

## ◎タケキャブ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ボノプラザン フマル酸塩 Vonoprazan Fumarate 【分類】胃酸分泌抑制剤 [カリウムイオン競合型アシッドブロッカー (P-CAB)]

【単位】◎10mg・◎20mg/錠

【常用量】■胃潰瘍：20mg/日 [8週間まで]

■十二指腸潰瘍：20mg/日 [6週間まで]

■逆流性食道炎：20mg/日 [通常4週間まで、効果不十分の場合8週間まで] 再発・再燃例で10mg/日で、効果不十分例20mg/日

■低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制：10mg/日

■NSAIDs投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制：10mg/日

■H.pylori除菌の補助：40mg/日 [抗生物質と併用して7日間]

【用法】■分1

■H.pylori除菌は分2

【透析患者への投与方法】ESRD患者でのAUCは、腎機能正常者の1.3倍 (1)

【保存期CKD患者への投与方法】排泄遅延により血中濃度が上昇することがあるため慎重投与 (1) 腎障害患者のAUCは、腎機能正常者に比べ1.3~2.4倍高い (1) 腎障害患者のAUCは健常人の2.4倍 (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【特徴】カリウムイオン競合型アシッドブロッカー (P-CAB)。胃壁細胞における酸分泌の最終段階であるプロトンポンプをカリウムイオンと競合的に阻害し、強力かつ持続的な酸分泌抑制をもたらす。投与早期からの効果発現が期待できるという。

【主な副作用・毒性】血球減少、便秘、下痢、腹部膨満感、悪心、発疹、肝機能障害、浮腫、好酸球増多など。H.pylori除菌時には偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎。

【安全性に関する情報】PPIとCD腸炎が関連 (1) ランソプラゾールに比べ、ガストリン濃度は2~3倍高く上昇 (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】不明 (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【tmax】空腹時で1.5hr、食後で3hr (1) 1.2~2.0hr (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【代謝】主に肝CYP3A4で代謝され、一部CYP2B6, 2C19, 2D6で代謝 (1) 硫酸チオキソ酵素SULT2A1でも代謝される (1) 代謝物の活性はごく弱い (1) CYP2C19遺伝的多型の影響はわずか (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【排泄】尿中未変化体排泄率12%、尿中回収率67% [po, 168hrまで] (1)

【CL/F】約90L/hr (1)

【t1/2】7~9hr (1) 7.7hr (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【蛋白結合率】85.2~88.0% (1) 80% (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【Vd/F】1000L/man (1) 1050L/man (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775)

【MW】461.46

【透析性】透析液中に1%未満が移行 (1)

【OW係数】-0.0059 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1)

【相互作用】アタザナビル、リルピピリンの吸収が低下するので併用禁忌 (1) CYP3A4阻害剤により血中濃度上昇 (1) ジゴキシンの血中濃度上昇 (1) クラリスロマイシンによりAUCが1.6倍に上昇 (1) P-gpを阻害する (1) クラリスロマイシン併用でAUCが1.8倍に上昇 (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 55: 409-18, 2016 PMID: 26369775) CYP3A4阻害作用を有し、基質薬剤 (ミダゾラム等) の代謝を阻害 (1)

【肝障害患者への投与】血中濃度が上昇するので慎重投与 (1)

【主な臨床報告】CYP2C19のEM被験者においてエソメプラゾール20mgやラベプラゾール10mgと比較して、本剤20mgは胃酸抑制効果が早期に発現しかつ持続していた (Sakurai Y, et al: Aliment Pharmacol Ther 42: 719-30, 2015 PMID: 26193978)

ピロリ除菌成功率はランソプラゾールやラベプラゾールより高く、エソメプラゾールと同等であり、胃粘膜萎縮の程度に関わらず80%以上を示した (Shinozaki S, et al: Kaohsiung J Med Sci 32: 255-60, 2016 PMID: 27316584)

20mg×2回/日によるピロリ除菌成功率は、エソメプラゾール投与例のCYP2C19のIMやPMと同等で、EMより高い (Kagami T, et al: Aliment Pharmacol Ther 43: 1048-59, 2016 PMID: 26991399)

ピロリ除菌成功率においてランソプラゾールに非劣勢 (Murakami K, et al: Gut 2016 PMID: 26935876)

びらん性食道炎患者において内視鏡的治癒率99%であり、ランソプラゾール95.5%に非劣勢 (Ashida K, et al: Aliment Pharmacol Ther 43: 240-51, 2016 PMID: 26559637)

ピロリ除菌療法においてPPIよりも除菌成功率が高く安全性にも優れる (Lyu QJ, et al: Biomed Res Int 2019 PMID: 31211144)

ピロリ除菌療法でCAM抜き2剤でも同等の効果 (Furuta T, et al: Digestion 2019 PMID: 31434101)

【備考】半錠分割可、粉砕可 (遮光) であるが、苦みがある (1)

【更新日】20220308

---

※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業務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。