

▼レグナイト錠 [内]

【重要度】★★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】ガバペンチン エナカルビル gabapentin enacarbil 【分類】レストレスレッグス症候群治療薬

【単位】▼300mg/錠

【常用量】1日1回600mg

【用法】1日1回夕食後

【透析患者への投与方法】禁忌 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr 60～89mL/min : 1日1回300mg とし, 最大600mg, Ccr 30～60mL/min : 1日1回300mg, Ccr 30mL/min 未満 : 禁忌 (1)

【その他の報告】CL/F は Ccr と正相関するので減量すべき (Lal R, et al: Clin Ther 34: 201-13, 2012)

【特徴】抗てんかん補助薬ガバペンチンのプロドラッグの徐放性製剤。吸収が線形で吸収後ガバペンチンに変換される。中等度から高度の特発性レストレスレッグス症候群に用いられる。

【主な副作用・毒性】SJS, DIHS, 急性腎不全, 肝障害, めまい, 消化器症状, 好酸球増多, 動悸, 霧視, 筋肉痛, 傾眠, 疲労, 体重増加など

【吸収】モノカルボン酸トランスポータータイプ1 (MCT1) および, Na 依存性マルチビタミントランスポーター (SMVT) を介した能動輸送, pH 依存的受動拡散により吸収される (1) 吸収部位は小腸～大腸 (1)

【F】尿中回収率から73%以上 (1)

【tmax】4～6hr (1)

【代謝】消化管上皮細胞内あるいは肝臓等に存在しているカルボキシルエステラーゼにより速やかに加水分解され, 活性代謝物であるガバペンチンに変換される (1) CYP の代謝を受けず, 阻害・誘導作用は認められない (1)

【排泄】ガバペンチンとして尿中に73%回収 (1) 腸肝循環しない (1)

【CL】CL/F=5.29L/hr (1) 腎 CL=7～9L/hr で糸球体ろ過により尿中排泄されるが, OCT2 の関与による尿細管分泌も存在する (1) Ccr 15～30mL/min の CL/F=1.33L/hr (1)

【t1/2】4～6hr (1) Ccr 15～30mL/min : 16.4hr (1)

【蛋白結合率】3%未満 (1) 未変化体78～87% (1)

【Vd】Vd/F=56L/man (1)

【MW】329.39

【透析性】透析性は高い (1)

【O/W 係数】LogP=3.07 (1)

【相互作用】モルヒネ併用時にガバペンチンの Cmax 24%上昇, AUC 44%増加 [モルヒネの消化管運動抑制による吸収の増加?] (1) アルコールとの同時服用により徐放性が失われる可能性があるため飲酒を避けるよう指導 (1)

【備考】粉砕, 分包不可 (1)

【更新日】20170417

※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。