

## ▼イノベロン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ルフィナミド Rufinamide 【分類】抗てんかん剤

【単位】▼100mg・▼200mg/錠

【常用量】■4歳以上の小児：体重15.0～30.0kgの場合：最初の2日間は200mg/日[分2]，その後は2日ごとに200mg/日ずつ漸増，維持量は1000mg/日，体重30.1kg以上の場合：成人の用法・用量に従う

■成人：最初の2日間は1400mg/日[分2]，その後は2日ごとに400mg/日ずつ漸増，維持量：体重30.1～50.0kgの患者には1800mg/日，体重50.1～70.0kgの患者には2400mg/日，体重70.1kg以上の患者には3200mg/日

【用法】1日2回，食後（他の抗てんかん薬と併用）

【透析患者への投与方法】設定されていないが，減量の必要はないと思われる（5）

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 30mL/min未満の患者でもAUCに変化なし（1）PKは腎機能低下の影響を受けない（Perucca E, et al: Epilepsia 49: 1123-41, 2008）

【特徴】トリアゾール骨格を有し，電位依存性Naチャンネルの不活性化状態からの回復を遅延，Na依存性活動電位の高頻度発火を抑制する作用が推定。部分発作，Lennox-Gastaut症候群への有用性がある。

【主な副作用・毒性】薬剤性過敏症候群，SJS，発疹，食欲減退，嘔吐，便秘，傾眠，浮動性めまい，運動失調，痙攣，攻撃性，嗜眠，疲労，複視，霧視，体重減少など

【安全性に関する情報】連用中の急激な中止を避ける（1）

【吸収】食事によりAUCが44%増大するが半減期は変わらない（Cardot JM, et al: Biopharm Drug Dispos 19: 259-62, 1998）

【F】85%以上（1）高用量で低下（Perucca E, et al: Epilepsia 49: 1123-41, 2008）

【tmax】3～4hr（1）3.4hr（Palhagen S, et al: Epilepsy Res 43: 115-24, 2001）

【代謝】ヒト肝ミクロソーム中でCYP非依存のカルボキシエステラーゼによって主にCGP 47292に代謝され，その後グルクロン酸抱合を受ける（1）代謝物に活性はない（1）

【排泄】尿中未変化体排泄率2% [po, 48hrまで]（1）代謝物として84.7%が尿中に排泄 [po, 168hrまで]（1）P-gpの基質ではない（Chan PS, et al: Epilepsy Res 108: 359-66, 2014）

【t1/2】8.5～10hr（1）7.3hr（Palhagen S, et al: Epilepsy Res 43: 115-24, 2001）6～10hr（Perucca E, et al: Epilepsia 49: 1123-41, 2008）

【蛋白結合率】34%（1）

【Vd】資料なし（1）脳内移行性は血中とのAUCで44% [ラット]（Gall Z, et al: Eur J Pharm Sci 68: 106-13, 2015）

【MW】238.19

【透析性】投与後のHDによりAUCは29%低下（1）資料なし（1）

【O/W係数】LogP=0.65 [1-オクタノール水系]（1）

【薬物動態】食後投与で1600mg/日まで線形動態であるが高用量で吸収率低下（Perucca E, et al: Epilepsia 49: 1123-41, 2008）1200mgまででも非線形性がある（Xu M, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2015 PMID: 26294172）

【相互作用】バルプロ酸によりルフィナミドのカルボキシエステラーゼによる代謝が阻害され血中濃度が上昇する可能性（1）CYP3A4を誘導（1）フェノバルビタール，プリミドン，カルバマゼピン，フェニトインにより本剤の血中濃度が低下する可能性（1）カルバマゼピン，フェニトイン，バルプロ酸の血中濃度には影響しない（Palhagen S, et al: Epilepsy Res 43: 115-24, 2001）酵素誘導能がある他の抗てんかん薬との併用で平均血中濃度が21%低下（May TW, et al: Ther Drug Monit 33: 214-21, 2011）

【小児における報告】小児のPK検討（Dahlin MG, et al: Neuropediatrics 43: 264-70, 2012）

【主な臨床報告】再発性部分発作への効果（Biton V, et al: Epilepsia 52: 234-42, 2011）日本人におけるLennox-Gastaut syndromeへのRCT（Ohtsuka Y, et al: Epilepsy Res 108: 1627-36, 2014）

【更新日】20220224

※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。