コンパス薬局横浜西 スキルアップ勉強会

2017.4.13 根井

第 115 回『リアルダ錠』

持田製薬　若井さん

参加者：川村先生、野口、加藤、加納、佐藤、渡辺、根井

潰瘍性大腸炎は、大腸粘膜が炎症を起こしてただれ、びらんや潰瘍を形成し、症状は粘血便、下痢、腹痛などである。20～30 代の若年成人に多く発症するが、50～60 代の人にもみられる。日本国内では１０００人に１人の割合で発症する。いったんよくなったように見えても、数カ月から数年後に悪化することがある。大腸粘膜に対する異常な免疫反応、つまり、体のなかに異常な抗体ができ、これが自分の大腸粘膜を攻撃することなどが原因とされているが、遺伝的素因や食生活、腸内細菌の変化などが複雑に絡み合っており、すべてが明らかになっているわけではない。

【効能効果】

潰瘍性大腸炎（重症を除く）

【用法及び用量】

通常、成人にはメサラジンとして１日１回 2,400mg を食後経口投与する。活動期は、通常、成人にはメサラジンとして１日１回 4,800mg を食後経口投与するが、患者の状態により適宜減量する。

【禁忌】

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. サリチル酸塩類に対し過敏症の既往歴のある患者［交叉アレルギーを発現するおそれがある。］
3. 重篤な腎障害のある患者［腎障害がさらに悪化するおそれがある。］
4. 重篤な肝障害のある患者［肝障害がさらに悪化するおそれがある。］

【作用機序】

メサラジンは、活性酸素種産生の抑制 [13~17]、活性酸素種による組織／細胞傷害の抑制 [18~20]、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 γ(PPAR-γ)活性化 [21]、核内因子 κB(NF-κB)活性化の抑制 [22~24]、アラキドン酸代謝物産生の抑制 [25,26] 及びホスホリパーゼ D 活性化 [27] を示し、これらの作用機序により有効性を示すと考えられている。

【特徴】

・国内最高用量　４８００ｍｇ/日

・新規ＤＤＳ-MMＸにより直腸まで大腸全域をカバー

・活動期・寛解期ともに１日１回
・【副作用】
国内臨床試験(3 試験)において、安全性解析対象となった 406 例中、97 例(23.9%)に臨床検査値異常を含む副作用が認められている。その主なものは尿中 *N*-アセチル-β-D-グルコサミニダーゼ(NAG)増加(5.2%)、ビリルビン増加(3.2%)、潰瘍性大腸炎の悪化(3.0%)、アミラーゼ増加(1.5%)、腹部膨満(1.0%)、頭痛(1.0%)、貧血(1.0%)、CRP 増加(1.0%)、尿中蛋白陽性(1.0%)等
【考察】
既存のメサラジン製剤に対し特有の副作用、慎重投与はないが、既存薬より優越性が認められている。また服薬アドヒアランスが低い潰瘍性大腸炎患者は、寛解維持率が優位に低くなるため、１日１回投与は有用性があると思われる。
調剤時には、吸湿性があるため一包化不可、冷所保存という点に注意したい。

【質問事項】
Ｑ：１日１回はいつがよいか？
→臨床試験は朝だが、ライフスタイルに合わせることができる。
（川村Ｄｒより）寝てる間に便をつくり、大腸に到達するのに１日かかるので、やはり朝がいいのでは？
Ｑ　：罹患者の数
→２０年前に比べ増えている。重症でないと難病指定受けられな