(高血圧症) アンギオテンシンⅡ受容体拮抗薬 (ARB) フォーミュラリ Ver. 1.0

2025.10.7作成

推奨	推奨					
一般名	アジルサルタン		カンデサルタン シレキセチル		テルミサルタン	
代表的な 製品名	(GE) アジルサルタン錠	(先発) アジルバ [®] 錠	(GE) カンデサルタン錠	(先発) ブロプレス®錠	(GE) テルミサルタン錠	(先発) ミカルディス®錠
標準的 1日薬価	27. ⁴ ~30. ² 円 (20mg/日)	76. ³ 円 (20mg/日)	10. ⁷ ~28. ⁵ 円 (8mg/日)	43. ⁷ 円 (8mg/日)	10. ⁴ ~17. ³ 円 (40mg/日)	32. ¹ 円 (40mg/日)
効能・効果	※1歳が1高血圧症※6歳以上の小児に適応あり(先発医薬品のみ)(開始③慢性		あり。 ②腎実質性系 (開始 2mg、 ③慢性心不全	以上の小児に適応 。 程質性高血圧症 2mg、8 mg まで)		
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	
用量 (成人)	1回 20mg (最大 40mg)		1回4~8mg (最大①12mg、②③8mg)		1回 40mg (20mg から開始し、最大 80mg)	
※半減期 (hr)	13.2±1.4(成人 20mg,単回)		2.2±1.4 (4mg,1 日目)		20.3±12.1(40mg,単回)	
特徴など	・妊婦又は妊娠している可能性のある女性は禁忌。 ・アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者は禁忌。 ・後発医薬品に口腔内崩壊錠(OD 錠)がある。 <積極的適応 ¹² > ・脳血管障害、左室肥大、心筋梗塞後、左室駆出率の低下した心不全、蛋白尿/微量アルブミン尿を有する CKD ・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あり。 ・経性心不全の適応あり。患者は禁忌・代謝に CYP の関与がない。					

※半減期等の詳細については各メーカーにご確認ください

推奨	オプション				
一般名	ロサルタンカリウム				
代表的な 製品名	(GE) ロサルタンカリウム錠	(先発) ニューロタン®錠			
標準的 1日薬価	14. ⁷ ~25. ⁹ 円 (50mg/日)	42. ² 円 (50mg/日)			
効能・効果	○高血圧症 ○高血圧症及び蛋白尿を伴う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				
用量	1 回 25~50mg (最大 100mg)				
※半減期 (hr)	約 2 時間(25 及び 50mg,単回)				
特徴など	(共通) ・妊婦又は妊娠している可能性のある女性は禁忌。 ・アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者は禁忌。 <積極的適応 ¹² > ・脳血管障害、左室肥大、心筋梗塞後、左室駆出率の低下した心不全、蛋白尿/微量アルブミン尿を有する CKD				
וא אייפ כ	・重篤な肝障害のある患者は禁忌。 ・高血圧症及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症に適応有り。 ・尿酸低下作用を有する。 ・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。 ・先発・後発医薬品ともに普通錠のみの発売であり、剤型選択の利便性では他剤に劣る。				

※半減期等の詳細については各メーカーにご確認ください

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 2019^1 」など国内のガイドライン $^{2-9}$ において使い分けについて明記されていない。
- ・「高血圧管理・治療ガイドライン 2025^{12} 」において、ARB、長時間作用型ジヒドロピリジン系 Ca 拮抗薬、ACE 阻害薬、少量のサイアザイド系利尿薬、 β 遮断薬を主要降圧薬とし、各種降圧薬の特徴、積極的な適応、禁忌と注意点を理解したうえで、適切な降圧薬を選択するとの記載がある。尚、異なるクラスの降圧薬の併用は、単剤の倍量に比べ、降圧効果が大きい。また、半量の併用療法では、単剤常用量より大きな降圧が得られるうえ、副作用(有害事象)の発生率を低く抑えることができると記載がある。
- ・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^{10} 」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 ¹¹ 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 2025 年 9 月時点で、7 種類(アジルサルタン、カンデサルタン、テルミサルタン、ロサルタン、イルベサルタン、オルメサルタン、バルサルタン)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 》アジルサルタン、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタン

ARB は、日本高血圧学会「高血圧治療ガイドライン 2019¹」など国内のガイドライン ²⁻⁷ において使い分けについて明記されていない。「高血圧管理・治療ガイドライン 2025¹²」においては、各種降圧薬の特徴、積極的な適応、禁忌と注意点を理解したうえで、適切な降圧薬を選択するとの記載がある。

アジルサルタンは、日本での最大用量 $40 \, \text{mg}$ 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。 $2023 \pm 6 \,$ 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ほか、薬価が約 $4 \,$ 分の $1 \,$ となり 経済面での障害は低くなった。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。

カンデサルタン シレキセチルは、日本において、高血圧症だけでなく「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。

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。一方で、大部分が胆汁を介してグルクロン酸抱合体として糞中に排泄されるため、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に禁忌であることは注意が必要である。

アジルサルタン、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタンは、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、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剤すべてを第1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。「高血圧管理・治療ガイドライン 2025¹²」においては、各種降圧薬の特徴、積極的な適応、禁忌と注意点を理解したうえで、適切な降圧薬を選択するとの記載がある。

ロサルタンカリウムは、日本において、高血圧症だけでなく「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、主に肝臓で代謝され胆汁中に排泄されるため、重篤な肝障害のある患者に禁忌であることは注意が必要である。

ロサルタンカリウムは、上記のとおり優れている部分は見受けられるものの、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が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。

<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:日本糖尿病学会.糖尿病診療ガイドライン 2024
- 9:日本循環器学会. 2023 年改訂版 冠動脈疾患の一次予防に関する診療ガイドライン
- 10: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
- 11 : AHA: Scientific statement on resistant hypertension Detection, evaluation, and management (2018)
- 12: 高血圧管理・治療ガイドライン 2025

<u>本フォーミュラリは 2025 年 9 月時点の添付文書・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。</u>