◎サイトテック錠　[内]

【重要度】　【一般製剤名】ミソプロストール（U）　Misoprostol　【分類】抗 NSAID 潰瘍剤
【単位】▼100μg・◎200μg/錠
【常用量】800μg/日
【用法】分 4［毎食後および就寝前］■1 回量を増やすと下痢が起こりやすいため少量分割投与がよい
【透析患者への投与方法】尿中未変化体排泄率が低く減量の必要はないと思われるが，腎不全患者ではクリアランスが低下し腹部膨満感や下痢が起こりやすい可能性があり，そのような患者では減量を考慮（5）
【その他の報告】腎不全では血漿濃度上昇による副作用を回避するため減量すべき（J Clin Pharmacol 35: 384-9,1995）
腎不全患者では健常者に比し AUC は上昇し，t1/2 は延長するが，投与量を減量する必要はない（J Rheumatol Suppl 20: 33-7,1990）
腎以外の経路で排泄されるため，投与量を減量する必要はない（Clin Pharmacokinet 27: 393-408,1994）
減量の必要なし（3）
【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし（3）
【その他の報告】Ccr 20mL/min 以上では t1/2 やクリアランスに変化ないため減量の必要性はない（Foote EF, et al: J Clin Pharmacol 35: 384-9, 1995）
Ccr＞30mL/min：常用量（18）
NSAIDs の AKI リスク軽減に関与しているかもしれない（Mitsuboshi S, et al: Br J Clin Pharmacol 2023 PMID: 37309574）
【特徴】プロスタグランジン E1 誘導体．胃酸分泌抑制作用，粘膜防御作用を有する．NSAIDs の長期投与時にみられる胃潰瘍及び十二指腸潰瘍に対し抑制効果を示す．NSAIDs 誘発性腎障害に対する保護効果があるという報告もある（J Reumatol 22: 713-6, 1995）.
【主な副作用・毒性】下痢、腹部膨満感など
【安全性に関する情報】
【吸収】速い（U）88%（11）吸収は高脂肪食により遅延する（13）
【F】ミソプロストール酸 80%以上（13）初回通過効果を受ける（11）
【tmax】ミソプロストール酸 24min、食物と同時摂取で延長（13）12±3min（U）【Cmax】健常者に 400μg を単回投与後の Cmax は 674pg/mL、食物との同時摂取で低下する（13）
【代謝】急速に脱エステル化されミソプロストール酸（主な生物学的活性代謝物）になる．ジエステル化された代謝物はさらに beta、omega 酸化により代謝され体内の各組織に存在する（U）
【排泄】尿中ミソプロストール酸排泄率 1%以下（13）腎 64～73%、糞便 15%（U）
【CL】ミソプロストール酸 240mL/min、腎障害・肝障害で低下（13）284mL/kg/min，末期腎不全 94mL/kg/min（Foote EF, et al: J Clin Pharmacol 35: 384-389,1995）
【t1/2】ミソプロストール酸 0.5hr，末期腎障害で延長し（CCr20mL/min 以上では変化なし），肝障害で延長する（13）活性体 1.5hr、親化合物は血中で検出不能（10）20～40min（terminal）（U）21min（1,11）【透析患者の t1/2】腎機能正常者の t1/2 が 0.70hr であるのに比し、1.27hr に延長する（J Clin Pharmacol 35: 384-389,1995）
【蛋白結合率】約 85%（U,10）ミソプロストール酸 81～89%（11,13）
【Vd】858L/man（11）ミソプロストール酸 14L/kg（13）40L/man（U）
【MW】382.5
【透析性】除去されにくいと思われる（5）
【TDM のポイント】TDM の対象にはならない【O/W 係数】∞[クロロホルム系，pH4-9］（1）
【相互作用】酸化 Mg との併用で下痢が発現しやすくなる（1）
【主な臨床報告】1200μg/日で腸管通過時間短縮し慢性便秘に有用（Soffer EE, et al: Dig Dis Sci 1994 PMID: 8174433）
【効果持続時間】3～6hr　（U）
【備考】子宮収縮作用があるため、妊婦または妊娠している可能性のある婦人には禁忌（1）スクラルファートよりも NSAIDs 胃潰瘍の予防に優れる（Agrawal NM, et al: Ann Intern Med 115: 195-200, 1991）アスピリン大量投与の RA 患者の胃・十二指腸潰瘍治療に有用（Roth S, et al: Arch Intern Med 149: 775-9, 1989）NSAIDs 誘発性消化性潰瘍の予防効果あり［年間発生率 12.5%対 28.9%］（Elliott SL, et al: Scand J Rheumatol 23: 171-6, 1994）100～200μg×4 回/日投与で NSAIDs 使用患者の胃潰瘍予防効果あり［下痢の副作用は多い］（Graham DY, et al: Lancet 8623: 1277-80, 1988）200μg×2～3 回/日によって十分な NSAIDs 誘発性胃・十二指腸潰瘍の予防効果が期待できる［副作用は 800μg/日よりも少ない］（Raskin J, et al: Ann Intern Med 123: 344-50, 1995）200μg とジクロフェナク 75mg を 1 日 2 回投与でも胃・十二指腸潰瘍を予防できる（Bocanegra TS, et al: 25: 1602-11, 1998）NSAIDs 胃潰瘍の予防効果はランソプラゾールと同等（Graham DY, et al: Arch Intern Med 162: 169-75, 2002）ミソプロストールはほぼ同量の偏左右異性体 diastereomer を含有する（13）
【更新日】20240715

※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。