

◎オメプラゾン錠・△オメプラール錠 [内], ◎オメプラゾール注射 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 オメプラゾール (U) Omeprazole 【分類】 プロトンポンプインヒビター

【単位】 △10mg・◎20mg/錠, ◎20mg/V「NP」

【常用量】

■胃潰瘍、吻合部潰瘍、十二指腸潰瘍、Zollinger-Ellison 症候群：1日1回20mg [胃潰瘍、吻合部潰瘍：8週間まで、十二指腸潰瘍では6週間まで]

■逆流性食道炎：1日1回20mg [8週間まで] 再発・再燃を繰り返す場合の維持療法：1日1回10~20mg

■ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助：1回20mg/1日2回7日間 [AMPC, CAM と併用]

■非びらん性胃食道逆流症：1日1回10mg [4週間まで]

■注射：40mg/日

【用法】

■内服：1日1回

■注射：1日2回 静注又は点滴静注 [生食もしくは5%ブドウ糖に溶解] 内服可能となった後は経口投与に切りかえる [めやすとして3日間, 最大7日間]

▼単独ルート投与

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1,3,10) 透析除去されないので透析に関係なく投与してよい (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10,12)

【特徴】 壁細胞のプロトンポンプを阻害することによって胃酸分泌抑制作用を示す。基礎分泌及びあらゆる刺激分泌、各種実験潰瘍に対して H2 ブロッカーよりも強力な作用を示す。効果持続時間が長く 1日1回投与で胃潰瘍・十二指腸潰瘍に対して効果を発揮する。注射の適応は出血性潰瘍であるので、pH6~7 を目標としており 1日20mg を 1日2回静注する。

【主な副作用・毒性】 ショック、血液障害、肝障害、SJS、TEN、視力低下、間質性腎炎、急性腎不全、発疹、皮疹、蕁麻疹、掻痒感、消化器症状、口渇、口内炎、顕微鏡的大腸炎、頭痛、めまい、振戦、しびれ感、発熱、浮腫、女性化乳房、脱毛、頻尿、倦怠感、味覚異常、心悸亢進、月経異常など

【モニターすべき項目】 血液像、肝機能、腎機能

【吸収】 少なくとも 80%以上 (1) 速やか (U)

【F】 53.6% (1) 初回通過効果を 43%受ける (1) 65% (11) 53%, 肝硬変・加齢により上昇 (13)

【tmax】 0.5~3.5hr (U) 2.1~2.5hr (1) CYP2C19 の EM で 1hr 以内、PM で 3~4hr (13) 【Cmax】 健常者に 1日2回、1回20mg を 4日間経口投与後 Cmax は EM で 0.68 μM、PM で 3.5 μM (13)

【代謝】 肝代謝 (U) CYP2C19 によって 5 位が水酸化され、CYP3A4 によって S 位が酸化される (9) 血漿中には水酸化・スルフィド体・スルホン酸体の 3 つの代謝物が、尿中には活性を持たない 6 つの代謝物が同定されている。オメプラゾールは CYP1A1, 1A2 を誘導する (11) 代謝物に活性なし (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 5%以下 (10) 0% (U) 1%以下 (Clin Pharmacol Ther 40: 344-351,1986 および Scand J Gastroenterol 166: 33-40,1989) 尿中に 72~80%回収、一部腸肝循環を経て糞便中に 18~23%回収 (U) 尿中回収率 78% [iv] (1)

【CL】 530mL/min (1) 500~600mL/min (U) 594mL/min、慢性肝疾患で 67mL/min (U,11) 7.5mL/min/kg, 加齢・肝硬変で低下 (13)

【t1/2】 EM で 0.7~1.2hr, PM で 2.5~3hr (1) 1.5~3hr (10) 0.7hr, 加齢・肝硬変により延長 (13) 0.5~1.0hr (12) 【透析患者の t1/2】 2~4hr (10) 腎機能正常者と同じ (12)

【蛋白結合率】 96% (1) 約 95% [Alb と AAG] (U,11,12,13)

【Vd】 0.31L/kg (1) 0.34L/kg (13) 【分布】 臓器、特に胃壁細胞に分布 (U) 0.3~0.4L/kg、胃・肝・腎・胆嚢に分布 (11)

【MW】 345.42

【透析性】 蛋白結合率が高いため除去されない (U) 除去されない (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない。20mg 投与で基礎酸分泌 93~94%抑制。20mg 投与でテトラガストリン刺激後 2hr までの胃酸分泌を 93%抑制する。20mg 投与で夜間 8hr の胃酸分泌を 73%抑制する (1) 24hr 胃内 pH は 10mg [iv] および 20mg [po] で 3~4, 20mg [iv] で 3.5~5. Martin らはシメチジンによる上部消化管出血の予防効果を検討した結果、胃内 pH を持続的に 4 以上に保つことが必要としている。Green らは、in vitro で pH6.4 では血液凝固能が 50%に減少し、pH5.4 で血小板凝集がみられなくなると報告している (Gastroenterology 74: 38,1978) 【O/W 係数】 LogP=2.2 (11) ∞ [クロロホルム/buffer, pH7] (1) 【pKa】 4.5, 8.9 (1)

【相互作用】 胃 pH 上昇のため、経口ペニシリン (アンピシリンエステル)、鉄剤、ケトコナゾールの吸収が低下する。CYP を阻害することにより、ジアゼパム、フェニトイン、ワルファリンの血中濃度を上昇させる (U) CYP2C19 を阻害してクロピドグレル活性代謝物の血中濃度が低下して抗血小板作用が減弱する可能性がある (1) アタザナビル、リルピビリンの吸収阻害に関連するため併用禁忌 (1) SJW により特に CYP2C19 の EM でオメプラゾールの代謝が促進される (Wang LS, et al: Clin Pharmacol Ther 75: 191-7, 2004)

【主な臨床報告】

【H pylori 除菌治療】 CYP2C19 の EM では初回の除菌失敗例が PM に比べて多いが、PPI および抗生剤の増量で除菌可能である (Clin Pharmacol Ther 69:159-168,2001)

【出血性消化性潰瘍の内視鏡的治療後】 高用量注射 (80mg を単回静注後 8mg/hr で 72hr 点滴) し、終了後は 20mg/日を 8 週間経口投与するという治療により、そ

の後の再出血のリスクが大幅に低下した (James YW. et al: N Engl J Med 343: 310-6,2000)

【遺伝子多型の影響】 遺伝子型により内服薬の至適投与量は Poor metaboliser: 20mg/日、Intermediate metaboliser: 60mg/日、Rapid metaboliser: 100mg/日 (石崎高志 第23回日本臨床薬理学会,2002)RM では治療初期に十分な胃酸分泌抑制を得るにはH2-blockerとの併用が有用で,PM ではオメプラゾール単剤でよい(Sugimoto M, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 539-48, 2006)

【効果発現時間】 1hr 以内 【最大効果発現時間】 2hr 以内

【効果持続時間】 内服 : 72hr 以上 (酸産生が完全に回復するのに96hr かかる) (U) 注射 : 12 時間にわたり胃酸分泌を抑制 (1)

【更新日】 20211111

---

※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。