

◎ネキシウムカプセル, △懸濁用顆粒分包装 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エソメプラゾール [マグネシウム水和物] (U) Esomeprazole Magnesium Hydrate 【分類】 プロトンポンプインヒビター

【単位】 △10mg・◎20mg/Cap, △20mg/懸濁用顆粒分包装

【常用量】 ■20mg/日 [胃潰瘍, 逆流性食道炎 8週間まで, 十二指腸潰瘍6週間まで]

■再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎: 10~20mg/日

■非びらん性胃食道逆流症: 10mg/日 [4週間まで]

■NSAIDs 投与時の胃潰瘍, 十二指腸潰瘍再発抑制: 20mg/日

■H.pylori 除菌の補助: 1回 20mg1日2回, 7日間

【用法】 1日1回 [ピロリ除菌時は1日2回]

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【その他の報告】 PK への腎機能の影響は認められない (Andersson T, et al: Clin Pharmacokinetics 40:411-6, 2001)

高齢者での用量調節は不要 (Hasselgren G, et al: Clin Pharmacokinetics 40:145-50, 2001)

【特徴】 オメプラゾールの S エナンチオマー。カプセル内は腸溶性コーティングされている顆粒。プロトンポンプ (H⁺,K⁺-ATPase) の SH 基と活性体 (スルフェンアミド体) が不可逆的に S-S 結合して活性を阻害する。

【主な副作用・毒性】 ショック・アナフィラキシー, 無顆粒球症, 肝障害, SJS, TEN, 横紋筋融解症, 間質性腎炎, 錯乱, 皮膚炎, CK 上昇, 女性化乳房, 消化器症状, 視力障害, 味覚障害など

【吸収】 食事の影響を受けて吸収率が低下するので, 食事の 1hr 以上前に投与すべき (U) 臨床効果に食事の影響なし (1)

【F】 単回 64%, 反復 90% (U) 50% (1) 単回 50%, 反復投与時 68% (Hassan-Alin M, et al: Eur J Clin Pharmacol 56: 665-70, 2000)

【tmax】 1.6hr (U)

【代謝】 主に CYP2C19 で水酸化体, 脱メチル体で代謝, CYP3A4 ではスルホン体に変換され CYP2C19 と 3A4 の寄与率は同等 (1,U) 代謝物に活性なし (1,U) オメプラゾールよりも CYP2C19 による固有クリアランスは低下しているが, CYP3A4 の寄与は上昇している (1) 血中の主代謝物はスルホン体とヒドロキシ体でいずれも不活性 (1) R 体よりも消失が遅い (1) オメプラゾールと同様の代謝経路をたどる (Andersson T, et al: Clin Pharmacokinetics 40:411-26, 2001) オメプラゾールよりも CYP3A4 の関与が高く, CYP2C19 の遺伝的多型は, GERD の効果に関連しない (Schwab M, et al: Clin Pharmacol Ther 78: 627-34, 2005)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1%未満 (1,U) 80%が代謝物として尿中に回収 (U)

【CL】 21.7L/hr (1) 反復投与時の AUC 増加は初回通過効果の低下と CL の低下の両者によると思われる (Hassan-Alin M, et al: Eur J Clin Pharmacol 56: 665-70, 2000)

【t1/2】 1.0~1.5hr (U) CYP2C19 の EM=0.9hr, hetero EM=1.3hr, PM 1.6hr (1) R 体よりも消失は遅い (1)

【蛋白結合率】 97% (1,U)

【Vd】 Vss=16L/man (U) 17.8L/man (1)

【MW】 767.2 [Mg 水和物]

【透析性】 HD, PD でも除去されない (1)

【O/W 係数】 2.24 [1-オクタノール水系] (1) 【薬物動態】 非線形の AUC 増加 (U) 【TDM のポイント】 TDM の対象にならない。血中濃度と胃酸分泌抑制効果は相関しない (1) CYP2C19 の EM ではオメプラゾール, ラベプラゾール, ランソプラゾールよりも胃酸分泌抑制効果が強い (Sahara S, et al: Aliment Pharmacol Ther 38: 1129-37, 2013)

【相互作用】 アタザナビル, リルピビリンの吸収低下のため併用禁忌 (1)

【主な臨床報告】 ピロリ除菌では CYP2C19 遺伝的多型の影響を受けない [メタ解析] (Morino Y, et al: Front Pharmacol 2021 PMID: 34721043)

【更新日】 20220512

※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。