

B. エンドセリン受容体拮抗薬

[特] エンドセリン-1(ET-1)の作用

(血管収縮,血管透過性亢進,肺動脈壁肥大,肺線維化)を抑制.

ET-1に選択的なET_A受容体と非選択的なET_B受容体(血管収縮,平滑筋増殖)がある.アンプリゼンタンはET_A受容体に拮抗,
マシテンタン,ボセンタンはET_A,ET_B受容体の両方と拮抗.

マシテンタン Macitentan

● オブスミット(アクテリオン)

錠: 10mg, PTPシート30錠(15錠×2).

[特] フルファリン, シクロスポリン等
併用時: 用量調節必要はなし.

[効] 肺動脈性肺高血圧症

[用] 10mgを1日1回内服.

[体内動態] a. 食事の影響がない,

b. 未変化体: ピーク5時間, 半減期12時間

活性代謝物: ピーク36時間, 半減期41時間

透析中, 重度腎障害で半減期32%延長.

[禁] 1. 妊婦(催奇性).

中止後も1カ月は確実な避妊法

2. 授乳婦.

3. 重度の肝障害に禁忌:

投与前, 投与中: AST, ALT, ビリルビン
が基準値の2倍, 黄疸等は中止.

4. 肺水腫に禁.

肺水腫の徴候(→肺静脈閉塞)→中止.

[注] 1. 重度の貧血: 投与前~投与中は,
ヘモグロビンを定期的に検査.

2. 血管拡張作用がある: 降圧薬は慎重に

3. 低血圧.

4. 重度腎障害→低血圧, 貧血に注意.

[併] CYP3A4で代謝:

A. 禁: 強いCYP3A4誘導剤:

リファンピシン(リファジン),

セイヨウオトギリソウ含有食品,

カルバマゼピン(テグレートール),

フェニトイン(アレビアチン),

フェノバルビタール(フェノバル),

リファブチン(ミコブティン)

で本剤の血中濃度低下.

B. 慎: a. 強いCYP3A4阻害剤:

HIV感染症治療薬(リトナビル等)

で本剤の血中濃度上昇

b. CYP3A4誘導剤:

エファビレンツ, モダフィニル,

ルフィナミド等

で本剤の血中濃度低下.

[副] 70%] A. 重大: ● 貧血4.0%

D. 血小板減, ● 頭痛5%, 片頭痛, 浮動性めまい, 潮紅, 低血圧, 鼻閉, 呼吸困難, 悪心/嘔吐, 腹痛, 下痢, そう痒, 発疹, 蕁麻疹, 血管浮腫, 浮腫, 末梢性浮腫, 顔面浮腫, 胸痛, 肝異常, ALT↑, AST↑, ヘマトクリット↓, ヘモグロビン↓.