

## ▼リフヌア錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】ゲーファピキサント クエン酸塩 Gefapixant Citrate 【分類】咳嗽治療薬 [選択的 P2X3 受容体拮抗薬]

【単位】▼45mg/錠

【常用量】1回 45mg, 1日2回 (頓服は承認外)

【用法】1日2回

【透析患者への投与方法】データなし (1) 設定されていないが, 適用する場合は 45mg/日 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】AUC が増大するため, eGFR 30 未満の保存期 CKD : 1日1回 45mg に減量 (1)

腎機能低下により AUC が増大 [AUC 増大度は中等度腎障害 2.98 倍, 重度腎障害 4.43 倍, ESRD 4.74 倍] (Nussbaum JC, et al: J Clin Pharmacol 2022 PMID: 35656754)

【特徴】気道の迷走神経の C 線維上にみられる ATP 依存性イオンチャネルである P2X3 受容体を遮断し, 炎症又は化学刺激物質に反応した活性化を抑制する。

【主な副作用・毒性】悪心, 口内乾燥, 味覚障害, 下痢, 腹痛, 食欲減退, 浮動性めまい, 咽頭痛など

【安全性に関する情報】スルホンアミド過敏症に注意 (1) 味覚障害の頻度が非常に高いが可逆的 (1) 用量依存的な味覚障害 (Abu-Zaid A, et al: Ann Thorac Med 2021 PMID: 34012479) 味覚障害は P2X2/3 受容体の拮抗作用 (機能的阻害) によるものと推測 (1)

味覚障害は用量依存性で, 平均 9 日で発生し, 以後も持続しやすいが可逆的 (1) 尿中の結晶性異物に起因する腎障害が重要な潜在的リスク (1)

COUGH-1/2 での味覚異常発生率は 16~21% (McGarvey LP, et al: Lancet. 2022 PMID: 35248186)

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】吸収率として 78%以上 (1, Nussbaum JC, et al: Pharmacol Res Perspect 2022 PMID: 35106949) fe より 64%以上 (5)

【tmax】1.5hr (1)

【代謝】代謝を受けにくい, 一部が酸化, グルクロン酸抱合を受ける (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 64% [po], 糞便中に未変化体として 20%回収 (1, Nussbaum JC, et al: Pharmacol Res Perspect 2022 PMID: 35106949) 排出トランスポータ BCRP, P-gp, MATE1/MATE2-K の基質であるが, 排泄経路への寄与は小さい (1) 代謝物として尿中に 12%回収 (Nussbaum JC, et al: Pharmacol Res Perspect 2022 PMID: 35106949)

【CL/F】10.8L/hr (1)

【t1/2】7hr (1)

【蛋白結合率】55% (1)

【Vd/F】138L/body (1)

【MW】545.52

【透析性】一部除去されるが, 効率的ではないと思われる (5) HD 日は非 HD 日に比べて AUC が 25%減 (Nussbaum JC, et al: J Clin Pharmacol 2022 PMID: 35656754)

【OW 係数】LogD=1.15 (1)

【相互作用】CYP を阻害・誘導しない (1) OATP1B1 を阻害する可能性は低い (McCrea JB, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2022 PMID: 34821075)

【肝障害患者への投与方法】PK には影響しない (1)

【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】

COUGH-1/2 にて 90mg/日による咳嗽頻度の低下を確認 (McGarvey LP, et al: Lancet. 2022 PMID: 35248186)

特発性肺線維症での持続咳嗽への効果は確認できず (Martinez FJ, et al: Pulm Ther 2021 PMID: 34152585)

【更新日】20240815

※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。