

◎レミッチ OD 錠, ○ナルフラフィン塩酸塩 OD 錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ナルフラフィン塩酸塩 Nalfurafine Hydrochloride 【分類】経口そう痒症改善剤

【単位】◎2.5 μ g/OD 錠

【常用量】2.5 μ g/日 [最大5 μ g]

【用法】分1 [夕食後もしくは寝る前] (HDで除去されるためHD前には内服しない)

【透析患者への投与方法】常用量 (1) 夕食後もしくは就寝前などに投与し, HD前には服用しない (1)

【その他の報告】不眠を訴える場合には「透析のない日は朝食後, 透析日はHD後」も選択肢 (5)

2.5~5 μ g/日の2年間投与でも有効で効果の減弱はなく, 副作用は投与開始2週間以内に出現しており長期投与での安全性も高い (高橋直子, 他: 透析会誌 46: 371-8, 2013) 透析掻痒症およびそれに伴う睡眠障害に有用 (山田成樹, 他: 透析会誌 45: 1133-40, 2012)

【PD】常用量 [PD液交換のタイミングを考慮] (1) PD除去性は限定的であり, APDを含めて任意のタイミングで投与可 (5)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【特徴】選択的 κ 受容体作動薬。内因性オピオイドの β -エンドルフィンによる μ 受容体の活性化によるかゆみの発現に対して, 相反する作用を發揮する κ 受容体の活性化 (ダイノルフィンによる作用) をもたらすと考えられている。抗ヒスタミン剤などが効きにくいかゆみに対しても効果がある。 κ 受容体への結合選択性は, μ 受容体より9倍, σ 受容体より1980倍強い。透析患者, 慢性肝疾患患者のそう痒症の改善 (既存治療で効果不十分な場合に限り) に適用。

【主な副作用・毒性】不眠, 眠気, めまい, プロラクチン上昇, TSH変動, 倦怠感, 不穏, 脱力感, いらいら, 頭痛, 幻覚, 悪心, 嘔吐, 便秘, 胸部不快感, 肝機能検査値異常, 好酸球増多など

【中毒症状】幻覚, 不安, 重度の眠気, 不眠等

【安全性に関する情報】投与後に意識レベルの低下血圧低下を来した透析症例の報告 (水野真理, 他: 第56回日本透析医学会 2011) 自動車運転禁止 (1) プロラクチン値上昇等をモニター (1) 脱毛との関連が疑われたHD症例 (Kida Y, et al: Intern Med 2024 PMID: 39401915)

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】58.1% (1)

【tmax】3~4hr (1)

【代謝】CYP3A4により, 脱シクロプロピルメチル化され (de-CPM), さらにグルクロン酸抱合される (de-CPM-G) 経路と, グルクロン酸抱合された後 (NFA-G), 脱シクロプロピルメチル化される (de-CPM-G) 経路がある (1)

【排泄】糞中および尿中排泄。未変化体の尿中排泄率23~32%、糞中排泄率4.7~6.8%、代謝物 de-CPM の尿中排泄率2.8~3.7%、糞中排泄率28~40%、代謝物 NFA-G の尿中排泄率1.6~3.5% (外国人) (1)

【CL】51±19L/hr (単回), 16±5L/hr (反復) (1) 【腎CL】170~210mL/min (1)

【t1/2】単回14hr, 反復25hr [HD患者] (1)

【蛋白結合率】73.3~76.3% (1)

【Vd】880±251L/man (単回), 610±135L/man (反復) (1)

【MW】513.03 (塩酸塩)

【透析性】服用後4hr以内なら透析される (1) 【透析時のt1/2】7.6hr (1) 【HDクリアランス】45~62mL/min/1.5m²膜面積 (PMMA, PS, トリアセート, PAN膜) (1) 代謝物も透析で除去される (1)

【O/W係数】LogP=0.95 [1-オクタノール/buffer, pH6.8] (1)

【併用注意】CYP3A4阻害作用のある薬剤との併用により血中濃度が上昇する可能性がある (1) オピオイド系薬剤との併用で作用増強または減弱のおそれあり (1) セベラマーと12%程度, PS-Naと65%程度, PS-Caと98%程度吸着する [vitro] (1)

【更新日】20241028

※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。