

過活動膀胱治療剤

処方箋医薬品※

日本標準商品分類番号

87259

イミダフェナシン錠0.1mg「サワイ」
イミダフェナシンOD錠0.1mg「サワイ」

IMIDAFENACIN Tablets, OD Tablets [SAWAI]

イミダフェナシン製剤

貯法：室温保存(気密容器)
使用期限：外箱に表示

	錠0.1mg	OD錠0.1mg
承認番号	30200AMX00199000	30200AMX00154000
薬価収載	2020年6月	2020年6月
販売開始	2020年6月	2020年6月

※注意—医師等の処方箋により使用すること

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)



- 1) 尿閉を有する患者〔抗コリン作用により排尿時の膀胱収縮が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕
- 2) 幽門、十二指腸又は腸管が閉塞している患者及び麻痺性イレウスのある患者〔抗コリン作用により胃腸の平滑筋の収縮及び運動が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕
- 3) 消化管運動・緊張が低下している患者〔抗コリン作用により胃腸の平滑筋の収縮及び運動が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕
- 4) 閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状が悪化するおそれがある。〕
- 5) 重症筋無力症の患者〔抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。〕
- 6) 重篤な心疾患の患者〔期外収縮等の心電図異常が報告されており、症状が悪化するおそれがある。〕
- 7) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

・組成

品名	イミダフェナシン錠0.1mg 「サワイ」	イミダフェナシンOD錠0.1mg 「サワイ」
有効成分 [1錠中]	イミダフェナシン 0.1mg	
添加剤	アルファー化デンプン、結晶セルロース、酸化チタン、三酸化鉄、ステアリン酸Mg、タルク、二酸化ケイ素、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース	クロスポビドン、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール

・製剤の性状

品名	イミダフェナシン錠0.1mg 「サワイ」	イミダフェナシンOD錠0.1mg 「サワイ」
外形		
剤形	フィルムコーティング錠	素錠(口腔内崩壊錠)
性状	淡赤色～淡赤褐色 又は淡赤紫色	白色
直径(mm)	7.2	7.0
厚さ(mm)	3.4	3.5
重量(mg)	約138	約150
本体表示	イミダフェナシン 0.1 サワイ	イミダフェナシン OD0.1 サワイ

【効能・効果】

過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

- 1) 本剤を適用する際、十分な問診により臨床症状を確認するとともに、類似の症状を呈する疾患(尿路感染症、尿路結石、膀胱癌や前立腺癌等の下部尿路における新生物等)があることに留意し、尿検査等により除外診断を実施すること。なお、必要に応じて専門的な検査も考慮すること。
- 2) 下部尿路閉塞疾患(前立腺肥大症等)を合併している患者では、それに対する治療を優先させること。

【用法・用量】

通常、成人にはイミダフェナシンとして1回0.1mgを1日2回、朝食後及び夕食後に経口投与する。効果不十分な場合は、イミダフェナシンとして1回0.2mg、1日0.4mgまで増量できる。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- 1) イミダフェナシンとして1回0.1mgを1日2回投与し、効果不十分かつ安全性に問題がない場合に増量を検討すること。〔本剤を1回0.2mg 1日2回で投与開始した場合の有効性及び安全性は確立していない。〕
- 2) 中等度以上の肝障害のある患者については、1回0.1mgを1日2回投与とする。〔慎重投与〕の項参照)
- 3) 重度の腎障害のある患者については、1回0.1mgを1日2回投与とする。〔慎重投与〕の項参照)

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 排尿困難のある患者〔抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。〕
- 2) 不整脈のある患者〔抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。〕
- 3) 肝障害のある患者〔主として肝で代謝されるため、副作用が発現しやすくなるおそれがある。〕
- 4) 腎障害のある患者〔腎排泄が遅延するおそれがある。〕
- 5) 認知症又は認知機能障害のある患者〔抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。〕
- 6) パーキンソン症状又は脳血管障害のある患者〔症状の悪化あるいは精神神経症状があらわれるおそれがある。〕
- 7) 潰瘍性大腸炎の患者〔中毒性巨大結腸があらわれるおそれがある。〕
- 8) 甲状腺機能亢進症の患者〔抗コリン作用により、頰脈等の交感神経興奮症状が悪化するおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

- 1) 前立腺肥大症等の下部尿路閉塞疾患を有する患者に対しては、本剤投与前に残尿量測定を実施し、必要に応じて、専門的な検査をすること。投与後は残尿量の増加に注意し、十分な経過観察を行うこと。
- 2) 眼調節障害(羞明、霧視、眼の異常感等)、めまい、眠気があらわれることがあるので、本剤投与中の患者には、自動車の運転等、危険を伴う機械の操作に注意させること。
- 3) 過活動膀胱の症状を明確に認識できない認知症又は認知機能障害患者は本剤の投与対象とはならない。
- 4) 本剤投与により効果が認められない場合には、漫然と投与せず、適切な治療を考慮すること。
- 5) OD錠(口腔内崩壊錠)は口腔内で崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込ませること。〔適用上の注意〕の項参照)

3. 相互作用

本剤は、主として肝の薬物代謝酵素CYP3A4及びUGT1A4により代謝される。

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP3A4を阻害する薬剤 イトラコナゾール エリスロマイシン クラリスロマイシン 等	健康成人男性においてイトラコナゾールと併用したとき、本剤のCmaxは約1.3倍上昇し、AUCは約1.8倍に上昇したとの報告がある。	本剤は主としてCYP3A4で代謝されるので、これらの薬剤により本剤の代謝が阻害される。
抗コリン剤 抗ヒスタミン剤 三環系抗うつ剤 フェノチアジン系薬剤 モノアミン酸化酵素阻害剤	口渇・口内乾燥、便秘、排尿困難等の副作用が強くあらわれることがある。	抗コリン作用が増強される。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **急性緑内障**：眼圧亢進があらわれ、急性緑内障を生ずるとの報告があるので、観察を十分行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、直ちに適切な処置を行うこと。
- (2) **尿閉**：尿閉があらわれることがあるので、観察を十分に行い、症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (3) **肝機能障害**：AST(GOT)、ALT(GPT)、ビリルビンの上昇等を伴う肝機能障害があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、直ちに適切な処置を行うこと。

2) 重大な副作用(類薬)

- (1) **麻痺性イレウス**：類似化合物(他の頻尿治療剤)において麻痺性イレウスがあらわれるとの報告があるので、観察を十分行い、著しい便秘、腹部膨満感等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (2) **幻覚・せん妄**：類似化合物(他の頻尿治療剤)において幻覚・せん妄があらわれるとの報告があるので、観察を十分行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。
- (3) **QT延長、心室性頻拍**：類似化合物(他の頻尿治療剤)においてQT延長、心室性頻拍、房室ブロック、徐脈等があらわれるとの報告があるので、観察を十分行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

3) その他の副作用

	頻度不明
過敏症[※]	発疹、そう痒等
精神神経系	眠気、味覚異常、めまい、頭痛、しびれ、幻覚・せん妄
消化器	便秘、胃・腹部不快感、悪心、腹痛、腹部膨満、下痢、食欲不振、消化不良、胃炎、嘔吐、口唇乾燥、異常便、口内炎
循環器	動悸、期外収縮、血圧上昇
呼吸器	咽喉頭疼痛、咳嗽、咽喉乾燥、嗝声
血液	赤血球減少、白血球減少、血小板減少
泌尿器・腎臓	排尿困難、残尿、尿中白血球・赤血球陽性、尿路感染(膀胱炎、腎盂腎炎等)、尿中蛋白陽性、クレアチニン増加
眼	羞明、霧視、眼の異常感、眼球乾燥、眼精疲労、眼瞼浮腫、複視
肝臓	γ-GTP、アルカリホスファターゼ、AST(GOT)、ALT(GPT)、ビリルビンの上昇
その他	口渇・口内乾燥、トリグリセリド増加、浮腫、LDH増加、血中尿酸上昇、倦怠感、コレステロール増加、胸痛、背部痛、脱力感、皮膚乾燥

注)発現した場合には、投与を中止する等適切な処置を行うこと。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。動物実験(ラット)において胎児への移行が報告されている。〕
- 2) 授乳婦には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。〔動物実験(ラット)で乳汁中に移行することが報告されている。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

8. 過量投与

- 1) **症状**：尿閉、散瞳、興奮、頻脈等
- 2) **処置**：胃洗浄又は活性炭投与を行い、次にアトロピン過量投与の場合と同様の処置を行う。また、尿閉に対しては導尿等、散瞳に対してはピロカルピン投与等、各症状に応じて適切な処置を行う。

9. 適用上の注意

- 1) **薬剤交付時**：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)
- 2) **服用時**：
 - (1) OD錠(口腔内崩壊錠)は舌の上のせ唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。
 - (2) OD錠(口腔内崩壊錠)は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

10. その他の注意

マウスに2年間経口投与したがん原性試験(30、100及び300mg/kg)において、雌雄の300mg/kg群で肝細胞腺腫の増加が認められたとの報告がある。また、ラットに2年間経口投与したがん原性試験(3、7、15及び30mg/kg)において、肝細胞腺腫の増加は認められなかったとの報告がある。

【薬物動態】

生物学的同等性試験

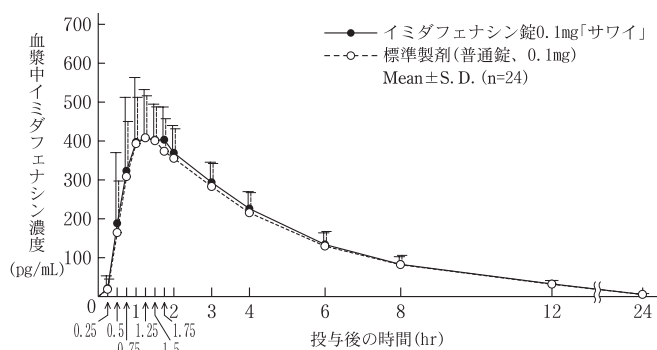
○イミダフェナシン錠0.1mg「サワイ」

イミダフェナシン錠0.1mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(イミダフェナシンとして0.1mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中イミダフェナシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (pg/mL)	Tmax (hr)	T1/2 (hr)	AUC _{0-24hr} (pg·hr/mL)
イミダフェナシン錠 0.1mg「サワイ」	457 ± 126	1.4 ± 0.4	3.9 ± 0.4	2209 ± 451
標準製剤 (普通錠、0.1mg)	443 ± 90	1.4 ± 0.4	3.8 ± 0.5	2132 ± 459

(Mean ± S. D., n=24)



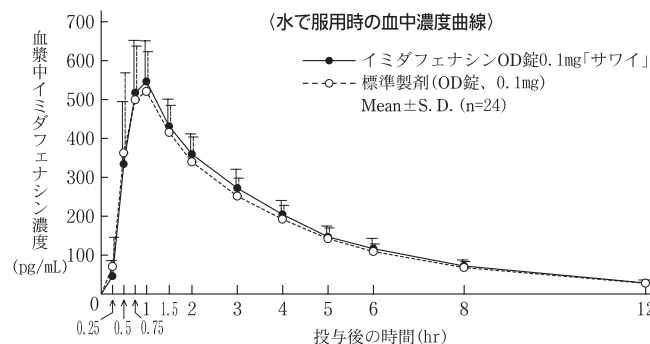
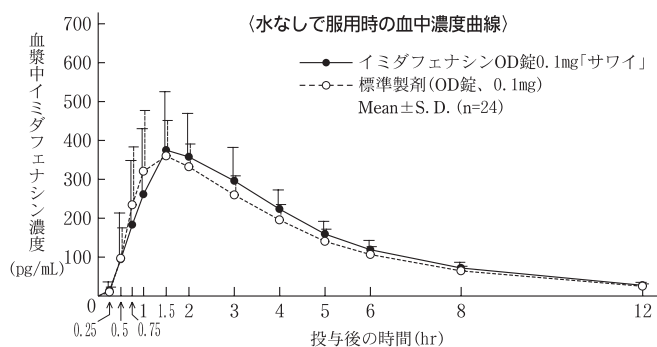
○イミダフェナシンOD錠0.1mg「サワイ」

イミダフェナシンOD錠0.1mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(イミダフェナシンとして0.1mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中イミダフェナシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (pg/mL)	Tmax (hr)	T1/2 (hr)	AUC _{0-12hr} (pg·hr/mL)	
水なし	イミダフェナシンOD錠 0.1mg「サワイ」	454 ± 89	1.5 ± 0.6	2.8 ± 0.3	1754 ± 253
	標準製剤 (OD錠、0.1mg)	410 ± 71	1.5 ± 0.6	2.9 ± 0.3	1632 ± 228
水あり	イミダフェナシンOD錠 0.1mg「サワイ」	566 ± 119	1.0 ± 0.3	2.9 ± 0.4	1983 ± 312
	標準製剤 (OD錠、0.1mg)	558 ± 134	0.9 ± 0.2	3.0 ± 0.4	1898 ± 310

(Mean ± S. D., n=24)



血漿中濃度ならびにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬効薬理】

イミダフェナシンは、ムスカリン性アセチルコリン(ACh)受容体サブタイプのうちM₃およびM₁受容体に高親和性を有する抗コリン薬である。副交感神経刺激による膀胱平滑筋の収縮反応において、M₃受容体を介した拮抗作用を示すだけでなく、神経終末においてM₁受容体を介したACh遊離の阻害をされると考えられている。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：イミダフェナシン (Imidafenacin)

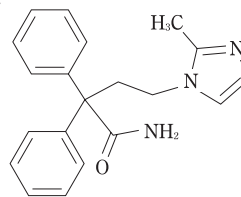
化学名：4-(2-Methyl-1H-imidazol-1-yl)-2,2-diphenylbutanamide

分子式：C₂₀H₂₁N₃O

分子量：319.40

融点：192~196℃

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。酢酸(100)に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

錠0.1mg：PTP包装(PTPシートをアルミビロー包装)及びバラ包装したものを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁴⁾

OD錠0.1mg：PTP包装(PTPシートをアルミビロー包装)したものを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁵⁾

【包装】

イミダフェナシン錠0.1mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)

バラ：200錠

イミダフェナシンOD錠0.1mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

- 1)、2) 沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]
- 3) 小林文義他, 日本排尿機能学会誌, 18(2), 292(2007).
- 4)、5) 沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355



製造販売元
沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

D01 B200502