◎タケプロン OD 錠，○ランソプラゾール OD 錠 ［内］，▼タケプロン静注用 ［注］

【重要度】 【一般製剤名】ランソプラゾール（U） Lansoprazole 【分類】PPI
【単位】◎15mg・◎30mg/OD 錠，▼30mg/V
【常用量■30mg/日［胃潰瘍・吻合部潰瘍・逆流性食道炎では 8 週間まで、十二指腸潰瘍では 6 週間まで］
■逆流性食道炎再発・再燃時：15mg/日でさらに無効な場合は 30mg/日
■非びらん性胃食道逆流症：15mg/日（4 週間まで）
■H.pylori 除菌：30mg×2/日［AMPC，CAM と併用で 7 日間］
■NSAIDs 併用時の胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制：15mg/日［期間制限なし］
■静注：30mg を 1 日 2 回
【用法】■分 1［朝服用が望ましい］
■静注：生食もしくは 5%ブドウ糖 20mL に溶解して 1 日 2 回点滴静注もしくは緩徐に静注［3 日間までで多くは効果有り，7 日間以上の使用経験なし］
【透析患者への投与方法】常用量（3,10, Clin Pharmacol Ther 61: 450-8,1997）
【その他の報告】PD 患者において，15mg/日投与時のコラーゲン性大腸炎の報告（松村実美子，他: 透析会誌 47: 387-93, 2014）
【保存期 CKD 患者への投与方法】常用量（3,10,12）
【特徴】胃粘膜壁細胞の酸生成部位へ移行した後，酸による転移反応を経て活性体へと構造変換され，この活性体が酸生成部位に局在してプロトンポンプとしての役割を担っている H+, K+-ATPase の SH 基と結合し，酵素活性を抑制することにより酸分泌を抑制する（抑制されたプロトンポンプ活性は内因性のグルタチオンあるいは de novo の蛋白合成により回復すると推定されている）．

【主な副作用・毒性】血小板減少，無顆粒球症，肝障害，便秘，下痢，口渇，悪心，嘔吐，カンジダ症，舌炎，味覚異常，頭痛，うつ，めまい，振戦，女性化乳房，浮腫，関節痛，筋肉痛，脱毛など．膠原線維性大腸炎（collagenous colitis）との関連も示唆されている
【安全性に関する情報】利尿剤使用患者では PPI による血清 Mg の低下が認められる（Danziger J, et al: Kidney Int 83: 692-699, 2013）
PPI は高度な血清 Mg 濃度の低下に関連している可能性がある［H2B で補正しても有意］（Markovits N, et al: J Clin Pharmacol 2014）
PPI の毒性機序には，上皮機能障害，低 Mg 血症，薬物間相互作用，栄養素吸収低下，胃内最近の増加，小腸内細菌の異常増殖，免疫反応異常，尿細管間質の炎症，骨代謝亢進，脳内アミロイド沈着が知られている［レビュー］（Corsonello A, et al: Curr Drug Metab 2018 PMID: 29219052）
CKD での PPI 使用者は，腎機能低下による血清 Mg 濃度の上昇が発現しにくい（Hughes J, et al: PLoS One 2018 PMID: 29799851）
PPI は尿路結石発生と関連するかも知れない［尿中クエン酸，Mg レベルが低い］（Bapir R, et al: Arch Ital Urol Androl 2022 PMID: 36576453）

【吸収】85%（11）胃を通過すると速やかにほぼ完全に吸収される．空腹時に比し食後 30min の服用では F は低下する．肝硬変患者では吸収が遅延する（U）
【F】66.2%［EM］（1）ほとんど初回通過効果を受けない（11）81%（13）食物と同時摂取により低下，食後 30 分でも影響を受ける（13）
【tmax】2.2hr（絶食下）3.5hr（食後）（1）1～2hr だが、夜間投与に比し朝投与の方が tmax は短縮する。ランソプラゾール自体の血清濃度と胃酸分泌は相関しないが、胃酸分泌は用量依存性である。夜投与するよりも朝投与する方が 2 倍血中濃度は高い。胃壁細胞内のランソプラゾールと活性体濃度が酸分泌抑制効果の主な決定因子である（U）1.3hr（13）
【Cmax】15mg 単回経口投与時 248ng/mL，食物と同時摂取で低下する（13）
【代謝】主として肝臓，一部腸内細菌によって代謝［ラット］（1）胃壁細胞の酸性環境下では 2 種類の活性体になるが，これらの活性体は全身循環血中には存在しない（U）主として CYP2C19 により代謝され水酸化体に変換（1）CYP3A4 によっても代謝される（1）CYP2C9，3A，1A による水酸化される経路も存在するが寄与率は低い（1）GERD への効果は CYP2C19 の遺伝子型により影響され，PM で最も高い（Furuta T, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 453-60, 2002）
【排泄】尿中未変化体排泄率 0%［iv］（1）1%以下（U,13）5%以下（10）0%（12）尿中に代謝物として 12～17%回収［iv，24hr まで］（1）投与量の 14～25%が水酸化代謝物とその抱合体として尿中に排泄（U）投与量の 2/3 が代謝物として糞便中に排泄（U）
【CL】CYP2C19 の EM：7～8L/hr，PM：2～2.5L/hr［iv］（1）6.23mL/min/kg，加齢・肝障害により低下（13）【非腎 CL/総 CL】100%（10）
【t1/2】CYP2C19 の EM：1.5hr，PM：4hr（1）0.9hr，加齢・肝障害により延長（13）2hr（10）平均 1.5hr［1.3～1.7hr］（11）1.3～2.9hr（12）【透析患者の t1/2】1.6～2hr（10）短縮する（U）腎機能正常者と同じ（12）
【蛋白結合率】97%［腎不全で 1～1.5%低下するのみ］（U,13）97～99%（11）98%以上（12）
【Vd】12L/man［iv］（1）24L/man（11）0.35L/kg（13）【分布】組織，特に胃壁細胞に分布する（1）
【MW】369.36
【透析性】ランソプラゾールおよびその代謝物ともに HD でほとんど除去されない（U）除去されない（1）
【TDM のポイント】TDM の対象にはならない
【O/W 係数】240（pH7）0.8（pH13）（11）240［1-オクタノール/水系，pH7］（1）【pKa】1.3，4.5，8.87（1）
【相互作用】テオフィリンの血中濃度低下 ： ランソプラゾールによる肝代謝酵素誘導が考えられている．フェニトイン・ジアゼパムの代謝・排泄遅延：オメプラゾールで報告されている．アタザナビル：胃酸分泌抑制による溶解性の低下による吸収率低下（1）イトラコナゾールカプセル，チロシンキナーゼ阻害剤，ベルモスジル吸

収抑制（1）酸化Mgの緩下作用減弱のおそれ（1）

【主な臨床報告】H.pylori 除菌治療におけるランソプラゾールの役割は胃内の pH を上昇させることにより，併用される AMPC 及び CAM の抗菌活性を高めることにある．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 69:159-68, 2001）胃潰瘍，十二指腸潰瘍，胃 MALT リンパ腫，TTP，早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃の H.pylori 除菌の補助に使用できる（1）CYP2C19 の EM（wt/wt）は除菌不成功に関連するので用量を増やすべき（Schwab M, et al: Clin Pharmacol Ther 76: 201-9, 2004）

低用量アスピリンの長期服用に関連して潰瘍合併症を発症した患者では H. pylori 感染の除菌に加えて，除菌後のランソプラゾールによる治療が潰瘍合併症の再発率を有意に減少（Lai KC, et al: N Engl J Med 346: 2033-8,2002）

GERD には食後に血中濃度を上げる事とプロトンポンプ発現量から夕食前投与がベター（島谷智彦，他: 日消誌 110: 979-988, 2013）

【効果発現時間】胃内 pH の上昇は 30mg 単回投与後 1～2hr で現れ、30mg 連続投与後 1hr で現れる（U）

【効果持続時間】24hr 以上．中止後の酸分泌のリバウンドは示されない．Zollinger-Ellison 症候群の患者では作用時間が延長する（U）

【備考】カプセルおよび OD 錠は腸溶性顆粒を含有する製剤である

【更新日】20241030

※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。