

◎フォゼベル錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 テナパノール塩酸塩 Tenapanor Hydrochloride 【分類】 高リン血症治療剤 [NHE3 阻害剤]

【単位】 ◎5mg・◎10mg・▼20mg・▼30mg/錠

【常用量】

開始量 1回 5mg, 以後 1回量を 10mg, 20mg, 30mg に段階的に増量可 (1週間以上の間隔で)

(休薬後の再開は、休薬前と同量あるいは1段階減量した投与量で)

用量変更時は1~2週後に血清リン濃度を確認

基本的に上乗せで開始し、経過をみて他剤を含め用量調節

▼オピニオン

下痢が発現しやすいため、便秘傾向の高リン血症例に優先して適用考慮

リン低下作用が強いため、開始時は下痢があっても忌避せず、患者の使用できる日を選んで継続し、リン低下効果を確認する

高リン血症のため食事制限への負担が大きい場合にも、その軽減とのトレードオフとして下痢が発現したとしても調節の上で服薬継続を自身で選択してもらう

【用法】 1日2回、朝食・夕食<直前>

便中 Na 排泄量は食前投与が食後投与よりも大きい、便中 (および尿中) リン排泄に関しては影響はほとんどない (Johansson SA, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2017 PMID: 28339149)

同量なら1日1回よりも2回に分ける方が便中 Na 排泄量が多い (Rosenbaum DP, et al: Clin Drug Investig 2018 PMID: 29363027)

【透析患者への投与方法】 常用量 (1)

便重量や便中 Na 排泄量は増えるが、透析間体重増加量には影響しない (Block GA, et al: Clin J Am Soc Nephrol 2016 PMID: 27340281)

血清リン 7mg/dL 台の群で、4週で血清リンが最大 1.98mg/dL 低下した (Block GA, et al: J Am Soc Nephrol 2017 PMID: 28159782)

透析患者への適用による副作用は予期できるものであった [P3] (Block GA, et al: J Am Soc Nephrol 2019 PMID: 30846557)

HD 中の下痢症状と関連すると関連する場合は、HD 前の投与を避けて朝夕以外の食直前投与でもよい (1)

FGF23 を低下させる (Block GA, et al: Nephrol Dial Transplant 2019 PMID: 29617976)

他のリン吸着薬併用で相加作用あり (Pergola PE, et al: J Am Soc Nephrol 2021 PMID: 33766811)

使用中のリン吸着薬に追加して血清リン低下 (Shigematsu T, et al: Am J Nephrol 2021 PMID: 34098559)

透析患者のリン管理での必要錠剤数におけるメリットあり (Akizawa T, et al: Kidney Int Rep 2021 PMID: 34514198)

下痢の副作用は1回量 5mg では9.8%だったが、10mg 以上で5割超となった (Inaba M, et al: Kidney Int Rep 2021 PMID: 35155857)

52週の試験でも有効性、安全性確認 (Block GA, et al: Kidney360 2021 PMID: 35372979)

臨床試験のメタ解析では血清リンを 1.79mg/dL 低下させていると評価 (Luo H, et al: Ther Apher Dial 2023 PMID: 37349983)

下痢の有無で血清リン低下効果は変わらない (1)

【PD】 HD と同用量で有用 (Nakayama M, et al: Clin Exp Nephrol 2023 PMID: 37910313)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 透析例のみ適用 (1)

【特徴】 腸管で局所的にナトリウムイオン/プロトン交換輸送体 3 (NHE3) を阻害し、細胞内の pH が低下してリン吸収の主要経路である腸管上皮細胞間隙 (傍細胞経路) でのリン透過性が低下することでリンの吸収を抑制 (King AJ, et al: Sci Transl Med 2018 PMID: 30158152)

【主な副作用・毒性】 重度の下痢、軟便、悪心、嘔吐、腹痛など

【安全性に関する情報】 下痢が4割に出現 (Sprague SM, et al: Kidney360 2024 PMID: 38323855)

【吸収】 ほゞ吸収されない (Johansson S, et al: Clin Exp Nephrol 2017 PMID: 27368672, Rosenbaum DP, et al: Clin Drug Investig 2018 PMID: 29363027)

【F】 ほゞ0% (1)

【tmax】 該当しない (1)

【代謝】 CYP3A4 (寄与率: 56.8%), CYP3A5 (寄与率: 39.8%) で代謝 (1)

【排泄】 尿中に未変化体は検出されない (1) 糞便中に未変化体として 65%回収 (1)

【t1/2】 吸収されないので該当しない (1)

【蛋白結合率】 99.9%以上 (1)

【Vd】 該当しない (1)

【MW】 1217.97

【透析性】 該当しない (1)

【OW 係数】 LopP=4.1 [1-オクタノール水系] (1)

【相互作用】 OATP2B1 を阻害してエナラプリルの吸収が低下 (1)

vitro では CYP3A4/5 を阻害するが、vivo では影響を認めない (Johansson S, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2017 PMID: 28301096)

PetT1 基質薬物の吸収に影響しない (Johansson S, et al: Br J Clin Pharmacol 2017 PMID: 28432691)

【肝障害患者への投与方法】

【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】

90mg×2日の試験でも軟便はあるが忍容性良好 (Johansson S, et al: Clin Exp Nephrol 2017 PMID: 27368672)

AMPLIFY[p3] (Pergola PE, et al: J Am Soc Nephrol 2021 PMID: 33766811)

レビュー (Lin T, et al: J Pharm Pharm Sci 2022 PMID: 35041802)

RCT メタ解析ではプラセボと比較し、血清リン値低下度は 1.79 mg/dL (Luo H, et al: Ther Apher Dial 2023 PMID: 37349983)

構造活性相関 (Jacobs JW, et al: ACS Med Chem Lett 2022 PMID: 35859876)

【IBS-C】

IBS-C に有用 [1 回量 50mg] (Chey WD, et al: Am J Gastroenterol 2017 PMID: 28244495, (Sinagra E, et al: Expert Rev Clin Pharmacol 2020 PMID: 32478632)

IBS-C の腹部症状を改善 (Lembo AJ, et al: Am J Gastroenterol 2024 PMID: 38294158)

【備考】細胞間隙からのリン吸収のレビュー (Saurette M, et al: Exp Biol Med (Maywood) 2019 PMID: 30764666)

吸湿性があり一包化は避ける (1)

【更新日】20241022

※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。