

くすり一口メモ

空腹時に服用する薬剤とその理由

鹿児島市医師会病院 薬剤部 | 桐野 玲子

多くの内服薬は、飲み忘れを防ぎ胃腸障害などの副作用を軽減する目的で食後の服用となっていますが、食事の影響や薬理作用上の観点から、食前または食間などの空腹時に服用しなければならない薬剤も存在します。添付文書上の用法が「空腹時」と記載されている薬剤の多くは、食後に服用すると空腹時と比べて吸収が悪くなり十分な薬効を発揮することができません。これは、食後投与では空腹時投与と比較してCmax（最高血中濃度）およびAUC（血中濃度曲線下面積）が低下して血中濃度が下がるといったデータに基づいています。

食事の影響を受ける薬剤の中には、起床時に服用するビスホスフォネート（BP）製剤や睡眠薬の一部も含まれます。BP製剤は金属イオンとキレート（錯体）を形成することで吸収が非常に悪くなるため、飲食物との影

響を避ける目的で空腹である起床時の服用となっています。睡眠薬のベルソムラ[®]、ルネスタ[®]、ロゼレム[®]は、食後に服用すると空腹時投与に比べて血中濃度が低下し入眠効果の遅れにつながり、ドラル[®]については、食後に服用すると吸収が高まり空腹時の2～3倍の効果になることが報告されているため注意が必要となります。また、分子標的治療薬については、食事との影響を避ける目的で「空腹時」の用法となっている薬剤が多いですが、食後投与は空腹時投与に比べて血中濃度が低下する薬剤だけでなく上昇する薬剤もあり、「食事の1時間前から食後2、3時間までの間の服用は避けること」と具体的な服用方法も記載されています。

下記に添付文書の用法に空腹時（空腹時、食前、食直前、食間等）投与として記載された薬剤について抜粋しまとめました。

用法	分類	商品名 (先発薬)	成分名	添付文書の記載事項			食後の 血中 濃度			
				用法	食事の影響	服薬タイミング				
空 腹 時	前立腺がん治療薬	ザイティガ	アピラテロン	1日1回 空腹時	絶食時と比べて高脂肪食後はCmaxが17倍、AUCが10倍に増加	食事の1時間前から食後2時間までの間の服用は避けること	増加			
		ジェセリ	ビミテスピブ		空腹時と比べ高脂肪食摂取後はCmaxが1.92倍、AUCが約1.64倍に増加					
	分子標的治療薬 (抗悪性腫瘍薬)	ベレキシブル	チラブルチニブ		空腹時と比べ食後の幾何平均値の比はCmax:1.74、AUC:1.29		食事の1時間前から食後2時間までの間の服用は避けること	低下		
		カボメティクス	カボザンチニブ		空腹時と比べ食後はCmaxが41%、AUCが57%増加					
		メキニスト	トラメチニブ		絶食時と比べ高脂肪食摂取後はCmaxが約70%、AUCが約10%低下					
		エザルミア	パレメトスタット		空腹時と比べ高脂肪食摂取後の幾何平均値の比はCmax:0.487、AUC:0.703					
		ニンラーロ	イキサゾミブ		空腹時と比べ高脂肪食摂取後はCmaxが69%、AUCが28%低下					
		タフィンラー	ダブラフェニブ		絶食時と比べ高脂肪食摂取後はCmaxが51%、AUCが31%に低下					
		セムブリックス	アシミニブ		空腹時と比べ高脂肪食摂取後の幾何平均値の比はCmax:0.318、AUC:0.377			増加		
		コセルゴ	セルメチニブ		絶食時と比べ高脂肪食摂取後はCmaxが50%、AUCが16%低下					
		ゼルボラフ	ベムラフェニブ		1日2回 経口投与				絶食時と比べ高脂肪食摂取後はCmaxが2.5倍、AUCが4.6倍に増加	
		ジオトリフ	アフアチニブ		1日1回 空腹時			空腹時と比べ高脂肪食摂取後はCmaxが50%、AUCが39%低下	食事の1時間前から食後3時間までの間の服用は避けること	低下
		タルセバ	エルロチニブ		1日1回			空腹時投与に比べて高脂肪食後はAUCがほぼ2倍に増加	食事の1時間以上前または食後2時間以降に経口投与（食事の影響を避けるため食事の1時間前から食後2時間までの間の服用は避けること）	増加
		ヴォトリエント	パゾパニブ					絶食時と比べて高脂肪食後はCmaxが約2.1倍、AUCが約2.3倍に増加		
		タシグナ	ニロチニブ		1日2回			空腹時と比べて食事30分後はCmaxが1.55倍、AUCが1.32倍に増加		

用法	分類	主な商品名 (先発薬)	成分名	添付文書における用法 および服薬のタイミング	空腹時服用の理由
空腹時	抗真菌薬	イトリゾール 内用液	イトラコナゾール	1日1回 空腹時	空腹時投与の方が食直後と比べてイトラコナゾールの吸収が良好でCmaxが高かったため
	糖尿病治療薬 (GLP-1受容体作動薬)	リベルサス	セマグルチド	1日1回 空腹時(1日の最初の飲食の前)に約120ml以下の水とともに服用	セマグルチドは主に胃で吸収され、胃内に飲食物があると有効成分の吸収が低下するため
	抗B型肝炎ウイルス薬	バラクルード	エンテカビル	1日1回 空腹時 (食後2時間以降かつ次の食事の2時間以上前)	食事の影響により吸収率が低下するため
	がん悪液質治療薬	エドルミズ	アナモレリン	1日1回 空腹時 (本剤服用後 1時間は食事をしないこと。起床時の服用を推奨)	Cmax, AUCについて、食事1時間前投与は空腹時と比べて大きな違いはなかったが、食後2時間後投与は空腹時と比べて大きく低下したため
	抗アレルギー薬	ビラノア	ビラスチン	1日1回 空腹時(食事の1時間以上前または食後2時間以上あと)	空腹時に比べ食後投与は、Cmaxが約60%、AUCが約40%低下するため
		ディレグラ配合	フェキソフェナジン・ ブソイドエフェドリン	1日2回 朝と夕の空腹時	空腹時に比べ食後投与は、フェキソフェナジンのCmax, AUCともに低下するため
	免疫調節薬	メタルカプターゼ	ベニシラミン	1日1~数回 空腹時 食前または食間の空腹時	2価の金属イオンと結合しやすいため、食事との間隔をあけて空腹の食前または食間に服用(空腹時に比べ食後のCmaxおよびAUCが低下)
	ファブリー病治療薬	ガラフォルド	ミガーラスタット	1日1回隔日投与(食事の前後2時間を避けて投与)	絶食時と比べて食事摂取の1時間前後ではCmax, AUCともに低下するため
消化性潰瘍治療薬	アルロイドG	アルギン酸	1日3~4回 空腹時	胃や食道の粘膜を覆って保護するため、空腹時の食前または食間服用がより効果的であるため	
食前	抗結核薬	リファジン	リファンピシン	原則として朝食前空腹時	食前投与は食後に比べて血中濃度が高いという報告に基づき食前投与しているが、「食後投与でも許容できる」と結核診療ガイドに記載あり
	女性ホルモン剤 (GnRHアンタゴニスト)	レルミナ	レルゴリクス	1日1回 食前	食後投与のCmax, AUCは絶食時と比べて顕著に低くなり、食前投与のCmax, AUCは絶食時と比べて大きな違いはなかったため
	ALS治療薬	リルテック	リルゾール	1日2回 朝夕食前	空腹時より高脂肪食摂取後は血中濃度が低下するという報告に基づき食前としている
	アルドース還元酵素阻害薬	キネダック	エバルレスタット	1日3回 毎食前	食後高血糖による神経内ソルビトール増加時に血中濃度が高くなるように食前に服用(食後は食前に比べCmaxが約30%減少したとの報告あり)
	ディスベプシア治療薬	アコファイド	アコチアミド	1日3回 毎食前	食後の症状改善を目的としており、食事の影響も受けるため(空腹時、食前、食後投与の比較でCmaxは食前が最も高くAUCは食後が最も低い)
	慢性便秘症治療薬	ゲーフィス	エロピキシバット	1日1回 食前	血中に移行して効果を発揮する薬剤ではなく、食事の刺激により胆汁酸が放出される前に投与した方が良かったため
		リンゼス	リナクロチド	1日1回 食前	食前投与に比べて食後投与では軟便、下痢の症状が多かったため食前投与となっている
	消化管機能調整薬	ガナトン	イトブリド	1日3回 毎食前	制吐剤であり、また、消化管の蠕動運動を亢進させて食後胃内の食物が長く滞留しないように腹部の不快感を改善するために食前投与がより効果的である
		ナウゼリン	ドンペリドン		
		プリンペラン	メトクロプラミド	1日2~3回 食前	
食欲抑制剤 (肥満症治療薬)	サノレックス	マジンドール	1日1回 昼食前	食欲抑制剤であるため食前服用としており、朝は消化器症状の副作用が現れやすく、夕は睡眠障害の副作用があるため昼食前としている	
食直前	糖尿病治療薬 (速効型インスリン分泌促進薬)	グルファスト	ミチグリニド	食事5分前以内の毎食直前	速やかなインスリン分泌作用により食後の過血糖を改善するため食直前に服用。食後投与では吸収が悪く十分な効果が得られない
		ファステック	ナテグリニド	食事10分前以内の毎食直前	
		シュアポスト	レバグリニド		
	糖尿病治療薬 (αグルコシターゼ阻害薬)	ベイスン	ボグリボース	1日3回 毎食直前	食物中の二糖類の消化吸収を遅らせて食後の過血糖を改善するため食直前に服用
		グルコバイ	アカルボース		
		セイブル	ミグリトール		
高リン血症治療薬	レナジェル	セベラマー	1日3回 毎食直前	リン吸着薬は一般的に食直前、食事中、食直後のどのタイミングでも食中のリンの吸着を目的としているため、食事と服用が近ければ効果があるとされている	
	キックリン	ピキサロマー			
	ピートル	スクロオキシ			
食間	抗真菌薬	ブイフェンド	ポリコナゾール	1日2回 食間	高脂肪食摂取後のCmaxとAUCが、空腹時に比べそれぞれ34%、24%低下したデータに基づき、食事の影響を受けないように食間投与としている
起床時	骨粗鬆症治療薬	ベネット	リセドロン酸	起床時 (最初の飲食前に服用し服用後30分以上は水以外の飲食を避ける)	2価陽イオンとキレート(錯体)を形成し吸収が著しく低下するため、飲食物との影響を避ける目的で空腹時の起床時投与としている
		フォサマック	アレンドロン酸		
		ボノテオ	ミノドロロン酸		
就寝前	睡眠薬	ロゼレム	ラメルテオン	就寝前 (食事と同時にまたは食直後の服用は避けること)	食後投与は空腹時と比べて血中濃度が低下し、入眠効果の発現が遅れるおそれがあるため
		ベルソムラ	スボレキサント		
		ルネスタ	エスゾピクロン		
		ドラール	クアゼパム	就寝前 (食後の服用を避けること)	難溶性薬物である本剤は、胃内容物の残留によって吸収性が向上し、血中濃度が空腹時の2~3倍に高まることが報告されているため

【参考資料】添付文書および各社メーカー資料