

▼ジスバルカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】 バルベナジン トシル酸塩 Valbenazine Tosilate 【分類】 遅発性ジスキネジア治療剤 [VMAT2 阻害剤]

【単位】 ▼40mg/Cap

【常用量】 40mg/日 [最大 80mg]

▼QT 延長のリスクから以下では最大 40mg/日

CYP2D6 の PM, CYP2D6 もしくは 3A4 阻害剤併用者、中等度異常の肝障害

【用法】 1 日 1 回

食事の影響を受けるため、増量時はタイミングを固定

【透析患者への投与方法】 PK は腎機能低下の影響を受けない (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 PK は腎機能低下の影響を受けない (1)

【特徴】 小胞モノアミントランスポーター2 (VMAT2) 阻害剤。中枢神経系の前シナプスにおいて、モノアミン (DA 等) の貯蔵及び遊離のために細胞質からシナプス小胞へのモノアミンの取込みを制御している VMAT2 を選択的に阻害し、遅発性ジスキネジアにおける治療効果を発揮すると考えられる。

【主な副作用・毒性】 QT 延長、傾眠、鎮静、錐体外路障害、発疹、悪性症候群、倦怠感、体重変化、消化器症状など多数。

【安全性に関する情報】

【吸収】 空腹時投与で血中濃度上昇 (1)

【F】 48.6% (1)

【tmax】 0.75hr, 活性代謝物 4~6hr (1)

【代謝】 バリンエステルの加水分解より活性代謝物 (+)- α -DHTBZ ; NBI-98782) へ代謝され、CYP3A4/5 により酸化的代謝を受ける (1) 活性代謝物は CYP2D6 及び CYP3A4/5 により酸化代謝されグルクロン酸抱合を受ける (1) 未変化体は主に CYP3A で代謝 (1) 活性代謝物は主に CYP2D6, CYP3A で代謝 (1) AUC 比として、未変化体 42%, 活性代謝物 10% (1) 活性代謝物の AUC は未変化体の 20~30% (Luo R, et al: Psychopharmacol Bull 2017 PMID: 28839339)

【排泄】 尿中回収率 60%, 未変化体 1.8%, 活性代謝物 1.6% [po, 9 日まで] (1)

P-gp を阻害 (1) OATP の基質にならない (1)

【CL】

【t1/2】 17hr (1) 未変化体, 活性代謝物ともに 20hr (Luo R, et al: Psychopharmacol Bull 2017 PMID: 28839339)

【蛋白結合率】 未変化体 99.9%, 活性代謝物 62.9% (1)

【Vd】

【MW】 762.97 [ester・salt]

【透析性】

【O/W 係数】 Log P=3.72 (中性形), 1.35 (モノカチオン型) (1)

【相互作用】 P-gp を阻害し、ジゴキシンの Cmax, AUC が上昇 (1) CYP3A4 阻害剤により血中濃度上昇 (1)

【肝障害患者への投与方法】

【小児 CKD 患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】

【主な臨床報告】

【更新日】 20240725

※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、当院では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。