

◎ミカルディ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】テルミサルタン (U) telmisartan 【分類】アンジオテンシン受容体拮抗薬

【単位】△20mg・◎40mg・▼80mg錠

【常用量】20mg/日から開始し、40mg/日 [最大 80mg] ■血中濃度の個人間変動が大きく非線形の薬物動態を示すことから、投与量の増加に伴い血中濃度の大幅な上昇が認められることがあるので、1日 20mg から投与を開始し忍容性をみながら漸次増量■肝障害患者は最大 40mg/日

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】減量の必要はないが、Cmax と AUC は腎機能正常者に比べ低下する (Stangier J, et al: J Clin Pharmacol 40:1365-72, 2000)

【その他の報告】透析患者のインスリン抵抗性の改善に寄与する可能性がある (佐々木敏作,他: 透析会誌 42: 325-31, 2009)

40~80mg/日にて安全に使用できる (濱田欣哉, 他: Prog Med 24:1571-4, 2004)

【保存期 CKD 患者への投与方法】腎機能を悪化させるおそれがあるため、Scr 3.0mg/dL 以上の場合には慎重投与 (1)

【その他の報告】減量の必要はないが少量から開始 (5)

【特徴】作用時間が長くプロドラッグではない化合物を目指して開発された ARB. CYP の影響を受けずほぼ 100%胆汁排泄されるため腎障害を伴う場合でも減量の必要がない。

【主な副作用・毒性】ショック、血管浮腫、間質性肺炎、失神・意識消失、肝機能障害、腎障害、高 K 血症、めまい、眠気、咳、心悸亢進、低血糖 (DM 患者であらわれやすい)、しびれ、味覚異常など

【安全性に関する情報】プラセボに比べて腎機能正常者の GFR を有意に低下 (Mann JF, et al: Ann Intern Med 151: 1-10, 2009 PMID: 19451556)

【モニターすべき項目】血圧、腎機能、血清 K 値、貧血

【吸収】吸収率約 50% (1) 食事により tmax が遅延し、Cmax が 57%、AUC が 32%低下 (1)

【F】43% (1) 用量増加により F も上昇する (U)

【tmax】約 4hr (1) 0.5~1hr (U)

【代謝】小腸および腸臓で UGT によりグルクロン酸抱合される (1) 肝取り込みには OATP1B3 が関与. CYP では代謝されないが 2C19 の阻害剤として作用 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 5%未満 (12) 主に胆汁を介して糞便中へ排泄され尿中回収率は 1%以下 (1,U) 胆汁中排泄率 97%以上 (U)

【CL】880±247mL/min (1)

【t1/2】20~24hr (1) 約 24hr (U,12) 【透析患者の t1/2】16hr (12) ke=0.0518/hr (1)

【蛋白結合率】99%以上 (1,12) 99.5%以上 [Alb, AAG] (U) HD 患者の PBR は 98.8~99.1% (Stangier J, et al: J Clin Pharmacol 40: 1365-72, 2000)

【Vd】509±193L/man (1) 500L (U) 7.1L/kg (12)

【MW】514.62

【透析性】0.01%以下 (1) 除去されない (U,5)

【薬物動態】血中濃度の個人間変動が大きく、非線形の薬物動態を示す (1)

【O/W 係数】LogP=3.2 [1-オクタノール/リン酸 buffer, pH7.4] 【pKa】3.5, 4.1, 6.0

【相互作用】CYP2C19 の阻害剤 (U) ジゴキシンの血中濃度上昇 (機序不明) も、トラフ値への影響は小さい (1) スピロラクトン・カリウム製剤: 高 K 血症 (1) 炭酸リチウム: リチウム中毒を惹起 (1) 特に糖尿病治療中の患者で低血糖が現れることがある [ARB 共通の注意] (1) DM 患者ではアリスキレンとの併用禁忌 (1) アリスキレンとの併用は腎機能障害、高 K 血症、低血圧のリスクから慎重投与 (1) GFR 60mL/min/1.73m² 未満の患者ではアリスキレンとの併用は原則避ける (1)

【備考】PPAR γ 活性化を介してインスリン抵抗性を改善させる (島本和明: Therapeutic Res 32: 341-7, 2011)

【更新日】20170508

※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。