透析患者に関する薬剤情報
医療法人に真会 白鷺荷完 薬剤科

▼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 30μ g/月超, CERA 25μ 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

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

【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、Cma x 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)

他の HIF-PH 阻害剤は OATP1B により肝取り込みされるが、モリデュスタットの機序は不明(Bi YA, et al: Drug Metab Dispos 2024 PMID: 38388380)

【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 $6\sim10$ hr(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】開発時の構造活性相関(Beck H, et al: ChemMedChem 2018 PMID: 29485740)

保存期 CKD で Hb 管理においてダルベポエチンに非劣勢 [MIYABI:保存期,切り替え試験] (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)

グリシンアミドを有さない化学構造であり 20G と競合でPHD2 を阻害、トリアゾールによる結合で他のPHD を阻害(Figg WD Jr, et al: ChemMedChem 2021 PMID: 33792169)

ESA より低濃度 EPO レベルで Hb を上昇 (Flamme I, et al: PLoS One 2014 PMID: 25392999)

鉄動態の解析 (Akizawa T, et al: Nephron 2019 PMID: 31387097)

phase3 試験(Akizawa T, et al: Ther Apher Dial 2022 PMID: 34310049)

【更新日】20250524

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確生、完全性、適切性こ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、直接または間路が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高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・写真などの無類転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法が沢工国際条約により保護されています。