▼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 1 400mg/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 2008 PMID: 18503564）

【特徴】トリアゾール骨格を有し，電位依存性 Na チャ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 2014 PMID: 24530088）

【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 2008 PMID: 18503564）

【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 までででも非線形性がある（Xu M, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2015 PMID: 26294172）

【TDM のポイント】併用する抗てんかん薬の影響で血中濃度が変化する可能性があり，治療域上限 20mg/L 程度（Yamamoto Y, et al: Ther Drug Monit 2022 PMID: 35213526）

【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）バルプロ酸併用で CL/F 低下して血中濃度上昇（Arzimanoglou A, et al: Eur J Paediatr Neurol 2016 PMID: 26805435）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】20231129

※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。