△ステーブラ OD 錠，▼ウリトス錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】イミダフェナシン　Imidafenacin　【分類】過活動膀胱治療剤［抗コリン］
【単位】△0.1mg/錠
【常用量】0.2mg/日［最大 0.4mg］
【用法】1 日 2 回 朝・夕食後
【透析患者への投与方法】重度の腎障害患者は 1 回 0.1mg1 日 2 回（1）
【保存期 CKD 患者への投与方法】重度の腎障害患者は 1 回 0.1mg1 日 2 回（1）
【特徴】ムスカリン受容体サブタイプの M3 及び M1 受容体に対して選択的に作用し，膀胱平滑筋収縮抑制作用とアセチルコリン遊離抑制作用を示す．唾液腺に比べ膀胱に選択的な作用を示すが，口渇の副作用は約 3 割に出現している（1）半減期が短い．
【主な副作用・毒性】急性緑内障，口渇，便秘，羞明，霧視，眠気，胃不快感，不整脈など
【安全性に関する情報】認知機能障害に関連した可能性のある 2 症例（Shiota T, et al: BMC Res Notes 7:672, 2014 PMID: 25252702）
中枢ムスカリン受容体にはほとんど影響しない（Yamada S, et al: Int Neurourol J 2012 PMID: 23094215）
ソリフェナシンよりも長期投与時の口渇が少ない（Zaitsu M, et al: Adv Urol 2011 PMID: 22046182）
オキシブチニンよりも脳内ムスカリン受容体占拠率が低く安全性が高い可能性［サル］（Yamamoto S, et al: Neuroimage 2011 PMID: 21712096）
疫学的に認知機能への影響は認めず（Sakakibara R, et al: Low Urin Tract Symptoms 2014 PMID: 26663594）
【吸収】約 40%が消化管で初回通過効果を受ける（1）
【F】ほぼ完全に吸収されるが初回通過効果により F は 57.8%（1）
【tmax】1.5hr（1）
【代謝】肝の薬物代謝酵素 CYP3A4 及び UGT1A4 により代謝（1）メチルイミダゾール基が酸化された M-2，また M-2 のメチルイミダゾール基が環開裂を受けた M-4 及び未変化体の N－グルクロン酸抱合体である M-9 で，M-2 及び M-4 への代謝には主として CYP3A4 が，M-9 への代謝には主として UGT1A4 が関与（1）M-2 と N-グルクロニド（M-9）は初回通過効果により生成する（Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008）
【排泄】尿中未変化体排泄率 10%未満（1）回収率：尿中 65.6%，糞中 29%［192hr まで］（Ohmori S, et al: Drug Metab Dispos 35:1624-33, 2007）
【CL/F】35.5L/hr（1）29.5±6.3L/hr［iv］（Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008）CL/F は加齢により低下する（Ohno T, et al: Drug Metab Pharmacokinet 23: 456-63, 2008）【腎 CL】3.44±1.08L/hr（Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008）
【t1/2】約 3hr（1）生体内半減期は 72hr（Ohmori S, et al: Drug Metab Dispos 35:1624-33, 2007）
【蛋白結合率】87.1～88.8%（アルブミン，AAG）（1）
【Vd】147L/man（1）Vss：122±28L/man（Ohno T, et al: Br J Clin Pharmacol 65:197-202, 2008）
【MW】319.40
【透析性】データなし（1）蛋白結合率が高く，Vd がやや大きいため透析されにくいと思われる（5）
【O/W 係数】4.47［1-オクタノール/beffer，pH6.08］（1）
【薬物動態】PPK 解析（Ohno T, et al: Drug Metab Pharmacokinet 2008 PMID: 19122340）
【相互作用】CYP3A4 阻害剤による代謝阻害に注意（1）イトラコナゾール併用により未変化体の Cmax が 1.3 倍，AUC が 1.8 倍に上昇する（Ohno T, et al: J Clin Pharmacol 48: 330-4, 2008）未変化体や代謝物は CYP を阻害しない（Kanayama N, et al: Xenobiotica 37: 139-54, 2007）CYP の阻害作用はない（Kanayama N, et al: Xenobiotica 2007 PMID: 17484517）
【主な臨床報告】ソリフェナシンよりも口渇が少なく，治療継続率が高かった（Yokoyama T, et al: Urol Int 2013 PMID: 23207959）
OAB 治療の有効性評価においてフェソテロジンに非劣勢で，安全性も同等（Lee KS, et al: Int J Clin Pract 2013 PMID: 24246210）
OAB に対する抗コリン薬と β3 作動薬の有効性は同等であり，副作用の傾向を評価して適用を決定するのが望ましい（Mostafaei H, et al: Eur Urol Focus 2022 PMID: 34563481）
開始から 3 日目には OAB の症状が緩和した（Kitagawa Y, et al: Urol Int 2011 PMID: 21325789）
タムスロシン治療中の BPH を合併した OAB に併用して効果的（Takeda M, et al: Urology 2013 PMID: 23953605）
【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。