

くすり一口メモ

アンギオテンシンⅡ受容体拮抗薬の比較

アンギオテンシン 受容体拮抗薬 (以下ARB) はACE (アンギオテンシン変換酵素) 阻害薬と同等か、それ以上の降圧効果が期待できる副作用 (咳, 発疹, 血管神経浮腫等) の少ない降圧剤です。平成16年度の降圧薬の国内販売高では, ARB 1位のCa拮抗剤に匹敵するほど増加してきます。以下, 現在薬価収載されていますARBについて比較してみました。

一般名	ロサルタンカリウム	カンデサルタンシレキセチル	バルサルタン	テルミサルタン	オルメサルタンメドキシソミル	
商品名	ニューロタン	プロプレス	ディオバン	ミカルディス	オルメテック	
規格	25mg, 50mg	2mg, 4mg, 8mg, 12mg	40mg, 80mg	20mg, 40mg	10mg, 20mg	
適応	高血圧症	高血圧症 腎実質性高血圧症	高血圧症	高血圧症	高血圧症	
用法・用量	1日1回25~50mg (最大: 100mg/日)	: 1日1回4~8mg (最大: 12mg/日) : 1日1回4~8mg (最大: 8mg/日)	1日1回 40~160mg	1日1回40mg 20mgから開始 (最大: 80mg/日) 肝障害時は 最大40mg/日)	1日1回10~20mg 5~10mgから開始 (最大: 40mg/日)	
禁忌	本剤過敏症, 妊婦, 重篤な肝障害	本剤過敏症, 妊婦	本剤過敏症, 妊婦	本剤過敏症, 妊婦, 胆汁分泌が きわめて悪い又は 重篤な肝障害	本剤過敏症, 妊婦	
排泄 (%)	肝臓	58	67	86	100	77.2
	腎臓	35	11~12	13	0.02	12.6
T/P比	50~70%	80%以上	66%	92%	69%	
活性型・プロドラッグ	活性型	プロドラッグ	活性型	活性型	プロドラッグ	

(T/P比: 血中濃度トラフ時の降圧度/血中濃度ピーク時の降圧度)

ロサルタンカリウムは肝臓排泄率が他のARBと比較して低いのに対し, 重篤な肝障害には禁忌となっています。これは200万人の患者に使用され, 肝機能障害に関する報告が80件あったことが背景にあります。テルミサルタンは, ほとんどが胆汁中に排泄されるため腎障害時にも投与可能な薬剤です。しかしARBは一般的に腎障害時においては血清クレアチニン値が3.0mg/dl以上の場合には慎重に投与するのが望ましい, と添付文書に記載されています。

バルサルタン, オルメサルタンメドキシソミルは血管壁, 近位尿細管, 副腎皮質などに多く存在するAT₁受容体への選択性が高く, カンデサルタンシレキセチルは末梢血管抵抗を低下させる点が特徴です。降圧持続性を表す指標となっているT/P比はテルミサルタンが最も高い値となっています。カンデサルタンシレキセチルはAT₁受容体への阻害活性を上げる目的で, オルメサルタンメドキシソミルは吸収率を上げる目的でプロドラッグになっています。また, ARBはカリウム保持性利尿薬との相互作用で血清カリウム濃度が上昇する恐れがあるので併用には注意が必要です。

【参考文献】今日の治療薬

各種インタビューフォーム
MEDIAPEX 第165号 (15)

(鹿児島市医師会病院薬剤部 田中 梨沙)