

グレープフルーツジュースと降圧薬



Point

1. 降圧薬として用いられるカルシウム拮抗薬の中にはグレープフルーツジュースを飲むことで血中濃度が上昇し、副作用が生じるものがある。
例) バイミカード、スプレンジール、カルスロット、バイロテンシン、アテレック、アダラート、コニール、ランデルなど
2. アムロジンとノルバスクは影響がないと報告されている。
3. グレープフルーツジュースの効果は飲用後3日間持続する。
4. グレープフルーツジュースにより影響を受ける薬剤はカルシウム拮抗薬のみではないため注意が必要である。

食べ物や薬剤を経口摂取すると食道、胃を通
過し、小腸に到達して、そこで吸収されます。
小腸で吸収された薬剤は血液中に取り込まれ、
全身に届けられます。



吸収の場所である小腸には、食べ物や薬剤などを含む化学物質を分解するチトクロム「P450(CYP)」という酵素が存在します。チトクロム系のなかでも「CYP3A4」により我々医師が日常的に処方している50%以上の薬剤が解毒・分解されます。では、なぜこのような酵素が存在するのでしょうか。

前述したように小腸には口から取り込まれた食物をはじめ、さまざまな物質が流れ込んできます。これらの物質の中には、丸ごと吸収すると人体に悪影響を与える物質もあります。人体に悪影響を与える可能性のある異物を分解して体内に吸収する量を調整するのが「CYP3A4」なのです（図. 1）。

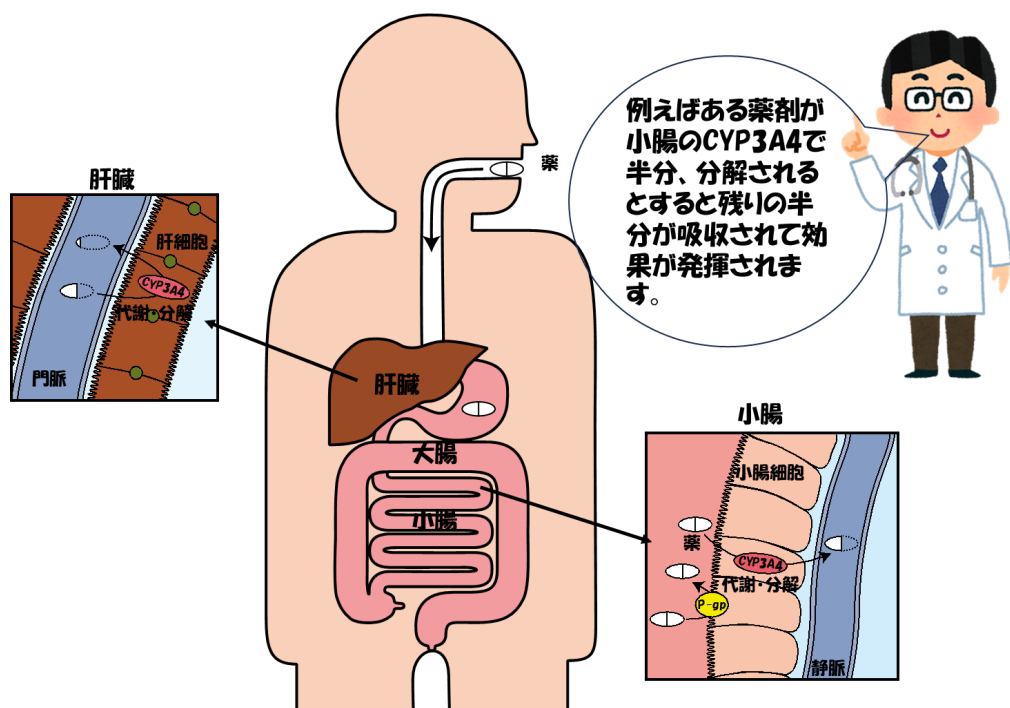


図. 1 薬剤分解酵素である CYP3A4

この CYP3A4 の働きを邪魔して、薬剤の解毒・分解できなくする物質がグレープフルーツジュースに多く含まれている「フルクノマリ

ン」という物質です（図. 2）。なぜグレープフルーツジュースかというとグレープフルーツジュースはグレープフルーツ果汁を濃縮還元し

て作られているため、グレープフルーツ自体よりもフルクノマリンが多く含有されているためです。その効果はグレープフルーツジュース摂取後 3 日程度持続すると報告されています。

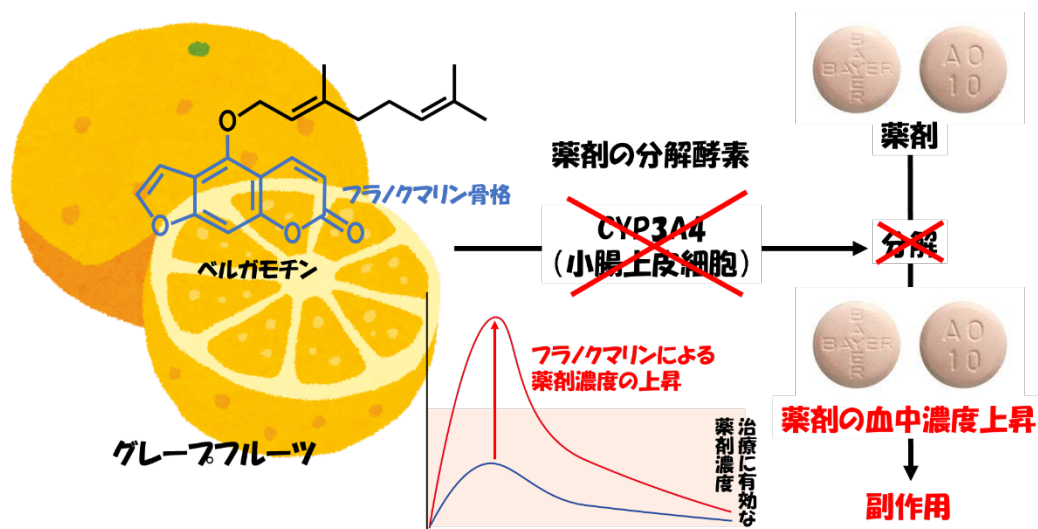


図. 2 フルクノマリンと薬剤の相互作用

また、この効果はグレープフルーツのみに限らず、ブンタンやダイダイなど他の柑橘系の果物でも見られるものがあるので注意が必要です（図. 3）。

高血圧治療薬であるカルシウム拮抗薬を内服している方は薬剤師さんにグレープフルーツジュースを避けるように指導を受ける場合があります。



摂取を控えるべき柑橘類	少量であれば摂取してもよいとされる柑橘類	フラノクマリン類が含まれないとされる柑橘類
グレープフルーツ スウィーティー メロゴールド バンヘイユ レッドボメロ ダイダイ フンタン ハッサク サワーボメロ メキシカンライム 夏ミカン パール柑 サンボウカン	レモン(果汁のみ) 日向夏(果汁のみ) スウィートオレンジ(果汁のみ) ネーフルオレンジ ポンカン イヨカン ユス カボス スダチ キンカン	温州ミカン テコボン

図. 3 フルノマリンが含まれる柑橘類

それはカルシウム拮抗薬の中にはフルノマリンの影響で小腸での分解が邪魔され、血液中の薬剤濃度が上昇するために血圧を過度に低下させてしまうものがあるためです（図. 4）。バイミカードやスプレ

影響の程度	商品名	一般名	AUC	Cmax
影響大	バイミカード	ニソルジピン	1.98～4.55倍	3.06～4.92倍
	スプレンジール	フェロジピン	1.43～3.34倍	1.7～4.35倍
影響を受ける	カルスロット	マニジピン	2.31～2.44倍	2.35～3.07倍
	バイロテンシン	ニトレンジピン	1.4～2.06倍	1.4～1.99倍
	アテレック	シルニジピン	2.3倍	
	アダラート	ニフェジピン	1.08～2.03倍	1.04～1.94倍
	コニール	ベニジピン	1.59倍	1.73倍
	ランテル	エホニジピン	1.67倍	1.55倍
若干影響を受ける	ワソラン	ベラパミル	1.28～1.42倍	0.85～1.61倍
ほとんど影響しない	ヘルベッサー	ジルチアゼム	1.03～1.1倍	1.02～1.07倍
	ハルバスク	アムロジピンベシル	1.08～1.16倍	1.07～1.15倍

* AUC どのくらい吸収されるか
Cmax 薬剤投与後の最大血中濃度

図. 4 フルノマリンの影響を受けるものと受けないもの

ジールを内服している方はグレープフルーツジュースの飲用は避けた方がよさそうです。アムロジンやノルバスクはグレープフルーツジュースの影響は受けにくいと報告されています。

他にもグレープフルーツジュースにより影響を受ける薬剤が多くありますが、以下に一部を記載しておきます（図. 5）。以下の薬剤はほんの一部ですので、ご自身の内服している薬剤でグレープフルーツとの相互作用が気になることがあれば医師、薬剤師にご相談ください。

降圧薬	ニソルジピン(商品名バイミカード) フェロジピン(商品名スプレンジール)	
脂質代謝異常治療薬	シンバスタチン(商品名リポバス) アトルバスタチン(商品名リビトール)	
抗血小板薬	シロスタゾール(商品名フレタール)	
免疫抑制薬	シクロスポリン(商品名サンディミュン、ネオーラル) タクロリムス(商品名グラセフター)	
抗てんかん薬	カルママゼピン(商品名テグレートール)	
利尿薬	トルバプタン(商品名サムスカ) エフシレノン(商品名セララ)	
睡眠導入剤	ゾルピデム(商品名マイスリー) トリアゾラム(商品名ハルシオン) フロチゾラム(商品名レンドルミン)	

図. 5 フルク/マリンの影響を受ける薬剤

東京医科大学八王子医療センター

心臓血管外科

赤坂 純逸