▼アラバ錠　［内］

【重要度】

【一般製剤名】レフルノミド（U）　Leflunomide（U）　【分類】抗リウマチ剤［DMARD］

【単位】▼10mg・▼20mg・▼100mg/錠

【常用量】

■初期量［負荷量］：1日1回100mgを3日間　［20mg/日からの開始も可］

■維持量20mg/日［適宜10mg/日に減量］

【用法】1日1回　［100mg錠は負荷量として3日間］

【透析患者への投与方法】常用量［慎重投与］（1）

【その他の報告】10～20mg/日で適用した症例があるが，半減期が長く，活性代謝物が透析されないため危険性を伴う（秋山雄次: 日臨免疫会誌 34: 485-491, 2011）

常用量適用可能（Bergner R, et al: Clin Rheumatol 2013 PMID: 23179005）

代謝物を含め透析性は低く，常用量適用可（Beaman JM, et al: Ann Pharmacother 2002 PMID: 11816264）

【PD】10mg/日から開始し維持量20mg/日で治療できた（Russo PA, et al: Ann Pharmacother 47: e15, 2013）

【保存期CKD患者への投与方法】常用量［慎重投与］（1）

【特徴】活性代謝物A771726が，de novoピリミジン生合成に関与する酵素ジヒドロオロテートデヒドロゲナーゼ（DHODH）を阻害し，de novo経路からのピリミジンヌクレオチドの供給に依存している活性化リンパ球の増殖が抑制されるという機序が関与していると考えられている.

【主な副作用・毒性】アナフィラキシー，SJS，TEN，間質性肺炎，肝障害，汎血球減少症，下痢，脱毛症，尿沈渣異常，発疹，高血圧，上気道感染，腹痛，尿蛋白など

【安全性に関する情報】可逆的な末梢神経障害と関連（Bonnel RA, et al: Clin Pharmacol Ther 75: 850-5, 2004）

【モニターすべき項目】肝機能，CBC

【吸収】腸管から吸収され，マウス、ラット、イヌでは吸収率はほぼ100%（1）

【F】活性代謝物として76～95%［マウス，ラット，イヌ］（1）M1として約80%（U）

【tmax】2～3hr（1）M1として6～12hr（U）

【代謝】肝臓及び消化管壁による初回通過効果を受けて活性代謝物テリフルノミドA771726（M1）に変換され，M1はさらに肝臓で代謝（1）投与量の約84%がA771726に代謝される（1）薬効のほとんどは活性代謝物A771726［M1］によってもたらされる（U）

【排泄】尿中に未変化体は検出されない（1）尿中回収率42.8%［po，28日まで］（1）活性体は主に胆汁中に排泄され，腸肝循環を受ける（1）過量投与時にコレスチラミン，活性炭は解毒剤になる（1）

【CL/F】0.5mL/min［活性体］（1）

【t1/2】14.9～16.3日（1）M1として2週間（U）【透析患者のt1/2】HD：4.45±1.53日，PD：8.7±1.82日（1）

【蛋白結合率】99.38%，アルブミンと結合［活性体］（1）99%以上（U）

【Vd】14L/man［活性体］（1）

【MW】270.21

【透析性】ほとんど透析されないと思われる（5）透析CLは1～4mL/min程度で未変化体・活性代謝物ともにほとんど除去されない（Bergner R, et al: Clin Rheumatol 2013 PMID: 23179005）

【O/W係数】3.49［1-オクタノール/水系］（1）

【相互作用】活性代謝物M1はCYP2C9を阻害するがIC50は生体内濃度に比べ高い（1）リファンピシン併用で活性体のCmax，AUC上昇（1）MAO阻害活性を有している可能性（Petzer JP, et al: Cent Nerv Syst Agents Med Chem 2016 PMID: 26299850）

【主な臨床報告】IgA腎症治療にステロイド量を減らして併用すると高用量ステロイド単独よりも寛解成績が良好（Li Y, et al: BMC Nephrol 2021 PMID: 34736419）

【備考】効果は投与開始後2週間～3か月で発現するので少なくとも3か月間継続投与し効果をみることが望ましい（1）　投与に際しては結核感染の有無を確認する.

【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。