

▼バリキサ錠・▼バリキサドライシロップ [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】バルガンシクロビル塩酸塩 (U) Valganciclovir Hydrochloride 【分類】抗サイトメガロウイルス化学療法剤

【単位】▼450mg/錠, ▼5000mg/12g

【常用量】■CMV 感染症：初期治療：1回900mg1日2回, 維持治療：1回900mg1日1回

■臓器移植（造血幹細胞移植を除く）におけるサイトメガロウイルス感染症の発症抑制：1回900mg, 1日1回食後

■DS1 瓶（12.0g）に精製水91mLを加えて50mg/mL (Total 100mL) に調製

【用法】CMV 感染症の初期治療：1日2回 [通常最大21日], その他1日1回

■食後に投与

■移植：移植後早期より投与を開始し, 腎移植患者では200日まで, 腎臓以外の臓器移植患者では100日までの投与を目安

【透折患者への投与方法】450mg/回以下の設定になるので, ガンシクロビルの静脈内投与もしくはドライシロップ剤を選択 (1)

【その他の報告】避ける (U,3,12) 静注製剤を考慮 (17)

【PD】避ける (3,17)

【CRRT】450mgを48hr毎とするが, 静注製剤を考慮 (17) 450mgを48hr毎 (Perrottet N, et al: J Antimicrob Chemother 2008 PMID: 18344549)

【保存期CKD患者への投与方法】CCr 60mL/min以上: 減量の必要なし, CCr 40~59mL/min: 450mgを1日2回, CCr 25~39mL/min: 450mgを1日1回, Ccr 10~24mL/min: 450mgを1日おき, もしくは, DS 225mgを1日1回, 維持療法はそれぞれ投与間隔を2倍にする [ただしCcr 10~24mL/minでは450mgを週2回投与もしくはDSを125mg1日1回], Ccr 10mL/min未満: DS 200mgを週3回HD後 [維持療法は100mgを週3回HD後] (1)

【その他の報告】Ccr 10mL/min未満の患者には450mg/日以下の設定になるので投与を避ける (U)

GFR>50mL/min: 50~100%, GFR 10~50mL/min: 450mgを24~48hr毎, GFR<10mL/min: 450mgを週2回 (3)

GFR>50mL/min: 900mgを1日2回, GFR 10~50mL/min: 450mgを24~48hr毎, GFR 10mL/min未満: 450mgを週2回 (17)

腎移植後に腎機能が低値の場合には通常の減量適用ではAUCが目標レベルに到達しない可能性がある (Tangden T, et al: Clin Pharmacokinet. 2018 PMID: 29546589)

PPK解析により, 腎機能に応じてさらに細かく用量設定すると目的AUCに維持されやすい (Padulles A, et al: Antimicrob Agents Chemother 2016 PMID: 26824942)

【特徴】ガンシクロビルのバリルエステルでガンシクロビルより消化管吸収率が約10倍に上昇した製剤。

【主な副作用・毒性】骨髄抑制, 出血, 腎不全, 肺炎, 血栓性静脈炎, 精神神経症状, 感染症など

【吸収】空腹時投与に比べ食後投与でAUCが30%増加する (1) PEPT1に乗る (1)

常用量の比較でGCV血中濃度としての非劣勢性が, 腎機能正常, 体重88kgの条件下で確認 (Pescovitz MD, et al: Antimicrob Agents Chemother 2000 PMID: 10991864)

【F】約60% [ガンシクロビルカプセルの約10倍] (1) 新生児41.1% (Kimberlin DW, et al: J Infect Dis 2008 PMID: 18279073)

【tmax】1~3hr (U) 1~2hr, 透折患者7.3hr (Czock D, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 142-50, 2002)

【代謝】腸管・肝臓のエステラーゼにより活性体のガンシクロビルに代謝される (1) エステラーゼ分解による抽出比は約90% (1) ほとんど代謝されない (1)

【排せ】尿中未変化体排泄率90%以上 (12) 100%が未変化体として糸球体ろ過および尿細管分泌により尿中に排せ (U)

【CL】3.07±0.64mL/min/kg (1) 【腎CL】腎機能正常時3.21±0.75mL/min/kg (1)

【t1/2】4hr (1,U) 3.8hr (Czock D, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 142-50, 2002) 【腎不全患者のt1/2】10~67.5hr (12) Ccr 51~70mL/min: 5hr, Ccr 21~50mL/min: 10hr, Ccr 11~20mL/min: 22hr, Ccr 10mL/min以下: 68hr (Czock D, et al: Clin Pharmacol Ther 2002 PMID: 12189361)

【蛋白結合率】1~2% (1,12,U)

【Vd】0.680±0.161L/kg (1) 0.7L/kg (12,U) 髄液には血中濃度は24~67%移行 (1) 脳脊髄液への移行性についての症例報告 (Peredo I, et al: BMJ Case Rep 2015 PMID: 26670887)

【MW】390.82

【透折性】約50%除去される (1,12,U, Czock D, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 142-150, 2002)

【TDMのポイント】TDMの対象ではないが有用性も示唆 (ガンシクロビル注参照)

臓器移植時のCMV予防におけるTDMの有用性も示唆 (Wong DD, et al: Rev Med Virol 2019 PMID: 30556615)

経口治療は点滴静注よりAUCが高くなることもあり, また腸管におけるGVHDの影響を受けるかもしれない (Einsele H, et al: Blood 2006 PMID: 16352807)

小児での全身CLにはCCrと体重が関与 (Franck B, et al: Br J Clin Pharmacol 2021 PMID: 33373493)

【O/W係数】0.0095 [1-オクタノール水系] (1)

【主な臨床報告】腎移植例における投与設計に用いる関連因子の検討 (Posadas Salas MA, et al: Transpl Infect Dis 2013 PMID: 24010993)

AIDSのCMV網膜炎治療の選択肢になる (Martin DF, et al: N Engl J Med 2002 PMID: 11948271)

小児で450mg/48hr投与時にCCr 20mL/min以下となり中枢毒性を認めた症例 (Peyriere H, et al: Ann Pharmacother 2006 PMID: 16368917)

腎移植小児における17.3±6.1 mg/kg投与時のPPK解析 (Facchin A, et al: Antimicrob Agents Chemother 2019 PMID: 31527022)

腎移植後のCMV感染の予防・治療に有用 (Ruenroengbun N, et al: Transpl Int 2021 PMID: 34580930)

【備考】PKはガンシクロビルも参照

【更新日】20220303

※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。