

△マスーレッド錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 モリデュスタットナトリウム Molidustat Sodium 【分類】 腎性貧血治療薬 [HIF-PH 阻害薬]

【単位】 ▼5mg・▼12.5mg・△25mg・△75mg/錠

【常用量】

■保存期 CKD

新規開始：1回 25mg から開始

ESA からの切り替え：1回 25mg もしくは（目安としてダルベポエチン 30 μ g/月超，CERA 25 μ g/月超なら）50mg から開始

■HD・PD

1回 75mg から開始

いずれも最大 1回 200mg

【用法】 1日 1回食後

用量変更設定段階

5mg/12.5mg/25mg/50mg/75mg/100mg/150mg/200mg

【透析患者への投与方法】 75mg/日から開始 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 25mg もしくは 50mg/日から開始 (1) ナイーブ例の投与初期の Hb 濃度上昇は小さい (1)

腎障害は未変化体の PK に大きな影響を与えないと思われる (Lentini S, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2020 PMID: 32248614)

【特徴】 HIF-PH 阻害薬。他剤とは構造が異なる。貧血治療のガイドラインを参照して適用すること。経口鉄剤の同時投与で AUC が 1/2~1/4 に低下する。

【主な副作用・毒性】 血栓塞栓症、間質性肺疾患、鉄欠乏、めまい、眼出血、高血圧、消化器症状、浮腫、皮膚症状など

【安全性に関する情報】

【吸収】 食事により tmax が 1hr 遅れ、AUC が 23.3%低下し、Cmax が 41.1%低下 (1)

【F】 90%以上が吸収されるが、初回通過効果を受け、59% (1)

【tmax】 0.5hr (1)

【代謝】 UGT1A1 で不活性の N-グルクロン酸抱合体 [M-1] に代謝 [M-1 は AUC 比で血中に 82%存在] (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 3~6% (1) 4.12% (Lentini S, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2020 PMID: 32248614) 尿中回収率 90.7% [po] (1) BCRP の基質、M-1 は OAT3 の弱い基質 (1)

【CL】 28.7L/hr [iv] (1) 28.7~34.5L/hr [iv] (Lentini S, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2020 PMID: 32248614)

【t1/2】 健常人 6~10hr (1) 透析患者 19hr で終末相で延長 (1)

【蛋白結合率】 79.3% [主に Alb] (1)

【Vd】 Vdss 46.9L/body [iv] (1) 39.3~50.0L/body [iv] (Lentini S, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2020 PMID: 32248614)

【MW】 336.28

【透析性】 ほとんど除去されない (1)

【O/W 係数】 LogP=0.27 [1-オクタノール/水系, pH 7.5]

【pKa】 4.6

【相互作用】 UGT1A1 阻害剤併用でクリアランス低下 (1) 多価陽イオン含有経口剤：消化管吸収の低下 (1) UGT1A1 阻害剤のアタザナビル併用で AUC 約 2 倍 (van der Mey D, et al: Basic Clin Pharmacol Toxicol 2021 PMID: 33232579) CYP1A1 を阻害、M-1 は CYP2D6 を阻害 (1)

【肝障害患者への投与方法】 中等度以上の肝障害では減量を考慮し、慎重に観察 (1)

【小児 CKD 患者における報告】 データがない (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】 妊婦に禁忌 (1) 授乳婦には有益性投与 (1) 妊娠可能な女性には避妊を指導 (1)

【主な臨床報告】

保存期 CKD で Hb 管理においてダルベポエチンに非劣勢 (Yamamoto H, et al: Am J Nephrol 2021 PMID: 34569482)

ESA 未治療の保存期 CKD 患者 (ほぼ G4/5) で中央値 50mg/日程度で Hb 管理が可能だが、ダルベポエチンより初期反応は遅れ気味 (Yamamoto H, et al: Am J Nephrol 2021 PMID: 34569489)

【更新日】 20220222

※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。