

▼レキササルティ OD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】▼0.5mg・▼1mg・▼2mg/OD錠

【常用量】

■統合失調症

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CYP3A4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

■うつ病・うつ状態（既存治療で十分な効果が認められない場合）

1mg/日 [効果不十分な場合2mg/日可]

【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_{1A}受容体及びドパミンD₂受容体に対して部分アゴニスト作用を、セロトニン5-HT_{2A}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。アリピプラゾールよりもD₂受容体に対してはアンタゴニスト作用が強化されており、陽性症状改善作用が強い。D₂部分アゴニスト作用があり、錐体外路障害、不眠を起こしにくい。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) 体重増加に注意 (Citrome L: Drugs Today (Barc) 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)

【tmax】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 (I, Sasabe H, et al: Xenobiotica 2021 PMID: 33685346) グルタチオン抱合体やシステイン抱合体が検出 (Thakkar D, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2020 PMID: 32002811)

【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 2018 PMID: 28750151)

【t_{1/2}】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) 99%以上 (Sasabe H, et al: Xenobiotica 2021 PMID: 33685346)

【V_d/V_t】V_c=63.0L/man, V_t=24.6L/man (1) 1.82L/kg [サル] (Sasabe H, et al: Xenobiotica 2021 PMID: 33685346)

【MW】433.57

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【薬物動態】線形動態 (Sasabe H, et al: Xenobiotica 2021 PMID: 33685346) 肥満の影響あり (Bruno CD, et al: J Clin Pharmacol 2022 PMID: 34339048) CYP2D6のPMに対する用量設定は減らし過ぎかもしれない (Elmokadem A, et al: J Clin Pharmacol 2022 PMID: 34328221)

【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) CYPおよびトランスポータを介する相互作用のポテンシャルは低い (Sasabe H, et al: Xenobiotica. 2021 PMID: 33663326) GFJにてAUC 3.43倍 (Thakkar D, et al: Biomed Chromatogr 2021 PMID: 34148241) CYP2D6やCYP3A4の強い阻害剤併用時には減量の指示あり (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】

【備考】D₂受容体部分アゴニスト作用があるため、受容体のup-regulationを起こさず、ドパミン過感受性精神病を起こさない。

【更新日】20240117

※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。