydrochloride 【分類】 頻尿治療剤

【単位】 ◎200mg/錠

【常用量】 600mg/日

【用法】 分3

【透析患者への投与方法】 常用量 [残腎機能により必要性を判断] (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 常用量 (5)

【特徴】 実質膀胱容量を増大し排尿回数を減少、刺激膀胱状態を改善、膀胱排尿力を保持。中枢性の排尿反射抑制作用、膀胱平滑筋に対する Ca 拮抗作用、PDE 阻害作用による膀胱の直接弛緩作用により頻尿や残尿感を改善すると推察されている (1)

【主な副作用・毒性】 ショック、胃腸障害、めまい、しびれ感、眼圧亢進、調節障害、尿閉、肝障害など。霧視、羞明、嗜眠などにも注意。

【安全性に関する情報】 弱い副交感神経抑制作用 (抗コリン作用) があり、腸管運動の抑制作用のため幽門、十二指腸及び腸管が閉塞している患者や、排尿筋を弛緩、膀胱括約筋を収縮させるため下部尿路に高度の通過障害のある患者には禁忌、緑内障患者に注意 (1) 弱い抗ヒスタミン作用、局所麻酔作用、鎮痛作用あり (U) 高用量で弱い抗コリン作用がもたらされる (U)

【吸収】 吸収は経口投与後 55min で始まり完全に吸収 (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Com 1976 PMID: 1026965) 消化管から良好に吸収される (U)

【F】 100% (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Com 1976 PMID: 1026965)

【tmax】 112min (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Com 1976 PMID: 1026965)

【代謝】 速やかに 3-methyl-flavone-8-carboxate (MFCA) に代謝される (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Com 1976 PMID: 1026965)

【排泄】 24hr 以内に 57% が尿中に回収される (U) 尿中回収率 57% でほぼ遊離型の MFCA およびその抱合体で、尿中未変化体排泄率 0% (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Commun 1976 PMID: 1026965)

【t1/2】 フラボキセート 5min, MFCA 35min (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Com 1976 PMID: 1026965) 2.7hr (1)

【蛋白結合率】 フラボキセート 0%, MFCA は血漿蛋白と強く結合し血漿中にとどまり、フラボキセートは臓器に分布するため血中にはフラボキセートとしてはほとんど存在しない (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Com 1976 PMID: 1026965)

【Vd】 0.23kg/L (Bertoli M, et al: Pharmacol Res Com 1976 PMID: 1026965)

【MW】 427.92 [塩酸塩]

【透析性】 活性体の蛋白結合率が高いと思われるため、透析では除去されにくいと思われる (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない

【主な臨床報告】 他の OAB 治療薬である Emepronium, Propantheline, Phenazopyridine と比較して有効 (Sweeney P, et al: Eur Rev Med Pharmacol Sci 2016 PMID: 27649675)

【備考】 脳橋排尿抑制領域からの下降神経経路を抑制すると推測 (Kimura Y, et al: Int J Urol 1996 PMID: 8776621) 平滑筋 L 型 Ca 受容体拮抗作用 (Tomoda T, et al: Br J Pharmacol 2005 PMID: 15965499)

【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。