◎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α1 受容体（α-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，掻痒感など
【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）肝障害時に 75%に上昇（Farthing MJ, et al: Postgrad Med J 1994 PMID: 8016009）
【tmax】50mg 食後投与時 2.20±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α1 受容体遮断活性は未変化体の 1/24（1）
グルクロン酸抱合がメジャーな代謝経路［ラット］（Liu X, et al: J Pharm Biomed Anal 2017 PMID: 27744175）UGT2B4，2B7 が関与と示唆（Liu XW, et al: Front Pharmacol 2018 PMID: 29375383）
【排泄】尿中未変化体排泄率は 0.01%以下（1）【CL/F】158L/hr～226L/hr（1）
【t1/2】13.2±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）
【肝障害患者における情報】肝障害があると経口投与時の F が上昇（17%→75%）に上昇するため，減量が必要（Farthing MJ, et al: Postgrad Med J 1994 PMID: 8016009）
【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）
小結石の排石に有用（Ohgaki K: J Clin Med Res 2019 PMID: 31236168）
遠位尿管結石の排石に有用（Zhou SG, et al: World J Urol 2011 PMID: 21845472）
BPH での他のα-blocker との比較（Castiglione F, et al: Curr Med Res Opin 2014 PMID: 24188134）
日本人の両性における神経因性膀胱のウロダイナミクスを改善（Takeda M, et al: BJU Int 2011 PMID: 21062392）
【備考】起立性低血圧，立ちくらみ，血圧変化に注意.
【更新日】20230608

※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。