

# 마시텐탄(macitentan)

## 요약

마시텐탄은 폐동맥고혈압 치료에 사용되는 약물이다. 하루에 한 번 경구로 복용하며, 단독으로 복용하거나 다른 약물과 함께 투여한다. 태아의 선천성 결함을 일으킬 수 있으므로 임부에 투여하지 않는다.

외국어 표기	macitentan(영어)
CAS 등록번호	441798-33-0
ATC 코드	C02KX04
분자식	C <sub>19</sub> H <sub>20</sub> Br <sub>2</sub> N <sub>6</sub> O <sub>4</sub> S
분자량	588.3 g/mol

동의어: 마시텐탄, 옴서밋, 옴수미트

유의어·관련어: 폐동맥 고혈압 약, pulmonary arterial hypertension drug, 엔도텔린 수용체 길항제, endothelin receptor antagonist, 옴서미트, Opsumit

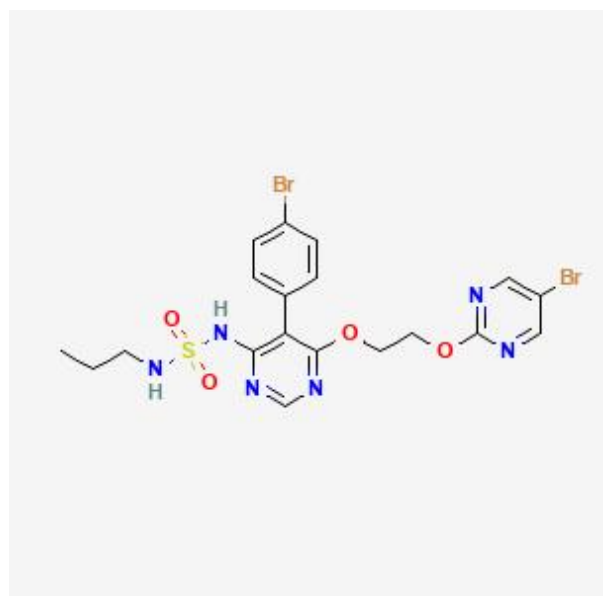


그림 1. 마시텐탄의 구조식

## 폐동맥고혈압

혈압이 높아져 폐의 혈액순환이 나빠지는 질병이다. 운동 시 호흡곤란, 가슴통증, 실신, 부종 등의 다양한 증상이 나타날 수 있다. 일반적인 생각과 달리, 폐동맥압 자체보다는 우심실의 기능, 환자의 운동 능력, 영상 및 혈액검사 결과를 포함한 여러 요인을 종합적으로 평가하고 치료해 사망 위험을 낮추고 삶의 질을 높이는 것이 치료의 목표다. 특히, 환자의 호흡곤란 정도를 세계보건기구 기능등급(WHO functional class, WHO-FC)에 따라 평가한 결과(I~IV 단계)는 환자를 진단하고 예후를 예측하는 데 중요한 지표다.

폐고혈압(pulmonary hypertension, PH)과 용어의 구별이 필요하다. 폐고혈압은 안정 시 평균 폐동맥압이 증가한 상태를 보다 포괄적으로 의미하며, 임상 증상과 병리학적 결과, 혈액학적 특징 및 치료 전략에 따라 다음 5개 군으로 분류된다.: 폐동맥고혈압(1군), 좌심장질환으로 인한 폐고혈압(2군), 폐질환이나 저산소증으로 인한 폐고혈압(3군), 폐동맥폐쇄로 인한 폐고혈압(4군), 불명확하거나 다인자 요인들에 의한 폐고혈압(5군). 즉, 폐고혈압 1군이 폐동맥고혈압이다.

## 약리작용

마시텐탄은 혈관 내피와 평활근에서 엔도텔린-1(endothelin-1, ET-1)\*이 수용체 ET<sub>A</sub>와 ET<sub>B</sub>에 결합하는 것을 방해하는 엔도텔린 수용체 길항제다. ET-1은 혈관의 긴장도와 혈압을 높이는 신체의 여러 물질 중에서 가장 강력하며, 체세포 분열, 세포의 생존, 혈관 신생 등의 다양한 생리 활성화에 관여한다. 폐동맥고혈압 환자의 혈액과 폐에서 특히 ET-1이 활성화된 경우가 많은데, 이러한 과활성을 억제하면 환자의 운동능력을 증가시키고 이환율과 사망률을 감소시킬 수 있는 것으로 알려졌다.

\* 엔도텔린(endothelin): 신체의 펩타이드로 세 가지 유형(ET-1, -2, -3)이 있으며, 여러 수용체(ET<sub>A</sub>, ET<sub>B1</sub>, ET<sub>B2</sub>, ET<sub>C</sub> 등)에 결합함으로써 여러 장기에서 다양한 역할을 나타낸다.

## 효능·효과

WHO 기능 분류 II~III 단계에 해당하는 폐동맥고혈압(폐고혈압 1군) 성인 환자를 장기적으로 치료하는데 사용된다. 폐동맥고혈압 중에서도 특발성, 유전성, 결합조직질환과 연관된 경우, 선천성 심장질환과 연관된

경우에 유효성이 입증되었다. 제품으로 옵서미트®가 있다.

## 용법

하루 한 번 10 mg을 식사와 관계없이 복용하며, 정제를 부수지 않고 물과 함께 전체를 삼킨다. 단독으로 사용하거나 포스포다에스터라제-5 억제제(실테나필 등) 또는 프로스타사이클린 유사체(베라프로스트) 및 프로스타사이클린 수용체 효능제(셀렉시파 등)와 병용해서 투여한다.

그 외 상세 내용은 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다.

## 주의사항

- 간기능에 영향을 미칠 수 있으므로 중증의 간장애 환자에게는 권장되지 않는다. 치료 중 간부전 증상이 나타나거나 간수치가 정상 상한치의 2배 이상 증가할 경우 투여를 중지한다. 이후 간 효소 수치가 정상으로 돌아오면 재투여를 고려할 수 있다.
- 다른 엔도텔린 수용체 길항제와 마찬가지로 헤모글로빈\* 농도가 감소할 수 있으며, 일반적으로 치료 초기에 감소하다가 투여 4~12주 후에 안정화된다. 투여 시작 전에 헤모글로빈 농도를 측정해야 하고, 중증 빈혈 환자에게는 투여가 권장되지는 않는다.
- 치료 또는 질병의 상태와 관련된 체액 저류와 말초 부종이 나타날 수 있다. 증상 완화를 위해 추가적인 치료(이뇨제 복용, 입원 등)가 필요했다는 시판 후 보고가 있다. 중증 심부전이 있는 환자에는 주의해서 투여한다.
- 신장기능이 떨어져 있는 환자에서는 약물의 배설이 느려지고 혈중 농도가 필요이상 상승함으로써 저혈압과 빈혈 위험이 높아질 수 있다. 따라서 혈압과 혈색소 모니터링이 필요하며, 중증의 신장장애 있거나 투석을 시행하는 환자에게는 권장되지 않는다.

\* 헤모글로빈(hemoglobin): 혈액 내의 적혈구에서 철을 포함하고 있는 붉은 색의 단백질로 산소의 운반을 담당한다.

## 부작용

마시텐탄 투여 시 발생 가능한 주요 부작용은 다음과 같다. 그 외 상세한 정보는 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다. 부작용이 발생하면 의사, 약사 등 전문가에게 알려 적절한 조치를 취할 수 있도록 한다.

**흔한 부작용**(사용자의 10% 이상에서 보고)

두통, 빈혈, 비인두염, 기관지염 등

**일반적 부작용**(사용자의 1~10%에서 보고)

간 효소 수치 상승, 요로감염 등

**드문 부작용**(사용자의 1%미만에서 보고)

혈관부종, 체액 저류 등

## 상호작용

마시텐탄은 주로 간 대사 효소 CYP3A4에 의해 대사되므로, 이 효소의 활성화에 영향을 미치는 약물은 마시텐탄의 혈중 농도에 영향을 미칠 수 있다. 함께 투여 시 상호작용을 일으킬 수 있는 약물은 다음과 같다.

Table 1. 마시텐탄의 약물 상호작용

상호작용	약물
마시텐탄의 효과를 증가시켜 부작용 위험성을 증가시키는 약물	CYP3A4 효소 억제제(아미오다론, 이트라코나졸, 케토코나졸 등) 등
마시텐탄의 효과를 감소시키는 약물	CYP3A4 효소 유도제(리팜피신, 카르바마제핀, 페니토인) 등

## 소아, 청소년 사용

18세 미만 소아, 청소년에 대한 안전성과 유효성은 확립되지 않았다.

## 고령자 사용

임상시험에서 고령자와 비고령자 간 안전성과 유효성에 차이가 나타나지 않았다. 다만 75세를 초과하는 환자에 대한 임상 경험이 제한적이고, 고령자는 간기능과 신기능을 포함한 생리 기능이 저하되어 있는 경우가 많으므로 신중하게 투여한다.

## 임부·수유부 사용

- 임부에 투여하면 태아의 선천적 결함을 일으킬 수 있으므로 투여해서는 안된다.
- 가임기 여성의 경우 치료를 시작하기 전 뿐만 아니라 치료 중에도 매달 임신 여부를 확인해야 하며, 치료 중 및 치료 후 1개월까지 확실한 피임을 해야 한다.
- 사람에서 약물이 유즙으로 분비되는지에 대해서는 알려지지 않았지만, 동물실험에서 모유로 이행되는 것으로 나타났다. 모유를 먹는 유아에게 부작용이 나타날 가능성을 배제할 수 없으므로, 약물 투여 중에는 수유하지 않는다.