▼サブリル散分包　［内］

【重要度】★★　【一般製剤名】ビガバトリン　Vigabatrin（VGB）　【分類】抗てんかん薬［点頭てんかん］
【単位】▼500mg/包
【常用量】50mg/kg から開始，3 日以上の間隔で最大 50mg/kg 幅で増量可．最大 150mg/kg もしくは 3g/日
小児には 40～50 mg/kg/日（Rodrigues C, et al: Epilepsy Res 2019 PMID: 30639958）
【用法】1 日 2 回，用時溶解して経口投与
【透析患者への投与方法】設定されていないが CKD 用量に準じる（1）
【その他の報告】透析患者の全身クリアランスは S 体 2.97L/hr，R 体 0.48L/hr と R 体で小さく，長期投与時には R 体が蓄積傾向になるがその影響については不明（Jacqz-Aigrain E, et al: Br J Clin Pharmacol 1997 PMID: 9278207）
【保存期 CKD 患者への投与方法】腎機能障害患者では低用量で反応する可能性があるため，低用量からの投与開始，又は投与間隔の調節を考慮（1）
腎機能正常者に比べ，Ccr 40～79mL/min の患者の AUC は約 1.5 倍，Ccr 10～39mL/min の患者の AUC は約 2.5 倍（1）
【その他の報告】腎機能正常者に比べ，軽度腎機能低下の高齢者では血中濃度が高くなるため腎機能に応じた投与設計が必要（Haegele KD, et al: Clin Pharmacol Ther 1988 PMID: 3180638）
腎 CL は Ccr と非線形に相関し，腎障害患者で減量が必要（Rey E, et al: Clin Pharmacokinet 1992 PMID: 1395360）
尿中排泄率から推定すると，中等度腎障害：50～75%に減量，高度腎障害：25～50%に減量，が提案される（5）
【特徴】小児期の難治性てんかんである点頭てんかん治療薬．GABA トランスアミナーゼの阻害剤．不可逆的な網膜障害による視野障害，視力障害に注意．ラセミ体であり，S 体が活性体.
【主な副作用・毒性】不可逆的な視野障害及び視力障害（網膜毒性には累積投与量が関連），鎮静・昏迷・錯乱・意識消失等の脳症症状，運動障害,
【安全性に関する情報】連用中における投与量の急激な減量や中止により発作の増悪又は重積状態があらわれることがあるため，徐々に減量（1）網膜色素細胞内にはタウリントランスポータが関与している可能性（Police A, et al: AAPS PharmSciTech 2020 PMID: 32666325）
【吸収】
【F】資料なし（1）92±11%で食事の影響を受けない（Frisk-Holmberg M, et al: Br J Clin Pharmacol 1989　PMID: 2757905）小児では低下している可能性（Rey E, et al: Clin Pharmacokinet 23: 267-78, 1992 PMID: 1395360）
【tmax】1～2hr（1）若年者ほど遅い（Nielsen JC, et al: Clin Pharmacokinet 53: 1019-31, 2014 PMID: 25172554）
【代謝】ほとんど代謝されないが，5%未満が 2 種の代謝物に変換され，うち 1 種はラクタム体（Durham SL, et al: Drug Metab Dispos 1993 PMID: 8100505）
【排泄】尿中未変化体排泄率 82%，尿中回収率 95.4%［po，72hr まで］（1）S 体として 49%，R 体として 65%が尿中に回収（Haegele KD, et al: Clin Pharmacol Ther 1986 PMID: 3769388）尿中未変化体排泄率およそ 70%（Rey E, et al: Clin Pharmacokinet 1992 PMID: 1395360）
【CL】CL/F=1.77mL/min/kg，腎 CL=1.45mL/min/kg［po］（Durham SL, et al: Drug Metab Dispos 1993 PMID: 8100505）全身 CL は Ccr と相関（Nielsen JC, et al: Clin Pharmacokinet 2014 PMID: 25172554）
【t1/2】5.5hr［S 体］（1）6～8hr（Haegele KD, et al: Clin Pharmacol Ther1986 PMID: 3769388）
【蛋白結合率】ほとんど結合しない（1）結合しない（Rey E, et al: Clin Pharmacokinet 1992 PMID: 1395360）
【Vd】4L/kg［S 体］，2L/kg［R 体］（1）0.8L/kg（Rey E, et al: Clin Pharmacokinet 1992 PMID: 1395360）
1.18L/kg［po］（Durham SL, et al: Drug Metab Dispos 1993 PMID: 8100505）
【分布】だ液中濃度は血漿濃度の 10%（Durham SL, et al: Drug Metab Dispos 1993 PMID: 8100505）
【MW】129.16
【透析性】資料なし（1）除去されるが，Vd がやや大きい場合には効率的ではない可能性がある（5）HD クリアランス 5L/hr［S 体，R 体同レベル］（Jacqz-Aigrain E, et al: Br J Clin Pharmacol 1997 PMID: 9278207）
【薬物動態】血中濃度は S 体より R 体の方が高いが，脳内濃度は S 体の方が高い（1）0.5～2.0g の間で線形動態（Hoke JF, et al: J Clin Pharmacol 1993 PMID: 8331204）
PK に性差を認めない（Nielsen JC, et al: Clin Pharmacokinet　2014 PMID: 25172554）
【TDM のポイント】TDM が有用である可能性（Rey E, et al: Clin Pharmacokinet 1992 PMID: 1395360）
【O/W 係数】資料なし（1）
【相互作用】フェニトインの血中濃度が低下する可能性（1）フェニトイン血中濃度が 23%低下（Rimmer EM, et al: Br J Clin Pharmacol 1989 PMID: 2757906）フェニトインの血中濃度が低下するのは bioavailability が低下するのではない（Gatti G, et al: Br J Clin Pharmacol 1993 PMID: 12959280）薬物相互作用のポテンシャルは低い（Richens A: Acta Neurol Scand 1995 PMID: 7495190）カルバマゼピンのクリアランスを約 1.3 倍上昇させる（Sanchez-Alcaraz A, et al: J Clin Pharm Ther 2002 PMID: 12472982）
【主な臨床報告】
【更新日】20230527

※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。