▼ロナセン錠　［内］，△ロナセンテープ　［外］

【重要度】　【一般製剤名】ブロナンセリン　Blonanserin　【分類】非定型抗精神病薬［SDA］
【単位】▼2mg・▼4mg・▼8mg/錠，△20mg・▼30mg・▼40mg/テープ
【常用量】8～16mg/日［最大 24mg/日］
テープは１日１回 40mg［最大 80mg］

D2 受容体占有率からの評価では，テープ 40～80mg/日は経口 8～24mg/日に相当（Tomita Y, et al: J Clin Psychopharmacol 2022 PMID: 35384896）

【用法】１日２回・食後［空腹時投与では吸収率が低下］
テープは１日１回貼付：胸部，腹部，背部のいずれか
【透析患者への投与方法】肝代謝型薬物であり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】肝代謝型薬物であり減量の必要はないと思われる（5）
【特徴】第２世代のドパミン・セロトニン系遮断剤．5-HT2 受容体より D2 受容体に対する遮断作用が強い（リスペリドンやオランザピンは 5-HT2A 受容体親和性が D2 受容体より高い）．5-HT6 受容体に比較的高い親和性がある．陽性症状に対してハロペリドールやリスペリドンと同等の効果があり，陰性症状に対してハロペリドールより効果が高い．錐体外路症状に発現率が低く，体重増加や高プロラクチン血症の副作用も少ない．α1，H1，M1 受容体への親和性は低い（石橋正，他：日薬理誌 132:351-60, 2008）
【主な副作用・毒性】悪性症候群，遅発性ジスキネジア，血糖上昇，麻痺性イレウス，パーキンソン症候群，アカシジア，不眠，プロラクチン上昇，眠気，不安，焦燥など
【安全性に関する情報】低 Na 血症の症例報告あり（Bavle A: J Neuropsychiatry Clin Neurosci 26: E43, 2014）ハロペリドールより高プロラクチン血症，めまい，アカシジアを起こしにくく，リスペリドンよりアカシジアを起こしやすい（Kishi T, et al: J Psychiatr Res 47: 149-54, 2013）リスペリドンに比べ構音障害，めまい，AST/ALT 上昇，プロラクチン上昇の頻度は低いが，手の振戦は多い（Yang J, et al: Clin Neuropharmacol 33: 169-75, 2010）
体重増加が少ない（Kishi T, et al: Neuropsychiatr Dis Treat 2017 PMID: 28553116）
【吸収】食後投与の方が BA がよいため，空腹時投与では作用が減弱するおそれがある（1）空腹時投与に比べ食後投与では AUC が増大（Saruwatari J, et al: Eur J Clin Pharmacol 66: 899-902, 2010）80～98%が吸収される［ラット］（1）腸肝循環を受ける（1）
【Ka】0.974/hr（1）
【F】3%［サル］，10～15%［ラット］，19～53%［イヌ］（1）吸収率からみると初回通過効果が大きい（1）食後投与に比べ，空腹時投与の F は 55%（Wen YG, et al: Hum Psychopharmacol 28: 134-41, 2013）
【tmax】2hr（1）テープ 25hr（1）
【代謝】CYP3A4 で代謝［M-1，M-3 の生成に関与］（1）主な代謝産物は N-脱エチル体［in vivo 薬理活性：未変化体の 1/4.4～1/25］，7,8 位の各水酸化体及びこれらのグルクロン酸抱合体（1）M-2［N-オキシド化］の生成には FMO［フラビン含有モノオキシゲナーゼ］が関与（1）
【排泄】尿中回収率 59%，尿中に未変化体としては排泄されず，グルクロン酸抱合体として回収（1）高齢者ではクリアランスが低下する（1）腸肝循環する（1）P-gp の基質ではない（Inoue T, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 39: 156-62, 2012）
【t1/2】単回投与 13hr，反復投与 68hr（1）代謝物 M-1：単回 29hr，反復 37hr（1）テープ 42hr（1）
【蛋白結合率】99.7%以上（1）
【Vd】資料なし（1）F を 5%とするとおよそ 5L/kg（5）P-gp の基質とならないことが脳内移行が良好である原因［vitro］（井上朋子，他：臨床薬理 41: S281, 2010）
【MW】367.50
【透析性】蛋白結合率が高く透析されにくいと思われる（5）資料なし（1）
【TDM のポイント】血漿濃度と錐体外路障害のスコアは相関し，抗 5-HT(2A) 活性が抗 D2 活性よりも有意であれば，錐体外路症状が抑制できるかも知れない（Suzuki H and Gen K: Psychiatry Clin Neurosci 2012 PMID: 22353327）
テープ剤は血中濃度の日内変動が小さい（Kitamura A, et al: J Clin Pharmacol 2021 PMID: 33599975）
【相互作用】CYP3A4 を強く阻害する薬物との併用禁忌（1）エリスロマイシンとの併用で Cmax，AUC が約 2.5 倍上昇する（1）グレープフルーツジュース 200mL との同時投与で Cmax，AUC が 1.8 倍上昇する（1）P-gp を阻害（1）テープ剤は初回通過効果を受けないので相互作用のポテンシャルは低くなることが推測（1）
【主な臨床報告】初発の統合失調症に対して長期（1 年）投与時の有効性と安全性が確認（Ninomiya Y, et al: Psychiatry Clin Neurosci 2014 PMID: 24835911）
リスペリドンやオランザピンによるジストニアを改善（Takaki M, et al: J Neuropsychiatry Clin Neurosci 2014 PMID: 24763772）
統合失調症患者においてリスペリドンよりも日常生活の改善度に優れている（Hori H, et al: Neuropsychiatr Dis Treat 2014 PMID: 24707178）
抗精神病薬で治療を受けている統合失調症の女性における高プロラクチン血症は本剤への切り替え治療により改善する（Kawabe K, et al: Clin Neuropharmacol 2013 PMID: 24201238）
アルコール依存症の治療に有用（Takaki M, et al: Clin Neuropharmacol 36: 68-69, 2013）ICU 症候群の治療にも有効（Kato K, et al: Psychiatry Clin Neurosci 2011 PMID: 21569175）
経口よりも貼付剤で統合失調患者における錐体外路症状の頻度が低い（Ohi K, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 2022 PMID: 34740708）

ハロペリドールよりもEPSが少なく，陰性症状への効果が高い（Harvey PD, et al: Neuropsychopharmacol Rep 2019 PMID: 31041855）

【備考】マトリックス型であるため，切断使用は物理的には可能であるが，貼付強度や吸収量が変化する可能性はある．切断して使用する場合にはテープ等で補強［ただし，指導箋には切断不可とある］(5)
【更新日】20241016

※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。