

△ベタニス錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】ミラベグロン Mirabegron 【分類】β3 受容体刺激型過活動膀胱治療薬

【単位】△25mg・△50mg/錠

【常用量】50mg/日

【用法】1日1回食後

【透析患者への投与方法】設定されていない (1)

【その他の報告】12.5~25mg/日から開始 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】CKD G4 [eGFR 15~29mL/min/1.73m²]では25mg/日から開始 [AUC が約2倍に上昇するため] (1)

【その他の報告】高度腎障害患者ではAUCが118%、Cmaxが92%上昇するが個人差は大きい (Dickinson J, et al: Clin Drug Investig 2013 PMID: 23208320)

【特徴】β3 受容体刺激薬で膀胱容量を増大 (蓄尿機能の増大) させる。過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿および切迫性尿失禁に適用。下部尿路閉塞を合併していればその治療を優先させる。膀胱のβ受容体はβ3が97%を占める。BPHを伴うOABにも有効だが、尿閉や排尿困難の出現に注意。

【主な副作用・毒性】消化器症状、便秘、尿閉、頭痛、白血球減少、口内乾燥、動悸、心室性期外収縮、回轉性めまい、倦怠感、浮腫、肝機能検査値異常、CK 上昇、発疹、高血圧、霧視、振戦、傾眠など

【安全性に関する情報】緑内障患者では定期的に眼科を受診 (1) 生殖可能年齢の患者への投与は原則不可 (1) 血圧の上昇および咽・心血管系イベントとの関連が報告 (UK 安全性情報 2015) 血圧上昇が発現することがあるため、定期的に血圧測定を行う (1) 便秘誘発リスクはなさそうである (Ito H, et al: In Vivo 2022 PMID: 35738641) 抗コロナ薬に比べ心血管イベントリスクを増大させない (Hoffman V, et al: Drug Saf 2021 PMID: 34236595)

【吸収】高脂肪食摂取後には空腹時と比べCmaxが約2倍に上昇 (1)

【F】25mg : 28.9%, 50mg : 35.4%, 100mg : 45.0%と用量依存的に上昇 (1)

【tmax】3~4hr (1)

【代謝】エステラーゼによる加水分解、CYPによる酸化的代謝、グルクロン酸抱合などで代謝 (1) 代謝物の血中存在率は未変化体に比べ低値で活性も弱い (1) 一部がCYP3A4で代謝され、2D6、P-gpを阻害する (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率25% [160mg, po] (1) 尿中回収率55%、糞便中回収率34% (1)

【CL/F】191L/hr (1) 腎機能低下によりCL/Fは低下 (1)

【t1/2】28~36hr (1) 腎障害時にも変化なし (1)

【蛋白結合率】76.3~76.9% [主にAlb] (1)

【Vd】1643L/man [iv] (1)

【MW】396.51

【透析性】低いと思われる (5)

【O/W 係数】logP=0.4 [オクタノール/水系, pH6.9] (1)

【薬物動態】吸収は非線形でCmaxおよびAUC比は用量比を越えて上昇 (1) 男性に比べ女性では反復投与時に曝露量が高くなる (1)

【相互作用】CYP2D6、P-gpを阻害する (1) フレカイニド、プロパフェノンと併用禁忌 [ともに催不整脈作用がありさらにCYP2D6阻害による抗不整脈薬の血中濃度上昇の可能性] (1) CYP2D6の基質薬物の血中濃度が上昇 (1) ジゴキシンの血中濃度が1.27倍上昇 [100mg 投与時] (1) CYP3A4阻害剤や誘導剤の影響を受ける (1)

【肝障害患者への投与方法】重度の肝障害患者には禁忌、中等度の肝障害患者には25mg/日から開始 (1)

【備考】徐放性製剤であり粉砕・分割不可、かまずに服用する (1)

【更新日】20231111

※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。