

## 目次

2.6.1	緒言.....	2
-------	---------	---

### 2.6.1 緒言

パリペリドンは、非定型抗精神病薬リスペリドンの主活性代謝物（9-ヒドロキシ-リスペリドン）であり、セロトニン 5-HT<sub>2A</sub> 受容体及びドパミン D<sub>2</sub> 受容体に高い親和性を有するセロトニン・ドパミンアンタゴニストである。現在までに国内では1日1回投与のパリペリドン経口製剤であるインヴェガ錠が承認されている。

パリペリドンパルミチン酸エステル（図 2.6.1-1）は、パリペリドンをパルミチン酸エステル化したプロドラッグであり、本剤は月1回の筋肉内投与により血漿中パリペリドン濃度を維持できる非定型抗精神病薬の持効性注射剤（水性懸濁注射液）である。

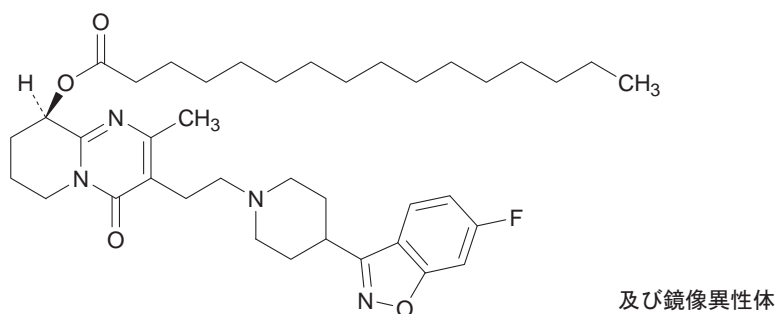


図 2.6.1-1 パリペリドンパルミチン酸エステルの構造式

本邦での本剤の医薬品製造販売承認申請における効能・効果（案）及び用法・用量（案）は、以下のとおりとした。

**【効能・効果（案）】**

統合失調症

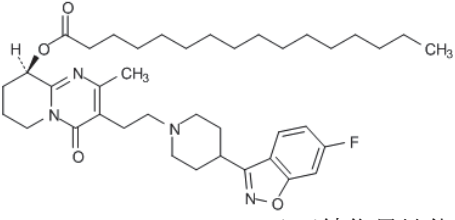
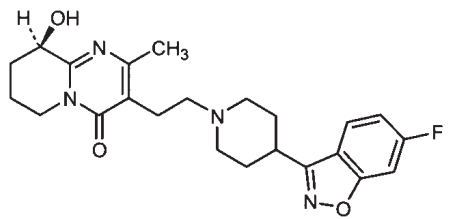
**【用法・用量（案）】**

通常、成人にはパリペリドンとして初回 150 mg、1 週後に 2 回目 100 mg を三角筋内に投与する。その後は 4 週に 1 回、パリペリドンとして 75 mg を三角筋又は臀部筋内に投与する。なお、患者の症状及び忍容性に応じて、パリペリドンとして 25 mg から 150 mg の範囲で適宜増減するが、増量は 1 回あたりパリペリドンとして 50 mg を超えないこと。

## 目次

2.6.2	薬理試験の概要文.....	3
-------	---------------	---

略号一覧表

略号又は略称	化学名又は一般名	構造式	由来
<p>パリペリドン パルミチン酸エステル</p>	<p>(9<i>RS</i>)-3-{2-[4-(6-Fluoro-1,2-benzisoxazol-3-yl)piperidin-1-yl]ethyl}-2-methyl-4-oxo-6,7,8,9-tetrahydro-4<i>H</i>-pyrido[1,2-<i>a</i>]pyrimidin-9-yl palmitate</p>	 <p>及び鏡像異性体</p>	<p>主薬</p>
<p>パリペリドン</p>	<p>(9<i>RS</i>)-3-{2-[4-(6-Fluoro-1,2-benzisoxazol-3-yl)piperidin-1-yl]ethyl}-9-hydroxy-2-methyl-6,7,8,9-tetrahydro-4<i>H</i>-pyrido[1,2-<i>a</i>]pyrimidin-4-one</p>	 <p>及び鏡像異性体</p>	<p>活性本体</p>

## 2.6.2 薬理試験の概要文

パリペリドンパルミチン酸エステルは、ヒト及び動物に筋肉内投与後、主に投与部位筋肉内で活性本体であるパリペリドンに加水分解され、パリペリドンパルミチン酸エステルとしてはほとんど全身循環に到達しない。実際に、ヒトにパリペリドンパルミチン酸エステルを筋肉内投与したときのパリペリドンパルミチン酸エステルの曝露量はわずかであり、血漿中パリペリドンパルミチン酸エステル濃度は、定量下限（0.2 ng/mL）未満又は極めて低値であった【2.7.2.3 参照】。

したがって、パリペリドンパルミチン酸エステルの筋肉内投与後の全身作用は、パリペリドンに起因するものと考えられる。

パリペリドンの薬理学的特性は、パリペリドン経口製剤であるインヴェガ錠承認申請時に提出した資料【1.13 2.6.2 参照】で評価されており、パリペリドンパルミチン酸エステルを用いた新たな薬理試験は実施しなかった。