

△ペンタサ錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】メサラジン Mesalazine 【分類】潰瘍性大腸炎・クローン病治療剤

【単位】△250mg・▼500mg/錠

【常用量】1500～2250mg/日 [最大 4000mg]

【用法】分3食後 [寛解期には1日1回]

【透析患者への投与方法】透析患者に投与したデータはない。腎不全患者では5-ASAは蓄積するという報告 (Gastroenterol Endosc 39(Suppl):2159,1997) があるが、低用量では吸収量が少ないため、腎不全でも蓄積しないと考えられる。しかし投与量の増加により吸収量が増加し、尿中排泄率も非線形の上昇をするため (Dan Med Bull 47: 20-41,2000)、腎不全患者では投与量増加とともに蓄積する可能性がある (5) 【その他の報告】重篤な腎障害患者には禁忌となっている (1) がサラゾスルファピリジンよりは副作用は少ないと思われる

【保存期 CKD 患者への投与方法】サラゾスルファピリジンよりもよく吸収されるために尿中排泄率が高くなり、腎障害の原因となる可能性があるが、その発現率は非常に低いため通常用量でよい (5)

【特徴】サラゾスルファピリジンの活性本体である5-ASAが腸管全体で徐々に放出するようにエチルセルロースでコーティングした放出調節製剤。5-ASAは小腸上部で速やかに吸収されてしまうため病変部に有効量が到達しない欠点があったが、その欠点を製剤により改善したもの。サラゾスルファピリジンの副作用の多くはスルファピリジンが原因といわれているため、毒性が軽減されていると考えられる。

【主な副作用・毒性】過敏性肺障害、心筋炎、心膜炎、間質性腎炎、血小板減少症、発疹、下痢、腹痛、嘔気・嘔吐、膵炎、食欲不振、腹部膨満感、口内炎、肝障害、腎機能異常、白血球減少、貧血、筋肉痛、関節痛など

【安全性に関する情報】5-ASAは急性間質性腎炎の主な原因薬剤であるため定期評価が必要 (Moss JG, et al: Eur J Med Res 2022 PMID: 35488310)

【モニターすべき項目】eGFR、尿蛋白 (Guillo L, et al: Dig Liver Dis 2022 PMID: 34866011)

【吸収】食後に投与すると血漿濃度は低下する (1)

【F】20～30%が吸収されるが剤形・条件によって異なる (U)

【tmax】ペンタサ錠 2.3hr、メサラジン原末 0.8hr (1) 6.5～7hr (U) 【Cmax】1448.6ng/mL [ペンタサ 1000mg], Cmax20734ng/mL [5-ASA原末 1000mg] (1)

【代謝】全身に分布するN-アセチルトランスフェラーゼによってアセチル体に代謝される (1) 初回通過効果を受けやすい (1) 5-ASAのアセチル化代謝物にも活性があるかもしれない (Clin Pharmacokinetics 10: 285-302,1985) 腎不全患者では5-ASAは蓄積する (Gastroenterol Endosc 39(Suppl):2159,1997) 健常者への経口投与では腸管内濃度は上昇するが局所およびおそらく全身的なアセチル化能が飽和して血漿濃度が上昇し、尿中排泄量も上昇する (Dan Med Bull 47: 20-41, 2000)

【排泄】尿中排泄率28.4%であるが、アセチル化体尿中排泄率27.7%で未変化体は少ない (1) 糞中排泄率50% (アセチル化体23.5%) (1) 投与量の増加と共に5-ASAの尿中排泄率は非線形の上昇を示す (1.2g, 2.4g, 4.8g/日投与で尿中排泄量は1.8, 85.5, 445mg/日) が、アセチル化体は線形 (1.2g, 2.4g, 4.8g/日投与で尿中排泄量は250, 524, 1468mg/日) 糞中排泄量は投与量によって変化せず (Br J Clin Pharmacol 49: 323-30, 2000) 尿中排泄されるものはアセチル化体である (U)

【t1/2】ペンタサ錠 6.4hr、メサラジン原末 4.5hr (1) 徐放性なのでt1/2は求められない (U)

【蛋白結合率】未変化体 70～78%、アセチル体 85～91% (1)

【MW】153.14

【透析性】低いと思われる (5) 資料なし (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない 【OW係数】0.03 [1-オクタノール水系, pH3～9] (1) 【pKa】2.6, 5.8, 12.0

【更新日】20230130

※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。