

## △バフセオ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 バダデュスタット Vadadustat 【分類】 腎性貧血治療薬 [HIF-PH 阻害薬]

【単位】 △150mg・△300mg/日

【常用量】

■開始用量：1回300mg

■増量は150mg幅で4週間以上の間隔をあける

■休薬後の再開は150mg減で実施

■最大600mg/日

【用法】1日1回■多価金属イオンにより吸収が低下するので、前後2時間以上あける

【透析患者への投与方法】常用量(1)

【PD】平均維持投与量のめやすとしてESA使用時Hb 11g/dL以上なら300mg、11g/dL未満なら450mg/日 (Nangaku M, et al: Ther Apher Dial 2020 PMID: 33283981)

【保存期CKD患者への投与方法】常用量(1)フロセミドの血中濃度が上昇することに注意(5)

ダルベポエチンと比べてMACEにおいて非劣性を示せず(グローバルフェーズ3)(1)

【特徴】HIF-PH阻害薬。保存期、透析期の腎性貧血に適用。

【主な副作用・毒性】血栓塞栓症、肝機能障害、高血圧、消化器症状、皮膚症状、めまい、動悸、傾眠など。

鉄利用が促進されるので鉄状態を評価する。

【安全性に関する情報】MACEについてダルベポエチンに対して非劣性を示さず(PROTECT試験)

【モニターすべき項目】Hb、鉄状態、血栓塞栓症の発症、血圧、網膜症の管理

【吸収】食事により主にCmaxが低下する傾向があるが、AUCの低下はわずかであり、臨床問題とならない(1)

【F】75%以上[animal](1)

【tmax】1.5~2hr(1)

【代謝】グルクロン酸抱合[UGT1A1, 1A7, 1A8, 1A9(主)]で代謝(1)血中には未変化体75%、O-グルクロン酸抱合体15%の順に多く、糞便中には脱グリシン体が多い(1)CYPの寄与は小さい(1)肝・腎ではO-グルクロン酸抱合体(UGT1A1, 1A7, 1A8, 1A9)、腸管ではアシルグルクロン酸抱合体(UGT1A1, 2B7)が生成(1)O-グルクロン酸抱合体にはPHD2阻害活性があるが、IC50は未変化体の195倍と弱い(1)

【排泄】尿中未変化体排泄率1%未満(1)尿中回収率58.9%(1)尿中回収物はほとんどO-グルクロン酸抱合体(1)糞便中への排泄物は脱グリシン体が優位(1)

【CL/F】1.2L/hr(1)

【t1/2】6hr(1)

【蛋白結合率】99%以上(1)

【Vd/F】10L/man(1)血球へはほとんど移行しない(1)

【MW】306.70

【透析性】除去されない(1)

【OW係数】LogP=3.34(1)

【相互作用】OAT1, OAT3の基質, BCRP, OAT3を阻害(1)代謝物のO-グルクロン酸抱合体はOAT3の基質で阻害剤(1)

BCRP基質のスタチン(特にロスバスタチン, シンバスタチン), SASP(SPが上昇)の血中濃度上昇(1)OAT3の基質薬剤のフロセミド, MTXの血中濃度上昇(1)

鉄剤とキレート形成して、吸収が低下する可能性(Kokado Y, et al: Clin Ther 2021 PMID: 34511184)

【肝障害患者への投与方法】PKはほとんど変化しない(Chavan A, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2021 PMID: 33661566)

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】

【主な臨床報告】HD患者においてダルベポエチンに非劣勢(Nangaku M, et al: Nephrol Dial Transplant 2021 PMID: 33650630)

前臨床データ(Zuk A, et al: J Pharmacol Exp Ther 2022 PMID: 35926869)

【更新日】20221017

※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、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。