

▼リルテック錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】リルゾール riluzole 【分類】筋萎縮性側索硬化症用剤

【単位】▼50mg/錠

【常用量】1回50mg, 1日2回

【用法】分2, 朝・夕食前

【透析患者への投与方法】安全性が確立していないので慎重投与 (1)

【その他の報告】PKの特徴からは減量の必要はないと思われる (5)

【保存期腎不全患者への投与方法】安全性が確立していないので慎重投与 (1) 3

【その他の報告】PKの特徴からは減量の必要はないと思われる (5)

【特徴】作用機序は解明されていないが、グルタミン酸遊離阻害, 興奮性アミノ酸受容体との非競合的な阻害, 電位依存性Na⁺チャネルの阻害等の作用を有しており, これらが単独あるいは複合して神経細胞保護作用を発現するものと考えられる。

【主な副作用・毒性】アナフィラキシー, 好中球減少, 間質性肺炎, 肝機能障害, 黄疸, 味覚障害, 嘔吐, 下痢, 便秘, 食欲不振, めまい, 傾眠, 頭痛, 貧血, 膝炎など

【Ka】5/hr (1)

【F】63.1% (1) 初回通過効果あり (1)

【tmax】1hr (1)

【代謝】肝CYP1A2により代謝され, N-水酸化体になる (1) UGT1A1*28多型は未変化体体内動態に関連しない (van Kan HJ, et al: Biopharm Drug Dispos 29:139-44, 2008) グルクロン酸抱合はプロボフォールにより阻害される (Sanderink GJ, et al: J Pharmacol Exp Ther 282:1465-72, 1997)

【排泄】尿中未変化体排泄率1~2%, グルクロン酸抱合体として20~25% (1) 尿中回収率90.9% [168hrまで] (1)

【CL】5.9mL/min (1) 非喫煙男性51.4L/hrで女性ではそれより32%小さく, 非喫煙者は喫煙者より36%低い (Bruno R, et al: Clin Pharmacol Ther 62:518-26, 1997) 全身CLは投与量, 投与期間, 年齢, 腎機能に関連せず, 性別と喫煙は個体間変動に関連しているが用量を変更するほどの変化ではない (Bruno R, et al: Clin Pharmacol Ther 62: 518-26, 1997)

【t1/2】5~6hr (1)

【蛋白結合率】97% (1)

【Vd】893.5L/man (1)

【MW】234.20

【透析性】除去されないとと思われる (5)

【O/W係数】LogP=3.5 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】相互作用の検証は行われていないが, CYP1A2阻害剤との併用には注意 (1) phase I代謝での相互作用の程度は小さいと思われる (Sanderink GJ, et al: J Pharmacol Exp Ther 282: 1465-72, 1997)

【更新日】20200406

※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。