

△ミネプロ OD 錠 [内]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】エサキセレンオン Esaxerenone 【分類】高血圧症治療薬 [選択的ミネラルコルチコイド受容体ブロックア]

【単位】△1.25mg・△2.5mg・▼5mg/OD 錠

【常用量】2.5mg/日 [最大 5mg]

■血清 K 値が 5.0mEq/L を超えた場合には減量を考慮し、5.5mEq/L 以上の場合には減量ないし中止し、6.0mEq/L 以上の場合には直ちに中止

■中等度の腎機能障害 (eGFR 30mL/min/1.73m²以上 60mL/min/1.73m²未満) のある患者及びアルブミン尿又は蛋白尿を伴う糖尿病患者: 1.25mg/日から開始し、状態に応じて投与開始から 4 週間以降を目安に 2.5mg を 1 日 1 回投与へ増量 [最大 5mg]

■K 5mEq/L 以下を確認して開始

【用法】1 日 1 回

【透析患者への投与方法】禁忌 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】eGFR 30~60mL/min/1.73m²: 血清 K 値上昇が発現するリスクが高いため 1.25mg から開始して血清 K チェックし可能なら漸増、eGFR 30mL/min/1.73m²未満: 禁忌 (1)

アルブミン尿または蛋白尿を伴う糖尿病患者では 1.25mg/日から開始 (1)

中等度腎障害患者への RAS 阻害薬への追加投与では血清 K 上昇に注意 (Ito S, et al: Hypertens Res 2020 PMID: 33323991)

【特徴】非ステロイド型のミネラルコルチコイド受容体 (MR) 拮抗薬で、アルドステロンによる MR 活性化を阻害。治療抵抗性高血圧症、低レニン性高血圧症、心筋梗塞後や心不全を合併している高血圧症、二次性高血圧症としての原発性アルドステロン症などに適用。高血圧症にエプレレノンとは Ccr 50mL/min 未満で禁忌であったが、本剤は低用量から開始を条件に eGFR 30mL/min/1.73m² まで使用可。利尿作用はほとんどない。

【主な副作用・毒性】高 K 血症、血球減少、高尿酸血症、めまい、肝障害、腎障害、低血圧など

【安全性に関する情報】開始から 2 週以内と 1 か月後付近で血清 K をチェック (1) 高 K 血症は用量依存的に発現 (Ito S, et al: Clin J Am Soc Nephrol 2019 PMID: 31248950)

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】89% (1) 食事の影響を受けず、90%が吸収 (Kurata A, et al: Adv Ther 2019 PMID: 31119692)

【tmax】

【代謝】CYP3A で代謝 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 1.6% [po, 288hr まで] (1) P-gp と BCRP の基質であるが、排泄への寄与は小さい (Yamada M, et al: Drug Metab Dispos 2019 PMID: 30541878)

【CL】3.7L/hr [iv] (1)

【t1/2】22hr (Kato M, et al: Br J Clin Pharmacol 84: 1821-1829, 2018 PMID: 29688582)

【蛋白結合率】98%以上 (1)

【Vd】80L/man [iv] (1)

【MW】466.47

【透析性】低い (1)

【O/W 係数】LogP=3.4 [pH7] (1) 【pKa】10.53

【相互作用】スピロラクソン、エプレレノン、カリウム製剤と併用禁忌 (1) イトラコナゾール併用で AUC1.5 倍、リファンピシム併用で AUC 0.3 倍 (Kirigaya Y, et al: Br J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32250463)

【肝障害患者への投与方法】中等度肝障害までは用量調節の必要なし (Kurata A, et al: Adv Ther 2019 PMID: 31705436)

【主な臨床報告】降圧効果において 2.5mg はエプレレノン 50mg に非劣勢 (Ito S, et al: Hypertension 2020 PMID: 31786983)

CKD G3b までの微量アルブミン尿のある 2 型 DM 患者において、用量依存的に ACR の低下をもたらしたが 5mg 開始は避けた方がよさそう (Ito S, et al: Clin J Am Soc Nephrol 2019 PMID: 31248950)

RAS 阻害薬使用中の T2DM に 1.25mg/日開始でカリウムを見ながら 2.5mg/日に増量して ACR の低下を認めたが、高 K 血症は 9% に出現 (Ito S, et al: Clin J Am Soc Nephrol 2020 PMID: 33239409)

CKD での MRA のレビュー (Cosimato C, et al: Pharmacol Ther 2021 PMID: 33027644)

DKD における降圧効果と UACR 低下効果 [EX-DKD 試験] (Uchida HA, et al: Adv Ther 2022 PMID: 36070133)

【更新日】20230615

※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、日本国特許法並びに国際条約により保護されています。