

尿酸生成抑制薬 フォーミュラリ

2024.12.01

一般名	推奨				オプション	
	アロプリノール		フェブキソスタット		トピロキソスタット	
代表的な製品名	GE:アロプリノール	ザイロリック(先発品)	GE:フェブキソスタット	フェブリク(先発品)	GE:なし	トピロリック ウリアデック (先発品)
標準的1日薬価	23. ⁴ ~30. ³ 円 (300mg/日)	43. ⁵ 円 (300mg/日)	22. ⁰ 円(各社同一) (40mg/日)	86. ⁰ 円 (40mg/日)	—	89. ⁶ ~90. ⁰ 円 (120mg/日)
効能・効果	下記の場合における高尿酸血症の是正 痛風、高尿酸血症を伴う高血圧症		①痛風、高尿酸血症 ②がん化学療法による高尿酸血症		痛風、高尿酸血症	
用法・用量	1回100mgを1日2~3回		①1回10mgを1日1回から開始(維持量40mg) ②1回60mgを1日1回		1回20mgを1日2回朝夕から開始 (維持量は1回60mgを1日2回)	
半減期(hr)	約1.6(単回経口投与:未変化体)		6.5±1.1(単回経口投与)		5.16±1.01(単回経口投与)	
特徴など	安価である 重大な副作用に中毒性表皮壊死融解症(TEN)及び皮膚粘膜性眼症候群(Stevens-Johnson 症候群)等の重症薬疹がある 活性代謝物の半減期が長い(約17.1hr)ため腎機能障害のある患者については減量等が必要		尿酸値低下作用が最も強い 1日1回服用 ※臨床で使用されることが多い 後発品の場合一番安価でOD錠も存在 アザチオプリン、メルカプトプリンと禁忌		尿酸値低下作用は2番目に強い 1日2回服用 薬価が他の2剤に比べて高い 中等度腎機能低下者に対し比較的安全性が高い 尿酸変動値が少ない(フェブキソスタットに比べ) アザチオプリン、メルカプトプリンと禁忌	

※つくば市内の病院、薬局調べ

有効性・安全性

- ・2024年12月1日時点で、3種類(アロプリノール、フェブキソスタット、トピロキソスタット)の尿酸生成抑制薬がある。
- ・日本痛風・尿酸核酸学会「高尿酸血症・痛風の治療ガイドライン第3版¹」では患者背景に対する薬効群選択については記載されているが、個々の薬剤に対する総括した推奨順は明記されていない。
- ・心血管疾患の既往を有する患者を対象とした大規模臨床試験(CARE試験)では、心血管イベントを複合エンドポイントとする主要評価項目でアロプリノールに対するフェブキソスタットの非劣性が示されている。²
しかし心血管・全死亡についてはアロプリノール群よりもフェブキソスタット群で有意に多いという結果が出ており、FDAでは警告追記されている。
- ・フェブキソスタットには「がん化学療法に伴う高尿酸血症」の適応があるが、腫瘍崩壊症候群の発症リスクを考慮してがん化学療法開始1~2日前から投与となっている。またがん化学療法後に発症した高尿酸血症に対する有効性、安全性は確立されていない。
- ・フェブキソスタットとトピロキソスタットの投与開始10週間以上の痛風発作(痛風関節炎)の有害事象発生率は、フェブキソスタット40mg/日群(10週超16週以下)で7.5%³、トピロキソスタット120mg/日群(10週超14週以下)4.3%⁴である。
- ・中等度腎機能低下群では、トピロキソスタットが安全性が高い。

推奨の理由

有効性・安全性、各製剤の特徴(上記)を踏まえ、推奨薬をアロプリノール、フェブキソスタットとし、オプションとしてトピロキソスタットとした。

〈参考文献〉

- 1:日本痛風・尿酸核酸学会「高尿酸血症・痛風の治療ガイドライン第3版」(2018)
- 2:WhiteWB,et al. N Engl J Med. 2018 ; 378 : 1200-10
- 3:フェブリク錠 医薬品インタビューフォーム
- 4:ウリアデック錠 医薬品インタビューフォーム