

△エナロイ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エナロデュスタット Enarodustat 【分類】 腎性貧血治療薬 [HIF-PH 阻害薬]

【単位】 △2mg・△4mg/錠

【常用量】

■保存期 CKD・PD：1回2mgから開始，最大8mg

■HD：1回4mgから開始，最大8mg

増量間隔は4週間以上で，休薬からの再開は減量が必要

1回量の設定は1mg, 2mg, 4mg, 6mg, 8mgのいずれか

【用法】1日1回，食前または寝る前

■開始後，Hb値が安定するまでは2週に1回程度Hbをチェック

■維持期は4週に1回程度Hbチェック

【透析患者への投与方法】常用量(1)

【保存期CKD患者への投与方法】常用量(1)

【特徴】HIF-PH阻害薬。代謝を受けにくい特性。

【主な副作用・毒性】血栓塞栓症，網膜出血，高血圧，湿疹など

【安全性に関する情報】マウスでは発がん性は否定的 (Kemmochi Y, et al: Int J Toxicol 2023 PMID: 37480334)

【吸収】食事によりCmax, AUC低下 [機序不明] (1)

【F】41.7% [サル] (1)

【tmax】0.5~1.3hr (1)

【代謝】代謝を受けにくい (Pai SM, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2019 PMID: 31876104) 一部が水酸化 (M1, M2) とその硫酸抱合 (M3)，グルコース抱合 (M4)，グルクロン酸抱合 (M5) により代謝 (1) M2にはHIF-PH阻害活性はあるがEPO産生能は弱い (1) わずかにCYP2C8, 2C9, 3A4で代謝 (1) マスバランス試験 (Pai SM, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2020 PMID: 31876104)

【排泄】尿中回収率10.9%，主に未変化体として胆汁排泄 (Pai SM, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2019 PMID: 31876104)

尿中未変化体排泄率7% (HD患者)，健常人27~61% (1) BCRPの基質，OAT1の基質，OAT1とOAT3を阻害 (1)

【t1/2】8~9hr，HD患者11hr (1)

【蛋白結合率】99%以上 [主にAlb] (1)

【Vd】20L/body [健常人]，12.66L/body [HD] (1)

【MW】340.33

【透析性】除去率6.74%でほとんど透析されない (1, Pai SM, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2021 PMID: 33788422)

【O/W係数】

【相互作用】リン吸着薬 (セベラマー，多価陽イオン，ランタン) ととの同時投与を避ける (1) OAT1とOAT3を阻害するが臨床的影響は低い (1) 臨床用量ではCYP基質への影響はないと思われる (1) 炭酸セベラマー同時投与によりAUC50%に減 (Pai SM, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2023 PMID: 37975611)

【肝障害患者への投与方法】

【小児CKD患者における報告】臨床試験未実施 (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦に禁忌，授乳を避ける (1)

【主な臨床報告】PK/PD解析と用量設定に関する評価 (Naruhashi S, et al: J Clin Pharmacol 2022 PMID: 36057843)

透析期と保存期CKD例への長期投与 phase 3 試験 (Akizawa T, et al: Ther Apher Dial 2022 PMID: 34390314)

EPOと異なり，ヘプシジンを低下させる [ラット] (Shinozaki Y, et al: Eur J Pharmacol 2021 PMID: 33657422)

【更新日】20240515

※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。