◎アダラート CR 錠，○ニフェジピン CR 錠，◎セパミット R カプセル・○R 細粒 2%［内］

【重要度】　【一般製剤名】ニフェジピン（U）　Nifedipine　【分類】Ca 拮抗薬

【単位】△10mg・◎20mg・△40mg/CR 錠，◎10mg/Cap［セパミット R］，○R 細粒 2%：0.5g/包（10mg/0.5g 包）

【常用量】【L 錠，CR 錠】■高血圧症：20～40mg/日［最大 80mg/日］

■腎実質性高血圧症，腎血管性高血圧症：20～40mg/日

■狭心症：40mg/日［最大 60mg/日］

【カプセル】30mg/日【セパミット R】■本態性高血圧症，腎性高血圧症：20～40mg/日■狭心症：40mg/日

【用法】■速放カプセル 1 日 3 回■L 錠・L カプセル 1 日 2 回■CR 錠 1 日 1 回［カプセル剤の舌下投与は禁忌］

【透析患者への投与方法】減量の必要なし（3,4,6）

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし（3,10,12）

【特徴】強力な血管拡張剤であり、頭痛、顔面紅潮などの副作用があるが、一般的に軽度で代謝への悪影響が無く、冠血流、脳・腎血流の増加が期待できる。心伝達抑制が少なく反射性の頻脈をきたしやすい．CR 錠は従来のニフェジピン製剤に比し血中濃度が安定し、1 日 1 回投与で安定した降圧作用が持続する．

【主な副作用・毒性】血液凝固障害，紅皮症，頭痛，めまい，顔面紅潮，動悸，下肢浮腫（静脈系の拡張を伴わない細動脈の拡張による毛細血管内静水圧上昇に起因する血管内から外への水分移動によるといわれており臓器障害によるものではない．通常，利尿薬投与や Na 制限では改善しない），肝障害，血糖値上昇，胃腸障害，便秘，排尿障害，歯肉肥厚，味覚異常，女性化乳房，発疹，掻痒感など

【モニターすべき項目】血圧、ECG、心拍数、肝機能、腎機能

【吸収】90%以上（11）完全に吸収される（U）

【F】30～40%が初回通過効果を受ける（1）52±13%［L 錠］（1）初回通過効果を受け 65～70%（U）45～70%（11）HD 患者，肝障害で F は上昇（U）50%，肝硬変・加齢で上昇（13）

【tmax】カプセル・細粒：0.5hr、L 錠：3hr（11）R 細粒：4hr（1）カプセル 0.5hr，徐放製剤 6hr 以下（13）

【Cmax】健常者に 10mg カプセルを単回経口投与したとき 79ng/mL，60mg 徐放製剤を連続投与した時の定常状態で 35～49ng/mL（13）

【代謝】肝で完全に代謝（U）CYP3A4 により代謝（1,9）代謝物に活性はない（1）

【排泄】80%が腎排泄だが、未変化体の排泄はほとんどなし（U）胆汁・糞中排泄は 20%で全て代謝物（U）尿中未変化体排泄率 0%（1）10%以下（10）2%（14）0%（13,14）腎 80%，糞中 20%（ほぼ代謝物）（11）尿中回収率 60%［24hr まで］（1）

【CL】29.3±3.0L/hr［po］（1）7.0mL/min/kg（13）19.3mL/min/kg（15）腎不全で上昇（Van Borel L, et al: Eur J Clin Pharmacol 37: 185-9,1989）

【t1/2】カプセル，細粒：2～4hr（6）3.7hr（1）4～5.5hr（2,10）L 錠：3.5～3.7hr（1）1.8hr（13）アダラート CR は徐放性製剤であるため半減期の概念は適応できない（5）2hr（12）　【透析患者の t1/2】3.8hr（6）5～7hr（10）5～7hr（12）

【蛋白結合率】92～98%（1,U）96%、腎障害・肝硬変で低下（13）97%（12）

【透析患者の蛋白結合率】健常者 94%に対し末期腎不全 89%と低下するが血液透析によって正常化しないため尿毒症性蛋白阻害物質が関与している（Martre H, et al: Br J Clin Pharmacol 20: 155-8,1985）腎不全で経口剤、注射薬ともに CL は上昇し AUC、Cmax が低下するが蛋白結合率に著変なしと Martre H らの報告と異なる（Van Borel L, et al: Eur J Clin Pharmacol 37: 185-9,1989）

【Vd】98.9±8.1L［po］（1）0.78L/kg、肝硬変・腎障害・加齢により上昇（13）0.3～1.2L/kg（11）1.4L/kg（12,14）215～287L/man［L 錠］（1）

【MW】346.3

【透析性】HD，PD ともに除去されにくい（1,U）　2%以下（1）蛋白結合率が高いため透析によって除去されにくいと思われる（5）血漿交換は有効かもしれない（U）

【TDM のポイント】有効血中濃度 50～150ng/mL（15）25～100ng/mL（16）高血圧患者の拡張期血圧を低下させる血清濃度は 47ng/mL（13）有効血中濃度は 12ng/mL であり平均血圧を 13mmHg 下降させることができる．TDM の対象にはならない

【O/W 係数】1673［1-オクタノール/水系］（1）

【相互作用】CYP3A4 関連の相互作用に注意（1）リファンピシン併用により AUC が 64%（Ndanusa BU, et al: J Pharm Biomed Anal 15:1571-5, 1997），92%（Holtbecker N, et al: Drug Metab Dispos 24:1121-3,1996）低下する．GFJ 飲用で血中濃度が約 1.3～2 倍に上昇する（フラボノイドやクマリン類が小腸または肝の CYP3A4 アイソザイムを阻害することによると考えられる）．CR 錠については Cmax が約 1.6 倍上昇するが臨床使用において大きな問題を生ずる可能性は少ない（田中利明，他: 臨床薬理 32: 23-33, 2001）GFJ が CYP3A4 を阻害してクリアランス低下（1）

【効果発現時間】20min（カプセル経口投与）

【効果持続時間】12 時間（L 錠）

【備考】異型狭心症には良好な適応．

【更新日】20240530

※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。