

ニカルジピン塩酸塩

新様式

運転△

2149

nicardipine hydrochloride

ペルジピン Perdipine(LTL)

錠：10・20mg 散：10% 100mg/g

LAカプセル：20・40mg(徐放)

注：2・10・25mg/2・10・25mL/A

後 ニカルジピン塩酸塩(錠 10・20 散 10% 注 2・10・25 各社, 徐力 20・40 日医工)

適応

内 本態性高血圧症 注 ① 手術時の異常高血圧の救急処置 ② 高血圧性緊急症 ③ 急性心不全(慢性心不全の急性増悪を含む)

用法

内 1回10～20mg 1日3回(徐力 1回20～40mg 1日2回) 注 生食又は5%ブドウ糖で希釈し、0.01～0.02%(0.1～0.2mg/mL)溶液を点滴静注 ① 2～10μg/kg/分で開始し、目的値まで血圧を下げ、以後血圧モニターしながら速度調節。尚、急速な降圧には原液(10～30μg/kg)を静注 ② 0.5～6μg/kg/分で投与。尚、0.5μg/kg/分より開始し、目的値まで血圧を下げ、以後血圧モニターしながら速度調節 ③ 1μg/kg/分で投与。尚、病態に応じて0.5～2μg/kg/分の範囲で速度調節 注意

① ②

a)目的血圧が得られた後、引き続き降圧治療が必要で経口投与可能な場合は切替

b)終了後に血圧再上昇がある為、終了する際は徐々に減量し、終了後も血圧管理。尚、経口投与切替後にも血圧の再上昇等に留意

② ③ 期待した改善がみられない場合は中止し、他の治療法(利尿薬、陽性変力作用をもつ強心薬、血管拡張薬等の静注又は機械的補助循環等)に切替等、必要な措置を講じる

！ 警告

注 脳出血急性期及び脳卒中急性期で頭蓋内圧が亢進している患者に投与する場合、緊急対応が可能な医療施設において、最新の関連ガイドラインを参照しつつ、血圧等の患者状態を十分モニタリングしながら投与

禁忌

内

1)頭蓋内出血で止血が完成していないと推定(出血促進)

2)脳卒中急性期で頭蓋内圧が亢進(頭蓋内圧が高まる)

3) 妊婦・妊娠

注 (共通) 過敏症 (適応 ③)

1)高度な大動脈弁狭窄・僧帽弁狭窄、肥大型閉塞性心筋症、低血圧(収縮期血圧90mmHg未満)、心原性ショック(心拍出量及び血圧が更に低下)

2)発症直後で病態安定していない重篤な急性心筋梗塞(広範囲、3枝病変による梗塞等の重篤な急性心筋梗塞患者では血行動態の急激な変化を生じる、更に病態悪化)

注意**〈基本〉 内**

①Ca拮抗剤を急に中止した時、症状悪化した症例報告→休薬は徐々に減量．又、医師指示なしに服薬中止しないように注意

②降圧作用に基づくめまい等→**運転注意**

注 〔共通〕

①作用には個人差がある為、血圧、心拍数等を管理しながら慎重に

②過剰投与により著明な低血圧を来した場合は中止．又、速やかに血圧回復には昇圧剤(ノルアドレナリン)投与

〔適応 3〕

①血圧、心拍数、尿量、体液及び電解質、また可能な限り肺動脈楔入圧、心拍出量及び血液ガス等患者の全身状態を十分管理しながら投与

②血管拡張作用による過度の血圧低下、動脈血酸素分圧低下の発現に注意．特に血圧低下作用から、血圧がやや低く(収縮期血圧が100mmHg未満を目安)、循環血液量が相対的に減少している場合、嚴重な血圧モニターを行い、更なる血圧低下があれば中止等、必要な措置を講じる

③臨床症状が改善し、状態安定した場合(急性期状態を脱した場合)は漫然と投与せず他の治療法に変更．投与期間は患者の反応性に依じて異なるが、急性心不全に対する24時間超の使用経験が少ない為、これ以上の投与が必要な場合は血行動態及び全身状態等を管理しながら慎重に

④他の血管拡張薬併用は過度の血圧低下に注意

⑤急性心筋梗塞による急性心不全への使用は血行動態及び全身状態等を管理しながら慎重に

〈適用上〉

①点滴静注する場合の0.01～0.02%溶液は、配合可能な輸液に必要量を加えて調製

②**配合** 点滴静注では配合輸液によりpHが高い等の原因で本剤析出あり注意．尚、配合試験結果、以下輸液は配合可能：生食、5%ブドウ糖、10%EL-3号、ソリタ-T1号、ソリタ-T3号、フィジオゾール・3号、ポタコールR、リンゲル液

③薬液の血管外漏出で注射部位を中心に炎症・硬結等→慎重に

④長時間投与し、注入部位に痛みや発赤等がみられた場合は注入部位変更

〈その他〉 開心術後の回復管理期では症例により循環不全を生じ、心不全状態になることが知られているが、使用経験少なく(計21例)、有効性は未確立

患者背景**〈合併・既往〉 内**

①低血圧症(更に血圧低下)

②緑内障(血管拡張作用により眼圧上昇)

注 〔共通〕

①脳出血急性期(有益のみ．出血促進)

②脳卒中急性期で頭蓋内圧が亢進(有益のみ．頭蓋内圧を高める)

③大動脈弁狭窄症(症状悪化)

④遺伝性果糖不耐症(添加剤D-ソルビトールが体内で代謝されて生成した果糖が正常に代謝されず、低血糖、肝不全、腎不全等が誘発)

〔適応 3〕

①重篤な不整脈(不整脈を慎重に管理しながら治療が必要)

②血圧が低い(更なる血圧低下)

〈腎〉腎機能障害〔重篤な腎機能障害患者では降圧(注 急激な降圧)に伴い腎機能低下〕 〈肝〉肝機能障害(肝代謝)

〈妊婦〉 妊C 内 禁忌(動物の妊娠末期投与で出生児の体重が少なく、その後も体重増加抑制) 注 有益のみ(動物で妊娠末期に高用量では胎児死亡増加、分娩障害、出生児体重減少及びその後の体重増加抑制が報告) 〈授乳婦〉 有益性を考慮して継続又は中止(動物で乳汁中移行が報告) 〈小児〉 臨床試験は未実施
〈高齢〉 低用量(注 例：0.5µg/kg/分で点滴静注)から開始し慎重に

相互

主にCYP3A4で代謝

〈併用注意〉

- 1)他の血圧降下剤：血圧降下作用増強(両剤の薬理学的な相加作用等)
- 2)β遮断剤(プロプラノロール等)：うっ血性心不全患者では過度の血圧低下、心機能低下→必要に応じどちらかを減量又は中止〔両剤の薬理学的な相加作用(血圧降下作用増強、陰性変力作用増強)〕
- 3)ジゴキシンの作用増強し、中毒症状(嘔気、嘔吐、めまい、徐脈、不整脈等)→必要に応じ前記薬剤減量(本剤が主に腎でのクリアランス減少させ、前記薬剤の血中濃度上昇)
- 4)ダントロレン：心室細動、循環虚脱が他のCa拮抗剤(ベラパミル等)の動物実験で報告(高K血症)
- 5)タンドスピロン：動物実験で血圧降下作用増強が報告(前記薬剤は中枢性の血圧降下作用を有し、相加的な降圧作用)
- 6)ニトログリセリン：動物実験で房室ブロックが報告(機序不明)
- 7)免疫抑制剤(シクロスポリン、タクロリムス等)の作用増強し、中毒症状(特に腎機能異常)。又、本剤の作用増強し、血圧低下、頻脈等→必要に応じ両剤減量(本剤或いは前記薬剤によりCYP3A4阻害され、前記薬剤或いは本剤の血中濃度上昇)
- 8)フェニトイン
 - a)前記薬剤の作用増強し、中毒症状(神経的)→必要に応じ前記薬剤減量(本剤の蛋白結合率が高い為、血漿蛋白結合競合により遊離型フェニトイン上昇)
 - b)本剤の作用減弱→必要に応じ本剤増量(CYP3A4誘導され、本剤の代謝促進)
- 9)リファンピシン：作用減弱→必要に応じ本剤増量(CYP3A4誘導され、本剤の代謝促進)
- 10)シメチジン：作用増強され、血圧低下、頻脈等→必要に応じ本剤減量(前記薬剤によりCYP3A4阻害され、本剤の血中濃度上昇※)
- 11)HIVプロテアーゼ阻害剤(サキナビル、リトナビル等)：血中濃度上昇し、作用増強(前記※参照)
- 12)内 グレープフルーツジュース：作用増強(前記※参照)
- 13)注 フェンタニール(麻酔時)：β遮断剤と併用で血圧低下→必要に応じどちらかを減量又は中止(機序不明)
- 14)注 筋弛緩剤(パンクロニウム、ベクロニウム等)の筋弛緩作用増強→筋弛緩作用に注意し、異常があれば両剤の減量若しくは中止(本剤が神経筋接合部位でシナプス前或いは後にアセチルコリン放出を抑制及び骨格筋の筋小胞体でのCa遊離抑制による筋自体の収縮力低下等)
- 15)注 アゾール系抗真菌薬(イトラコナゾール等)：血中濃度上昇し、作用増強(前記※参照)

副作用

〈重大〉 内

- 1)血小板減少
- 2)肝機能障害(AST・ALT・γ-GTPの上昇等を伴う)、黄疸

注

1)麻痺性イレウス

2)低酸素血症(0.1～5%未満)

3)肺水腫，呼吸困難(各0.1%未満)

4)狭心痛(外国で注射剤治療した冠動脈疾患患者の1%未満に狭心痛発現或いは悪化が報告)

5)血小板減少(0.1%未満)

6)肝機能障害(0.1～5%未満．AST・ALT・γ-GTPの上昇等を伴う)，黄疸

〈その他〉内〔※：徐力のみ〕

1)肝臓(AST・ALT・γ-GTP※・ビリルビン・Al-P・LDH※・血清コレステロール※の上昇)

2)腎臓(BUN・Crの上昇)

3)血液(顆粒球減少)

4)消化器(悪心・嘔吐，胃部不快感，食欲不振，胸やけ，口渴，便秘，下痢，腹痛)

5)循環器(顔面潮紅，熱感，動悸，血圧低下，浮腫，脱力感※，倦怠感，のぼせ，立ちくらみ，頻脈)

6)過敏症(発疹，掻痒感，光線過敏症)

7)口腔(歯肉肥厚)

8)その他(頭痛・頭重，めまい，耳鳴，眠気，しびれ感，不眠，胸部不快感，流涎，発赤，頻尿，ふらふら感※)

注

1)循環器(頻脈，心電図変化，血圧低下，動悸，顔面潮紅，全身倦怠感，心室性期外収縮，房室ブロック)(急性心不全時：肺動脈圧の上昇，心係数の低下，心室頻拍，チアノーゼ)

2)肝臓(肝機能異常：AST・ALT等の上昇)

3)腎臓(BUN・Crの上昇)

4)消化器(嘔気，嘔吐，むかつき)

5)過敏症(皮疹)

6)その他(頭痛，体温の上昇，尿量減少，血中TC低下，悪寒，背部痛，血清K上昇，静脈炎)

動態

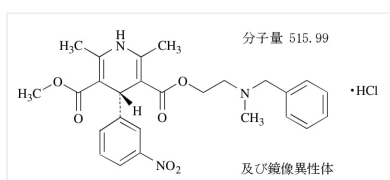
錠

(健常人10～40mg単回)**Tmax**：30～60分 **T1/2**：90分，(1回20mg1日3回連続)約4時間 **排泄**：24時間
 までの尿中排泄率は0.01%以下，主代謝物の脱ベンジル体が3.2%と最も多く排泄 **徐力** (健常人40mg単回)
 2峰性，**Tmax**：各々0.8時間及び6.0時間 **Cmax**：各々16.5ng/mL及び12.4ng/mL **AUC**：115ng・h/mL
 (1回40mg1日2回連続)**T1/2**：7.6時間 **注** (健康人0.01・0.02mg/kg単回静注)**T1/2β**：63・50分 **AUC**：
 23.3・38.3ng・h/mL (全身麻酔下0.01～0.03mg/kg単回静注)**T1/2β**：28・22・45分 **AUC**：21.8・2
 9.8・68.7ng・h/mL **蛋白結合率**：90%以上

作用

血管平滑筋細胞中へのCa²⁺の取り込みを抑制することにより，血管拡張作用を発揮する

構造式



保存

散

開封後遮光

徐力

内袋開封後は防湿

規制

内

処方箋

注

劇

処方箋

初出：治療薬マニュアル2023 発行：2023年1月／医学書院

収載：治療薬マニュアル2023（2023年7月13日 掲-ID：yaka016c001d001z0002）