

# アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬(ARB)(高血圧症)フォーミュラリ Ver.1

2024.09.19作成

推奨	推奨薬			オプション
一般名	テルミサルタン	カンデサルタン シレキセチル	アジルサルタン	ロサルタンカリウム
代表的な製品名	GE:有、先発:ミカルディス	GE:有、先発:プロプレス	GE:有、先発:アジルバ	GE:有、先発:ニューロタン
標準的1日薬価	10. <sup>1</sup> ~19. <sup>2</sup> 円(先発:38. <sup>2</sup> ) (40mg/日)	11. <sup>7</sup> ~31. <sup>3</sup> 円(先発:48. <sup>9</sup> ) (8mg/日)	32. <sup>1</sup> 円(先発:83. <sup>3</sup> ) (20mg/日)	16. <sup>6</sup> ~26. <sup>1</sup> 円(先発:71. <sup>7</sup> ) (50mg/日)
効能・効果	高血圧症	①高血圧症(1才以上の小児の適応有) ②腎実質性高血圧症(8mgまで) ③慢性心不全(8mgまで)	高血圧症(6才以上の小児の適応有)	①高血圧症 ②高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症
用法	1日1回 経口投与	1日1回 経口投与	1日1回 経口投与	1日1回 経口投与
用量	1回40mg(20mgから開始、最大:80mg)	1回4~8mg(最大:①12mg、②③8mg)	1回20mg(最大:40mg)	1回25~50mg(最大:100mg)
半減期(hr)	20.3±12.1(40mg,普通錠)	2.2±1.4(錠剤,4mg:1日目)	13.2±1.4(錠剤,20mg) 4.7±1.0(小児:5mg)	約2時間
特徴など	・肝障害のある患者に投与する場合、最大投与量は1日1回40mg ・後発品の20mgと40mgにOD錠あり	・後発品にOD錠あり	・後発品にOD錠あり	
禁忌	・妊婦妊娠している可能性のある女性 ・アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者 ・胆汁の分泌が極めて悪い患者又は重篤な肝障害のある患者	・妊婦妊娠している可能性のある女性 ・アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者	・妊婦妊娠している可能性のある女性 ・アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者	・妊婦妊娠している可能性のある女性 ・アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者 ・重篤な肝障害のある患者

## <解説>

### 有効性・安全性

- ・日本高血圧学会「高血圧治療ガイドライン2019」など国内のガイドラインにおいて使い分けについて明記されていない。
- ・日本神経学会/日本頭痛学会/日本神経治療学会の「頭痛の診療ガイドライン2021」では、予防療法としてカンデサルタン:B、オルメサルタン:Cが記載されている。
- ・米国心臓協会(AHA)のステートメント9では治療抵抗性高血圧において、アジルサルタンは他のARBと比較して、24時間自由行動下血圧測定における血圧降下作用があるとの記載がある。(ただし、米国で承認されているのはプロドラッグである)

### 推奨の理由

日本では2024年8月時点で、7種類(アジルサルタン、イルバサルタン、オルメサルタン、カンデサルタン、テルミサルタン、バルサルタン、ロサルタン)のARBが発売されている。全ての成分で後発品が発売されている。

・推奨薬:テルミサルタン、カンデサルタン シレキセチル、アジルサルタン ARBは、日本高血圧学会「高血圧治療ガイドライン2019」など国内のガイドラインにおいて使い分けについて明記されていない。  
テルミサルタンは、承認用量での降圧効果が高いこと、40mgを超えた用量では非線形に血中濃度が上昇すること、代謝にCYPの関与がないこと、英国及び米国では「心血管リスク低下」の適応が承認されていること、後発品において口腔内崩壊錠(OD錠)が発売されており、服用しやすいことが特徴として挙げられる。  
カンデサルタン シレキセチルは、「ACE 阻害薬の投与が適切でない場合の軽症~中等症の慢性心不全」の適応、および高血圧症の小児適応(1 歳以上)の適応も承認されていること、後発医薬品において口腔内崩壊錠(OD錠)が発売されており、服用しやすいことが特徴として挙げられる。

アジルサルタンは、日本での最大用量40mgにおいては他のARBより降圧効果が高いとの報告があること、日本において、高血圧症の小児適応(6 歳以上)の適応が承認されていること(先発のみ)が特徴として挙げられる。2023年6月に後発医薬品が発売され、先発医薬品には無いOD錠が発売されている。ARBで唯一の顆粒剤があるが、現時点では後発医薬品が存在しないので留意する。

テルミサルタン、カンデサルタン シレキセチル、アジルサルタンは、有効性・安全性において差がなく、後発医薬品が販売されて安価であり、適応症の観点からも標準的に用いやすい薬剤であると考えられることから3剤すべてを推奨薬とした。

・オプション:ロサルタンカリウム 上記と同様に、ARBは国内外のガイドラインにおいて使い分けが明記されていない。

ロサルタンカリウムは、「高血圧及び蛋白尿を伴う2 型糖尿病における糖尿病腎症」の適応も承認されていること、英国及び米国では「脳卒中リスク低下」の適応が承認されていること、半減期が短いため降圧効果より腎保護作用を目的に使用される頻度が高いことが特徴として挙げられる。一方で、先発医薬品・後発医薬品ともに普通錠のみの発売であり、剤形選択の利便性では他剤に劣ること、前述の通り降圧効果を目的とした処方よりも臓器保護作用を念頭においた処方を中心であると考えられることから、特に腎保護を優先する場合に使用するオプションとした。

\*上記のように日本フォーミュラリー学会が提示する情報をもとに推奨理由を検討した。

### 備考

ARNI(サクビトリルバルサルタン)について、2023年6月時点で「慢性心不全」「高血圧症」の適応を有しており、既存のARBとの比較試験なども報告されている。しかし、既存のARBと異なる薬理作用を有しており、実態はより心不全治療薬に近いと思われるため、検討対象からは除いた。

## <参考文献>

- 1:日本高血圧学会:高血圧症治療ガイドライン2019
- 2:日本腎臓学会, エビデンスに基づくCKD 診療ガイドライン2023
- 3:日本循環器学会/日本心不全学会合同ガイドライン 急性・慢性心不全診療ガイドライン(2017年改訂版)
- 4:日本循環器学会, 急性冠症候群ガイドライン(2018 年改訂版)
- 5:日本老年医学会, 日本医療研究開発機構研究費・高齢者の薬物治療の安全性に関する研究班 高齢者の安全な薬物療法ガイドライン2015
- 6:日本高血圧学会, 高血圧診療ガイド2020
- 7:日本循環器学会/日本心不全学会合同ガイドライン 2021年JCS/JHFS ガイドライン フォーカスアップデート版 急性・慢性心不全診療
- 8:日本神経学会/日本頭痛学会/日本神経治療学会, 頭痛の診療ガイドライン2021
- 9:AHA: Scientific statement on resistant hypertension – Detection, evaluation, and management (2018)

本フォーミュラリーは2024年8月16日時点の添付文書・インタビューフォーム・薬価ならびに各種ガイドラインを参考に作成していることに留意されたい。