▼メサペイン錠　［内］

【重要度】★　【一般製剤名】メサドン塩酸塩（U）　Methadone Hydrochloiride　【分類】オピオイド性癌疼痛治療剤
【単位】▼5mg・▼10mg/錠
【常用量】1回5～15mg，1日3回［初回もしくは増量後7日間は増量を行わない］
【用法】1日3回
■他の強オピオイドから切り替えて使用
■モルヒネ経口剤からの切り替え換算の目安：60～160mg/日→15mg/日，161～390mg/日→30mg/日，391mg/日以上→45mg/日［ただし，体内動態や効果の個人差が大きいことに注意］
【透析患者への投与方法】50～75%に減量（12,17）
常用量（Opdal MS, et al: Clin Ther 2015 PMID: 25963997）
【PD】50～75%に減量（12）
【CRRT】減量の必要なし（12,17）
【保存期CKD患者への投与方法】GFR 10mL/min以上：減量の必要なし，GFR 10mL/min未満：50～75%に減量（17）尿アルカリ化による血中濃度上昇に注意（17）
【その他の報告】GFR 10mL/min以上：減量の必要なし，GFR 10mL/min未満：50～75%に減量（12）

【特徴】オピオイドμ受容体のアゴニスト．モルヒネ60mg/日以上の時の選択肢．レスキューはメサドン以外のオピオイドを使用．他の強オピオイド鎮痛剤で治療困難な中等度から高度の疼痛を伴う各種癌における鎮痛に適用．退薬症候があらわれる可能性があり，徐々に減量する．
【主な副作用・毒性】ショック，アナフィラキシー，呼吸抑制，依存性，心停止，QT延長，錯乱，イレウス，肝機能障害，眠気，めまい，振せん，消化器症状，尿閉など多数．
【F】
【tmax】3.3～4.9hr（1）
【代謝】肝代謝により，N-脱メチル化，環化される．主代謝物は不活性な2-ethylidene-1,5-dimethyl-3,3-diphenylpyrrolidine（EDDP）（1）CYP3A4，2B6，2C8，2C9，2C19，2D6が関与（1）P-gpの基質（1）CYP3A4，2B6がメインで，2D6はマイナー（Crettol S, et al: Clin Pharmacol Ther 2006 PMID: 17178267）
【排泄】回収率：尿中24～79%，糞中18～42%（1）メインは腎排泄で，胆汁排泄も関与（U）酸性尿で排泄が増加［アルカリ尿で再吸収増大］（1,U）

【t1/2】40hr（1）15～25hr，反復投与で延長（U）定常状態まで約7日（1）13～58hr（12）
【蛋白結合率】89.4%［主にAAG］（1）高い（U）60～90%（12）
【Vd】3～6L/kg（12）
【MW】345.91
【透析性】低いと思われる（5）HD中の血中濃度変動は小さい（Perlman R, et al: Pain 2013 PMID: 23973378）除去率2.3%（Opdal MS, et al: Clin Ther 2015 PMID: 25963997）ハイカットオフHDでも除去率はほとんど向上しない（Arelin V, et al: Clin Nephrol 2016 PMID: 27116939）
【O/W係数】脂溶性の高い塩基性物質．【TDMのポイント】TDMの対象にならない．モルヒネ筋注10mgとメサドン経口20mgもしくはメサドン筋注10mgと同程度の効果（U）代謝酵素の多型によるPKへの影響は軽度（Crettol S, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 668-81, 2006）
【相互作用】CYP3A4，2B6を誘導する（1）フェニトインやリファンピシンはメサドンの代謝を促進する可能性（U）QT延長をきたす薬剤との併用注意（1）リファンピシンによる小腸トランスポータやCYP2B6誘導などにより血中濃度低下するが，CYP3A4関連の相互作用は受けにくい（Kharasch ED, et al: Clin Pharmacol Ther 76: 250-69, 2004）GFJ飲用CYP3A4を阻害してAUCを軽度増大させるのでは特に初期治療時には避けるべき（Benmebarek M, et al: Clin Pharmacol Ther 76: 55-63, 2004）
【効果発現時間】効果発現時間：15～30min［po］（U）ピークは服用後90～120min後（U）
【効果持続時間】4～6hr（U）
【更新日】20241010

※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。