

## ▼カログラ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 カロテグラストメチル Carotegrast Methyl (AJM300) 【分類】 潰瘍性大腸炎治療剤 [α4 インテグリン阻害剤]

【単位】 ▼120mg/錠

【常用量】 1回960mg (8錠) を1日3回

【用法】 1日3回食後

■PMLのリスクから、投与期間は6か月間とし、再治療時も8週間あけて開始

【透析患者への投与方法】 設定されていないがPKからは常用量適用可と思われる (5)

【保存期CKD患者への投与方法】 設定されていないがPKからは常用量適用可と思われる (5)

【特徴】 5-ASA治療でコントロール不十分な「中等症」の潰瘍性大腸炎に適用。生体内で活性体カロテグラストとなり、リンパ球表面のα4β1およびα4β7インテグリンとそれぞれの受容体VCAM-1およびMAd-CAM-1との結合を阻害し、T細胞を含む炎症性細胞の血管内皮細胞への接着および炎症部位への浸潤を阻害、抗炎症作用をもたらす。血管側から作用し、UCの病変部位に関わらず効果が期待できると考えられる。ステロイドとの併用は可。ナタリズマブとの併用不可。

【主な副作用・毒性】

【安全性に関する情報】 投与後のリンパ球増多が認められる (Fukase H, et al: Br J Clin Pharmacol 2020 PMID: 31658381)

【吸収】 食事によりAUCが低下するがリンパ球数で評価した薬効への影響はなし (Fukase H, et al: Clin Drug Investig 2020 PMID: 31965548)

【E】

【tmax】 2~3hr (1)

【代謝】 肝カルボキシエステラーゼ1 (CES1) 及びCYP3A4により活性体のカロテグラスト及びN-脱メチル体へと代謝され、さらにN-脱メチル体はエステル加水分解体へと代謝 (1) カロテグラストの一部はUGT1A3によりグルクロン酸抱合 (1)

【排泄】 尿中回収率2.6% [po, 168hrまで] (1) ほとんど肝胆系により糞便中に排泄される (1)

【t1/2】 8~16hr (1)

【蛋白結合率】 99%以上 (1) 未変化体はアルブミンとAAG、カロテグラストはアルブミンと主に結合 (1)

【Vd】

【MW】 569.44

【透析性】 透析性は低い (1)

【薬物動態】 3相性のPKで、未変化体より活性体が高濃度 (Fukase H, et al: Br J Clin Pharmacol 2020 PMID: 31658381)

【O/W係数】

【相互作用】 CYP3A4を阻害 (1) カロテグラストはOATP1B1及びOATP1B3の基質 (1)

【肝障害患者への投与方法】 重度には禁忌、中等度には慎重に観察要 (1)

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】 治療期間中は避妊、妊婦 (可能性を含む) に禁忌、授乳中止検討 (1)

【主な臨床報告】 開発時データ [P2a] (Yoshimura N, et al: Gastroenterology 2015 PMID: 26327130), [P3] (Matsuoka K, et al: Lancet Gastroenterol Hepatol 2022 PMID: 35366419)

【効果発現時期】 累積寛解率をみるとおおそ12週目までにて効果が判定できるだろう (1)

【備考】 エステラーゼにより活性体に変換されるが、プロドラッグという考えで設計されたものではない。

【更新日】 20220426

※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。