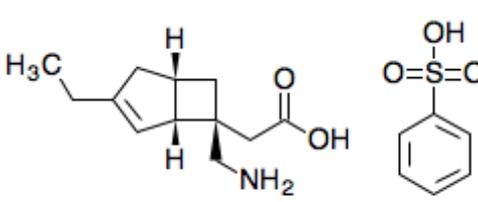
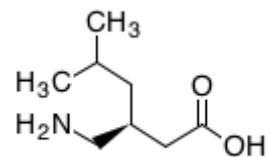


## DI 委員会トピックス

### 神経障害性疼痛治療剤の比較について

ミロガバリン、プレガバリンは、ともに電位依存性カルシウムチャネル $\alpha_2\delta$ サブユニットに対するリガンドで、末梢神経障害性疼痛治療剤である。 $\alpha_2\delta$ リガンドは、シナプス前終末においてカルシウムイオンの流入を減少させ、興奮性神経伝達物質の放出を抑制することで痛みの緩和をもたらすと考えられている。2019年1月に末梢性神経障害性疼痛を効能・効果としてタリージェ錠（ミロガバリン）が承認された。よって、今回、既存のプレガバリンとの比較を行った。

一般名	ミロガバリンベシル酸塩	プレガバリン
商品名	タリージェ	リリカ
化学名	[(1R, 5S, 6S)-6-(Aminomethyl)-3-ethylbicyclo[3.2.0]hept-3-en-6-yl]acetic acid monobenzenesulfonate	(3S)-3-(Aminomethyl)-5-methylhexanoic acid
分子式	$C_{12}H_{19}NO_2 \cdot C_6H_6O_3S$	$C_8H_{17}NO_2$
構造式		
分子量	367.46	159.23
効能・効果	末梢性神経障害性疼痛	神経障害性疼痛、線維筋痛症に伴う疼痛
規格	2.5mg 5mg 10mg 15mg	25mg 75mg 150mg
剤形	フィルムコーティング錠	カプセル 口腔内崩壊錠
排泄	腎排泄	腎排泄
用法・用量	初期用量1回5mgを1日2回経口投与し、その後1回用量として5mgずつ1週間以上の間隔をあけて漸増し、1回15mgを1日2回経口投与。年齢、症状により1回10mgから15mgの範囲で適宜増減し、1日2回投与。	（神経障害性疼痛）初期用量として1日150mgを1日2回に分けて経口投与し、その後1週間以上かけて1日用量として300mgまで漸増。年齢、症状により適宜増減するが、1日最高用量は600mgを超えない。 （線維筋痛症に伴う疼痛）初期用量として1日150mgを1日2回に分けて経口投与し、その後1週間以上かけて1日用量として300mgまで漸増

		した後、300～450mgで維持。年齢、症状により適宜増減するが、1日最高用量は450mgを超えない。
腎機能低下者	血漿中濃度が高くなり副作用が発現しやすくなるおそれがあるため、慎重に投与する。クレアチニンクリアランス値を参考として投与量及び投与間隔を調節する。	本剤は主として未変化体が尿中に排泄されるため、血漿中濃度が高くなり副作用が発現しやすくなるおそれがあるため、患者の状態を十分に観察し、慎重に投与する。腎機能障害患者に本剤を投与する場合は、クレアチニンクリアランス値を参考として投与量及び投与間隔を調節。また、血液透析を受けている患者では、クレアチニンクリアランス値に応じた1日用量に加えて、血液透析を実施した後に本剤の追加投与を行う。複数の用量が設定されている場合には、低用量から開始し、忍容性が確認され、効果不十分な場合に増量すること。各患者ごとに慎重に観察しながら、用法・用量を調節すること。
作用機序	電位依存性カルシウムチャネル $\alpha_2\delta$ -1サブユニットに結合し、カルシウムイオンの流入を抑制。シナプス小胞からの興奮性神経伝達物質の過剰放出を抑制することによりシナプス後膜へ痛覚刺激が伝達されず鎮痛効果を発揮	中枢神経系において電位依存性カルシウムチャネルの機能に対し補助的な役割をなす $\alpha_2\delta$ サブユニットとの結合を介して神経伝達物質遊離を抑制する。また、下行性疼痛調節系のノルアドレナリン経路及びセロトニン経路に対する作用も関与していることが示唆されている
解離半減期		
$\alpha_2\delta$ -1サブユニット	11.1h	1.4h
$\alpha_2\delta$ -2サブユニット	2.4h	1.4h
主な副作用	傾眠、浮動性めまい、意識消失、体重増加、肝機能障害、口渇、顔面浮腫、	浮動性めまい、傾眠、意識消失、浮腫、体重増加、心不全、肺水腫、

	転倒、糖尿病	霧視、複視、視力低下、肝機能障害、低血糖
血中濃度 (単回投与)	C <sub>max</sub> 到達時間：約1時間、 T <sub>1/2</sub> ：2.96～3.37時間	C <sub>max</sub> 到達時間：約1時間、 T <sub>1/2</sub> ：約6時間
<p>参考</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・第一三共株式会社ホームページ <a href="https://www.daiichisankyo.co.jp/">https://www.daiichisankyo.co.jp/</a>, タリージェインタビューフォーム、総合製品情報概要</li> <li>・エーザイ株式会社ホームページ <a href="https://medical.eisai.jp/">https://medical.eisai.jp/</a>, リリカインタビューフォーム</li> </ul>		