

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

徐放性ドパミンD₂受容体系作動薬

ロピニロール徐放錠2mg「サワイ」 ロピニロール徐放錠8mg「サワイ」

ROPINIROLE

ロピニロール塩酸塩徐放錠

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品※ ※注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	徐放錠2mg：1錠中ロピニロール塩酸塩2.28mg(ロピニロールとして2mg)含有 徐放錠8mg：1錠中ロピニロール塩酸塩9.12mg(ロピニロールとして8mg)含有
一般名	和名：ロピニロール塩酸塩 洋名：Ropinirole Hydrochloride
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2018年8月15日 薬価基準収載年月日：2018年12月14日 発売年月日：2018年12月14日
開発・製造販売(輸入)・提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2021年12月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書(以下、添付文書と略す)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IFの様式]

①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」(以下、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	23
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	23
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	23
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	23
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	23
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	23
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	23
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	24
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	25
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	26
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	26
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	27
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	27
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	27
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	27
4. 有効成分の定量法	4	15. その他の注意	27
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他	27
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	28
2. 製剤の組成	5	1. 薬理試験	28
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	28
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	X. 管理的事項に関する項目	29
5. 調製法及び溶解後の安定性	8	1. 規制区分	29
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	9	2. 有効期間又は使用期限	29
7. 溶出性	9	3. 貯法・保存条件	29
8. 生物学的試験法	14	4. 薬剤取扱い上の注意点	29
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	14	5. 承認条件等	30
10. 製剤中の有効成分の定量法	14	6. 包装	30
11. 力価	14	7. 容器の材質	30
12. 混入する可能性のある夾雑物	14	8. 同一成分・同効薬	30
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	14	9. 国際誕生年月日	30
14. その他	14	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	30
V. 治療に関する項目	15	11. 薬価基準収載年月日	30
1. 効能又は効果	15	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	30
2. 用法及び用量	15	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	31
3. 臨床成績	15	14. 再審査期間	31
VI. 薬効薬理に関する項目	17	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	31
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	17	16. 各種コード	31
2. 薬理作用	17	17. 保険給付上の注意	31
VII. 薬物動態に関する項目	18	XI. 文献	32
1. 血中濃度の推移・測定法	18	1. 引用文献	32
2. 薬物速度論的パラメータ	20	2. その他の参考文献	32
3. 吸収	20	XII. 参考資料	33
4. 分布	21	1. 主な外国での発売状況	33
5. 代謝	21	2. 海外における臨床支援情報	33
6. 排泄	21	XIII. 備考	33
7. トランスポーターに関する情報	22	その他の関連資料	33
8. 透析等による除去率	22		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロピニロール徐放錠 2 mg/徐放錠 8 mg「サワイ」は、ロピニロール塩酸塩を含有する徐放性ドパミンD₂受容体系作動薬である。

ロピニロールは黒質線条体ドパミン受容体に直接働き抗パーキンソン病効果を発揮する。¹⁾

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2018年8月
上市	2018年12月

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 三層構造からなるゲルマトリックス型徐放錠である。
- 2) 識別性を考慮し、錠剤本体に規格を刻印している。
- 3) 錠剤が見えるPTPシートである。
- 4) 個装箱の一部を切り離し、調剤棚のラベルとして使用可能である。
- 5) ロピニロールはドパミンD₂ファミリー受容体作動薬(非麦角アルカロイド)である。¹⁾
- 6) 黒質線条体ドパミン受容体に直接働き抗パーキンソン病効果を発揮する。¹⁾
- 7) 重大な副作用として、突発的睡眠、極度の傾眠、幻覚、妄想、興奮、錯乱、譫妄、悪性症候群が報告されている(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」

ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」

2) 洋名

ROPINIROLE

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

ロピニロール塩酸塩(JAN)

2) 洋名(命名法)

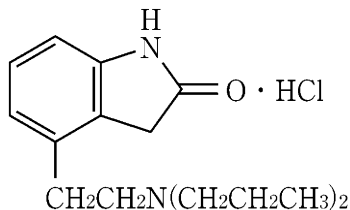
Ropinirole Hydrochloride(JAN)

Ropinirole(INN)

3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₁₆H₂₄N₂O · HCl

分子量 : 296.84

5. 化学名(命名法)

4-[2-(Dipropylamino)ethyl]-2-indolinone monohydrochloride(IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号
特になし

7. CAS登録番号
91374-20-8 [Ropinirole Hydrochloride]
91374-21-9 [Ropinirole]

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………
- 1) 外観・性状
白色～淡黄色の粉末である。
- 2) 溶解性
水に溶けやすく、メタノール又は酢酸(100)にやや溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、無水酢酸に極めて溶けにくい。
- 3) 吸湿性
水分：0.3%以下(0.5g、容量滴定法、直接滴定)
- 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点
融点：約244℃(分解)
- 5) 酸塩基解離定数
該当資料なし
- 6) 分配係数
0.266(1-オクタノール/水系、pH7.4)²⁾
- 7) その他の主な示性値
該当資料なし
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………
該当資料なし
3. 有効成分の確認試験法……………
- 1) 紫外可視吸光度測定法
2) 赤外吸収スペクトル測定法
3) 塩化物の定性反応
4. 有効成分の定量法……………
電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 12.7×6.9	 約474	 6.7	淡紅白色
ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 12.7×6.9	 約474	 6.7	赤褐色

2) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

3) 識別コード

●ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」：SW RR 2

●ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」：SW RR 8

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量

●ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」

1錠中にロピニロール塩酸塩2.28mg(ロピニロールとして2mg)を含有する。

●ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」

1錠中にロピニロール塩酸塩9.12mg(ロピニロールとして8mg)を含有する。

2) 添加物

●ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」

添加物として、カルメロースNa、グリセリン脂肪酸エステル、軽質無水ケイ酸、硬化油、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、デキストリン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ポビドン、マクロゴール6000、D-マンニトールを含有する。

IV. 製剤に関する項目

●ロピニロール徐放錠 8 mg「サワイ」

添加物として、カルメロースNa、グリセリン脂肪酸エステル、軽質無水ケイ酸、硬化油、酸化チタン、三酸化鉄、ステアリン酸Mg、デキストリン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ポビドン、マクロゴール6000、D-マンニトール、酸化鉄を含有する。

3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

●ロピニロール徐放錠 2 mg「サワイ」

1) 長期保存試験³⁾

本製剤の安定性を確認するため、長期保存試験を実施した。
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤入り脱酸素剤

	イニシャル	25°C60%RH・遮光 24ヵ月
性状	淡紅白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.0	97.8

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁴⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、光の条件で性状変化が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH・遮光3ヵ月)
性状	淡紅白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし
硬度(kg)	13.9	14.9	13.3
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.3	99.2

IV. 製剤に関する項目

	イニシャル	光		室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	淡紅白色のフィルムコーティング錠	変化なし	ごくわずかに退色(規格内)	変化なし
硬度(kg)	13.9	11.5	10.9	12.7
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.7	101.5	99.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁵⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	室温 (25°C60%RH・遮光6ヵ月)
性状	淡紅白色のフィルムコーティング錠	変化なし
硬度(kg)	13.9	14.2
純度試験	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.7

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

4) 粉砕後の安定性試験

本剤を粉砕すると放出制御の特性が失われるため、粉砕不可である。

●ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」

1) 加速試験⁶⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤入り脱酸素剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光6ヵ月
性状	赤褐色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	98.6	99.5

※：表示量に対する含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

2) 無包装下の安定性試験⁷⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、光の条件で性状変化が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH・遮光3ヵ月)
性状	赤褐色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし
硬度(kg)	14.9	15.6	15.1
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	102.3	100.5

	イニシャル	光		室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	赤褐色のフィルム コーティング錠	変化なし	ごくわずかに退 色(規格内)	変化なし
硬度(kg)	14.9	13.4	13.6	13.8
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.1	100.5	101.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁸⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、以下の結果が得られた。

	イニシャル	室温 (25°C60%RH・遮光6ヵ月)
性状	赤褐色のフィルムコーティング錠	変化なし
硬度(kg)	14.9	14.2
純度試験	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.3

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

4) 粉砕後の安定性試験

本剤を粉砕すると放出制御の特性が失われるため、粉砕不可である。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)……………
 該当資料なし

7. 溶出性……………

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」⁹⁾

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水、pH6.8ポリソルベート80 1.0% (W/V)添加)、100rpm(pH6.8)、200rpm(pH6.8)
	回転バスケット法	100rpm(pH6.8)、200rpm(pH6.8)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

パドル法

<50rpm : pH1.2>

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(60分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあった。

<50rpm : pH4.0>

標準製剤の平均溶出率が30%(360分)、50%(600分)及び80%(1080分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

<50rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30%(360分)、50%(600分)及び80%(1080分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

<50rpm : 水>

標準製剤の平均溶出率が30%(600分)、50%(900分)及び80%(1440分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

<50rpm : pH6.8ポリソルベート80 1.0% (W/V)添加>

標準製剤の平均溶出率が30%(360分)、50%(600分)及び80%(1080分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

<100rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30%(240分)、50%(480分)及び80%(900分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

<200rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30%(240分)、50%(480分)及び80%(900分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

IV. 製剤に関する項目

回転バスケット法

<100rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (360分)、50% (600分)及び80% (1080分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

<200rpm : pH6.8>

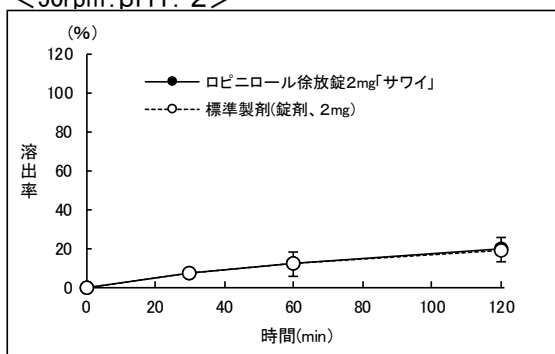
標準製剤の平均溶出率が30% (360分)、50% (600分)及び80% (1080分)付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

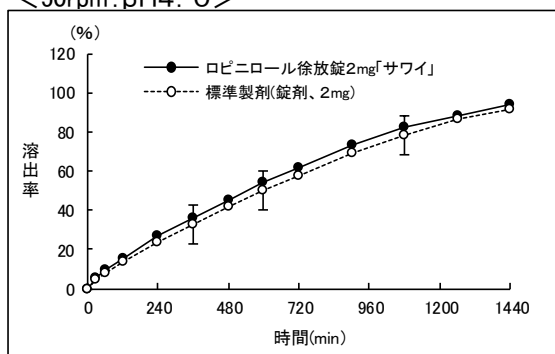
(溶出曲線)

パドル法

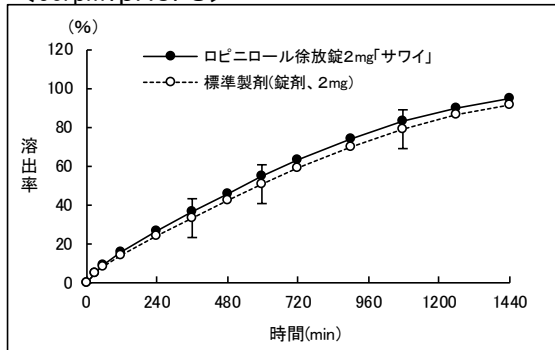
<50rpm:pH1.2>



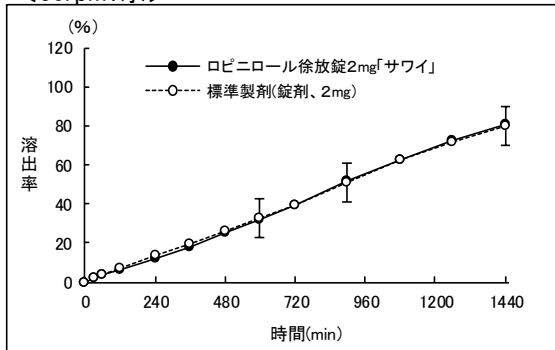
<50rpm:pH4.0>



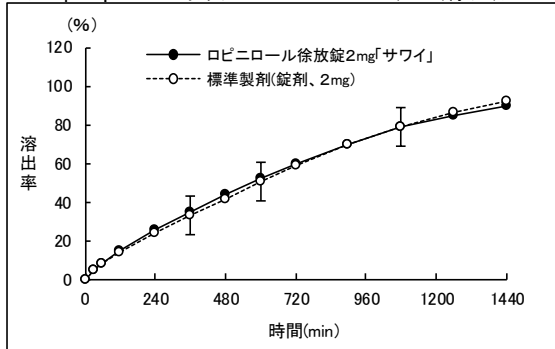
<50rpm:pH6.8>



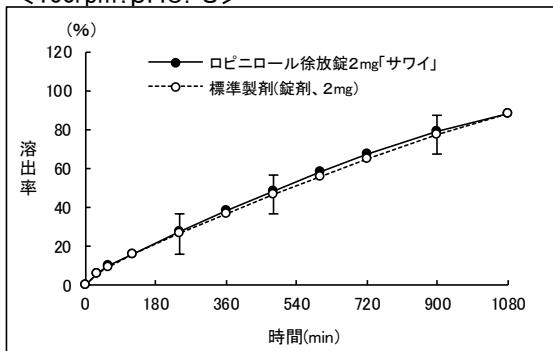
<50rpm:水>



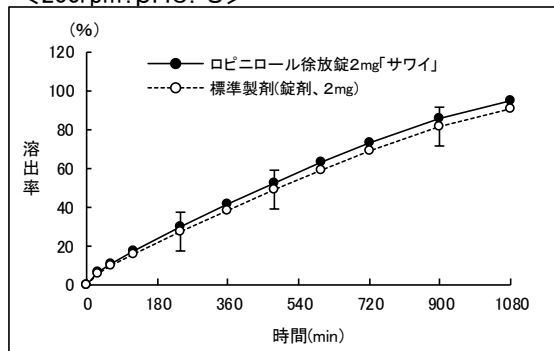
<50rpm:pH6.8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



<100rpm: pH6. 8>

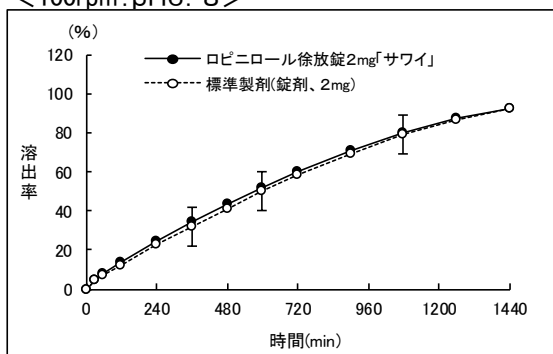


<200rpm: pH6. 8>

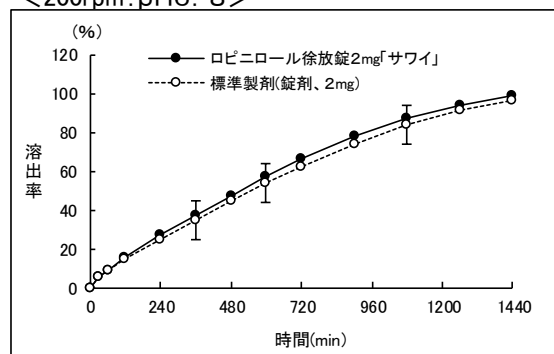


回転バスケット法

<100rpm: pH6. 8>



<200rpm: pH6. 8>



([] : 判定基準の適合範囲)

●ロピニロール徐放錠 8 mg「サワイ」¹⁰⁾

通知等	「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、3.0、6.8、水、pH6.8ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加)、100rpm (pH6.8)、200rpm (pH6.8)
	回転バスケット法	100rpm (pH6.8)、200rpm (pH6.8)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ロピニロール徐放錠 8 mg「サワイ」	
標準製剤	ロピニロール徐放錠 2 mg「サワイ」	

【結果及び考察】

パドル法

<50rpm : pH1. 2>

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(60分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあった。

最終比較時点(120分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH3. 0>

標準製剤の平均溶出率が30%(240分)、50%(600分)及び80%(1080分)付近の3時点において、

IV. 製剤に関する項目

試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(1080分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (240分)、50% (480分) 及び80% (1080分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(1080分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : 水>

標準製剤の平均溶出率が30% (600分)、50% (900分) 及び80% (1440分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(1440分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH6.8ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加>

標準製剤の平均溶出率が30% (360分)、50% (600分) 及び80% (1080分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(1080分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<100rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (240分)、50% (480分) 及び80% (900分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(900分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<200rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (240分)、50% (480分) 及び80% (900分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(900分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

回転バスケット法

<100rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (360分)、50% (600分) 及び80% (1080分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(1080分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

<200rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (240分)、50% (480分) 及び80% (900分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

最終比較時点(900分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

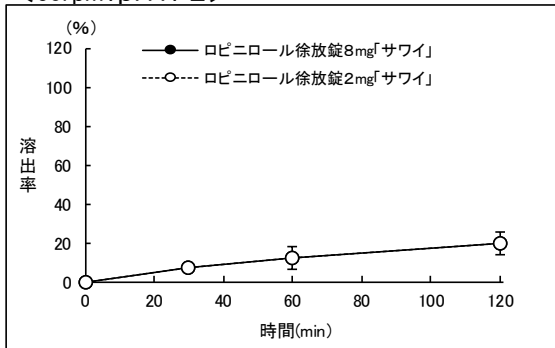
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

本剤の処方変更水準はC水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生

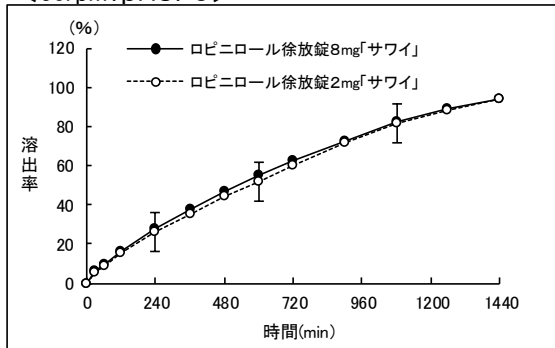
物学的に同等であるとみなした。

(溶出曲線)
パドル法

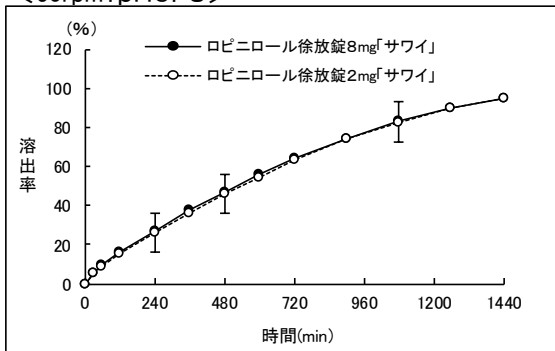
<50rpm: pH1. 2>



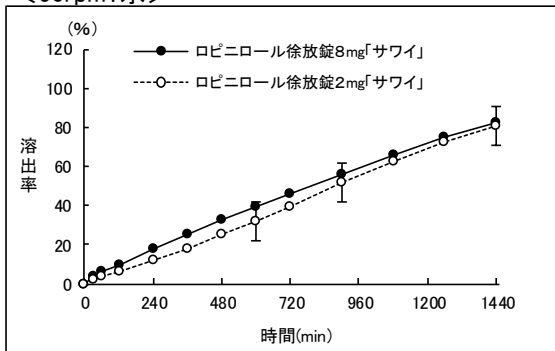
<50rpm: pH3. 0>



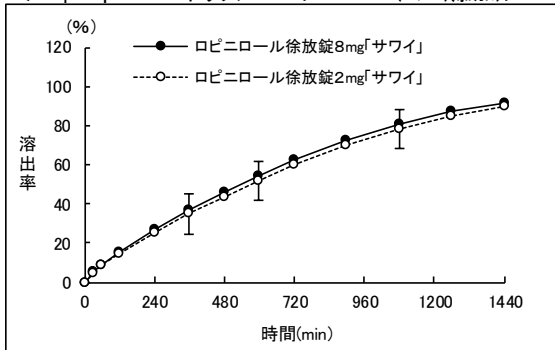
<50rpm: pH6. 8>



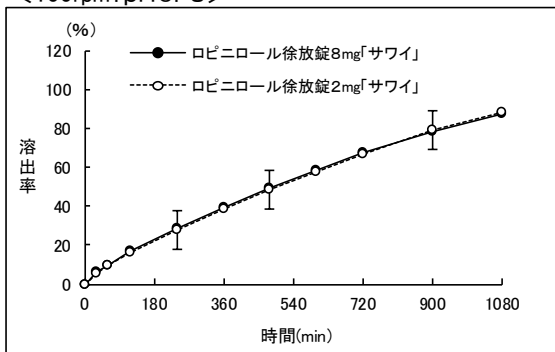
<50rpm: 水>



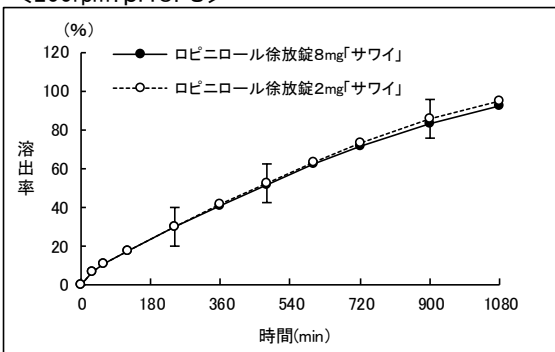
<50rpm: pH6. 8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



<100rpm: pH6. 8>



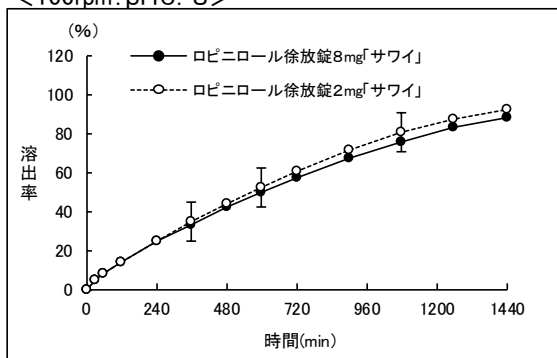
<200rpm: pH6. 8>



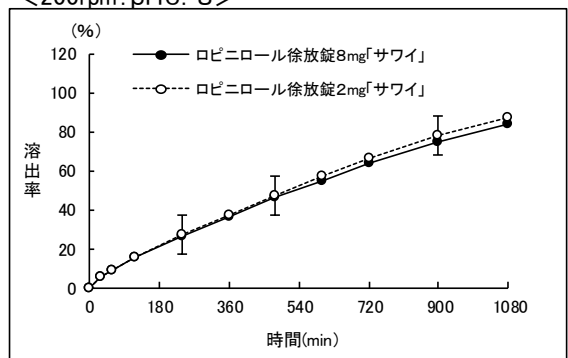
IV. 製剤に関する項目

回転バスケット法

<100rpm: pH6. 8>



<200rpm: pH6. 8>



(I : 判定基準の適合範囲)

- 8. 生物学的試験法
該当しない
- 9. 製剤中の有効成分の確認試験法
液体クロマトグラフィー
- 10. 製剤中の有効成分の定量法
液体クロマトグラフィー
- 11. 力価
該当しない
- 12. 混入する可能性のある夾雑物
該当資料なし
- 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報
該当資料なし
- 14. その他
該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

パーキンソン病

2. 用法及び用量

通常、成人にはロピニロールとして1日1回2mgから始め、2週目に4mg/日とする。以後経過観察しながら、必要に応じ、2mg/日ずつ1週間以上の間隔で増量する。いずれの投与量の場合も1日1回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、ロピニロールとして1日量16mgを超えないこととする。

<用法及び用量に関連する使用上の注意>

- 1) 本剤の投与は「用法及び用量」に従い少量から始め、消化器症状(悪心、嘔吐等)、血圧等の観察を十分に行い、忍容性をみながら慎重に増量し患者ごとに適切な維持量を定めること。また、本剤投与中止後再投与する場合にも少量から開始することを考慮すること。
- 2) 一般に空腹時投与において悪心、嘔吐等の消化器症状が多く発現する可能性があるため、食後投与が望ましい。
- 3) 本剤はできるだけ同じ時間帯に服用するよう指導すること。

3. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当しない

2) 臨床効果

該当資料なし

3) 臨床薬理試験

該当資料なし

4) 探索的試験

該当資料なし

5) 検証的試験

(1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

(2) 比較試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(3) 安全性試験

該当資料なし

(4) 患者・病態別試験

該当資料なし

6) 治療的使用

(1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当資料なし

(2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群……………

ドパミンD₂受容体作動薬：ブロモクリプチンメシル酸塩、タリペキソール塩酸塩、プラミペキソール塩酸塩水和物¹⁾

2. 薬理作用……………

ロピニロール塩酸塩の薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

黒質線条体ドパミン受容体に直接働き抗パーキンソン病効果を発揮する。¹⁾

2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

ロピニロール塩酸塩製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

1. 血中濃度の推移・測定法

1) 治療上有効な血中濃度

該当しない

2) 最高血中濃度到達時間

VII. - 1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」^{12, 13)}

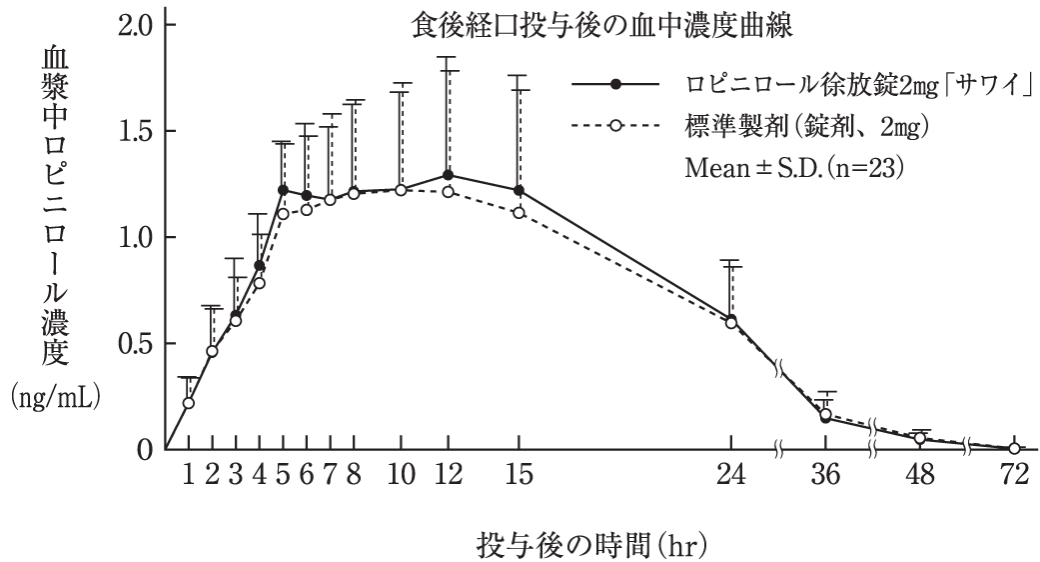
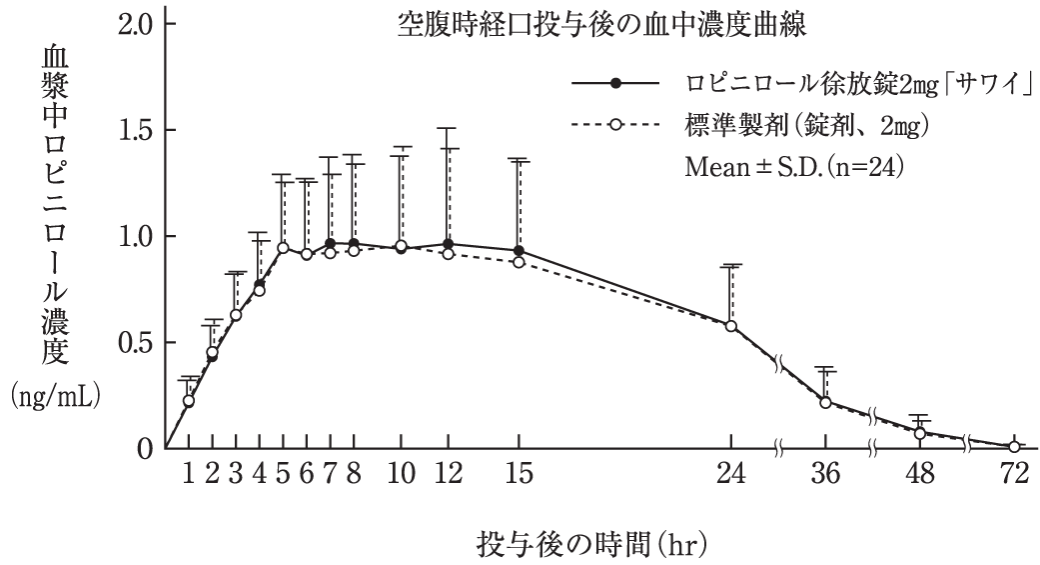
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号
採血時点	0、1、2、3、4、5、6、7、8、10、12、15、24、36、48、72hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ロピニロールとして2mg)空腹時及び食後単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロピニロール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _t (ng·hr/mL)
空腹時投与	ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」	1.09±0.52	8.7±5.0	7.3±1.3	26.48±11.27
	標準製剤 (錠剤、2mg)	1.06±0.45	8.3±3.9	7.3±1.4	25.67±11.30
食後投与	ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」	1.46±0.43	9.2±3.7	7.0±2.3	29.72±9.66
	標準製剤 (錠剤、2mg)	1.38±0.48	10.0±3.5	7.6±2.3	28.76±11.00

(Mean±S.D.)



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
空腹時投与	AUC _t	log(1.04)	log(0.97) ~ log(1.12)
	Cmax	log(1.01)	log(0.94) ~ log(1.08)
食後投与	AUC _t	log(1.06)	log(0.97) ~ log(1.15)
	Cmax	log(1.08)	log(0.99) ~ log(1.19)

血漿中濃度ならびにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

VII. 薬物動態に関する項目

●ロピニロール徐放錠 8 mg「サワイ」¹⁰⁾

ロピニロール徐放錠 8 mg「サワイ」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成24年2月29日付 薬食審査発0229第10号)」に基づき、ロピニロール徐放錠 2 mg「サワイ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。
(IV. -7. 参照)

4) 中毒域

該当資料なし

5) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 参照

6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ.....

1) 解析方法

該当資料なし

2) 吸収速度定数

該当資料なし

3) バイオアベイラビリティ

VII. -1. -3) 参照

4) 消失速度定数

ロピニロール徐放錠 2 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(ロピニロールとして 2 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{12,13)}
[空腹時]0.098±0.019hr⁻¹、[食後]0.108±0.032hr⁻¹

5) クリアランス

該当資料なし

6) 分布容積

該当資料なし

7) 血漿蛋白結合率

35~42%²⁾

3. 吸収.....

VII. -1. -3) 参照

4. 分布

1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>動物実験(ラット)で乳汁中に移行することが報告されている。

4) 髄液への移行性

該当資料なし

5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

主として肝薬物代謝酵素CYP1A2で代謝される。²⁾

3) 初回通過効果の有無及びその割合

初回通過効果が大きいことが示唆されている。²⁾

4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

2) 排泄率

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報.....

該当資料なし

8. 透析等による除去率.....

該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1. 警告内容とその理由

【警告】

前兆のない突発的睡眠及び傾眠等がみられることがあり、また突発的睡眠により自動車事故を起こした例が報告されているので、患者に本剤の突発的睡眠及び傾眠等についてよく説明し、本剤服用中には、自動車の運転、機械の操作、高所作業等危険を伴う作業に従事させないように注意すること。(「重要な基本的注意」及び「副作用」の項参照)

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

V. -2. 参照

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 幻覚、妄想等の精神症状又はそれらの既往のある患者〔症状が増悪又は発現しやすくなることがある。〕
- 2) 重篤な心疾患又はその既往歴のある患者〔本剤は薬理作用から心拍数低下を起こす可能性がある。〕
- 3) 低血圧症の患者〔症状が悪化することがある。〕
- 4) 重度の腎障害(クレアチニンクリアランス30mL/分未満)のある患者〔本剤は主として腎臓で排泄される。また、これらの患者での使用経験はなく安全性は確立されていない。なお、血液透析を受けている患者に対して、透析による用量調節の必要性はない。〕
- 5) 肝障害のある患者〔本剤は主として肝臓で代謝される。また、これらの患者での使用経験はなく安全性は確立されていない。重度の肝障害のある患者では、維持用量が決定するまではより低用量の用量調節が可能な速放錠である「ロピニロール錠0.25mg、同1mg、同2mg」を用いることも考慮すること。〕
- 6) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- 1) 突発的睡眠により自動車事故を起こした例が報告されていることから、患者には突発的

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

- 睡眠及び傾眠等についてよく説明し、自動車の運転、機械の操作、高所作業等危険を伴う作業に従事させないように注意すること。なお、海外において突発的睡眠を起こした症例の中には、傾眠や過度の眠気のような前兆を認めなかった例あるいは投与開始後1年以上経過した後に初めて発現した例も報告されている。(「副作用」の項参照)
- 2) 起立性低血圧がみられることがあるので、本剤の投与は少量から始め、めまい、立ちくらみ、ふらつき等の起立性低血圧の徴候や症状が認められた場合には、減量、休薬又は投与中止等の適切な処置を行うこと。
- 3) 本剤を他の抗パーキンソン剤と併用した場合、ジスキネジー、幻覚、錯乱等の副作用が発現しやすくなる可能性があるため、これらの副作用があらわれた場合には減量、休薬又は投与中止等の適切な処置を行うこと。(「副作用」の項参照)
- 4) 本剤の減量、中止が必要な場合は、漸減すること。急激な減量又は中止により、高熱、意識障害、高度の筋硬直、不随意運動、ショック症状等の悪性症候群があらわれることがある。また、ドパミン受容体作動薬の急激な減量又は中止により、薬剤離脱症候群(無感情、不安、うつ、疲労感、発汗、疼痛等の症状を特徴とする)があらわれることがある。(「副作用」の項参照)
- 5) レボドパ又はドパミン受容体作動薬の投与により、病的賭博(個人的生活の崩壊等の社会的に不利な結果を招くにもかかわらず、持続的にギャンブルを繰り返す状態)、病的性欲亢進、強迫性購買、暴食等の衝動制御障害が報告されているので、このような症状が発現した場合には、減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。また、患者及び家族等にこのような衝動制御障害の症状について説明すること。
- 6) 本剤は24時間かけて有効成分を放出し、溶解するよう設計されているので、腸切除の既往、人工肛門造設術、下痢等の影響で、本剤の消化管内滞留時間が短くなったと考えられる場合、又は糞便中に本剤の残留物が確認された場合には、本剤の効果が十分に得られないおそれがある。
- 7) 本剤の有効成分は速放錠である「ロピニロール錠0.25mg、同1mg、同2mg」と同一であるが、用法及び用量が異なることに注意すること。また、ロピニロール錠(速放錠)から本剤へ切り替える場合には、翌日から切り替え可能であるが、十分に患者の状態を観察すること。

7. 相互作用

本剤は主にCYP1A2により代謝される。

1) 併用禁忌とその理由

該当しない

2) 併用注意とその理由

併用注意(併用に注意すること)		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ドパミン拮抗剤 抗精神病薬 メトクロプラミド スルピリド 等	本剤の作用が減弱することがある。	本剤はドパミン作動薬であり、併用により両薬剤の作用が拮抗するおそれがある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP1A2阻害作用を有する薬剤 シプロフロキサシン エノキサシン フルボキサミン 等	ロピニロール速放錠とシプロフロキサシンとの併用によりロピニロールのCmax及びAUCがそれぞれ約60%及び84%増加したことが報告されている。 本剤投与中にこれらの薬剤を投与開始又は中止する場合は、必要に応じて本剤の用量を調整すること。	これらの薬剤のCYP1A2阻害作用により、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。
エストロゲン含有製剤	高用量のエストロゲンを投与した患者でロピニロールの血中濃度上昇がみられたとの報告があるので、本剤投与中に高用量のエストロゲンを投与開始又は中止する場合は、必要に応じて本剤の用量を調整すること。	機序不明

8. 副作用

1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

2) 重大な副作用と初期症状

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **突発的睡眠、極度の傾眠**：前兆のない突発的睡眠、極度の傾眠があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には、減量、休薬又は投与中止等の適切な処置を行うこと。(「重要な基本的注意」の項参照)
- (2) **幻覚、妄想、興奮、錯乱、譫妄**：幻覚、妄想、興奮、錯乱、譫妄等の精神症状があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には、減量、休薬又は投与中止等の適切な処置を行うこと。
- (3) **悪性症候群**：本剤の投与後、減量後又は中止後に、高熱、意識障害、高度の筋硬直、不随意運動、ショック症状等があらわれることがある。このような症状があらわれた場合には、投与開始初期の場合は中止し、また、継続投与中の用量変更・中止時の場合は一旦もとの投与量に戻した後慎重に漸減し、体冷却、水分補給等の適切な処置を行うこと。なお、投与継続中にも同様の症状があらわれることがある。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

3) その他の副作用

2) その他の副作用
 次のような症状があらわれることがあるので、異常が認められた場合には、減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過 敏 症	発疹、そう痒、蕁麻疹、血管性浮腫等
精 神 系	リビドー亢進、病的賭博、強迫性購買、暴食、攻撃性、躁状態
神 経 系	傾眠、ジスキネジー、めまい、失神
血 管 障 害	起立性低血圧、低血圧
胃 腸 障 害	悪心、便秘、腹痛、嘔吐、消化不良
そ の 他	末梢性浮腫、薬剤離脱症候群 ^{注)} (無感情、不安、うつ、疲労感、発汗、疼痛等)

注) 異常が認められた場合には、投与再開又は減量前の投与量に戻すなど、適切な処置を行うこと。

4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)
 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

副作用

2) その他の副作用
 次のような症状があらわれることがあるので、異常が認められた場合には、減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過 敏 症	発疹、そう痒、蕁麻疹、血管浮腫等

9. 高齢者への投与

他社が実施した臨床試験において高齢者に幻覚等の精神症状が多くみられたので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。〔動物実験(ラット)で胎児毒性(体重減少、死亡数増加及び指の奇形)が報告されている。〕

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

2)授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。[他社が実施した臨床試験で本剤投与後に血漿中プロラクチン濃度の低下が認められたため、乳汁分泌が抑制されるおそれがある。また、動物実験(ラット)で乳汁中に移行することが報告されている。]

11. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

1)徴候、症状：本剤の過量投与によりドパミン作用に関連する症状の発現が予想される。
2)処置：適宜、胃洗浄等行い、必要に応じて、適切な対症療法を行うこと。ドパミン拮抗薬(抗精神病薬、メトクロプラミド等)投与により症状が軽減することがある。
なお、血液透析による除去の効果については不明である。

14. 適用上の注意

1)薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)
2)服用時：本剤は徐放性製剤であるため、噛んだり、割ったり、砕いたりせずにそのまま服用するよう指導すること。

15. その他の注意

動物実験(ラット)で1.5~50mg/kg/日の2年間投与により、精巣Leydig細胞の過形成、腺腫の発生頻度が用量依存的に増加したとの報告がある。なお、マウスではがん原性は認められていない。

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

ロピニロール塩酸塩の非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

1. 薬理試験

1) 薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

2) 副次的薬理試験

該当資料なし

3) 安全性薬理試験

該当資料なし

4) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

規制区分	
製剤	劇薬、処方箋医薬品 ^{注)}
有効成分	毒薬

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間又は使用期限

- ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」

使用期限：2年

- ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

VIII. -6. 及びVIII. -14. 参照


ロピニロール徐放錠「サワイ」を
服用される患者さんとご家族の方へ

このお薬を正しく服用するため、飲む前に必ずお読みください。

このお薬を飲むと、急に眠くなったり、前ぶれもなく眠り込んでしまうことがあります(突発的睡眠)。飲み始めて1年以上経ったあとにあらわれる場合もあります。

車の運転、危険を伴う機械の操作、高い場所での作業などはしないでください!

社会的に不利な結果を招くにもかかわらず、欲求や行動を抑えることが難しくなる、『衝動制御障害(病的賭博、強迫性購買、病的性欲亢進、暴食など)』がおこることがあります。



裏面もご覧ください。

その他の注意点

- できるだけ毎日同じ時間帯に飲んでください。
- 必ず医師の指示に従って服用してください。自分の判断で飲む量を変えたり、服用を中止したりしないでください。
- このお薬はゆっくり溶けだし、長時間作用します。割ったり砕いたりせず、そのまま噛まずに飲んでください。
- 便の中にこのお薬が見つかった場合は、十分な効果が得られないことがありますので、医師または薬剤師に相談してください。
- このほかにも、気になることがあれば、医師または薬剤師に相談してください。

次のような症状があらわれたときは、すぐに医師または薬剤師に相談してください。

- 急な眠り込み、ひどい眠気
- 幻覚、妄想
- 衝動制御障害
- 発熱、意識がぼんやりする
- めまい、ふらつき
- 筋肉がひどくこわばる

医療機関名

沢井製薬株式会社

2020年11月03日

注) 当説明書は変更・改訂される場合があります。

X. 管理的事項に関する項目

3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

PTP : 112錠(14錠×8)

7. 容器の材質

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミ袋、乾燥剤入り脱酸素剤

8. 同一成分・同効薬

同一成分 : レキップCR錠 2 mg/CR錠 8 mg/錠0.25mg/錠 1 mg/錠 2 mg

同効薬 : ドパミンD₂受容体作動薬

ブロモクリプチンメシル酸塩、タリペキソール塩酸塩、プラミペキソール塩酸塩水和物¹¹⁾

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

●ロピニロール徐放錠 2 mg「サワイ」

製造販売承認年月日 : 2018年 8 月 15 日、承認番号 : 23000AMX00663000

●ロピニロール徐放錠 8 mg「サワイ」

製造販売承認年月日 : 2018年 8 月 15 日、承認番号 : 23000AMX00664000

11. 薬価基準収載年月日

2018年12月14日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容
 該当しない

14. 再審査期間
 該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報
 本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

品名	HOT番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」	126562001	1169013G1057	622656201
ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」	126563701	1169013G2053	622656301

17. 保険給付上の注意
 本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI . 文 献

1. 引用文献

- 1) 高折修二他監訳, グッドマン・ギルマン薬理書, 第12版, 廣川書店, 2013, p. 779.
- 2) 平田純生他編, 透析患者への投薬ガイドブック 慢性腎臓病(CKD)の薬物治療, 改訂3版, じほう, 2017, p. 337.
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験] ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロピニロール徐放錠 8mg「サワイ」
- 11) 薬剤分類情報閲覧システム<<http://www.iryohoken.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>
(2018/8/30 アクセス)
- 12) 竹内譲他, 診療と新薬, 55(10), 718(2018).
- 13) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロピニロール徐放錠 2mg「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

