

## ◎ディオバン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 バルサルタン (U) valsartan 【分類】 アンジオテンシンII 受容体拮抗薬

【単位】  $\Delta$ 20mg・ $\Delta$ 40mg・ $\odot$ 80mg/錠

【常用量】 40～80mg/日 [最大 160mg]

【用法】 1日1回

【透析患者への投与方法】 HD 患者では低用量から投与を開始 (1)

【その他の報告】 AN69 膜を使用してもショックは発現しない (Kidney Blood Press Res 24: 71-4, 2001)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要はないが少量から開始 (5)

【その他の報告】 腎機能障害を悪化させるおそれがあるため、血清 Cre 値が 3.0mg/dL 以上の場合には、投与量を減らすなど慎重に投与 (1)

両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈狭窄のある患者においては、腎血流量の減少や糸球体濾過圧の低下により急速に腎機能を悪化させるおそれがあるので、治療上やむを得ないと判断される場合を除き投与は避ける (1)

【特徴】 AngII 受容体のうち AT1 受容体に特異的かつ高親和性に結合し、持続的な降圧作用を示す。AT1 受容体への選択性は AT2 受容体に対して約 30000 倍と高い

【主な副作用・毒性】 SJS・TEN、血管浮腫、肝炎、腎障害、過度の血圧低下による失神・意識喪失、めまい、頭痛、動悸、腹痛、咳嗽、倦怠感、発疹、眠気、白血球減少、好酸球増多、貧血、下痢、便秘、嘔気、血清 K 上昇、浮腫、胸痛、血糖値上昇、疲労感など

【安全性に関する情報】 GFR 60mL/min/1.73m<sup>2</sup> 未満の患者ではアリスキレンとの併用は原則避ける (1)

【モニターすべき項目】 血圧、血清カリウム、肝機能、CBC

【吸収】 食事により Cmax が 50%、AUC が 40%低下 (U)

【F】 39% (1) 25% [10～35%] (U) 23%、食物と同時に摂取で低下 (13) 51% (Xenobiotica 27: 59-71,1997) 食事により 40～50%低下 (J Hum Hypertens 14: S73-86,2000)

【tmax】 2～3hr (1) 腎不全で 2～3hr、中等度肝障害で 3.5～4.0hr (U) 2hr (13)

【代謝】 約 10%が活性のない valeryl-4-hydroxy-valsartan に代謝され大部分が未変化体として胆汁排泄される (Xenobiotica 27: 59-71,1997) 9%が CYP2C9 により 4-水酸化体に代謝 (1)

【排泄】 便中 83%、尿中 13% (U) 尿中未変化体排泄率 9～14% (1) 29% (13) 13% (12) 29% (Eur J Clin Pharmacol 52:115-20,1997) 86%が糞中排泄 (Xenobiotica 27: 59-71,1997)

【CL】 2.19±0.39L/hr (1) 0.49mL/min/kg、加齢・肝硬変・胆汁うっ滞により低下 (13)

【t1/2】 4～6hr (1) 6hr (U) 腎不全 6.6hr (U) 9.4hr 加齢により延長 (12,13)

【蛋白結合率】 93.0～95.9% (1,U) 85～99%でアルブミンが主、ジクロフェナク、ヒドロクロロチアジド、ワルファリンとの結合置換は起こらない (J Clin Pharmacol 37: 214-21, 1997) 95% (12,13)

【Vd】 16.9±6.9/man (1) 17L/man (U) 0.23L/kg (12,13)

【MW】 435.53

【透析性】 透析により除去されない (1,U)

【TDM のポイント】 TDM の対象にはならない【薬物動態】 軽度～中等度肝障害時の AUC は約 2 倍に上昇する (Clin Pharmacol Ther 62: 272-8,1997)

【O/W 係数】 0.46 [1-オクタノール水系、pH7] (1) 【pKa】 3.9, 4.73 (1)

【相互作用】 リチウム製剤のクリアランスを低下 (U) 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) 炭酸リチウムとの併用時にバルサルタンの Na 排泄作用がリチウムの蓄積を招くおそれ (1)

【主な臨床報告】 PD 患者の残存腎機能保護効果が報告されている (Suzuki H, et al: Am J Kidney Dis 43: 1056, 2004)

【効果発現】 降圧作用は投与後 2hr で現れる (U) 効果が安定するまで 1 ヶ月近くかかることがある。

【効果持続】 24 時間 (U)

【備考】 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) 耐糖能障害時におけるバルサルタンの新規 DM 発症抑制効果は絶対的リスク低下 3.7%とわずかで CVD 予防効果は認められず (Navigator Study: N Engl J Med 362:1477, 2010)

【更新日】 20180425

※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。