

## ▼ベリキューボ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 ベレイシグアト Vericiguat 【分類】 慢性心不全治療剤 [可溶性グアニル酸シクラーゼ (sGC) 刺激剤]

【単位】 ▼2.5mg・▼5mg・10mg/錠

【常用量】

1回2.5mgから開始

2週間間隔で1回投与量を5mg及び10mgに段階的に増量 (SBP100以上で増量可)

血圧等患者の状態に応じて適宜減量

【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)

【保存期CKD患者への投与方法】 eGFR15未満: 血中濃度上昇のおそれあり投与の可否を慎重に判断し、状態を観察 [臨床試験から除外されている] (1)

遊離型薬物濃度AUCがeGFR30~60で1.76倍, eGFR30未満で2.28倍高い (1)

CV死+心不全入院のイベント抑制効果は腎機能と関連なく得られる (Voors AA, et al: Eur J Heart Fail 2021 PMID: 33999486)

【特徴】 可溶性グアニル酸シクラーゼを刺激し、NO非依存性的にcGMPの生成を促す。HFrEFに適用。神経体液性因子更新に伴う心リモデリングを抑制し、拡張能を保つ。リオシグアトよりも半減期が長く、また血圧低下を起こしにくい。

【主な副作用・毒性】 血圧低下, めまい, 頭痛, 貧血, 消化器症状

【安全性に関する情報】

【吸収】 食事で軽度AUCが19%上昇 (Boettcher M, et al: Eur J Clin Pharmacol 2021 PMID: 33125516) 空腹時投与で吸収率低下 (1)

【F】 93% [食後] (1)

【tmax】 1~2.5hr (1)

【代謝】 主代謝経路はN-グルクロン酸抱合 (M-1) へのグルクロン酸抱合で、主にUGT1A9及びUGT1A1が関与。CYP経路はマイナー (1, Boettcher M, et al: Clin Pharmacokinet 2020 PMID: 32458378)

【排泄】 尿中未変化体排泄率9% [po] (1) 代謝物として41%が尿中に回収 (1) P-gp, BCRPの基質 (1)

【CL】 1.6L/hr [iv] (1)

【t1/2】 平均22hr (Boettcher M, et al: Eur J Clin Pharmacol 2021 PMID: 33125516)

【蛋白結合率】 98% [Alb] (1)

【Vd】 44L/body [iv] (1) BBBを通過しにくい (1)

【MW】 426.38

【透析性】 PBRが高いため除去されないと考えられる (1)

【薬物動態】 1-コンパートメントモデルに適合 (Ruehs H, et al: Clin Pharmacokinet 2021 PMID: 34086190)

【OW係数】

【相互作用】 同効薬のリオシグアト (アデムバス) と併用禁忌 (1) PDE5阻害剤, 硝酸剤と併用注意 (1) PPIや制酸剤との併用でAUC低下 (1) 薬物間相互作用のポテンシャルは低い (Boettcher M, et al: Clin Pharmacokinet 2021 PMID: 33030703)

【妊婦・授乳婦への投薬】 妊婦に投与しない, 授乳は中止 (1)

【主な臨床報告】 高リスクの心不全患者における標準治療へのの上乗せで, CV死+心不全初回入院の複合アウトカムをわずかに改善 [観察期間の中央値1年に満たない] (Armstrong PW, et al: N Engl J Med 2020 PMID: 32222134 VICTORIA Study)

HFrEFにおいてNT-proBNP低下作用を認めなかったが, 高用量群でNT-proBNP低下, LVEF上昇 (Gheorghiu M, et al: JAMA 2015 PMID: 26547357 SOCRATES-REDUCED)

HFpEFではQOL改善効果のみ指摘 (Pieske B, et al: Eur Heart J 2017 PMID: 28369340 SOCRATES-PRESERVED)

初期に血圧は低下するが, 血圧の低いHFrEFでも安全に適用できる (Lam CSP, et al: J Am Heart Assoc 2021 PMID: 34743540)

NT-proBNP 8000以上でのイベント抑制効果は劣る (Ezekowitz JA, et al: JACC Heart Fail 2020 PMID: 33039447)

【更新日】 20211125

※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。