

methylprednisolone (JP)
メチルプレドニゾロン
副腎皮質ホルモン

245

基本電子添文 | ドロール錠2024年1月改訂

【製品】規制等：(処方)

メドロール Medrol 錠2・4mg (ファイザー)

【組成】〔錠剤〕：1錠中2mg, 4mg

【効能・効果】①内分泌疾患：急性副腎皮質機能不全(副腎クリーゼ)、慢性副腎皮質機能不全(原発性、続発性、下垂体性、医原性)、副腎性器症候群、亜急性甲状腺炎、甲状腺中毒症〔甲状腺(中毒性)クリーゼ〕、甲状腺疾患に伴う悪性眼球突出症、ACTH単独欠損症 ②膠原病：リウマチ熱(リウマチ性心炎を含む)、エリテマトーデス(全身性及び慢性円板状)、多発性筋炎(皮膚筋炎)、全身性血管炎(高安静脈炎、結節性多発動脈炎、顕微鏡的多発血管炎、多発血管炎性肉芽腫症を含む) ③アレルギー性疾患：気管支喘息、喘息性気管支炎(小児喘息性気管支炎を含む)、薬剤その他の化学物質によるアレルギー・中毒(薬疹、中毒疹を含む)、血清病、蕁麻疹(慢性例を除く。重症例に限る)、アレルギー性血管炎及びその類症(急性痘疹様苔癬状紅斑疹を含む) ④血液疾患：溶血性貧血(免疫性又は免疫性機序の疑われるもの)、白血病(急性白血病、慢性骨髄性白血病の急性転化、慢性リンパ性白血病、皮膚白血病を含む)、顆粒球減少症(本態性、続発性)、紫斑病(血小板減少性及び血小板非減少性)、再生不良性貧血、凝固因子の障害による出血性素因 ⑤神経疾患：脳脊髄炎(脳炎、脊髄炎を含む)。ただし、一次性脳炎の場合は頭蓋内圧亢進症状がみられ、かつ他剤で効果が不十分なときに短期間用いる、末梢神経炎(ギランバレー症候群を含む)、多発性硬化症(視束脊髄炎を含む)、小舞踏病、顔面神経麻痺、脊髄細網膜炎 ⑥消化器疾患：限局性腸炎、潰瘍性大腸炎、劇症肝炎(臨床的に重症とみなされるものを含む)、胆汁うっ滞型急性肝炎、慢性肝炎(活動型、急性再燃型、胆汁うっ滞型。ただし、一般的治療に反応せず肝機能の著しい異常が持続する難治性のものに限る)、肝硬変(活動型、難治性腹水を伴うもの、胆汁うっ滞を伴うもの) ⑦呼吸器疾患：びまん性間質性肺炎(肺線維症。放射線肺臓炎を含む) ⑧結核性疾患：結核性髄膜炎・結核性胸膜炎・結核性腹膜炎(いずれも抗結核剤と併用する) ⑨循環器疾患：ネフローゼ及びネフローゼ症候群、うっ血性心不全 ⑩重症感染症(化学療法と併用する) ⑪新陳代謝疾患：特異性低血糖症 ⑫その他内科的疾患：サルコイドーシス(ただし、両側肺門リンパ節腫脹のみの場合を除く)、重症消耗性疾患の全身状態の改善(癌末期、スプルーを含む)、悪性リンパ腫(リンパ肉腫症、網膜肉腫症、ホジキン病、皮膚細網症、菌状肉肉症)及び類似疾患(近縁疾患)、好酸性肉芽腫、乳癌の再発転移 ⑬外科：臓器・組織移植、侵襲後肺水腫、副腎皮質機能不全患者に対する外科的侵襲、蛇毒・昆虫毒(重症の虫さされを含む) ⑭整形外科：関節リウマチ、若年性関節リウマチ(スチル病を含む)、リウマチ性多発筋痛 ⑮泌尿器疾患：前立腺腫(他の療法が無効の場合)、陰莖硬結 ⑯眼科：内眼・視神経・眼窩・眼筋の炎症性疾患の対症療法(ブドウ膜炎、網脈絡膜炎、網膜血管炎、視神経炎、眼窩炎性偽腫瘍、眼窩漏斗尖端部症候群、眼筋麻痺)、外眼部及び前眼部の炎症性疾患の対症療法で点眼が不適当又は不十分な場合(眼瞼炎、結膜炎、角膜炎、強膜炎、虹彩毛様体炎)、眼科領域の術後炎症 ⑰皮膚科：*湿疹・皮膚炎群(急性湿疹、亜急性湿疹、慢性湿疹、接触皮膚炎、貨幣状湿疹、自家感作性皮膚炎、アトピー皮膚炎、乳・幼・小児湿疹、ビダール苔癬、その他の神経皮膚炎、脂漏性皮膚炎、進行性指掌角皮症、その他の手指の皮膚炎、陰部あるいは肛門湿疹、耳介及び外耳道の湿疹・皮膚炎、鼻前庭及び鼻翼周辺の湿疹・皮膚炎など)。ただし、重症例以外は極力投与しない、*痒疹群(小児ストロフルス、蕁麻疹様苔癬、固定蕁麻疹を含む。ただし、重症例に限る。また固定蕁麻疹は局注が望ましい)、*乾癬及び類症〔尋常性乾癬(重症例)、関節症性乾癬、乾癬性紅皮症、膿疱性乾癬、稽留性肢端皮膚炎、疱疹状膿疱疹、ライター症候群〕、*掌蹠膿疱症(重症例に限る)、*扁平苔癬(重症例に限る)、成年性浮腫硬化症、紅斑症(*多形浸出性紅斑、結節性紅斑。ただし、多形浸出性紅斑の場合は重症例に限る)、IgA血管炎、ウェーバー・クリスチャン病、粘膜皮膚眼症候群〔開口部びらん性外皮症、スチブンス・ジョンソン病、皮膚口内炎、フックス症候群、パーチェット病(眼症状のない場合)、リップシュッツ急性陰門潰瘍〕、レイノー病、*円形脱毛症(悪性型に限る)、天疱瘡群(尋常性天疱瘡、落葉状

天疱瘡, Senear-Usher症候群, 増殖性天疱瘡), デューリング疱疹状皮膚炎(類天疱瘡, 妊娠性疱疹を含む)、先天性表皮水疱瘡、帯状疱疹(重症例に限る)、*紅皮症(ヘブラ紅色靴襠疹を含む)、顔面播種状粟粒性狼瘡(重症例に限る)、潰瘍性慢性膿皮症、強皮症 ⑱耳鼻咽喉科：血管運動(神経)性鼻炎、アレルギー性鼻炎、花粉症(枯草熱)、進行性壞疽性鼻炎、耳鼻咽喉科領域の手術後の後療法、難治性口内炎及び舌炎(局所療法で治癒しないもの)。*印の効能・効果に対しては、外用剤を用いても効果が不十分な場合あるいは十分な効果を期待できないと推定される場合にのみ用いる

【用法・用量】メチルプレドニゾロンとして1日4~48mg, 1~4回に分服(増減)

【禁忌】①本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 ②デスモプレシン酢酸塩水和物(男性における夜間多尿による夜間頻尿)を投与中の患者(相互作用①参照) ③免疫抑制が生じる量の薬剤を投与中の患者には生ワクチン又は弱毒生ワクチンを接種しない(相互作用①参照)

【重要な基本的注意】①効能共通 ②本剤により、誘発感染症、続発性副腎皮質機能不全、消化性潰瘍、糖尿病、精神障害等の重篤な副作用が現れることがあるので、投与にあたっては、次の注意が必要である ③投与に際しては特に適応、症状を考慮し、他の治療法によって十分に治療効果が期待できる場合には、投与しない。また、局所の投与で十分な場合には、局所療法を行う ④投与中は副作用の出現に対し、常に十分な配慮と観察を行い、また、患者をストレスから避けるようにし、事故、手術等の場合には増量するなど適切な処置を行う ⑤副腎皮質ホルモン剤の連用後、急に中止すると、ときに発熱、頭痛、食欲不振、脱力感、筋肉痛、関節痛、ショック等の離脱症状が現れることがあるので、中止する場合には、徐々に減量するなど慎重に行う。離脱症状が現れた場合には、直ちに再投与又は増量する ⑥特に、本剤投与中に水痘又は麻疹に感染すると、致命的な経過をたどることがあるので、次の注意が必要である(重大な副作用⑨参照) ⑦投与前に水痘又は麻疹の既往や予防接種の有無を確認する ⑧水痘又は麻疹の既往のない患者においては、水痘又は麻疹への感染を極力防ぐよう常に十分な配慮と観察を行う。感染が疑われる場合や感染した場合には、直ちに受診するよう指導し、適切な処置を行う ⑨水痘又は麻疹の既往や予防接種を受けたことがある患者であっても、本剤投与中は、水痘又は麻疹を発症する可能性があるので留意する ⑩連用により眼圧亢進、緑内障、後囊白内障を来すことがあるので、定期的に検査することが望ましい(特定背景関連注意⑭、重大な副作用⑨参照) ⑪リンパ系腫瘍を有する患者に投与した場合に腫瘍崩壊症候群が現れることがあるので、血清中電解質濃度及び腎機能検査を行うなど、患者の状態十分に観察する(重大な副作用⑨参照) ⑫強皮症：強皮症患者における強皮症腎クリーゼの発現率は、副腎皮質ホルモン剤投与量が高いとの報告がある。強皮症患者に投与する場合は、血圧及び腎機能を慎重にモニターし、強皮症腎クリーゼの徴候や症状の出現に注意する。また、異常が認められた場合には適切な処置を行う

【特定背景関連注意】⑬合併症・既往歴等のある患者 ⑭次の患者には治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しない ⑮有効な抗菌薬の存在しない感染症、全身的真菌症の患者：免疫機能を抑制し、宿主防御能を低下させるので、感染症を悪化させるおそれがある(重大な副作用⑨参照) ⑯消化性潰瘍、憩室炎の患者：消化管粘膜保護作用を減弱させ、また、組織の修復を阻害するので、症状を悪化させるおそれがある(重大な副作用⑨参照) ⑰精神病の患者：中枢神経刺激作用により、症状を悪化させるおそれがある(重大な副作用⑨参照) ⑱結核性疾患の患者：免疫機能を抑制し、宿主防御能を低下させ、症状を悪化又は顕性化させるおそれがあるので、適宜抗結核療法を併用する(重大な副作用⑨参照) ⑲単純疱疹性角膜炎の患者：角膜に穿孔が生じるおそれがある(重大な副作用⑨参照) ⑳後囊白内障の患者：水晶体囊の透過性を変化させ、症状を悪化させるおそれがある(重要な基本的注意⑩、重大な副作用⑨参照) ㉑緑内障の患者：眼圧を上昇させ、症状を悪化させるおそれがある(重要な基本的注意⑩、重大な副作用⑨参照) ㉒高血圧症の患者：ナトリウム貯留作用により、症状を悪化させるおそれがある ㉓電解質異常のある患者：電解質代謝に影響を与えるので、症状を悪化させるおそれがある ㉔血栓症の患者：血液凝固促進作用により、症状を悪化させるおそれがある(重大な副作用⑨参照) ㉕最近行った内臓の手術創のある患者：組織の修復を阻害するので、創傷治癒が障害されるおそれがある ㉖急性心筋梗塞を起こした患者：心破裂を起こしたとの報告がある(重大

2 メチル

な副作用^①参照) ①感染症の患者(有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身の真菌症の患者を除く):免疫機能を抑制し、宿主防御能を低下させ、症状を悪化させるおそれがある。また、炎症反応を抑制し、徴候を隠蔽するおそれがあるので、感染症に対する適切な処置を行う(重大な副作用^②参照) ②糖尿病の患者:糖新生を促進させ、また、細胞のインスリンに対する感受性を低下させるので、症状を悪化させるおそれがある(重大な副作用^③参照) ③骨粗鬆症の患者:骨基質の合成を阻害し、骨形成を抑制するので、症状を悪化させるおそれがある(重大な副作用^④参照) ④うっ血性心不全の患者:ナトリウム貯留作用により、症状を悪化させるおそれがある(重大な副作用^⑤参照) ⑤甲状腺機能低下のある患者:代謝が阻害され、副作用が現れるおそれがある ⑥脂肪肝、脂肪塞栓症の患者:脂質代謝に影響を与えるので、症状を悪化させるおそれがある ⑦重症筋無力症の患者:使用当初、一時症状を悪化させるおそれがある ⑧潰瘍性大腸炎(切迫穿孔、膿瘍、他の化膿性感染症の疑いがある場合)の患者:炎症反応を抑制するので、これらの疑いがある場合、その徴候を隠蔽するおそれがある ⑨B型肝炎ウイルスキャリアの患者:投与期間中及び投与終了後は継続して肝機能検査値や肝炎ウイルスマーカーのモニタリングを行うなど、B型肝炎ウイルス増殖の徴候や症状の発現に注意する。異常が認められた場合には、本剤の減量を考慮し、抗ウイルス剤を投与するなど適切な処置を行う。副腎皮質ホルモン剤を投与されたB型肝炎ウイルスキャリアの患者において、B型肝炎ウイルスの増殖による肝炎が現れることがある。また、投与開始前にHBs抗原陰性の患者において、B型肝炎ウイルスによる肝炎を発症した症例が報告されている ⑩腎機能障害患者 腎不全の患者:ナトリウム貯留作用により、症状を悪化させるおそれがある ⑪肝機能障害患者 肝硬変の患者:代謝が阻害され、副作用が現れるおそれがある ⑫妊婦:妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与する。糖質コルチコイドを用いた動物実験で催奇形作用(口蓋裂)が報告されており、また、新生児に副腎不全を起こすことがある ⑬授乳婦:治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討する。糖質コルチコイドは母乳中へ移行することがある ⑭小児等 ⑮観察を十分に行う。発育抑制が現れることがある ⑯長期投与した場合、頭蓋内圧亢進症状が現れることがある ⑰高齢者:長期投与した場合、感染症の誘発、糖尿病、骨粗鬆症、高血圧症、後囊白内障、緑内障等の副作用が現れやすい

【相互作用】主として薬物代謝酵素CYP3A4で代謝される

①併用禁忌

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
生ワクチン又は弱毒生ワクチン ・乾燥弱毒生麻しんワクチン ・乾燥弱毒生風しんワクチン ・乾燥BCGワクチン等 (禁忌 ^① 参照)	ワクチン株の異常増殖又は毒性の復帰が現れるおそれがある	免疫抑制が生じる量の副腎皮質ホルモン剤の投与を受けている患者
デスモプレシン酢酸塩水和物(ミニリンメルト)(男性における夜間多尿による夜間頻尿) (禁忌 ^② 参照)	低ナトリウム血症が発現するおそれがある	機序不明

②併用注意

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
シクロスポリン	双方の血中濃度が上昇するおそれがある。また、痙攣が起こるおそれがある。必要に応じて本剤又はシクロスポリンを減量するなど用量に注意する	相互に代謝が阻害される
エリスロマイシン イトラコナゾール ミコナゾール キヌプリスチン ダルホプリスチン エストロゲン(経口避妊薬を含む) アプレピタント	本剤の作用が増強するおそれがある。必要に応じて本剤又はこれらの薬剤を減量するなど用量に注意する	これらの薬剤がCYP3A4を阻害することにより、本剤の代謝が阻害される
抗凝血剤 ・パルナパリンナトリウム ・ワルファリンカリウム等	抗凝血剤の作用を増強又は減弱させるおそれがある。必要に応じて本剤又は抗凝血剤の用量を調節する	本剤は血液凝固能を高め、抗凝血剤の効果に拮抗する可能性がある。また一方、本剤の消化器系の副作用によ

		り、抗凝血剤の出血の危険性が增大する可能性がある
非脱分極性筋弛緩剤 ・ベクロニウム臭化物 ・バンクロニウム臭化物等	非脱分極性筋弛緩剤の作用を増強又は減弱させるおそれがある。また、併用により短時間でミオパチーが現れ、四肢麻痺に至るおそれがある。必要に応じて本剤又は非脱分極性筋弛緩剤の用量を調節する	機序不明
非ステロイド性解熱鎮痛消炎剤 ・サザピリン ・ジクロフェナク等	消化器系の副作用(消化性潰瘍、消化管出血等)を起こすおそれが高くなる。必要に応じて本剤又は非ステロイド性解熱鎮痛消炎剤を減量するなど用量に注意する	ともに消化器系の副作用を起こすおそれがある
カリウム排泄型利尿剤 ・トリクロルメチアジド ・ヒドロクロロチアジド ・フロセミド等	低カリウム血症が現れるおそれがある。必要に応じて本剤又はカリウム排泄型利尿剤を減量するなど用量に注意する	カリウム排泄が促進される
ジゴキシン	ジゴキシン中毒が現れるおそれがある。必要に応じて本剤又はジゴキシンを減量するなど用量に注意する	カリウム排泄による血中カリウム値低下により、ジゴキシンの作用が増強する
サリチル酸誘導体 ・サザピリン ・アスピリン等	サリチル酸中毒(めまい、耳鳴、悪心・嘔吐、過呼吸、高熱、意識障害等の症状)を起こすおそれがある。必要に応じて本剤又はサリチル酸誘導体の用量を調節する。サリチル酸中毒が現れた場合には、サリチル酸誘導体を中止するなど適切な処置を行う	本剤はサリチル酸誘導体の代謝・排泄を促進すると考えられているので、本剤の急な減量又は中止により、血清中のサリチル酸誘導体の濃度が増加すると考えられる
バルビツール酸誘導体 ・フェノバルビタール等 フェニトイン リファンピシン カルバマゼピン	本剤の作用が減弱するおそれがある。必要に応じて本剤又はこれらの薬剤の用量を調節する	これらの薬剤はCYP3A4を誘導し、本剤の代謝が促進される
糖尿病用剤 ・ビグアナイド系薬剤 ・スルホニルウレア剤 ・速効型インスリン分泌促進剤 ・α-グルコシダーゼ阻害剤 ・チアゾリジン系薬剤 ・DPP-4阻害剤 ・GLP-1受容体作動薬 ・SGLT2阻害剤 インスリン製剤等	これらの薬剤の効果が減弱されるおそれがある。必要に応じて本剤又はこれらの薬剤の用量を調節する	本剤の糖新生促進作用等により、血糖値を上昇させる

【副作用】次の副作用が現れることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には中止するなど適切な処置を行う

①**重大な副作用** ②**感染症**(頻度不明):ウイルス、細菌、真菌、原虫、寄生虫等による感染症の誘発又は徴候の隠蔽、感染症の悪化等が現れることがある。これらの感染症の発現頻度は、副腎皮質ホルモン剤を増量すると高くなるとの報告があるので、抗菌剤等による適切な処置を行う(重要な基本的注意^{①②}、特定背景関連注意^{①②③}参照) ③**続発性副腎皮質機能不全**(頻度不明):観察を十分に行い、異常が認められた場合には直ちに再投与又は増量するなど適切な処置を行う ④**骨粗鬆症**(頻度不明)、**骨頭無菌性壊死**(頻度不明):脊椎圧迫骨折、病的骨折を起こすことがある。また、大腿骨及び上腕骨等の骨頭無菌性壊死が現れることがあるので、疼痛等の症状の観察を十分に行い、異常が認められた場合にはMRI等の検査を実施し、投与を中止するなど適切な処置を行う(特定背景関連注意^{①②}参照) ⑤**胃腸穿孔**(頻度不明)、**消化管出血**(頻度不明)、**消化性潰瘍**(頻度不明):便潜血のチェック等の観察を十分に行う(特定背景

関連注意^{①②}参照) ① **ミオパチー**(頻度不明): 連用によりミオパチーが現れることがあるので、筋力低下等の観察を十分に行う ① **血栓症**(頻度不明): (特定背景関連注意^{①②}参照) ② **心筋梗塞**(頻度不明)、**脳梗塞**(頻度不明)、**動脈瘤**(頻度不明): 長期投与を行う場合には、観察を十分に行う ③ **頭蓋内圧亢進**(頻度不明)、**痙攣**(頻度不明) ④ **精神変調**(頻度不明)、**うつ状態**(頻度不明): (特定背景関連注意^{①②}参照) ⑤ **糖尿病**(頻度不明): (特定背景関連注意^{①②}参照) ⑥ **緑内障**(頻度不明)、**後嚢白内障**(頻度不明)、**中心性漿液性脈絡網膜症**(頻度不明)、**多発性後極部網膜色素上皮症**(頻度不明): 連用により眼圧上昇、緑内障、後嚢白内障(症状: 眼のかすみ)、中心性漿液性脈絡網膜症・多発性後極部網膜色素上皮症(症状: 視力の低下、ものがゆがんで見えたり小さく見えたり、視野の中心がゆがんで見えにくくなる。中心性漿液性脈絡網膜症では限局性の網膜剥離がみられ、進行すると広範な網膜剥離を生じる多発性後極部網膜色素上皮症となる)を来すことがある(重要な基本的注意^{①②}、特定背景関連注意^{①②}参照) ⑦ **心破裂**(頻度不明): 急性心筋梗塞を起こした患者で、心破裂が現れたとの報告がある(特定背景関連注意^{①②}参照) ⑧ **うっ血性心不全**(頻度不明): 観察を十分に行い、異常が認められた場合には心電図等の検査を実施し、投与を中止するなど適切な処置を行う(特定背景関連注意^{①②}参照) ⑨ **食道炎**(頻度不明) ⑩ **カボジ肉腫**(頻度不明) ⑪ **腱断裂**(頻度不明): アキレス腱等の腱断裂が現れたとの報告がある ⑫ **アナフィラキシー**(頻度不明): 呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等の観察を十分に行い、異常が認められた場合には中止し、血圧の維持、体液の補充管理、気道の確保等の適切な処置を行う ⑬ **腫瘍崩壊症候群**(頻度不明): リンパ系腫瘍を有する患者に投与した場合、腫瘍崩壊症候群が現れることがある。異常が認められた場合には、適切な処置(生理食塩液、高尿酸血症治療剤等の投与、透析等)を行うとともに、症状が回復するまで患者の状態を十分に観察する(重要な基本的注意^{①②}参照)

② その他の副作用

	頻度不明
内分泌	月経異常, ケッシング様症状
消化器	膈炎, 下痢, 悪心・嘔吐, 胃痛, 胸やけ, 腹部膨満感, 口渇, 食欲不振, 食欲亢進
循環器	血圧上昇
精神神経系	多幸症, 不眠, 頭痛, めまい
筋・骨格	筋力低下, 筋肉痛, 関節痛
脂肪・蛋白質代謝	満月様顔貌, 野牛肩, 窒素負平衡
肝臓	AST, ALT, Al-Pの上昇, 脂肪肝
体液・電解質	浮腫, 低カリウム性アルカローシス, カリウム低下, ナトリウム貯留
眼	網膜障害, 眼球突出
血液	白血球増多
皮膚	創傷治癒障害, 紫斑, 皮下溢血, 瘡瘍, 多毛症, 脱毛, 色素沈着, 皮膚線条, 発汗異常, 皮膚非薄化・脆弱化, 脂肪織炎
過敏症	発疹, 紅斑, 痒痒
その他	発熱, 疲労感, ステロイド腎症, 体重増加, 精子数及びその運動性の増減, 仮性脳腫瘍, 易刺激性

【臨床検査結果に及ぼす影響】 副腎皮質ホルモン剤の投与により、皮膚試験の反応が抑制されることがあるので、本剤投与中に皮膚試験を実施する場合は注意する 【その他の注意】 臨床使用に基づく情報 ① β_2 -刺激剤との併用により、低カリウム血症が現れることがある ② 外国において、死菌ワクチン又は不活化ワクチンの効果を減弱させるとの報告がある 【保存等】 室温保存。有効期間：3年

【薬物動態】 ① 血中濃度：40mgを単回経口投与時の血漿中濃度は、投与2時間後に最高値329ng/mL(20人平均。外国入データ) ② 吸収：16 μ gをラットに筋注時速やかに吸収され、約1時間後に最高血中濃度を示し、血中消失半減期は57分 ③ 分布：ラット腎筋注で、一定時間後の各臓器の最高値は肝、腎で最も高く、次いで副腎、脾、心筋、肺、大腸、筋肉 ④ 代謝：ラットでは主に肝で代謝され、一次代謝は主として還元反応、二次代謝は抱合反応及び腸肝循環が推測される ⑤ 排泄：ヒトでは主として尿中に排泄され、96時間後に尿中へ75%、糞中へ9%が排泄。ラット筋注では主に糞中に排泄され、48時間後に尿中へ20.9%、糞中へ45.6%排泄 【薬効薬理】 ① 作用機序：糖質コルチコイドは細胞膜を通過し、細胞内の受容体との結合を介しDNAに働き、遺伝子の転写を調節 ② 抗炎症作用及

び免疫抑制作用：糖質コルチコイドは、リンパ球の数に対する作用に加え、リンパ球の免疫反応を著明に変化させ、抗炎症作用及び免疫抑制作用を示す。糖質コルチコイドにより炎症反応を誘起する重要な因子の産生が抑制され、血管活性因子及び化学走化性因子の放出が低下することで脂肪分解酵素及び蛋白質分解酵素の分泌が減少し、損傷部位への白血球の血管外遊出が減少し、最終的にフィブリン沈着を抑制。糖質コルチコイドによりリンパ球が減少し、抗体産生、抗原抗体反応及び免疫複合体沈着が抑制されることで、免疫機能を抑制。糖質コルチコイドは、炎症及び免疫系に関与するサイトカインの発現も減少させる ③ 薬効を裏付ける試験成績 ④ 抗炎症作用：ラット(雄、雌)に皮下注でヒドロコルチゾン(以降H)の6倍、プレドニゾロン(以降P)の2倍 ⑤ 肝グリコーゲン沈着作用：副腎摘出ラット(雄)に皮下注でHの10倍、Pの3倍、経口投与でHの16倍、Pの3倍 ⑥ 抗リウマチ作用・副腎抑制作用：ヒトに経口投与でPと同程度 ⑦ 好酸球減少作用・血糖上昇作用：ヒトに経口投与でHの5倍、Pの5/4 ⑧ ナトリウム貯留作用：副腎摘出ラット(雄)に皮下注、ヒトに経口投与で貯留作用はない

(性状) メチルプレドニゾロン(Methyl-PDL)は白色の結晶性の粉末で、においはない。メタノール又はエタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にはほとんど溶けない。融点：232~240℃(分解)