

## ▼ディアコミットカプセル [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 スチリペンツール Stiripentol 【分類】 抗てんかん剤 [Dravet 症候群治療薬]

【単位】 ▼250mg/cap

【常用量】 ■1 歳以上：20mg/kg/日から開始，1 週間以上の間隔をあけて 10mg/kg ずつ増量し，50mg/kg/日

■体重 50kg 以上：1000mg/日から開始，1 週間以上の間隔をあけて 500mg ずつ増量する。最大 50mg/kg/日もしくは 2500mg/日のいずれか低い方

30kg 以上の小児に 1 回 25mg/kg，1 日 2 回は過量になりやすい (Peigne S, et al: Clin Pharmacokinet 2018 PMID: 28819726)

【用法】 1 日 2～3 回，食中または食直後■クロバザム及びバルプロ酸ナトリウムと併用する

■乳製品禁止

【透析患者への投与方法】 低用量から開始して慎重に観察して増量 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 低用量から開始して慎重に観察して増量 (1)

【特徴】 Dravet 症候群 (重症乳児ミオクロニーてんかん：SMEI) 患者における間代発作又は強直間代発作に対するクロバザム及びバルプロ酸ナトリウムとの併用療法として使用。GABA 神経系への影響，併用薬 (クロバザム) の効果増強などの作用機序が推測。眠気，食欲低下，体重減少に注意。

【主な副作用・毒性】 好中球減少，血小板減少，気管支炎，肺炎，傾眠，振戦，ふらつき，不眠，行動障害，複視，皮膚障害，消化器症状，排尿障害など

【安全性に関する情報】 特異的な解毒剤や体内除去法は知られていない (1)

【吸収】 カプセル剤ではドライシロップ剤と比較して Cmax が低い (1) 吸収はゼロ次 (1) 胃酸で失活するため食後投与 (1)

【F】 21% [animal model] (1)

【tmax】 2.5～3hr (1)

【代謝】 複素環の開環がメインで，酸化，水酸化，抱合など 5 種の過程で代謝 (1) 代謝に関連する CYP は 1A2，2C19，3A4 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 30% [po] (1)

【CL/F】 1.8L/hr/kg，反復投与により低下 (1) 1.3～1.8L/hr/kg [成人,po] (Levy RH, et al: J Clin Pharmacol 1983 PMID: 6662977)

【t1/2】 8～11hr (1)

【蛋白結合率】 99% [Alb] (1)

【Vd】 1L/kg [iv, animal model] (1)

【MW】 234.29

【透析性】 資料なし (1) 蛋白結合率が高いため，除去されないとされる (5)

【薬物動態】 (+) 体は (-) 体よりも活性が強いが，半減期は短い (Arends RH, et al: Epilepsy Res 1994 PMID:7957040) 非線形動態を示し，反復投与により CL/F が低下する。また小児の年齢により変化する [12 歳以上に比べて低下] ことに加え，相互作用の問題もあるため TDM が有用かもしれない (May TW, et al: Ther Drug Monit 2012 PMID: 22743350)

フェニトイン型非線形動態を示す (Peigne S, et al: Epilepsy Res 2014 PMID: 24725808)

【O/W 係数】 LogP=2.94 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】 14.2

【相互作用】 クロバザム及びバルプロ酸ナトリウムの代謝を阻害する (1)

CYP1A2，2C9，2C19，2D6，3A4 を阻害し，薬物相互作用多数あり (1)

カルバマゼピンの代謝を抑制 (Kerr BM, et al: Epilepsia 1991 PMID:2004631)

CYP2C19，CYP3A4 の強力な阻害剤で，併用クロバザム代謝物への影響が 2C19 遺伝的多型により異なる (Yamamoto Y, et al: Ther Drug Monit 2020 PMID: 31318844)

【主な臨床報告】 Dravet 症候群への補助治療として有用 (Buck ML, et al: Ann Pharmacother 2019 PMID: 31167540)

【備考】 Dravet 症候群の原因の 8 割は，Na<sup>+</sup>チャネル遺伝子 SCN1A 以上で説明される。

【更新日】 20240926

※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。