

薬剤部 DI ニュース

アンジオテンシン受容体ネプリライシン阻害薬 (ARNI) 「エンレスト錠」について

「エンレスト」(一般名:サクビトリルバルサルタン)はアンジオテンシン受容体ネプリライシン阻害薬(ARNI)という新しい種類の慢性心不全治療薬です。2020年8月に発売され、2021年6月から院内採用医薬品として使用されています。現在は投与期間制限があり、2021年8月末までは最大14日の処方となります。

Oエンレスト錠(一般名:サクビトリルバルサルタン)について



院内・院外採用 100mg
院外のみ採用 50mg
200mg

(2021年7月現在)

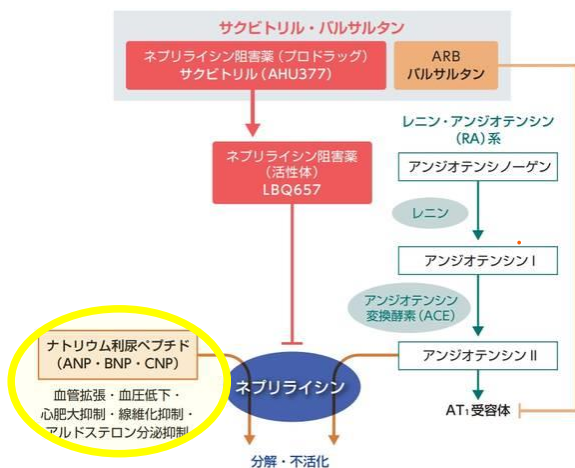
〈特徴〉 アンジオテンシン受容体ネプリライシン阻害薬(ARNI)という種類の慢性心不全治療薬で心臓刺激因子への作用に加えて心保護因子との両方に作用

〈効能・効果〉 慢性心不全(ただし慢性心不全の標準的な治療を受けている患者に限る)

〈用法・用量〉 通常、1回50mgを開始用量として1日2回経口投与
忍容性が認められている場合は、2~4週間の間隔で段階的に1回200mgまで増量する

〈注意点〉
・ACE阻害薬又はARBから切り替えて投与
・ACE阻害薬とは併用禁忌のため、ACE阻害薬から切り替えの場合、ACE阻害薬を少なくともエンレスト投与開始36時間前に中止

〈作用機序〉



体内でサクビトリルとバルサルタンに解離して、サクビトリルによるネプリライシン(NEP)阻害作用およびバルサルタンによるアンジオテンシンIIタイプ1(AT1)受容体拮抗作用の2つの薬理作用を發揮します。ネプリライシンは蛋白質分解酵素の一種で、ナトリウム利尿ペプチドやブラジキニンなどの生理活性ペプチドを分解する作用があります。サクビトリルは、エステラーゼによりNEP阻害の活性体に速やかに変換されるため、NEPを阻害することで、血管拡張作用、利尿作用、RAA系抑制作用、交感神経抑制作用、心肥大抑制作用、抗線維化作用、およびアルドステロン分泌抑制作用を有するナトリウム利尿ペプチド(NP)の作用亢進に寄与すると考えられています。バルサルタンのAT1受容体拮抗作用は、血管収縮、腎ナトリウム・体液貯留、心筋肥大、および心血管リモデリング異常に対する抑制作用をもたらします。

〈副作用〉

- ・低血圧：立ちくらみ、倦怠感、冷や汗、顔面蒼白
- ・高カリウム血症：手足等のしびれ・麻痺、筋力の低下
- ・腎機能障害：むくみ、尿量減少
- ・血管浮腫：顔や唇、舌、のどの腫れ、呼吸困難
- ・脱水：のどが渇く、頭痛、ふらつき
- ・咳嗽(せき)



心不全の薬がいっぱいありすぎて、わからない!!どんな種類の薬があったかな?

→心不全に用いる薬については、裏面へ

○心不全とは？

心不全とは、全身の臓器に必要な酸素が行き渡らない状態のことで、心臓のポンプ機能が低下し、心拍出量の低下や末梢循環不全、肺や体静脈系のうっ血をきたす病態です。心不全をきたす原因として、虚血性心疾患、高血圧、心筋症などの心疾患が多くを占めます。その他の原因として、糖尿病や肥満、動脈硬化などがあります。通常、心臓のポンプ機能が低下したとき、主に交感神経系、RAA系が亢進し血圧の維持に働きます。これを代償機構といいます。しかし、長期的に代償機構が働くと、心筋は十分な心拍出量を維持できなくなります。結果として心機能はさらに低下し、心不全を進行させる悪循環をきたします。

心不全への進行速度によって、急性心不全と慢性心不全に分類されます。急性心不全は血行動態の悪化を急激にきたす状態です。また、慢性心不全は代償機構が長時間働き、血行動態の悪化が徐々に進行する状態です。

心不全の主な治療目標は、生命予後の改善、心不全入院の予防・抑制、病状コントロールおよびQOL改善です。治療としては、急性心不全、慢性心不全ともに薬物療法を主体として血行動態の安定化を図ります。

《慢性心不全に用いる主な治療薬と分類》

	分類①	分類②	主な薬剤（一般名）	作用	
予後の改善	心臓を保護する薬	RAA系抑制薬	ACE阻害薬	・レニベース（○エナラプリル） ・ゼストリル/ロングス（リシノプリル）	・RAA系を阻害することで心筋リモデリングを抑制して心保護作用を示す ・ACE阻害薬が忍容性などの点で投与できない場合にARBを用いる（併用不可）
			ARB	・プロブレス（カンデサルタン）	
		アンジオテンシン受容体・ネプリライシン阻害薬（ARNI）	・○エンレスト（サクビト rilバルサルタン）	・心房性ナトリウム利尿ペプチド（ANP）を分解するネプリライシンを阻害すると同時に、RAA系の亢進を抑制することで心保護作用を示す	
		ミネラルコルチコイド受容体拮抗薬（MRA）	・アルダクトンA（○スピロラクソン） ・セララ（エプレレノン）	・RAA系を阻害することで心筋リモデリングを抑制して心保護作用を示す	
		SGLT2阻害薬	・フォシーガ（ダバグリフロジン）	・体液量調節を介した血行動態改善により心保護作用を示す	
	心臓を休ませる薬	β遮断薬		・アーチスト（○カルベジロール） ・メインテート（○ビソプロロール）	・交感神経系の活性化を抑制することで心拍数低下、血圧低下、心肥大改善作用などを示し、心筋リモデリングを抑制して心保護作用を示す
HCNチャンネル遮断薬		・○コララン（イバブラジン）	・洞結節のHCNチャンネルを阻害することで心拍数を減少させ心保護作用を示す		
症状の改善	心臓の負担やむくみをとる薬	利尿薬	ループ利尿薬	・ラシックス（○フロセミド） ・ダイアート（○アゾセミド）	・利尿作用により循環血流量を減少させ、うっ血に基づく呼吸困難や浮腫を改善する ・ループ利尿薬単独で効果不十分の場合にはサイアザイド系利尿薬との併用を試みる
			サイアザイド系	・○フルイトラン（トリクロルメチアジド）	
			パンプレシンV ₂ 受容体拮抗薬	・○サムスカ（トルバプタン）	
	心臓を力づける薬	強心薬	ジギタリス製剤	・○ハーフジゴキシン（ジゴキシン）	・心筋収縮力の増強によって血行動態の改善を示す
PDE阻害薬			・アカルディ（○ピモベンダン）	・短期的な血行動態の改善に有効	
心臓を楽にする薬	血管拡張薬	硝酸薬	・ミオコール（○ニトログリセリン） ・ニトロール（○硝酸イソソルビド）	・血管拡張作用によりうっ血や浮腫などを改善する。	

○院内採用薬 ○以外院外採用薬

RAA系：レニン・アンジオテンシン・アルドステロン系
ACE阻害薬：アンジオテンシン変換酵素阻害薬
ARB：アンジオテンシンII受容体拮抗薬



心臓に負担をかけ過ぎない
ためにも薬を正しく飲もう！

[参考文献]

- ・「エンレスト錠はじめてガイド」（ノバルティスファーマ株式会社・大塚製薬株式会社）
- ・蛋白質分解酵素とRAA系を同時に阻害する新機序の慢性心不全治療薬：日経メディカル
- ・今日の治療薬2021（南江堂） ・添付文書（エンレスト）
- ・心不全 ④慢性心不全の薬物療法：ASTEM
- ・薬がみえる vol.1（MEDIC MEDIA）

