

▼ホストイン静注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】ホスフェニトインナトリウム水和物 Fosphenytoin Sodium Hydrate [NPC-06] 【分類】抗てんかん薬

【単位】▼750mg/V [10mL]

【常用量】■てんかん重症：初回：22.5mg/kgを静注 [3mg/kg/min または 150mg/min のいずれか低い方を超えない速度で] 維持：5~7.5mg/kg/日を1回または分割静注 [1mg/kg/min または 75mg/min のいずれか低い方を超えない速度で]

■脳外科手術又は意識障害時のてんかん発作の発現抑制：初回：15~18mg/kg 静注，維持：5~7.5mg/kg/日を1回または分割静注 [1mg/kg/min または 75mg/min のいずれか低い方を超えない速度で]

■フェニトイン経口投与の代替：経口の1日投与量の1.5倍量を1日1回または分割静注 [1mg/kg/min または 75mg/min のいずれか低い方を超えない速度で]

ホスフェニトイン375mgはフェニトインNa250mgに相当 (Inoue Y, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2013 PMID: 22968854)

【用法】適宜5%ブドウ糖，生食などで30倍程度に希釈して静注 [維持投与は初回投与から12~24時間あける]

【透析患者への投与方法】慎重投与 (1) 低用量，低速度で静注が必要な可能性あり (1)

【その他の報告】減量の必要なし (12)

【PD】減量の必要なし (12)

【CRRT】減量の必要なし (12)

【保存期CKD患者への投与方法】慎重投与 (1) 低用量，低速度で静注が必要な可能性あり (1)

【その他の報告】減量の必要なし (12) 非結合型濃度が低下しやすい可能性があり，注入時間をゆっくりにする必要がある可能性 (Aweeka FT, et al: Epilepsia 1999 PMID: 10368078)

腎機能が低下して小児では減量が必要かもしれない (Moffett BS, et al: Pediatr Crit Care Med 2018 PMID: 29927880)

腎機能は全身CLに影響しない (1)

【特徴】難溶性のフェニトインを可溶化するためにプロドラッグ化した注射剤 (血管痛も軽減)。てんかん重症状態，脳外科手術又は意識障害 (頭部外傷等) 時のてんかん発作の発現抑制に用い，フェニトインの経口投与が不可になった場合の代替薬としても使用可能。

【主な副作用・毒性】SJS, TEN, 過敏症候群，血球減少，劇症肝炎，急性腎不全，悪性症候群，皮膚炎，中枢神経症状など

【安全性に関する情報】投与時の血管痛が軽減 (Browne TR, et al: Neurology 1996 PMID: 8649612) 注射部位反応がフェニトインより明らかに少ない (Boucher BA, et al: Pharmacotherapy 1996 PMID: 8840370) 高リン血症をきたしたESRDの少年 (McBryde KD, et al: Pediatr Nephrol 2005 PMID: 15965770)

【吸収】経口投与しても良好に吸収 (Kaucher KA, et al: Pharmacotherapy 2015 PMID: 26011141)

【F】100% (1)

【tmax】

【代謝】血液及び組織中のアルカリホスファターゼにより投与後2hr以内にフェニトインにほぼ完全に変換 (1) 変換される際に，ホルムアルデヒド及びリン酸塩が生成し，ホルムアルデヒドはすみやかにギ酸塩に変化 (1)

【排泄】フェニトイン参照。

【CL】 $CL (L/hr) = 1.99 \times (体重/53.4) \times (年齢/71)$ (Higuchi K, et al: Ther Drug Monit 2019 PMID: 31095070)

【t1/2】ホスフェニトインとして15min (1) 7~24hr (12) 変換半減期8~15min (Browne TR, et al: Neurology 1996 PMID: 8649612) 腎不全時17.6hrと腎機能正常者と比べやや短縮 (1)

【蛋白結合率】85.7~88.1% (1) 90% (12)

【Vd】1L/kg (1) 0.7L/kg (12)

【分布】プロドラッグのため，脳内送達がやや遅れる可能性 [ラット] (Walton NY, et al: Epilepsia 1999 PMID: 9952260)

【MW】532.34 (無水物406.24)

【透析性】除去されにくい (5) 血漿交換治療の影響を受けない (Nishida S, et al: Pharmazie 2020 PMID: 33305722)

【TDMのポイント】負荷投与時に血中濃度が高値となる可能性に注意 (Kim DW, et al: Clin Neuropharmacol 2015 PMID: 26536021)

小児において負荷用量の2hr後と12hr後の血中濃度評価が維持量設定に役立つかもしれない (Okamoto G, et al: Brain Dev 2022 PMID: 35879140)

【相互作用】フェニトインはCYP3A4, CYP2B6, p^{gp}を誘導 (1) ※フェニトインを参照

【肝障害時の投与方法】高いALP状態では変換が速くなる可能性 (Dasgupta A, et al: J Clin Lab Anal 2001 PMID: 11574952)

【主な臨床報告】経口投与と同量の筋注が選択可能 (Wilder BJ, et al: Arch Neurol 1996 PMID: 8759983)

臀部筋注でも急速に吸収される (Pryor FM, et al: Epilepsia 2001 PMID: 11240597)

静注フェニトインとの換算 (Fischer JH, et al: Clin Pharmacokinet 2003 PMID: 12489978)

小児では血中濃度への臍膈の影響はなさそう (Messinger MM, et al: Ther Drug Monit 2015 PMID: 26402424, Prusakov AB, et al: J Child Neurol 2018 PMID: 29714095)

自己免疫性脳症など病態の変化により血中濃度が低下して痙攣発作をきたすことがある (Ohno Y, et al: Ther Drug Monit 2018 PMID: 29683874)

【更新日】20240928

※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。