

## ▼ベルジピン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ニカルジピン塩酸塩 (U) nicardipine hydrochloride 【分類】 Ca拮抗薬

【単位】 ▼10mg・▼20mg/錠

【常用量】 40～80mg/日

【用法】 1日2回

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10) という報告が多いが、腎不全患者では腎外クリアランスが37%低下する (Dow RJ and Graham DJM: Br J Clin Pharmacol 22: 195S-202S,1986) という報告もあるため、少量から投与し効果を見ながら投与量を決定 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10,12) 【その他の報告】 腎障害患者では反復投与時の AUC が 1.6 倍上昇 (Ahmed JH, et al: Br J Clin Pharmacol 32:57-62, 1991)

【特徴】 主に心筋に作用する Ca 拮抗剤と異なり、特に血管平滑筋への Ca イオンの流入を抑制することにより血管平滑筋の緊張を緩解し血管を拡張させる。作用は持続的で脳血管及び冠血管に選択性が高い。ラセミ体混合体で (+) isomer に活性がある (13)

【主な副作用・毒性】 血液凝固障害、顆粒球減少、めまい、頭痛、顔面紅潮、動悸、頻脈、浮腫、肝障害、パーキンソン様症状、便秘、胃腸障害、頻尿、歯肉肥厚、発疹、搔痒感など

【モニターすべき項目】 血圧、ECG、心拍数、肝機能、腎機能

【吸収】 95%以上 (11) 70% (1)

【F】 48.6% (1) 35% [完全に吸収されるが初回通過効果を受ける] (U) 初回通過効果により 55～95%が消失する (11) 15～45% (10) 18%, 肝硬変で上昇 (13)

【tmax】 1hr (13) 2～6hr (1) 【Cmax】 0.885mg を単回静注後の Cmax は 25ng/mL、1日3回、1回30mg を3日間、経口投与後の Cmax は 88ng/mL (13)

【代謝】 肝で CYP3A4 により代謝 (1) CYP3A により代謝され多くが初回通過効果を受ける (13) 非透析腎不全患者での腎外クリアランス低下が示唆されている (Ahmed JH, et al: Br J Clin Pharmacol 32: 57-62, 1991)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1%以下 (12,13) 10%以下 (10) 腎 60% (未変化体 1%以下) 胆汁・糞中排泄 35% (U) 尿中回収率 21% [po] (1) 【CL】 700mL/min (1) 10.4mL/min/kg、肝硬変で低下 (13) 腎機能正常者の CL 10.4mL/min/kg、腎障害患者の CL 6.5mL/min/kg、HD 患者の CL 12.5mL/min/kg (Ahmed JH, et al: Br J Clin Pharmacol 32: 57-62, 1991) 【非腎 CL/総 CL】 100% (10)

【t1/2】 2 相性で  $\alpha$  相 2～4hr、 $\beta$  相 8.6hr (U) 8.6 [0.5～12] hr (11) 1hr (10) 1.3hr、肝硬変で延長 (13) 1.3～5hr (12) 【透析患者の t1/2】 1hr (10) 5～7hr (12)

【蛋白結合率】 93.2% (1) 98%以上 (10) 95%以上 (U,11) 98～99.5% (13) 98～99% (12)

【Vd】 0.75L/kg (10) 1.7L/kg (11) 1.1L/kg (13) 0.8～1.4L/kg (12)

【MW】 515.99

【透析性】 蛋白結合率が高いため透析されない (1)

【TDM のポイント】 最低有効血中濃度 5～10ng/mL。TDM の対象にはならない【薬物動態】 Cmax、AUC は腎障害により上昇し、CL は低下する (Dow RJ, Graham DJM: Br J Clin Pharmacol 22: 195S-202S,1986) 肝における初回通過効果が大きく大部分が不活性化される。経口では頻回の投与が必要となるため徐放製剤が開発された。中等度腎不全では AUC、Cmax とともに著しく上昇するが透析患者では腎機能正常者と変わらないため、透析によって除去される尿毒症性代謝阻害因子が存在する (Ahmed JH, et al: Br J Clin Pharmacol 32: 57-62,1991) 【O/W 係数】 有機層に分配 [1-オクタノール水系,pH6.8] (1) 【pKa】 7.2 (1)

【最大効果発現時間】 1～2hr (単回投与)

【効果持続時間】 8hr

【備考】 Ca 拮抗剤の投与を急に中止すると症状が悪化した症例が報告されているので、休薬を要する場合には徐々に減量し観察を十分に行う

【更新日】 20180410

※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、当院では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。