◎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】△20mg・△40mg・◎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（Tepel M, et al: Kidney Blood Press Res 2001 PMID: 11174010）
【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）

【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^2未満の患者ではアリスキレンとの併用は原則避ける（1）DM患者で低血糖の発現（1）
【モニターすべき項目】血圧、血清カリウム、肝機能、CBC
【F】39%（1）25%［10～35%］（U）23%、食物と同時摂取で低下（13）51%（Waldmeier F, et al: Xenobiotica 1997 PMID: 9041679）食事によりCmaxが50%，AUCが40%低下（U, Israili ZH: J Hum Hypertens 2000 PMID: 10854085）
【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（Waldmeier F, et al: Xenobiotica 1997 PMID: 9041679）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%（Flesch G, et al: Eur J Clin Pharmacol 1997 PMID: 917468）86%が糞中排泄（Waldmeier F, et al: Xenobiotica 1997 PMID: 9041679）
【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%［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（Colussi DM, et al: J Clin Pharmacol 1997 PMID: 9089423）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）
【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）
【肝障害患者における情報】軽度～中等度肝障害時のAUCは約2倍に上昇（Brookman LJ, et al: Clin Pharmacol Ther 1997 PMID: 9333102）
【主な臨床報告】厳格降圧ではCVイベントは抑制されたが，CKDの発症を増やした（Beddhu S, et al: Ann Intern Med 2017 PMID: 28869987）
RAS阻害薬開始後のクレアチニン上昇と長期心腎イベントリスク解析（Schmidt M, et al: BMJ 2017 PMID: 28279964）
【効果発現】降圧作用は投与後2hrで現れる（U）
【効果持続】24時間（U）
【更新日】20250512

※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。