

## ▼インヴェガ錠 [内]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】パリエリドン Paliperidone 【分類】非定型抗精神病薬 [SDA]

【単位】▼3mg・▼6mg・▼9mg錠

【常用量】6mg/日 [増量は5日以上あけて3mgずつ、最大12mgまで] [高齢者では腎機能低下例として3mgから開始を考慮]

【用法】分1, 朝食後

【透析患者への投与方法】禁忌 (1)

【その他の報告】データなし (17)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 50~79mL/min : 3mg/日から開始し、最大6mg/日 (1) Ccr 50mL/min未満 : 禁忌 (1)

【その他の報告】Ccr 10~50mL/min : 1.5mg/日で開始、最大3mg (FDA)

【特徴】リスベリドンの主代謝物でD2, 5-HT2A受容体拮抗がメカニズムとされる。浸透圧勾配を利用した薬物放出システムによる徐放性製剤で、錠剤の外被は内部の不溶性成分と一緒に糞便中に排泄される。

【主な副作用・毒性】起立性低血圧 (投与初期, 再投与時, 増量時に起こりやすい。α遮断作用に基づく)、悪性症候群、遅発性ジスキネジア、肝障害、横紋筋融解症、高血糖、糖尿病性ケトアシドーシス、SIADH、低血糖、白血球減少、肺塞栓、イレウス、精神症状、消化器症状など

【安全性に関する情報】過量によるAKIの症例 (Liang CS, et al: J Clin Psychopharmacol 32: 128, 2012 PMID: 22217944)

【吸収】空腹時と比べて食後投与でCmaxとAUCがそれぞれ36%及び37%増加 (1) 初回通過効果を受けない (1)

【F】28%, (1,FDA)

【tmax】24hr (1) 腎障害があっても24hr (1)

【代謝】CYP2D6と3A4でわずかに代謝される (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率59% [po, 168hrまで] (U, Vermeir M, et al: Drug Metab Dispos 36: 769-79, 2008) 尿中回収率80%, 糞便中回収率11% (Vermeir M, et al: Drug Metab Dispos 36: 769-79, 2008 PMID: 18227146) 尿中未変化体排泄率9% [po, 48hrまで (吸収率と解析時間の解釈に注意)] (1)

【CL/F】272~561mL/min (1) 腎機能正常時の腎CL=70mL/min, Ccr 10~30mL/minでの腎CL 13mL/min (1)

【t1/2】20~25hr (1) Ccr 30~49mL/min : 40hr, Ccr 10~29mL/min : 51hr (1) 23hr [製剤特性不明] (Citrome L: Expert Opin Drug Metab Toxicol 8: 873-88, 2012 PMID: 22632481)

【蛋白結合率】74% [ラセミ体] (U) 73.2% (1)

【Vd】487L/man (U) Vd/F=1045±374L/man (1)

【MW】426.48

【透析性】低いと思われる (5) 資料なし (1)

【O/W係数】LogP=1.02 [1-オクタノール/リン酸buffer, pH7.0] (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない。線形薬物動態をとる (Si T, et al: Hum Psychopharmacol 25: 404-9, 2010) 活性比はリスベリドンの1/2 (de Leon J, et al: Psychosomatics [Review] 51: 80-8, 2010) 線条体D2受容体占拠率60~80%を満たす血漿中濃度は9.98~26.6ng/mL (1)

【相互作用】CYP2D6を阻害するパロキセチン併用による影響はほとんどない[AUC増加率5~30%程度] (Berwaerts J, et al: Pharmacopsychiatry 42: 158-63, 2009) P-gpの基質である (井上朋子, 他: 臨床薬理 42:S344, 2011) カルバマゼピン

【更新日】20241007

※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。