

◎フリバス OD錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ナフトピジル Naftopidil 【分類】 前立腺肥大症に伴う排尿障害治療薬

【単位】 ◎25mg・△50mg・◎75mg/OD錠

【常用量】 25～75mg/日 [25mg/日から開始し、効果不十分な場合には1～2週間の間隔をおいて50～75mg/日に増量]

【用法】 分1

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5) 【その他の報告】 透析患者での体内動態の変化は認めない (1)

【保存期 CKD患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【特徴】 前立腺・尿道の $\alpha 1$ 受容体 ($\alpha 1D$) を選択的に遮断し、前立腺・尿道の平滑筋収縮を抑制することにより、尿道内圧を低下させ、前立腺肥大症に伴う排尿障害を改善させる。頻尿タイプに適用されることが多い。

【主な副作用・毒性】 めまい、頭痛・頭重、耳鳴り、ふらつき、倦怠感、立ちくらみ、低血圧、AST・ALT上昇、便秘、胃部不快感、口渇、下痢、浮腫、悪寒、眼瞼浮腫、肩こり、発疹、搔痒感など

【吸収】 $ka=0.79/hr$ (1) 70% [ラット] (1)

【F】 約18% (1) 9% [ラット] (Peter G, et al: Arzneimittelforschung 41: 924-931, 1991)

【 t_{max}] 50mg 食後投与時 $2.20 \pm 1.04hr$ 、空腹時は1時間以内 (1)

【代謝】 主にCYP2C9, 3A4により代謝 (1) CYP2A6, 2C19, 2D6も関与している可能性 (1) 主代謝経路は未変化体のグルクロン酸抱合、メトキシフェニル基の水酸化 (1) フェニル水酸化体の生成は主にCYP3A4, 2C9, 2D6、脱メチル体の生成には主にCYP2C9、ナフチル水酸化体の生成には主にCYP3A4が関与 (1) 代謝物の水酸化体の $\alpha 1$ 受容体遮断活性は未変化体の1/24 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率は0.01%以下 (1) 【CL/F】 $158L/hr \sim 226L/hr$ (1)

【 $t_{1/2}$] $13.2 \pm 5.4hr$ (1) 【 ke] $0.32/hr$ (1)

【蛋白結合率】 98.5% (1)

【Vd/F】 $423.3L/man$ (1)

【MW】 392.49

【透析性】 蛋白結合率が高く、Vdも大きいため、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 【O/W係数】 1000以上 [クロロホルム系, pH6.8] (1) 【pKa】 3.7, 6.7 (1)

【主な臨床報告】 シロドシンよりも射精障害が少ない。おそらく α 受容体サブタイプ選択性の違い (Yamaguchi K, et al: Int J Urol 2013 PMID: 23731168) フロプロピオンよりも10mm以下の遠位尿管結石排石までの期間が有意に短い (Kohjimoto Y, et al: World J Urol 2015 PMID: 25869815)

【備考】 起立性低血圧、立ちくらみ、血圧変化に注意。

【更新日】 20220428

※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。