

RU486 (Mifepristone) 之作用機轉及用途

[發表醫師] : 林德熙 醫師(婦產科)

[發布日期] : 2004/5/23

當 Gregory Pincus 發現阻斷黃體素受體可用來控制受孕時，抗黃體素藥物便一直受到科學家青睞。第一個有效的黃體素受體拮抗劑是在 1981 年，被法國知名藥廠 Roussel Uclaf 的一群科學家研發出來，此藥物最初被定名為 RU38486，後改名為 RU486，學名則為 Mifepristone。

Mifepristone 是一個 19-C 的化學物，跟黃體素及葡萄皮脂酮構造相似。Mifepristone 會和黃體素競爭與分佈於子宮內膜、子宮肌肉層、乳房及卵巢內的黃體素受體 (PR) 結合。當 Mifepristone 與黃體素受體結合後，反而使黃體素受體不活躍，從而抑制黃體素的作用。另外，Mifepristone 也可與葡萄皮脂酮受體結合，抑制葡萄皮脂酮作用。

Mifepristone 經口服後，主要經肝臟代謝，最後代謝物會分泌在膽汁中，並由糞便排出體外，只有 10% 左右的代謝物會透過尿液排出。婦女口服一劑 50~800mg 的 Mifepristone，一小時後，血中會達到最高濃度。但口服 Mifepristone 在體內的代謝主要分為兩種途徑：

若單一劑量 < 100Mg，Mifepristone 會以第一級速度代謝，半衰期為 20~25 小時

若劑量為 200~800mg，Mifepristone 會經過 6~10 小時後，達到最高濃度，並可維持 24 小時。

Mifepristone 的第一個臨床研究是在 1982 年使用於早期懷孕（六~八週）的婦女身上，在服用 Mifepristone 後，約三天內便會發生人工流產的現象，所以在一般人的觀念中，Mifepristone 被認定為是一種「墮胎藥」，但事實上，Mifepristone 在其他婦科方面也有相當卓越的貢獻。

如在懷孕方面，Mifepristone 除了可用作終止早期妊娠的藥物外，亦可用作長期避孕藥及事後避孕藥。另外，在第三期懷孕中，也可用作引產藥物，取代 PGE2。雖然 Mifepristone 有引起非拮抗的雌激素效果，但目前並未在子宮內膜中發現有異常組織。而由於長期使用低劑量 Mifepristone（2mg / kg / week），可使子宮內膜萎縮，因此臨床醫師也開始使用於治療子宮內膜異位症及子宮腺肌症所引起的非功能性子宮出血之臨床試驗上。此外，子宮肌瘤的增生因受黃體素影響，在若干臨床試驗上，Mifepristone 也被用作控制子宮肌瘤增大的藥物。

Mifepristone 在避孕、流產及引產作用已被確定並使用於臨床途徑上，對於其他有關婦科問題的處理，則須等待大型臨床試驗結果公佈，才能明確決定，開始臨床使用。

!!健康文章內文主要提供民眾降低對疾病因不了解產生之不安和恐懼，但不可取代實際的醫療行為，所以身體如有不適請您前往醫院就醫治療。