▼リオレサール錠，▼ギャバロン錠［内］

【重要度】★★★　【一般製剤名】バクロフェン（U）　Baclofen　【分類】抗痙縮剤
【単位】▼5mg・▼10mg/錠
【常用量】初回5～15mg/日，以後症状により標準用量30mgに達するまで2～3日毎に5～10mgずつ増量
【用法】分1～3
【透析患者への投与方法】尿中未変化体排泄率が高いため減量を要する．1日5mgから投与を開始（1）
【その他の報告】総投与量15mg［5mg1日3回］にて見当識障害をきたした症例［1～2回のHD実施にて回復］（Su W, et al: BMJ 7743: 420-1, 2010）
透析患者に投与して2日後に振せんを発現［投与量不明］（Ortiz LQ, et al: Nefrologia 31: 611-2, 2013）
バクロフェンによる中毒症例の6割はHD患者（El-Husseini A, et al:　Am J Nephrol 34: 491-5, 2011）
腎機能低下例には低用量から開始．特に透析例には5mg/日から開始（2020年10月アルフレッサファーマ 適正使用のお願い）
HD患者には脳症のリスクとなるため低用量で適用すべき（Chauvin KJ, et al: Kidney Int 2020 PMID: 32450156）
【保存期CKD患者への投与方法】Ccr＞50mL/min：20～30mg/日を分2～3，Ccr10～50mL/min：10～20mg/日を分1～2，Ccr＜10mL/min：10mgを1日1回（5）
【その他の報告】腎機能低下により脳症の発症リスクが増大するので，低用量から開始すべき（Muanda FT, et al: JAMA 2019 PMID: 31705755）
CKD患者に20mg/日以上で転倒による入院が増加（Muanda FT, et al: Am J Kidney Dis 2021 PMID: 33581166）
【特徴】GABA 誘導体の抗痙縮剤で，脊髄の単および多シナプス反射の両方を抑制するが特に前者を強く抑制する．臨床上，一般の脳性の痙性麻痺よりも多発性硬化症や脊髄性の痙性麻痺に対しより有効とされる．作用が強力で漸増しないと副作用が出やすく，至適用量に至るまで時間がかかる．
【主な副作用・毒性】眠気、脱力感、悪心、食欲不振、ふらつき、めまい、頭痛など
【安全性に関する情報】透析患者の吃逆への投与時における神経毒性の発現報告（Chou CL, et al：South Med J 99:1308-9, 2006）
20mg/日以上の開始で1か月以内の転倒，低血圧のリスク比有意に上昇［カナダ，Correspondence］（Muanda FT, et al: Am J Kidney Dis 78: 470-473, 2021）
脳症のリスクとして同定（Hwang YJ, et al: Mayo Clin Proc 2023 PMID: 37028980）
【吸収】すみやか，かつ良好に吸収されるが個人差がある．吸収速度や吸収率は用量が増加すると低下する（U）
【F】95%以上（11）
【tmax】2hr（U）1～2hr（11）【Cmax】500～600ng/mL（U）
【代謝】ほとんど代謝されない（1）15%が代謝される（11）一部は酸化的脱アミノ化されて4-hydroxy-3-（4-chlorophenyl）butyric acid に代謝（1）代謝物の活性は弱い（1）
【排泄】尿中未変化体排泄率83～93%［24hrまで］（1）70%（11）69%，尿細管において受動的に再吸収される（Wuis EW, et al: Eur J Clin Pharmacol 37: 181-184,1989）
投与後24hrまでに未変化体として尿中に70～85%（U）5%が代謝物として尿中排泄（11）4～8%が代謝物として尿中に排泄（1）
【腎CL】腎CLはCcrと同等（Wuis EW, et al: Eur J Clin Pharmacol 37: 181-4,1989）
【t1/2】3.6～4.5（1）2～4hr（U）3～4hr（11）6.8hr（Wuis EW, et al: Eur J Clin Pharmacol 37: 181-4,1989）
【蛋白結合率】約30%（U,11）
【Vd】0.83L/kg（Anderson P, et al: J Toxicol Clin Toxicol 22:11-20,1984）
【MW】213.66
【透析性】除去されやすいため中毒時にはHDが選択肢である（Anderson P, et al: J Toxicol Clin Toxicol 22:11-20,1984）　HD時ke= 0.152/hrで，HDクリアランスは2.14mL/sec（=128mL/min)と大きく，HDにより除去される（Brvar M, et al: Eur J Clin Pharmacol 63: 1143-6, 2007）中毒時にHDを実施すると2hrで改善するが，保存的に治療すると回復まで8日かかる（El-Husseini A, et al: Am J Nephrol 34: 491-5, 2011）HD時半減期3.1hr（Hsieh MJ, et al: Am J Emerg Med 30:1654.e5-7, 2012）
腎障害患者の中毒時には人工呼吸管理を必要とする場合に透析除去を試みる（Ghannoum M, et al: Kidney Int 2021 PMID: 34358487）
中毒時のHD除去率はわずかであった（Lee VR, et al: Clin Toxicol (Phila) 2021 PMID: 32734785）
【TDM のポイント】TDM の対象にならない。80～400ng/mL が治療濃度と思われる（U）治療濃度 80～400ng/mL（Peces R, et al: Nephrol Dial Transplant 13:1896-1897,1998）腎不全患者では感受性が亢進しており，治療濃度はもっと低い可能性がある（Chen KS, et al: Ann Pharmacother 31:1315-1320,1997）　【O/W係数】0.1（11）　【pKa】3.85，9.25
【効果発現時間】数時間から数日と幅がある（U）
【備考】
【更新日】20240509

※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。