

## ▼レキササルティ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ブレクスピプラゾール Brexpiprazole 【分類】抗精神病薬 [SDAM]

【単位】▼1mg・▼2mg/錠

【常用量】

■開始量 1mg/日, 4 日以上の間隔をあけて維持量 2mg/日 [4 週間以上 2mg で観察するのが良いだろう]

■CYP2D6 の PM, CYP2D6 阻害剤または強い 3A4 阻害剤併用時: 1mg/日

■CYP2D6 阻害剤と強い CYP3A4 阻害剤の両者併用, または CYP2D6 の PM に強い CYP3A4 阻害剤併用: 1mg を隔日

【用法】1 日 1 回

【透析患者への投与方法】高度腎障害患者に準じる (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr 30mL/min 未満では血中濃度上昇 (AUC 1.7 倍) するおそれから減量または投与間隔延長 (1)

【特徴】セロトニン 5-HT<sub>1A</sub> 受容体及びドパミン D<sub>2</sub> 受容体に対して部分アゴニスト作用を, セロトニン 5-HT<sub>2A</sub> 受容体に対してはアンタゴニスト作用を有する「セロトニン-ドパミン アクティビティ モジュレーター: SDAM」。錐体外路障害を起こしにくい。鎮静作用がないので, 焦燥, 興奮などの症状には鎮静作用のある薬剤を一時的に併用する。

【主な副作用・毒性】悪性症候群, 遅発性ジスキネジア, 麻痺性イレウス, 横紋筋融解症, 血球減少, DVT, 中枢神経抑制症状, アカシジア, パーキンソン症候群, 消化器症状, 高プロラクチン血症, 肝機能障害, 霧視など。アリピプラゾールよりアカシジアや不眠が軽減されている。

【安全性に関する情報】自動車運転等禁止 (1) アカシジア, 体重増加に注意 (Citrome L: Drugs Today (Bare) 51: 397-414, 2015 PMID: 26261843) 一過性のプロラクチン上昇を認める (Ishigooka J, et al: J Clin Pharmacol 58: 74-80, 2018 PMID: 28750151) 特異的解毒剤なし (1)

【F】100% (1)

【t<sub>max</sub>】6hr (1) 4~5hr (Ishigooka J, et al: J Clin Pharmacol 58: 74-80, 2018 PMID: 28750151)

【代謝】CYP3A4 及び CYP2D6 で代謝 (1) 腸肝循環を受ける (1) 主要代謝物 DM-3411 は未変化体より活性が低く, 脳内に移行しにくいので薬効への関与は低いと思われる (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 1%未満, 尿中回収率 24.6% [po, 480hr まで] (1)

【CL/F】CYP2D6 の EM で 1.15L/hr, IM で 0.74L/hr (1) CYP2D6 多型の影響を受ける (Ishigooka J, et al: J Clin Pharmacol 58: 74-80, 2018 PMID: 28750151)

【t<sub>1/2</sub>】53~67hr (1) 52~92hr (Ishigooka J, et al: J Clin Pharmacol 58: 74-80, 2018 PMID: 28750151)

【蛋白結合率】99.8% [Alb, AAG] (1)

【Vd/F】V<sub>c</sub>=63.0L/man, V<sub>t</sub>=24.6L/man (1)

【MW】433.57

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【O/W 係数】pH6 以上で非常に大きい

【相互作用】アドレナリンの血圧反転のため禁忌 (1)

【肝障害患者への投与方法】

【小児 CKD 患者における報告】安全性未確認 (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦には有益性投与, 授乳は避ける (1)

【主な臨床報告】

【更新日】20200404

※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。