

## ▼プロプレス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 カンデサルタンシレキセチル (U) candesartan cilexetil 【分類】 アンジオテンシン受容体拮抗薬

【単位】 ▼2mg・▼4mg・▼8mg・▼12mg/錠

【常用量】 ■高血圧症：4～8mg/日 [最大12mgまで] ■腎実質性高血圧症または腎障害を伴う高血圧症の場合2mg/日から開始 [最大8mgまで] ■軽症・中等症の慢性心不全：4mg/日より開始, 8mg/日まで [高血圧を合併している場合には12mg/日まで]

【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少量より開始 (1,5)

【その他の報告】 減量の必要なし (12) 腎障害者ではカンデサルタン・非活性代謝物CV-15959とともにC<sub>max</sub>、AUCが腎機能正常者に比し有意に上昇し、t<sub>1/2</sub>も延長するが、透析患者でも1日1回8mg投与で蓄積傾向は示さず安全で認容性の高い薬物といえるものの、透析患者を含む高度腎障害患者では初回投与量を減量した方がよい (de Zeeuw, et al: J Hum Hypertens 11(Suppl 2) : S37-42,1997) HD患者の心血管イベントおよび死亡リスクの低下に関連 (Takahashi A, et al: Nephrol Dial Transplant 21: 2507-12, 2006)

【保存期CKD患者への投与方法】 Cr 10mL/min以上：減量の必要なし, Cr<10mL/min：初回投与量を減量した方がよい (de Zeeuw, et al: J Hum Hypertens 11: S37-42, 1997) 【その他の報告】 減量の必要なし (12) 腎障害を伴う場合は2mg/日から開始し最大8mg/日まで (1)

【特徴】 ベンジルイミダゾール酢酸塩誘導体のARB。カンデサルタンは生物学的利用率が低いためプロドラッグ化されている。AngIIのAT1受容体に選択的に結合しAngIIの生理作用を抑制する。

【主な副作用・毒性】 高K血症、血管浮腫、肝機能障害、皮膚障害、めまい、動悸、ほてり、頭痛、不眠、眠気、消化器症状、血球減少・増多、BUN・クレアチニンの上昇、倦怠感、急性腎不全、低血糖 (DM患者であらわれやすい) など

【吸収】 食事の影響を受けない (U)

【F】 42% (13) カンデサルタンシレキセチルのアルコール溶液のFは32.3% (1) 活性本体として15% (U)

【t<sub>max</sub>】 カンデサルタン3.6～5hr, M-II : 6.8～9hr (1) カンデサルタン4hrで16mgを7日間投与したときのC<sub>max</sub>は119ng/mL (13) 3～4hr (U)

【代謝】 小腸での吸収過程で小腸カボキシルエステラーゼによって活性代謝物カンデサルタンに代謝される (1,13) カンデサルタンは一部がグルクロン酸抱合され、カンデサルタン-AGとカンデサルタン-NGに代謝され、一部が肝臓でCYP2C9により非活性代謝物M-IIに代謝される [ラット, イヌ] (1) CYP2C9の遺伝的多型 (\*1/\*3 遺伝子型) がCLの低下と過度の降圧作用に関連した89歳男性の症例 (Uchida S, et al: Clin Pharmacol Ther 74: 505-8, 2003)

【排泄】 尿中カンデサルタン排泄率52% (12,13) カンデサルタンシレキセチルは尿中に排泄されない (1) 尿中回収率：カンデサルタン8～9%、M-II3～4%、総排泄率11～12% [po, 24hrまで] (1) 静注時の尿中排泄率59%、糞便中36% (U) 【CL】 0.129L/hr/kg (1) 0.37mL/min/kg (13)

【t<sub>1/2</sub>】 9hr (U) カンデサルタン9.5～11.7hr, M-II 8.9～14.4hr (1) 血清Cr値3.0mg/dL以上の腎機能障害者でもカンデサルタン9.6～10.1hrと延長せず (1) 9.7hr (13) 9～13hr (12) 【透析患者のt<sub>1/2</sub>】 3～12hr (12)

【蛋白結合率】 99%以上 (1,U) 99.8% (12,13)

【Vd】 0.13L/kg (U,12,13) Vd/F=1.29L/kg (1)

【MW】 610.67

【透析性】 除去されない (1,U)

【TDMのポイント】 TDMの対象にはならない 【OW係数】 1000以上 [1-オクタノール水系, pH6.9] (1) 【pKa】 2.1, 4.6 (1)

【相互作用】 利尿降圧剤で治療を受けている患者に本剤を初めて投与する場合、降圧作用が増強するおそれがある。尿管管でリチウムの再吸収を促進するため、リチウム製剤との併用注意 (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/1.73m<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) ACE-Iと併用注意 (1)

【備考】 術中の過度の血圧低下を起こす可能性があるため手術前24hrは投与しないことが望ましい (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)

【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。