△ネキシウムカプセル・△懸濁用顆粒分包，◎エソメプラゾールカプセル　［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】PPI
【単位】△10mg・◎20mg/Cap，△20mg/懸濁用顆粒分包
【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】常用量（1）
【保存期 CKD 患者への投与方法】常用量（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 Pharmacokinet 2001 PMID: 11475467）
高齢者での用量調節は不要（Hasselgren G, et al: Clin Pharmacokinet 2001 PMID: 11286324）
【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
【安全性に関する情報】エソメプラゾールを含む PPI 関連低 Mg 血症のケースシリーズ（Hoorn EJ, et al: Am J Kidney Dis 2010 PMID: 20189276）
【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，脱メチル体に代謝，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 Pharmacokinet 2001 PMID: 11475467）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 2005 PMID: 16338278）
【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 2000 PMID: 11214773）
【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）

【薬物動態】非線形の AUC 増加（U）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 2013 PMID: 24099474）
【TDM のポイント】血中濃度と胃酸分泌抑制効果は相関しない（1）
【O/W 係数】2.24［1-オクタノール/水系］（1）
【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】20250528

※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。