※2019年6月改訂 法:冷所保存

使用期限:外箱に記載の期限内に使用すること。

催眠・鎮静・抗けいれん剤

ルピアール坐割 25

871125 ルピアール ルピアール ルピアール 坐剤25 坐剤50 坐剤100 承認番号 15500AMZ00211000 15500AMZ00199000 15500AMZ00422000 薬価収載 1980年12月 販売開始 1981年1月

日本標準商品分類番号

**** ***

劇薬

向精神薬

注1)注意—習慣性あり 注2)注意—医師等の処方箋により使用すること

LUPIAL SUPPOSITORIES (フェノバルビタールナトリウム坐剤)

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

習慣性医薬品注1) 処方箋医薬品^{注2)}

- 1.本剤の成分又はバルビツール酸系化合物に対して過 敏症の患者
- 2.急性間欠性ポルフィリン症の患者 [ポルフィリン合 成が増加し、症状が悪化するおそれがある。]
- 3.ボリコナゾール、タダラフィル(肺高血圧症を適応 とする場合)、アスナプレビル、ダクラタスビル、 マシテンタン、エルバスビル、グラゾプレビル、チ カグレロル、アルテメテル・ルメファントリン、ダ クラタスビル・アスナプレビル・ベクラブビル、ダ ルナビル・コビシスタット<u>、ドラビリン</u>、リルピビ リン、リルピビリン・テノホビル ジソプロキシル・ エムトリシタビン、リルピビリン・テノホビル ア ラフェナミド・エムトリシタビン、ビクテグラビ ル・エムトリシタビン・テノホビル アラフェナミ ド、エルビテグラビル・コビシスタット・エムトリ シタビン・テノホビル アラフェナミド、エルビテ グラビル・コビシスタット・エムトリシタビン・テ ノホビル ジソプロキシル、ソホスブビル・ベルパ タスビル、ドルテグラビル・リルピビリンを投与中 の患者(「相互作用」の項参照)
- 4.妊婦(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

【組成・性状】

- ・ルピアール坐剤25は、1個中にフェノバルビタール ナトリウム25mgを含有する。
- ・ルピアール坐剤50は、1個中にフェノバルビタール ナトリウム50mgを含有する。
- ・ルピアール坐剤100は、1個中にフェノバルビタール ナトリウム100mg を含有する。

剤形・性状 白色紡錘形の坐剤で、溶融点は34~36℃を示す。 加物 ハードファット

【効能・効果】

小児に対して経口投与が困難な場合の次の目的に用いる。 ○催 眠

- ○不安・緊張状態の鎮静
- ○熱性けいれんおよびてんかんのけいれん発作の改善

【用法・用量】

フェノバルビタールナトリウムとして通常小児では 1日4~7mg/kgを標準として直腸内に挿入する。 なお、症状・目的に応じ適宜増減する。

【使用上の注意】

- 1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
- (1)新生児、低出生体重児

[生後5日までの新生児では、直腸よりの吸収が極 めて微量のことがある。しかし、吸収されたときは 半減期が極めて長い。]

- (2)高齢者 [呼吸抑制、興奮、抑うつ、錯乱等があらわ れやすい。]
- (3)虚弱者、呼吸機能の低下している患者 [呼吸抑制を起こすことがある。]
- (4)頭部外傷後遺症又は進行した動脈硬化症の患者 [本剤の作用が強くあらわれることがある。]
- (5)心障害のある患者

[血圧低下や心拍数減少を起こすおそれがある。]

(6)肝障害、腎障害のある患者

[これらの症状の悪化、また血中濃度上昇のおそれ がある。]

- (7)薬物過敏症の患者
- (8)アルコール中毒のある患者 [中枢抑制作用が増強される。]
- (9)薬物依存の傾向又は既往歴のある患者 [精神依存及び身体依存を示すことがある。]
- (10)重篤な神経症の患者

[依存を示すおそれがある。]

(11)甲状腺機能低下症の患者

[甲状腺機能の異常をきたすおそれがある。] 1)

2.重要な基本的注意

- (1)連用中における投与量の急激な減少ないし投与の中 止により、てんかん重積状態があらわれることがあ るので、投与を中止する場合には、徐々に減量する など慎重に行うこと。なお、高齢者、虚弱者の場合 は特に注意すること。
- (2)連用中は定期的に肝・腎機能、血液検査を行うこと が望ましい。
- (3)連用により薬物依存を生じることがあるので、てん かんの治療に用いる場合以外は、漫然とした継続投 与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続 する場合には、治療上の必要性を十分に検討するこ と (「重大な副作用」の項参照)。
- (4)眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起 こることがあるので、本剤投与中の患者の行動には 十分注意すること。

3.相互作用

本剤は薬物代謝酵素CYP3A等の誘導作用を有する。

※※(1)併用禁忌(併用しないこと)

*

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ボリコナゾール	これらの薬剤の代謝が促進	本剤の肝薬物代謝
(ブイフェンド)	され、血中濃度が低下する	酵素 (CYP3A)
タダラフィル	おそれがある。	誘導作用による。
(肺高血圧症を適応		
とする場合:アドシ		
ルカ)		
アスナプレビル		
(スンベプラ)		
ダクラタスビル		
(ダクルインザ)		
マシテンタン		
(オプスミット)		
エルバスビル		
(エレルサ)		
グラゾプレビル		
(グラジナ)		
チカグレロル		
(ブリリンタ)		
アルテメテル・ルメ		
ファントリン		
(リアメット配合錠)		
ダクラタスビル・アス		
ナプレビル・ベクラブ		
ビル		
(ジメンシー配合錠)		
ダルナビル・コビシス		
タット		
(プレジコビックス		
配合錠)		
ドラビリン		
(ピフェルトロ)		

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リルピビリン (エジュラント) リルピビリン・テノホ ビル ジソプロキシル・ エムトリシタビン (コムプレラ配合錠)	リルピビリンの代謝が促進 され、血中濃度が低下する おそれがある。	本剤の肝薬物代謝 酵素(CYP3A) 誘導作用による。
リルピビリン・テノホ ビル アラフェナミド・ エムトリシタビン (オデフシィ配合錠) ビクテグラビル・エム	リルピビリン及びテノホビル アラフェナミドの血中 濃度が低下するおそれがある。 ビクテグラビル及びテノホ ビル アラフェナミドの血 中濃度が低下するおそれが ある。	本剤の肝薬物代 謝酵素 (CYP3A) 誘導作用及びP糖 蛋白誘導作用によ る。
エルビテグラビル・コ ビシスタット・エムト リシタビン・テノホビ ル アラフェナミド (ゲンボイヤ配合錠)	エルビテグラビル、コビシスタット及びテノホビル アラフェナミドの血中濃度 が低下するおそれがある。	
エルビテグラビル・コ ビシスタット・エムト リシタビン・テノホビ ル ジソプロキシル (スタリビルド配合 錠)	エルビテグラビル及びコビ シスタットの血中濃度が低 下するおそれがある。	
ソホスブビル・ベルパ タスビル (エプクルーサ配合 錠)	ソホスブビル及びベルパタ スビルの血中濃度が低下す るおそれがある。	
ドルテグラビル・リル ピビリン (ジャルカ配合錠)	ドルテグラビル及びリルピ ビリンの血中濃度が低下す るおそれがある。	本剤の肝薬物代 謝酵素 (CYP3A) 誘 導作 用 及 び UGT1A1誘導作用 による。

※(2)併用注意(併用に注意すること)

※(2)併用注意(併用に注意すること)					
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子			
中枢神経抑制剤	相互に作用が増強されるこ	相加的中枢神経抑			
フェノチアジン誘導体	とがあるので、減量するな	制作用による。			
バルビツール酸誘導体	ど注意すること。				
トランキライザー トピラマート等					
抗ヒスタミン剤					
ジフェンヒドラミン等					
アルコール					
MAO阻害剤		機序不明。			
三環系抗うつ剤	(1)相互に作用が増強される	(1)相加的中枢神経			
イミプラミン等	ことがあるので、減量す	抑制作用による。			
四環系抗うつ剤	るなど注意すること。	(2)本剤の肝薬物代			
マプロチリン等	(2)これらの抗うつ剤の血中 濃度が低下することがあ	謝酵素誘導作用			
	「 仮及が以下りることがめ る。 ^{注)}	による。			
メチルフェニデート	本剤の血中濃度が上昇する	メチルフェニデー			
, , . , _ , ,	ことがあるので、本剤を減	トが肝代謝を抑制			
	量するなど注意すること。	すると考えられて			
		いる。			
バルプロ酸	(1)本剤の血中濃度が上昇	(1)これらの薬剤が			
スチリペントール	し、作用が増強されるこ	肝代謝を抑制す			
	とがある。 (2)これらの薬剤の血中濃度	る。 (2)本剤の肝薬物代			
	(2)これらの架角の皿中辰及 が低下することがある。 ^{注)}	謝酵素誘導作用			
	, MET 3.000 May 10.00	による。			
クロバザム	(1)本剤の血中濃度が上昇す	(1)機序不明。			
	ることがある。	(2)本剤の肝薬物代			
	(2)クロバザムの血中濃度が	謝酵素誘導作用			
	低下することがある。注	による。			
イリノテカン	イリノテカンの活性代謝物の	本剤の肝薬物代謝			
	血中濃度が低下し、作用が 減弱することがあるので、併	酵素誘導作用によ			
		(3∘			
主に、CYP3Aの基質	これらの薬剤の血中濃度が				
となる薬剤	低下し、作用が減弱するこ				
アゼルニジピン	とがあるので、用量に注意				
イグラチモド	すること。 ^{注)}				
イマチニブ					
カルバマゼピン					
シクロスポリン ゾニサミド					
タクロリムス					
フェロジピン					
ベラパミル					
モンテルカスト等					
副腎皮質ホルモン剤					
デキサメタゾン等					

#脱ホルモン剤	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エチニルエストラ アセトー等 PDES阻害剤	体ホルモン剤	低下し、作用が減弱するこ	本剤の肝薬物代謝 酵素誘導作用によ
タダラフィル (勃	エチニルエストラ ジオール等	すること。注	<i>`</i> ∂∘
告まを適応とする場	タダラフィル (勃 起不全、前立腺肥		
マルデナフィル アミノフィリン水和物 クロラスフェニコール デオフィリン バロキセチシ フレカイニド ラモトリギン ルフィナミド アビキサバン エボジル レンパスピル・ソホス ブビル レンパスピル・ソカス グレカブレビル・ピブレンタスピル アリン系抗凝血剤 ワルファリン おる。 アセタゾランド アルベンダゾール 関東・減別が短縮することがある。 フマリン系抗凝血剤の作用 が減過解することがある。 クマリン系抗凝血剤 ワルファリン 「ドキシサイクリンの血中濃 度半減別が短縮することがある。を考えらいで、時間の抗凝血剤の作用 が減過解することがある。 アルベンダゾール 対しカボルル カース・カース・カース・カース・カース・カース・カース・カース・カース・カース・	害を適応とする場		
クロラムフェニコール テオフィリン フレカイニド ラモトリギン アフェラシロクス カナグリフロジン ルフィナミド アピキサバン これらの薬剤の血中濃度が 低下することがある。由 機序不明。 本和のアルルのインルので 機序不明。 本和の野薬作用及が 中糖蛋白。 本利がこれらの薬養 機序不明。 本和のアルルのインルので 機序不明。 本和の野薬作用及が 中糖蛋白。 ソホスブビル レジパスピル・ソホス ブレカプレビル・ピブレンタスピル アフノネだル レンタスピル アフノネだが カラスにピル フリン系抗凝血剤 ワルファリン ドキシサイクリンの血中濃 度半減期が短縮することが ある。 本利の所業等用による。 クマリン系抗凝血剤 ワルファリン アルベンダゾールの活性性、 満場でに血液凝固時間の測定者の受害 すること。 株房不明。 高・ をが高い低下し、 効果が減弱することがある。 をが高に用ビタトっ カーに子がある。 など注意することがある。 など注意することがある。 など注意することがある。 など注意することがある。 など注意することがある。 など注意すること。 機序不明。 高・ が、高用ビタトーさる。 カーに子がある。 大が、高用ビタトーさもことがある。 を利ののてははを作る。 本和による活性とのよる性をであって、 本和のので、はによる活性とのよる性をである。 と対しなよる活性とのよるに、 を持つシーで、シーンの、ではは、アセトトアトアシー・ イミをもの、アンドのといと、 カーに、 を持つシーで、シークによるに、 カーに、 を持つシーで、シークに表すいと、 カーに、 を持つシーで、 カーに、 カーに、 を持つシーで、 カーに、 カーに、 カーに、 カーに、 カーに、 カーに、 カーに、 カーに	シルデナフィル		
パロキセチンフレカイニド ラモトリギンデフェラシロクスカナグリフロジンルフィナミド アビキサバン 低下することがある。 機序不明。本剤のグルカ海等による。 機序不明。本剤の別離蛋白語。 本剤の別離蛋白語。 本剤の別離の中臓の形薬物による。 本剤の別糖蛋白語。 本剤の別糖蛋白語。 本剤の別糖蛋白語。 本剤の別糖蛋白語。 本剤の別糖蛋白語。 本剤の別糖蛋白語。 本剤の肝薬物代謝 ではよる。 本剤の肝薬物代謝 ではまる。 本剤の肝薬物代謝 ではまる。 では、	クロラムフェニコール		
 デフ・ローススカナグリフロジンルフィナミドアビキサバン サススプビルショススプビル・ソホスプビルフタスピル・フリンスにカアノボビルアラフェナミドドキシサイクリン 医半減期が短縮することがある。クマリン系抗凝血剤の作用の調査を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調音は関値を行い、の調度を対し、を対して、対して、対して、対して、対して、対して、対して、対して、対して、対して、	パロキセチン フレカイニド		
アビキサバン 本剤の肝薬物代謝で用及び ・ 本剤の肝薬物代別で ・ はよる。 マホスブビル グレカプレビル・ピブレンタスピル テノホビル アラフェナミド ドキシサイクリン 本剤のP糖蛋白誘 導作用による。 クマリン系抗凝血剤 ワルファリン ケマリン系抗凝血剤の作用が減弱することがある液凝固時間の測定を行い リン系抗凝血剤の量を調整すること。 本剤の肝薬物代謝 酵素誘導作用による。 アルベンダゾール アルベンダゾールの活性代謝物の血中濃度が低下し、効果が減弱することがある液凝固時間の測定を行い力と対象が減弱することがある。をと対意ることがあるので、通常ととがある。とが高ることがあるととがある。と対性低血圧が増強されることがある。と対性低血圧が増強されることがある。ことがあることとの表のことがある。と対性化チブラミド 機序に、不明であるフェノバルビタールさせることがある。と対性化が高のフェレーを低い、大がよる。と対性化チブラミドのスはに不活性セタリスに下活性と外尿解析の大力に不活性セタリスは、下でよるに不活性セタリスは、下でよりに不満によりまとられていいると考えられていいが考えので、対力を対して、よる所で、対力に下があるが考別を作用に、よる所書等で、シス・ド語書等性に、よる所で、対力を持定がして、対力に下落中に、フェンかのと対していい、オール・データーへ、プイ・計画を持ていい、オール・データーへ、プイ・に対していい、オール・データーへ、プイ・に対していい、オール・データーへ、対力に下落中に、フェンかの代書を表しれていい、オール・データーへ、対力に下薬物代で、カード・データーへ、対力に下薬物代で、オール・データー、オール・データー、対力に下すると対していい、オール・データー、アーベン・アース・データー、アーベン・アーベン・アーベン・アーベン・アーベン・アーベン・アーベン・アーベン・	デフェラシロクス		剤のグルクロン酸
P糖蛋白活溶液に			
レジパスビル・ソホス ブピル グレカプレビル・ピブ レンタスピル テノホビル アラフェ ナミド ドキシサイクリンの血中濃 度半減期が短縮することが ある。 本剤の肝薬物代謝 酵素誘導作用による。 クマリン系抗凝血剤 ワルファリン ・流离まり頻回に血クマリン系抗凝血剤の量を行し、効果が減弱することがある。 アルベンダゾール クマリン系抗凝血剤の作用が減速を作下し、効果が減弱することがある。 とがあることがある。とがある。 をと注意すること。 機序は不明であフェノバルを低下のフェレーを低下のフェレーを低下を断力ので、減量するなど注意すること。 アセタゾラミド くる病、骨軟化症があらわれやすい。 本剤に足を修名、 を必ずとである。 アセタゾラミド くる病、骨軟化症があらわれをすい。 本剤による。 アセタゾラミド 本剤の長期連用者は、アセトトアミノフェン 本剤の肝薬物代はと発促進、シンDの不は性を発促進、シンDの不は性を発促進、シンDの不は性を発促進、シンDの不は性を発促進、シーンのではよる腎臓・シンのではよる腎臓・シンのではよる腎臓・シンのではよる腎臓・シンのでは、シンのでは、本剤の肝薬作用アミノフェンのが、本剤の肝薬体化アント・ショーンズ・クロ・より誘発性を持ている。 アセトアミノフェン 本剤の代謝が促進され血中、表のと考えられている。 本剤が低によった。 本剤の肝薬物代はマンクによう誘きの計算作用による。 アルベンタゾラミドのよるにはよりまでは、カースのでは、本剤は、アセンシンが、では、対験が、では、シンのでは、本剤は、ウェンので、大きさいる。 を摂取しないよう注意すること。 セソウにより誘きでいる。 ・ボール・カート・ギリシウ含有食品素が本剤の代謝すると表し、クリフをよりまでは、カースをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリスを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリフをよりまでは、カースを表し、クリスを表し、人は、クリスを表し、クリスを表し、のは、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し、クリスを表し	7 24 97.0		酵素誘導作用及び P糖蛋白誘導作用
レンタスビル テノホビル アラフェ ナミド 本剤の肝薬物代謝 慶半減期が短縮することが ある。 本剤の肝薬物代謝 酸素誘導作用による。 クマリン系抗凝血剤 ワルファリン クマリン系抗凝血剤の作用 が減弱することがあるので、減量常とした。 機序不明。 アルベンダゾール アルベンダゾールの活性代 謝物の血中濃度が低下し、効果が減弱することがある。 機序は不明であるエールで、高用量のアルは 企とがあるので、減量する。 チアジド系降圧利尿剤等 と立性低血圧が増減量する。 など注意すること。 機序は不明であるエールのアルはもことがある。 アセタゾラミド くる病、骨軟化症があらわれやすい。 大アシドス等が高によるビタラにアンス等によるビタラにアンス等によるビタラにアンス等によるに対するよるに対するよるに対するよるに対するよるに対するよるに対するよるに対するよるに対するように対	レジパスビル・ソホス		
ドキシサイクリン 度半減期が短縮することがある。 本剤の肝薬物代謝 酵素誘導作用による。 クマリン系抗凝血剤 ワルファリン 流通常より類回に血液凝固時間の測定を行い、クマリン系抗凝血剤の量を調整すること。 機p下明。 アルベンダゾール 利尿剤 チ等 アルベンダゾールの活性代謝物の血中濃度が低下し、効果が減弱することがある。と立がある。とがあるので、減量するなど注意すること。 機pは不明であるイバーのフェは血圧を低ある。ととがあることがある。ととがあることがある。ととがあることがある。ととがあることがある。とがまること。 アセタブラミド くる病、骨軟化症があらわれやすい。 本剤によるビタミンDの不活性性変によると呼びによると考えられている。 アセトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェンの代謝物によるド等が考えられている。 る。 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェンの所所薬物代謝より、アセトアモチルンイミンへの代謝を表別等作用による。 アセトアミノフェン 本剤の代謝が促進され血中、よる肝薬物によると考えられているオールのよると考えられているオールの・スを生じやすくな。のの、本剤投与時はセイラール・ジョーンズ・フート・ジョーンズ・フート・ジョーンズ・フート・ジョーンズ・フート・ジョーンズ・フート・デリソウ含有食品を摂取しないよう注意すること。 セイヨウオトギリソウ含有食品を摂取しないよう注意するためと考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると考えられているように表別では、アナランスを考えられているよりにより、表別では、アナランスを考えられていると考えられていると考えられているように表別では、アナランスを考えられていると考えられていると考えられていると考えられているように表別では、アナランスを考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると考えられているように表別では、アナランスを考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると考えを表別では、アナランスを考えられていると考えられていると考えられていると考えられていると表別では、アナランスを考えられていると考えられていると表別では、アナランスを考えられていると表別では、アナランスを考えられていると表別では、アナランスを表別では、アナラン	レンタスビル		
クマリン系抗凝血剤の作用が減弱することがあるので、通常より類回に血液凝固時間の測定を行い、クマリン系抗凝血剤の量を調整すること。 アルベンダゾール アルベンダゾール アルベンダゾールの活性代謝物の血中濃度が低下し、効果が減弱することがある。 科尿剤 チアジド系降圧利尿剤 さとがあるので、減量するなど注意すること。 アセタブラミド くる病、骨軟化症があらわれやすい。 など注意すること。 アセタブラミド くる病、骨軟化症があらわれた肝薬物代よるによるによるによりによる、アンスにないる。 アセトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアシースの代謝がによる。 ・本剤の肝薬物代より、アセトアミノアェン 本剤の長期連用者は、アセトアシースの代謝がによる。 ・本剤の肝薬物代より、アセトア・シースを持つN・アセチルンイミンへのるときれている。 ・セイヨウオトギリソウ(St. John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート)含有食品 本剤の代謝が促進され血中、濃度が低下するおそれがあるので、本剤投与時はセイヨウオトギリソウ含有食品を扱取しないよう注意するにより、た肝薬物代謝酸を促進し、アルン・ルた肝薬物代謝を見ないよう注意すること。 セイヨウオトギリンウ含有食品を摂取しないよう注意すること。 などきえられていると考えられて		度半減期が短縮することが	酵素誘導作用によ
すること。		クマリン系抗凝血剤の作用 が減弱することがあるの で、通常より頻回に血液凝 固時間の測定を行い、クマ	ప ం
謝物の血中濃度が低下し、 効果が減弱することがある。 利尿剤 チアジド系降圧利尿剤 等 起立性低血圧が増強される ことがあるので、減量する など注意すること。 アセタゾラミド くる病、骨軟化症があらわ れやすい。 マカの長期連用者は、アセトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェンの代謝物による肝障害を生じやすくなる。 セイヨウオトギリソウ(St. John's Wort, セント・ジョーンズ・ワート)含有食品 を摂取しないよう注意する こと。 「関係など、クランスを入れて、カー・ギリソウ含有食品を摂取しないよう注意すること。 「関係など、クランスを入れて、大きので、本剤投与時はセイカー・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・		すること。	
等	アルベンダゾール	謝物の血中濃度が低下し、	機序不明。
アセタゾラミド くる病、骨軟化症があらわれやすい。 本剤によるビタミンDの不活性化促進、又はアセタゾラミドによる腎尿細管障害、代書等による腎尿性アシドーシスかられている。 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェンの代謝物による肝障害を生じやすくなる。 本剤の肝薬物代より、アセトアミノ なる。 本剤の肝薬物代より、アセトアミノスンの代謝物による肝障害を生じやすくなる。 本剤の肝薬物代財産を持つルアセチルフェンから肝毒性を持つルアセチルフィミンへの代謝が促進され血中に、よる肝臓では、大きに、大きに、大きに、大きに、大きに、大きに、大きに、大きに、大きに、大きに	チアジド系降圧利尿剤	ことがあるので、減量する	が、高用量のフェ
れやすい。			ことがある。
アセトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェンの代謝物による肝障害を生じやすくなる。 本剤の肝薬物代謝 酵素 デセトアミノフェンの代謝物による肝障害を生じやすくなったの形薬が足進されのとと考えられている。 本剤の代謝が促進され血中(St. John's Wort, セント・ジョーンズ・ワート)含有食品を摂取しないよう注意すること。 ながように変し、クリアランスを上昇されて	アセタゾラミド		ンDの不活性化促 進、又はアセタゾ
下セトアミノフェン 本剤の長期連用者は、アセトアミノフェンの代謝物による肝障害を生じやすくなる。			細管障害、代謝性 アシドーシス等が
よる肝障害を生じやすくな る。 はる肝障害を生じやすくな る。 り、アセトアミノフェンから肝毒性 を持つN-アセチル カーベンゾキノン イミンへの代謝が促進され血中 (St. John's Wort, セン ト・ジョーンズ・ワー ト)含有食品 本剤の代謝が促進され血中 濃度が低下するおそれがあ るので、本剤投与時はセイ ヨウオトギリソウ含有食品 を摂取しないよう注意する こと。 なと考えられて	アセトアミノフェン		本剤の肝薬物代謝
セイヨウオトギリソウ		よる肝障害を生じやすくな	り、アセトアミノ フェンから肝毒性
セイヨウオトギリソウ (St. John's Wort, セント・ジョーンズ・ワート) 含有食品 本剤の代謝が促進され血中 没度が低下するおそれがあるので、本剤投与時はセイヨウオトギリソウ含有食品を摂取しないよう注意する に進し、クリアランスを上昇させるためと考えられて			-p-ベンゾキノン イミンへの代謝が 促進されると考え
ト)含有食品 ヨウオトギリソウ含有食品 素が本剤の代謝を を摂取しないよう注意する 促進し、クリアラ こと。	(St. John's Wort, セン	濃度が低下するおそれがあ	ソウにより誘導さ
ためと考えられて		ヨウオトギリソウ含有食品 を摂取しないよう注意する	素が本剤の代謝を 促進し、クリアラ
注) 本剤を減量又は中止する場合には、これらの薬剤の血中濃度の上昇	\(\(\frac{1}{2}\) \(\frac{1}{2}\) \(\frac{1}{2		ためと考えられて いる。

注)本剤を減量又は中止する場合には、これらの薬剤の血中濃度の上昇 に注意すること。

4.副作用

2120例中副作用が報告されたのは3例(0.14%)で、その症状は、過敏症(発疹)、精神神経系症状(ねむけ、脱力感)、消化器症状(食欲不振)であった。 (承認時及び承認時以降の副作用調査時)



(1)重大な副作用

- 1)中毒性表皮壞死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis:TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群)、紅皮症(剥脱性皮膚炎)(頻度不明): 観察を十分に行い、発熱、紅斑、水疱・びらん、 瘙痒感、咽頭痛、眼充血、口内炎等の異常が認め られた場合には、投与を中止し、副腎皮質ホルモ ン剤の投与等の適切な処置を行うこと。2)
- 2) 過敏症症候群 (頻度不明): 初期症状として発疹、 発熱がみられ、さらにリンパ節腫脹、肝機能障害 等の臓器障害、白血球増加、好酸球増多、異型リ ンパ球出現等を伴う遅発性の重篤な過敏症状があ らわれることがあるので、観察を十分に行い、こ のような症状があらわれた場合には、投与を中止 し、適切な処置を行うこと。なお、ヒトヘルペス ウイルス6 (HHV-6) 等のウイルスの再活性化を 伴うことが多く、発疹、発熱、肝機能障害等の症 状が再燃あるいは遷延化することがあるので注意 すること。
- 3)依存性(頻度不明):連用により薬物依存を生じ ることがあるので、観察を十分に行い、用量及び 使用期間に注意し慎重に投与すること。また、連 用中における投与量の急激な減少ないし投与の中 止により、不安、不眠、けいれん、悪心、幻覚、 妄想、興奮、錯乱又は抑うつ状態等の離脱症状が あらわれることがあるので、投与を中止する場合 には、徐々に減量するなど慎重に行うこと。
- 4) 顆粒球減少、血小板減少 (頻度不明): 観察を十 分に行い、異常が認められた場合には、投与を中 止し、適切な処置を行うこと。
- 5) 肝機能障害 (頻度不明): AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ-GTPの上昇等を伴う肝機能障害があらわれるこ とがあるので、観察を十分に行い、異常が認めら れた場合には、投与を中止するなど適切な処置を 行うこと。
- 6)呼吸抑制 (頻度不明): 観察を十分に行い、異常 が認められた場合には、投与を中止するなど適切 な処置を行うこと。

(2)その他の副作用

種類	0.1%未満	頻度不明		
過敏症 ^{注1)}	猩紅熱様発疹	麻疹様発疹、中毒疹様発疹		
血液注2)		血小板減少、巨赤芽球性貧血		
肝臓注3)		AST (GOT) · ALT (GPT) ·		
		γ-GTPの上昇等の肝機能障		
		害、黄疸		
腎臓注4)		蛋白尿等の腎障害		
精神神経系3)4)	眠気、脱力感	アステリキシス (asterixis)、		
		眩暈、頭痛、ふらつき、せ		
		ん妄、昏迷、鈍重、構音障害、		
		知覚異常、運動失調、精神		
		機能低下、興奮、多動		
消化器	食欲不振	下痢		
骨・歯		くる病注5)、骨軟化症注5)、歯		
		牙の形成不全注5) 、低カルシ		
		ウム <u>血症^{注2)}</u>		
内分泌系1)		甲状腺機能検査値(血清 T4		
		値等)の異常		
その他		血清葉酸値の低下、ヘマト		
		ポルフィリン尿注4) 、発熱		

- 注1) 投与を中止すること。 注2) 投与を中止するなど適切な処置を行うこと
- 注3) 観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するな ど適切な処置を行うこと。 注4) 連用によりあらわれることがある。 注5) 連用によりあらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常(血
- 清アルカリフォスファターゼ値の上昇、血清カルシウム・無機リン の低下等)があらわれた場合には、減量又はビタミンDの投与等適 切な処置を行うこと。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

本剤は小児用の製剤である。

- (1)妊娠中に本剤を単独、又は併用投与された患者の中に、 奇形を有する児(口唇裂、口蓋裂、心奇形、大動脈縮 窄症等)を出産した例が多いとの疫学的調査報告がある。
- (2)妊娠中の投与により、新生児に出血傾向、呼吸抑制等 を起こすことがある。
- (3)分娩前に連用した場合、出産後新生児に離脱症状 (多 動、振せん、反射亢進、過緊張等)があらわれること
- (4)妊娠中の投与により、葉酸低下が生じるとの報告があ る。
- (5)授乳婦への投与は避けることが望ましいが、やむを得 ず投与する場合には、授乳を避けさせること [ヒト母 乳中へ移行し、新生児、乳児に傾眠、哺乳量低下を起 こすことがある。]

6. 過量投与

- (1)症状:中枢神経系及び心血管系抑制。血中濃度40~45 μg/mL以上で眠気、眼振、運動失調が起こり、重症 の中毒では昏睡状態となる。呼吸は早期より抑制され、 脈拍は弱く、皮膚には冷汗があり、体温は下降する。 肺の合併症や腎障害の危険性もある。
- (2)処置:呼吸管理。また、炭酸水素ナトリウム投与によ る尿アルカリ化、利尿剤投与により薬物の排泄を促進 させる。重症の場合は、血液透析や血液灌流を考慮す ること。

7.適用上の注意

投与経路

本剤は直腸内投与のみに使用し、経口投与はしないこと。

8. その他の注意

- (1)ラット及びマウスに長期間大量投与 (ラット:25mg/ kg、マウス:75mg/kg) したところ、対照群に比較 して肝腫瘍の発生が有意に増加したとの報告がある。
- (2)血清免疫グロブリン (IgA、IgG等) の異常があらわ れることがある。⁶⁾
- (3)本剤と他の抗てんかん薬 (フェニトイン、カルバマゼ ピン)との間に交差過敏症(過敏症症候群を含む皮膚 過敏症)を起こしたとの報告がある。

【臨床成績】

一般臨床試験として11施設354例、二重盲検試験として ①理学検査施行時の鎮静・催眠11施設40例、②不安・緊 張時の鎮静・催眠6施設32例の総計426例について臨床 試験を実施し、本剤の有用性が認められている。7080 使用目的別の有効率は、催眠・鎮静75.7% (209/276)、 抗けいれん83.3%(65/78)であった。

【薬効薬理】

フェノバルビタールナトリウムは、バルビツール酸誘導 体の長時間作用型催眠・抗てんかん薬で、ことに抗けい れん作用はバルビツール酸誘導体中、とくに強力である。

- 1)マウス又はラットを用い、フェノバルビタールナトリ ウム350mg/kgを直腸投与し、一般症状を観察したと ころ、10数分以内に運動量の減少、眼瞼下垂、歩行失 調および正向反射の消失がみられ、これら中枢抑制症 状の発現は経口投与の場合より速やかであった。⁹⁾
- 2)マウス又はラットにフェノバルビタールナトリウムを 直腸内前投与することにより、各種の実験的けいれん 発現(電気ショック、ペンテトラゾール、ストリキニ・ ネ) に対する抑制効果が認められ、この抗けいれん効 果は経口投与の場合よりまさっていた。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名:フェノバルビタールナトリウム

(Phenobarbital sodium)

化学名: Sodium 5-ethyl-5-phenyl-2,4,6 (1H,3H,5H) -pyrimidine trione

分子式:C₁₂H₁₁N₂NaO₃(分子量:254.22)

状:白色の結晶又は結晶性の粉末、においはなく、 味は苦い。吸湿性があり、湿った空気中に放





置すると徐々に分解する。 水に極めて溶けやすく、エタノール(95)にや や溶けやすく、ジエチルエーテル、クロロホ ルムにほとんど溶けない。

【包 装】

ルピアール坐剤25 25mg 100個 ルピアール坐剤50 100個 50mg ルピアール坐剤100 100mg 100個

【主要文献】

1)有田忠司他:精神医学27(11)1297(1985) 2)松本鐐-他:皮膚臨床12(11)973(1970)

3) 竹下久由他:精神医学26(12)1299(1984) 4) 金山隆生他:精神神経学雑誌83(7)448(1981)

5) Delgado-Escueta, A. V., et al.: Neurology **42**(Suppl.5) 149 (1992)

7) 有泉基水他: 小児科診療42(10)1367(1979) 8) 武部幸侃他: 小児科臨床**33**(3)589(1980) 9) 辻本明他: 薬理と治療6(8) 2415(1978)

【文献請求先】

久光製薬株式会社 学術部 お客様相談室 〒100-6330 東京都千代田区丸の内二丁目4番1号 フリーダイヤル 0120-381332

FAX. (03) 5293-1723

受付時間/9:00-17:50 (土日・祝日・会社休日を除く) 本剤は厚生労働省告示第107号(平成18年3月6日付)に もとづき、投薬量は1回14日分を限度とされています。