

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

ドパミンD₂ 受容体系作動薬**ロピニロール錠0.25mg「JG」**劇薬
処方箋医薬品^(注)**ロピニロール錠1mg「JG」****ロピニロール錠2mg「JG」**

(ロピニロール塩酸塩錠)

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) 注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠 0.25mg : 1 錠中 ロピニロール塩酸塩 0.285mg を含有 (ロピニロールとして 0.25mg) 錠 1mg : 1 錠中 ロピニロール塩酸塩 1.14mg を含有 (ロピニロールとして 1mg) 錠 2mg : 1 錠中 ロピニロール塩酸塩 2.28mg を含有 (ロピニロールとして 2mg)
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：2016年2月15日 薬価基準収載年月日：2016年6月17日 発売年月日：2016年6月17日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/

本 IF は 2021 年 12 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>)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 PMDA 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, PMDA 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 PMDA 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. 開発の経緯……………6
2. 製品の治療学的・製剤学的特性……………6

II. 名称に関する項目

1. 販売名……………7
2. 一般名……………7
3. 構造式又は示性式……………7
4. 分子式及び分子量……………7
5. 化学名(命名法) ……8
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号……………8
7. CAS 登録番号……………8

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………9
2. 有効成分の各種条件下における
安定性……………9
3. 有効成分の確認試験法……………9
4. 有効成分の定量法……………9

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形……………10
2. 製剤の組成……………11
3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する
注意……………11
4. 製剤の各種条件下における安定性…12
5. 調製法及び溶解後の安定性……………19
6. 他剤との配合変化(物理化学的
変化) ……19
7. 溶出性……………19
8. 生物学的試験法……………25
9. 製剤中の有効成分の確認試験法…25
10. 製剤中の有効成分の定量法……………26
11. 力価……………26
12. 混入する可能性のある夾雑物……………26
13. 注意が必要な容器・外観が特殊
な容器に関する情報……………27
14. その他……………27

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果……………28
2. 用法及び用量……………28
3. 臨床成績……………28

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は
化合物群……………30
2. 薬理作用……………30

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法……………31
2. 薬物速度論的パラメータ……………32
3. 吸収……………33
4. 分布……………33
5. 代謝……………33
6. 排泄……………34
7. トランスポーターに関する情報…34
8. 透析等による除去率……………34

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……………35
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌
を含む)……………35
3. 効能又は効果に関連する使用上
の注意とその理由……………35
4. 用法及び用量に関連する使用上
の注意とその理由……………35
5. 慎重投与内容とその理由……………35
6. 重要な基本的注意とその理由及
び処置方法……………36
7. 相互作用……………36
8. 副作用……………37
9. 高齢者への投与……………38
10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与…39
11. 小児等への投与……………39
12. 臨床検査結果に及ぼす影響……………39
13. 過量投与……………39
14. 適用上の注意……………39

15. その他の注意	39
16. その他	40

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	41
2. 毒性試験	41

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	42
2. 有効期間又は使用期限	42
3. 貯法・保存条件	42
4. 薬剤取扱い上の注意点	42
5. 承認条件等	42
6. 包装	43
7. 容器の材質	43
8. 同一成分・同効薬	43
9. 国際誕生年月日	43
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	43
11. 薬価基準収載年月日	44
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	44
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	44
14. 再審査期間	44
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	44
16. 各種コード	44
17. 保険給付上の注意	44

X I. 文献

1. 引用文献	45
2. その他の参考文献	45

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	46
2. 海外における臨床支援情報	46

X III. 備考

その他の関連資料	47
----------	----

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、ロピニロール塩酸塩を有効成分とするドパミン D₂ 受容体系作動薬である。

長生堂製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日)に基づき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、2016 年 2 月に承認を得て、2016 年 6 月発売に至った。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、ドパミン D₂ 受容体系作動薬である。
- (2) 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。なお、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、悪性症候群があらわれることがある。([VIII.8. (2) 重大な副作用と初期症状]の項参照)

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名：

ロピニロール錠 0.25mg 「JG」

ロピニロール錠 1mg 「JG」

ロピニロール錠 2mg 「JG」

(2) 洋名：

ROPINIROLE Tablets 0.25mg “JG”

ROPINIROLE Tablets 1mg “JG”

ROPINIROLE Tablets 2mg “JG”

(3) 名称の由来：

一般名＋剤形＋含量＋「JG」

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)：

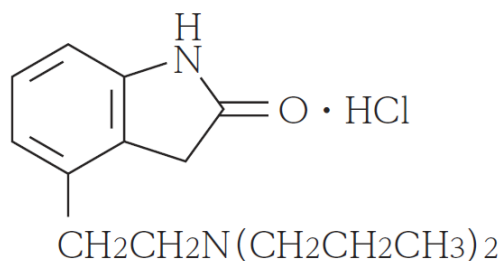
Ropinirole Hydrochloride (JAN)

Ropinirole (INN)

(3) ステム：

なし

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

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：

該当資料なし

(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：

該当資料なし

(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

極大吸収波長：248～252nm

(2) 赤外吸収スペクトル測定法(塩化カリウム錠剤法)

本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

(3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法(0.1mol/L 過塩素酸による滴定)

IV. 製剤に関する項目




1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状 :

錠 0.25mg

剤形・性状 : 白色のフィルムコーティング錠




外形 :

表	裏	側面	直径	7.2 mm
			厚さ	2.9 mm
			重量	124 mg

錠 1mg

剤形・性状 : 淡黄緑色のフィルムコーティング錠




外形 :

表	裏	側面	直径	7.6 mm
			厚さ	3.3 mm
			重量	155 mg

錠 2mg

剤形・性状 : 淡紅白色のフィルムコーティング錠

外形 :

表	裏	側面	直径	7.7 mm
			厚さ	3.3 mm
			重量	155 mg

(2) 製剤の物性 :

該当資料なし

(3) 識別コード :

錠 0.25mg : JG C54

錠 1mg : JG C55

錠 2mg : JG C56

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等 :

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量：

錠 0.25mg：1 錠中 ロピニロール塩酸塩 0.285mg 含有
(ロピニロールとして 0.25mg)

錠 1mg：1 錠中 ロピニロール塩酸塩 1.14mg 含有
(ロピニロールとして 1mg)

錠 2mg：1 錠中 ロピニロール塩酸塩 2.28mg 含有
(ロピニロールとして 2mg)

(2) 添加物：

錠 0.25mg	錠 1mg	錠 2mg
乳糖水和物, 結晶セルロース, クロスカルメロースナトリウム, ステアリン酸マグネシウム, ヒプロメロース, マクロゴール 400, 酸化チタン, タルク	乳糖水和物, 結晶セルロース, クロスカルメロースナトリウム, ステアリン酸マグネシウム, ヒプロメロース, マクロゴール 400, 酸化チタン, 青色 1 号, 黄色 5 号, タルク	乳糖水和物, 結晶セルロース, クロスカルメロースナトリウム, ステアリン酸マグネシウム, ヒプロメロース, マクロゴール 400, 酸化チタン, 三二酸化鉄, タルク

(3) その他：

該当しない

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

(1) 長期保存試験

錠 0.25mg¹⁾

長期保存試験 (25℃, 2年) の結果, 通常の市場流通下において 2年間安定であることが確認された。

包装形態 : PTP 包装 (PTP シート+アルミピロー)

試験項目	開始時	3 ヶ月	6 ヶ月	9 ヶ月	12 ヶ月	18 ヶ月	24 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験 (1)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験 (2)	-	-	-	-	-	-	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験 (%)	1.5	-	-	-	-	-	3.4
溶出試験 (%)	-	-	-	-	-	-	97.4
定量試験 (%)	98.0	96.9	98.3	97.3	97.2	97.0	96.5

錠 1mg²⁾

長期保存試験 (25℃, 2年) の結果, 通常の市場流通下において 2年間安定であることが確認された。

包装形態 : PTP 包装 (PTP シート+アルミピロー)

試験項目	開始時	3 ヶ月	6 ヶ月	9 ヶ月	12 ヶ月	18 ヶ月	24 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験 (1)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験 (2)	-	-	-	-	-	-	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験 (%)	1.5	-	-	-	-	-	1.6
溶出試験 (%)	-	-	-	-	-	-	99.1
定量試験 (%)	98.2	99.0	99.4	99.0	97.9	97.8	96.6

錠 2mg³⁾

長期保存試験(25℃, 2年)の結果, 通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。

包装形態: PTP包装(PTPシート+アルミピロー)

試験項目	開始時	3 ヶ月	6 ヶ月	9 ヶ月	12 ヶ月	18 ヶ月	24 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験(1)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験(2)	-	-	-	-	-	-	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験(%)	1.4	-	-	-	-	-	1.7
溶出試験(%)	-	-	-	-	-	-	98.5
定量試験(%)	98.6	98.5	99.9	98.7	98.6	97.9	97.8

(2) 無包装状態での安定性試験

錠 0.25mg

①温度: 40±2℃ 3 ヶ月〔遮光・気密容器(褐色ガラス瓶)〕

	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化なし	変化なし	変化なし
総合評価	◎	◎	◎

②湿度: 25±2℃/75±5%RH 3 ヶ月〔遮光・開放容器(褐色ガラス瓶)〕

	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化あり (規格内)	変化あり (規格内)	変化あり (規格内)
総合評価	○	○	○

③光：120 万 lux・hr (3000lux) 25±2°C/60±5%RH

[ガラスシャーレ+ポリ塩化ビニリデン製フィルム]

	30 万 lux・hr	60 万 lux・hr	120 万 lux・hr
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)
硬度試験	変化なし	変化なし	変化なし
総合評価	△	△	△

錠 1mg

①温度：40±2°C 3 ヶ月 [遮光・気密容器(褐色ガラス瓶)]

	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化なし	変化なし	変化なし
総合評価	◎	◎	◎

②湿度：25±2°C/75±5%RH 3 ヶ月 [遮光・開放容器(褐色ガラス瓶)]

	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化あり (規格内)	変化あり (規格内)	変化あり (規格内)
総合評価	○	○	○

③光：120万 lux・hr (3000lux) 25±2°C/60±5%RH

[ガラスシャーレ+ポリ塩化ビニリデン製フィルム]

	30万 lux・hr	60万 lux・hr	120万 lux・hr
性状	変化なし	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)
純度試験	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化なし	変化なし	変化なし
総合評価	△	△	△

錠 2mg

①温度：40±2°C 3ヵ月[遮光・気密容器(褐色ガラス瓶)]

	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化なし	変化なし	変化なし
総合評価	◎	◎	◎

②湿度：25±2°C/75±5%RH 3ヵ月[遮光・開放容器(褐色ガラス瓶)]

	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化あり (規格内)	変化あり (規格内)	変化あり (規格内)
総合評価	○	○	○

③光：120 万 lux・hr (3000lux) 25±2°C/60±5%RH

[ガラスシャーレ+ポリ塩化ビニリデン製フィルム]

	30 万 lux・hr	60 万 lux・hr	120 万 lux・hr
性状	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)	変化あり (規格外)
溶出試験	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験	変化なし	変化なし	変化なし
硬度試験	変化なし	変化なし	変化なし
総合評価	△	△	△

「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(社)日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会)の評価分類基準に準じる(一部改変)。

◎：全ての試験項目で変化を認めない

(性状：外観上の変化をほとんど認めない。純度試験：規格値内。溶出試験：規格値内。定量試験：含量低下が 3%未満。硬度試験：硬度変化が 30%未満。)

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認める

(性状：わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。定量試験：含量低下が 3%以上で、規格値内。硬度試験：硬度変化が 30%以上で、硬度が 2kg 重以上。)

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認める

(性状：形状変化や著しい変化を認め、規格を逸脱している。純度試験：規格値外。溶出試験：規格値外。定量試験：規格値外。硬度試験：硬度変化が 30%以上で、硬度が 2kg 重未満。)

(3) PTP 包装状態(一次包装)での安定性試験

錠 0.25mg

①温度：40±2°C 3 ヶ月[遮光・気密]

	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	101	101	100	96
定量試験(%)	99.9	100.4	100.5	98.6
硬度試験(kgf)	13.9	11.2	11.2	12.2

②湿度：25±2°C/75±5%RH 3ヵ月〔遮光・開放〕

	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	101	98	99	97
定量試験(%)	99.9	100.2	97.5	97.5
硬度試験(kgf)	13.9	9.8	9.5	8.6

③光：120万 lux・hr (3000lux) 25±2°C/60±5%RH

	開始時	30万 lux・hr	60万 lux・hr	120万 lux・hr
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	不適合	不適合
溶出試験(%)	101	96	96	95
定量試験(%)	99.9	96.8	96.7	96.8
硬度試験(kgf)	13.9	9.9	9.9	9.6

錠 1mg

①温度：40±2°C 3ヵ月〔遮光・気密〕

	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	100	97	97	99
定量試験(%)	98.3	98.5	98.4	98.3
硬度試験(kgf)	10.1	7.5	7.7	9.3

②湿度：25±2°C/75±5%RH 3ヵ月〔遮光・開放〕

	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	100	97	97	99
定量試験(%)	98.3	98.5	98.7	97.8
硬度試験(kgf)	10.1	7.4	7.3	6.7

③光：120 万 lux・hr (3000lux) 25±2°C/60±5%RH

	開始時	30 万 lux・hr	60 万 lux・hr	120 万 lux・hr
性状	適合	適合	不適合	不適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	100	98	97	96
定量試験(%)	98.3	97.9	97.8	97.1
硬度試験(kgf)	10.1	7.6	7.4	7.4

錠 2mg

①温度：40±2°C 3 ヶ月〔遮光・気密〕

	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	99	97	95	97
定量試験(%)	100.4	101.2	99.9	100.6
硬度試験(kgf)	11.5	8.6	8.6	11.1

②湿度：25±2°C/75±5%RH 3 ヶ月〔遮光・開放〕

	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	99	97	100	98
定量試験(%)	100.4	101.1	100.9	101.3
硬度試験(kgf)	11.5	8.2	8.2	7.6

③光：120 万 lux・hr (3000lux) 25±2°C/60±5%RH

	開始時	30 万 lux・hr	60 万 lux・hr	120 万 lux・hr
性状	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験(%)	99	98	97	101
定量試験(%)	100.4	99.6	100.4	100.2
硬度試験(kgf)	11.5	8.5	8.3	8.1

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

(1) 溶出規格

錠 0.25mg

試験法：日局溶出試験法(パドル法)

条件：回転数 50rpm

試験液 pH6.8

結果：15 分間 80%以上

錠 1mg

試験法：日局溶出試験法(パドル法)

条件：回転数 50rpm

試験液 pH6.8

結果：15 分間 80%以上

錠 2mg

試験法：日局溶出試験法(パドル法)

条件：回転数 50rpm

試験液 pH6.8

結果：15 分間 80%以上

(2) 生物学的同等性試験における溶出試験結果

錠 0.25mg⁴⁾

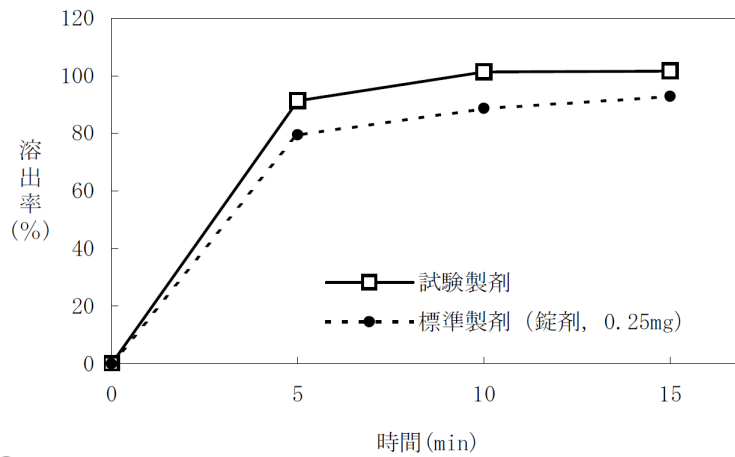
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号)」に従い、標準製剤との溶出挙動の類似性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は類似していると判断された。

試験法	試験液/回転数
パドル法	①pH1.2/50rpm
	②pH5.0/50rpm
	③pH6.8/50rpm
	④水/50rpm

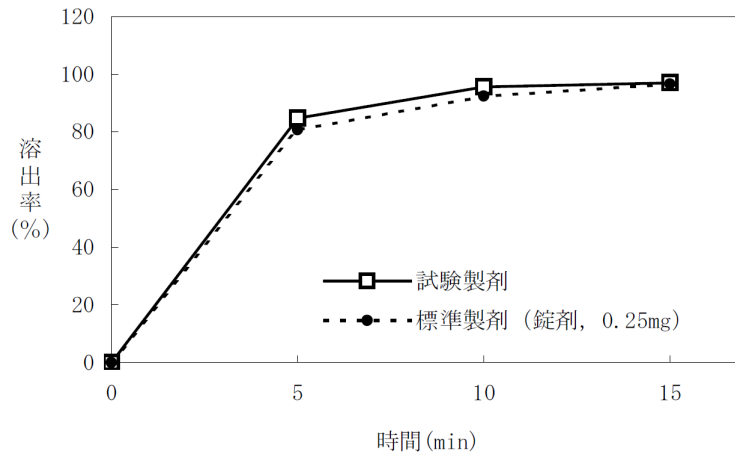
[判定基準]

- ①②③：試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にある。
- ④：標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 46 以上である。

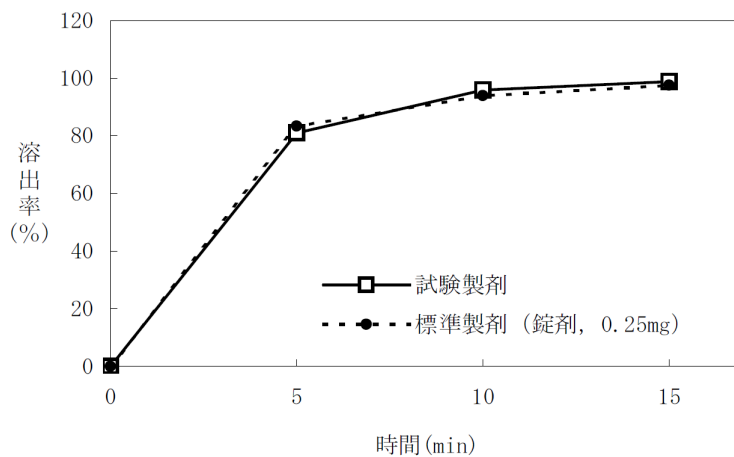
①pH1.2, 50rpm



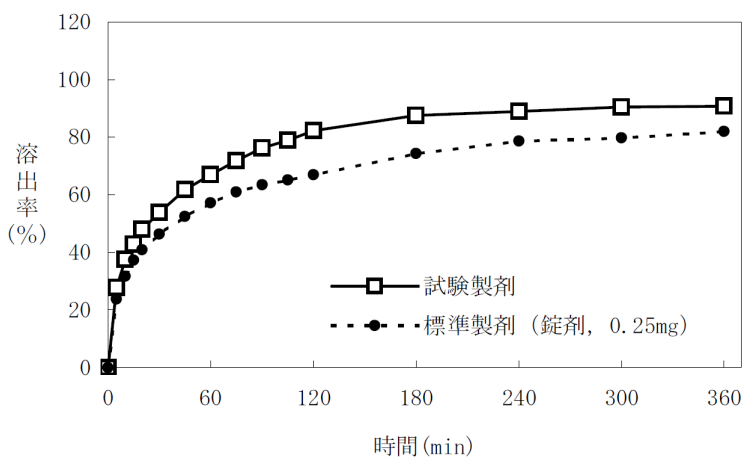
②pH5.0, 50rpm



③pH6.8, 50rpm



④ 水, 50rpm



錠 1mg⁵⁾

「含量が異なる経口固形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)」に従い、ロピニロール錠0.25mg「JG」を標準剤として溶出挙動の同等性を判定した結果、両剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	試験液/回転数
パドル法	①pH1.2/50rpm
	②pH3.0/50rpm
	③pH6.8/50rpm
	④水/50rpm

[判定基準]

a) 平均溶出率

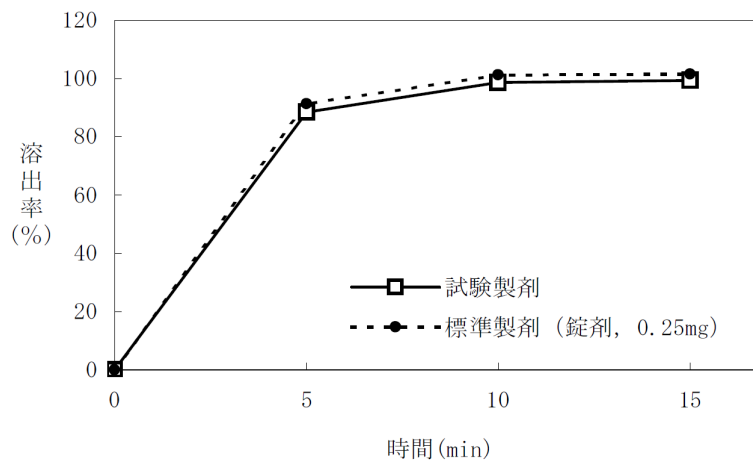
①②③：試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にある。

④：標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 50 以上である。

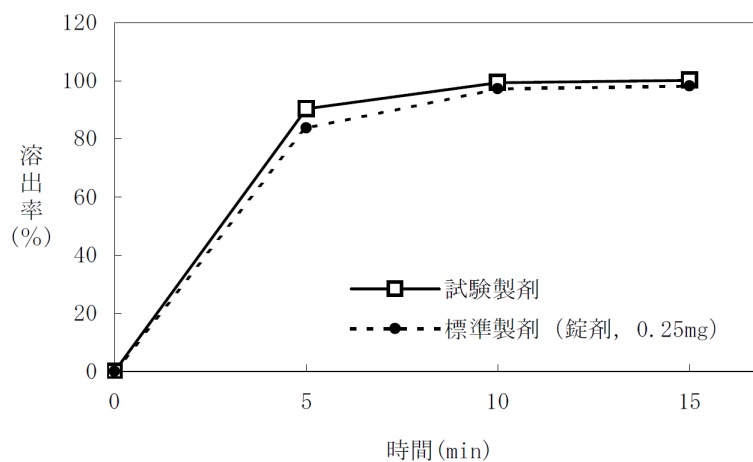
b) 個々の溶出率

①～④：最終比較時点において、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い。

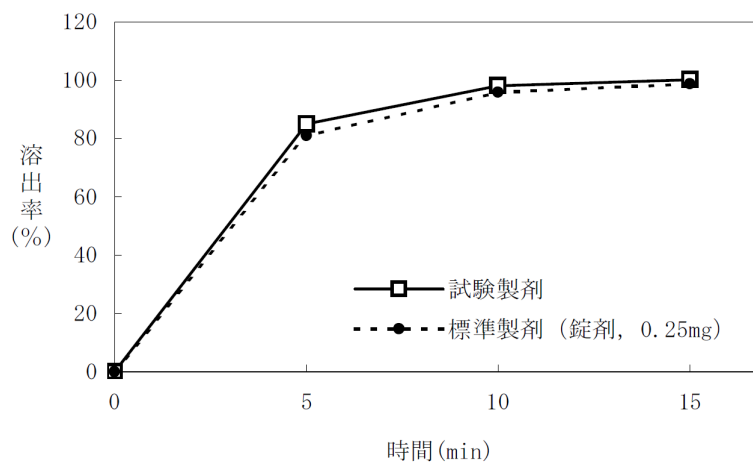
① pH1.2, 50rpm



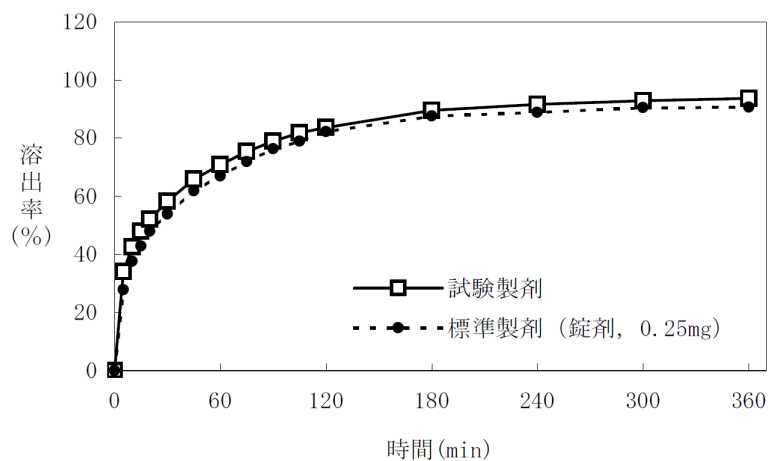
② pH3.0, 50rpm



③pH6.8, 50rpm



④ 水, 50rpm



錠 2mg⁶⁾

「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)」に従い, ロピニロール錠 0.25mg「JG」を標準製剤として溶出挙動の同等性を判定した結果, 両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	試験液/回転数
パドル法	①pH1.2/50rpm
	②pH3.0/50rpm
	③pH6.8/50rpm
	④水/50rpm

[判定基準]

a) 平均溶出率

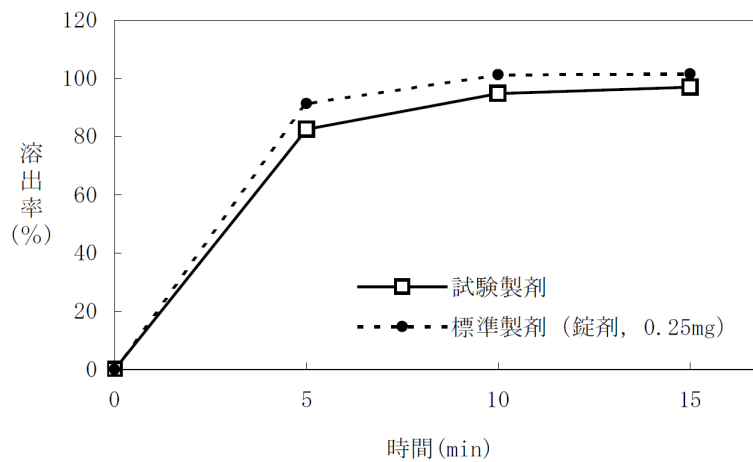
①②③：試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にある。

④：標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 50 以上である。

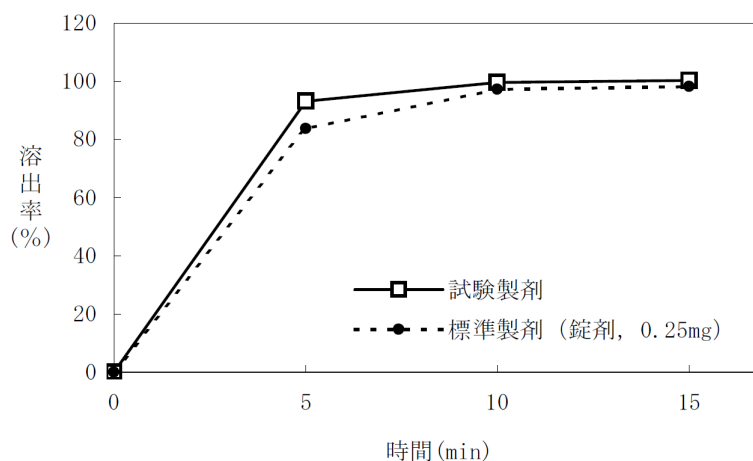
b) 個々の溶出率

①～④：最終比較時点において、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い。

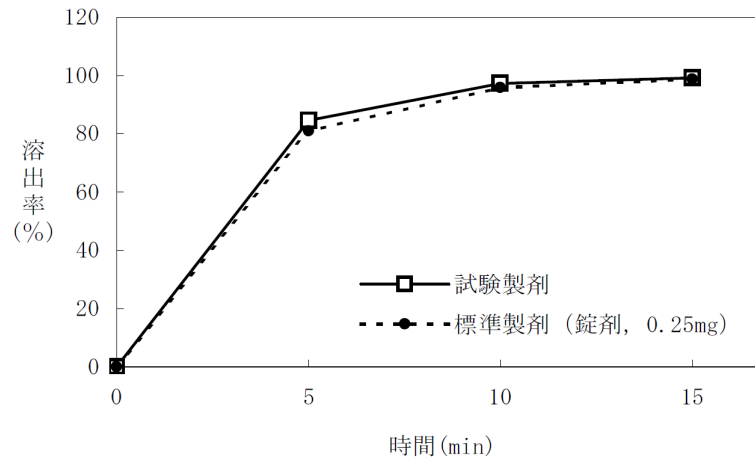
① pH1.2, 50rpm



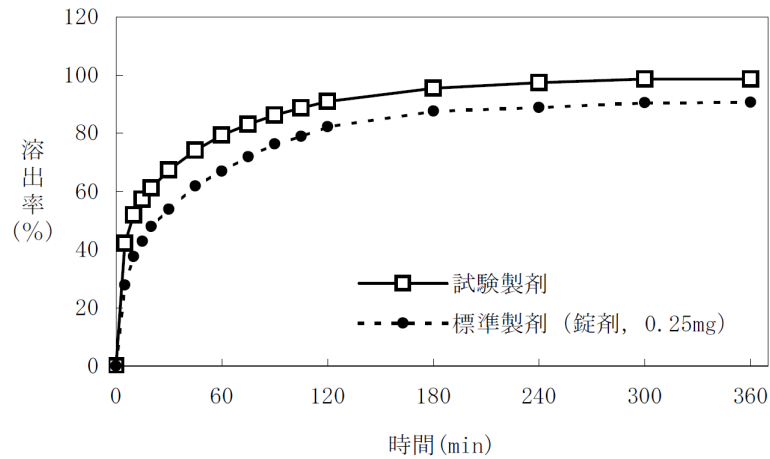
② pH3.0, 50rpm



③ pH6.8, 50rpm



④ 水, 50rpm



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

(1) 紫外可視吸光度測定法

極大吸収波長：247～251nm

(2) 薄層クロマトグラフィー

展開溶媒：酢酸エチル／トルエン／アンモニア水混液

薄層板：薄層クロマトグラフィー用シリカゲル(蛍光剤入り)

判定：紫外線(主波長 254nm)を照射するとき、試料溶液から得た主スポット及び標準溶液から得たスポットは青紫色を呈し、それらの R_f 値は等しい。

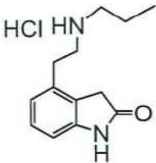
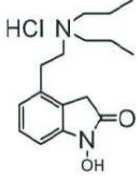
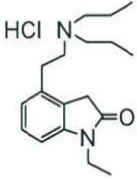
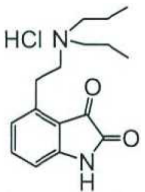
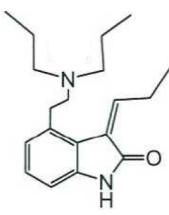
10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. カ価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

 <p>HCl HN(CH₂CH₂)₃</p> <chem>CCCNC(CCC)c1ccc2c(c1)c(=O)[nH]2</chem>
<p>4-[2-(n-Propylamino)ethyl]-2(3H)indolone hydrochloride</p>
 <p>HCl N(CH₂CH₂)₂</p> <chem>CCCNC(CCC)Cc1ccc2c(c1)c(=O)[nH](O)c2</chem>
<p>4-(2-Dipropylamino-ethyl)-1-hydroxy-1,3-dihydro-indol-2-one hydrochloride</p>
 <p>HCl N(CH₂CH₂)₂</p> <chem>CCCNC(CCC)Cc1ccc2c(c1)c(=O)[nH](CC)c2</chem>
<p>4-[2-(N,N-Di-n-propylamino)ethyl]-N-ethyl-2(3H)-indolone hydrochloride</p>
 <p>HCl N(CH₂CH₂)₂</p> <chem>CCCNC(CCC)Cc1ccc2c(c1)c(=O)[nH]c2=O</chem>
<p>4-[2-(Di-n-propylamino)ethyl]-1H-indol-2,3-dione hydrochloride</p>
 <p>CC(C)C=C1C(=O)[nH]c2ccc(CCN(CCC)CC)cc12</p>
<p>4-(2-(Dipropylamino-ethyl)-3-propylidene-1,3-dihydro-indol-2-one</p>

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

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回0.25mg、1日3回(1日量0.75mg)から始め、1週毎に1日量として0.75mgずつ増量し、4週目に1日量を3mgとする。以後経過観察しながら、必要に応じ、1日量として1.5mgずつ1週間以上の間隔で増量し、維持量(標準1日量3～9mg)を定める。いずれの投与量の場合も1日3回に分け、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15mgを超えないこととする。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

- (1) 本剤の投与は「用法・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. 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

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

プラミペキソール塩酸塩水和物, タリペキソール塩酸塩, カベルゴリン等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁷⁾ :

ドパミン受容体作動薬。D₂クラス部位(D₂およびD₃受容体に特異的)に選択性を持ち、D₁クラス部位にはほとんど作用しない。

(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

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度：

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間：

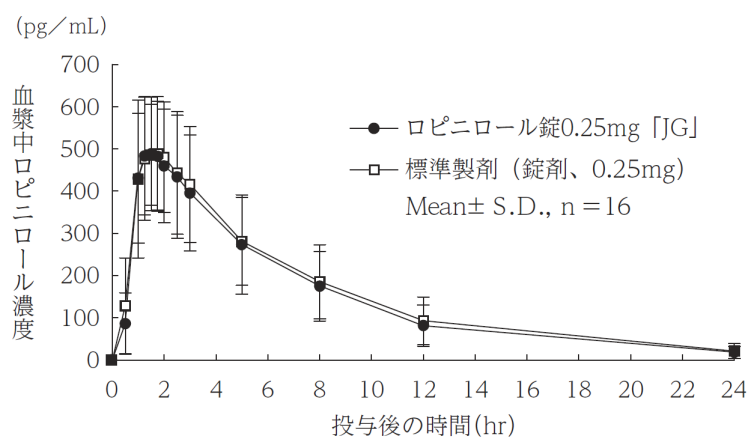
〔(3)臨床試験で確認された血中濃度〕の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度：

生物学的同等性試験

錠 0.25mg⁸⁾

ロピニロール錠 0.25mg 「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠(ロピニロールとして 0.25mg)健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中ロピニロール濃度を測定し、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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (pg · hr/mL)	Cmax (pg/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ロピニロール錠0.25mg [JG]	3508.2 ± 1438.0	551.5 ± 134.3	1.5 ± 0.6	4.6 ± 0.8
標準製剤 (錠剤、0.25mg)	3726.6 ± 1465.8	546.2 ± 149.5	1.7 ± 0.5	4.7 ± 1.0

(Mean ± S.D., n = 16)

血漿中濃度並びに 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。

錠 1mg⁹⁾

ロピニロール錠 1mg 「JG」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：薬食審査発 0229 第 10 号)」に基づき、ロピニロール錠 0.25mg 「JG」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。

錠 2mg¹⁰⁾

ロピニロール錠 2mg 「JG」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：薬食審査発 0229 第 10 号)」に基づき、ロピニロール錠 0.25mg 「JG」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。

(4) 中毒域：

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響：

〔VIII.7.相互作用〕の項参照

(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：

該当資料なし

(4) 消失速度定数：

錠 0.25mg

健康成人空腹時単回経口投与(1 錠, n=16)

$k_{el} \text{ (hr}^{-1}\text{)} : 0.1566 \pm 0.0288$

(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：

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

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：

[Ⅷ.10.妊婦,産婦,授乳婦等への投与]の項参照

(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：

[Ⅷ.7.相互作用]の項参照

(3) 初回通過効果の有無及びその割合：

該当資料なし

(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

(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。([6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法]及び[8.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([10.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.治療に関する項目]を参照

5. 慎重投与内容とその理由

- (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。]
- (6) 高齢者([9.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

- (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年以上経過した後初めて発現した例も報告されている。〔8.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。〔8.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。〔8.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。

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(現段階では定められていない)

(2) 併用注意とその理由：

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。

<p>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</p>	<p>シプロフロキサシンとの併用により 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。</p>	<p>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。</p>
<p>エストロゲン含有製剤</p>	<p>高用量のエストロゲンを投与した患者で本剤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。</p>	<p>機序不明</p>

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(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。〔6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕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には中止し、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。

(3) **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, 痒疹, 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, めまい, ジスキネジー, 失神
血液障害	起立性低血圧, 低血圧
胃腸障害	悪心, 嘔吐, 腹痛, 消化不良, 便秘
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**：

[2.禁忌内容とその理由]

[8.副作用]の項参照

9. **高齢者への投与**

ロピニロール塩酸塩製剤の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。]
- (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。[ロピニロール塩酸塩製剤の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

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。

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

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。)

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

該当しない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

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

- (1) 製剤：劇薬, 処方箋医薬品^注
注) 注意－医師等の処方箋により使用すること
- (2) 有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：2年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

室温保存, 気密容器

4. 薬剤取り扱い上の注意点

- (1) 薬局での取り扱い上の留意点について：
該当資料なし
- (2) 薬剤交付時の取り扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)：
〔VIII.1.警告内容とその理由〕
〔VIII.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕
〔VIII.14.適用上の注意〕の項参照

患者様用指導箋：

日本ジェネリック医療関係者向けホームページ：製品情報ページ[患者さま向け指導箋]参照
<https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/>

患者向医薬品ガイド：有り, くすりのしおり：有り

- (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

錠 0.25mg

PTP : 105 錠(21 錠×5)

錠 1mg

PTP : 105 錠(21 錠×5)

錠 2mg

PTP : 105 錠(21 錠×5)

7. 容器の材質

錠 0.25mg

PTP (ポリ塩化ビニルフィルム, アルミニウム箔), ピロー(アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム), 紙箱

錠 1mg

PTP (ポリ塩化ビニルフィルム, アルミニウム箔), ピロー(アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム), 紙箱

錠 2mg

PTP (ポリ塩化ビニルフィルム, アルミニウム箔), ピロー(アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム), 紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬 : レキップ[®]錠 0.25mg, レキップ[®]錠 1mg, レキップ[®]錠 2mg, レキップ[®]CR 錠 2mg, レキップ[®]CR 錠 8mg

同効薬 : プラミペキソール塩酸塩水和物, タリペキソール塩酸塩, カベルゴリン等

9. 国際誕生年月日

1996 年 7 月 8 日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
ロピニロール錠 0.25mg 「JG」	2016 年 2 月 15 日	22800AMX00230000
ロピニロール錠 1mg 「JG」	2016 年 2 月 15 日	22800AMX00231000
ロピニロール錠 2mg 「JG」	2016 年 2 月 15 日	22800AMX00232000

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日	薬価基準経過措置期限
ロピニロール錠 0.25mg 「JG」	2016年6月17日	—
ロピニロール錠 1mg 「JG」	2016年6月17日	—
ロピニロール錠 2mg 「JG」	2016年6月17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, 投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁) 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
ロピニロール錠 0.25mg 「JG」	124924801	1169013F1035	622492401
ロピニロール錠 1mg 「JG」	124925501	1169013F2031	622492501
ロピニロール錠 2mg 「JG」	124923101	1169013F3038	622492301

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。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 長生堂製薬株式会社 社内資料(安定性試験に関する資料：ロピニロール錠 0.25mg 「JG」の長期保存試験)
- 2) 長生堂製薬株式会社 社内資料(安定性試験に関する資料：ロピニロール錠 1mg 「JG」の長期保存試験)
- 3) 長生堂製薬株式会社 社内資料(安定性試験に関する資料：ロピニロール錠 2mg 「JG」の長期保存試験)
- 4) 長生堂製薬株式会社 社内資料(溶出試験に関する資料：ロピニロール錠 0.25mg 「JG」の溶出試験)
- 5) 長生堂製薬株式会社 社内資料(溶出試験に関する資料：ロピニロール錠 1mg 「JG」の溶出試験)
- 6) 長生堂製薬株式会社 社内資料(溶出試験に関する資料：ロピニロール錠 2mg 「JG」の溶出試験)
- 7) グッドマン・ギルマン薬理書 上巻：第 12 版, 廣川書店, 779-780 (2013)
- 8) 長生堂製薬株式会社 社内資料(生物学的同等性試験に関する資料：ロピニロール錠 0.25mg 「JG」の生物学的同等性試験)
- 9) 長生堂製薬株式会社 社内資料(生物学的同等性試験に関する資料：ロピニロール錠 1mg 「JG」の生物学的同等性試験)
- 10) 長生堂製薬株式会社 社内資料(生物学的同等性試験に関する資料：ロピニロール錠 2mg 「JG」の生物学的同等性試験)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎：

錠 0.25mg

1. 試験目的

ロビニロール錠0.25mg「JGJ」について、粉碎した検体を下記条件にて保存し、安定性を確認した。

2. 保存条件

- ・温度に対する安定性試験：40±2℃ 4週間〔遮光・気密容器〕
- ・湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH 4週間〔遮光・開放容器〕
- ・光に対する安定性試験：30万lux・hr(3000lux) 25±2℃/60±5%RH〔密閉容器〕

3. 試験項目

性状、純度試験、定量試験

4. 試験結果

		製剤の規格(参考) (粉碎前の状態)	試験開始時	2週間後	4週間後
温度	性状	(1)	白色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし
	純度試験	(2)	適合	適合	適合
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	99.9 100 ⁽³⁾	99.8 99.9	99.8 99.9
湿度	性状	(1)	白色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし
	純度試験	(2)	適合	適合	適合
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	99.9 100 ⁽³⁾	98.6 98.7	101.3 101.4

		製剤の規格(参考) (粉碎前の状態)	試験開始時	30万lux・hr
光	性状	(1)	白色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし
	純度試験	(2)	適合	不適合
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	99.9 100 ⁽³⁾	98.5 98.6

(1)白色のフィルムコーティング錠、(2)類縁物質：試料溶液のロビニロールに対する相対保持時間約0.2、0.5、0.9、1.2及び1.4のピーク面積は、標準溶液のロビニロールのピーク面積の0.5倍より大きくなく、ロビニロール及び上記のピーク以外のピーク面積は、標準溶液のロビニロールのピーク面積の0.2倍より大きくない。また、試料溶液のロビニロール以外のピークの合計面積は、標準溶液のロビニロールのピーク面積の1.5倍より大きくない、(3)試験開始時を100とした残存率で表示

錠 1mg

1.試験目的

ロピニロール錠1mg「JG」について、粉碎した検体を下記条件にて保存し、安定性を確認した。

2.保存条件

- ・温度に対する安定性試験: 40±2°C 4週間 [遮光・気密容器]
- ・湿度に対する安定性試験: 25±2°C/75±5%RH 4週間 [遮光・開放容器]
- ・光に対する安定性試験: 30万lux・hr(3000lux) 25±2°C/60±5%RH [密閉容器]

3.試験項目

性状、純度試験、定量試験

4.試験結果

		製剤の規格(参考) (粉碎前の状態)	試験開始時	2週間後	4週間後
温度	性状	(1)	淡黄緑色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし
	純度試験	(2)	適合	適合	適合
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	98.3 100 ⁽³⁾	97.8 99.5	99.6 101.3
湿度	性状	(1)	淡黄緑色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし
	純度試験	(2)	適合	適合	適合
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	98.3 100 ⁽³⁾	97.2 98.9	99.7 101.4
		製剤の規格(参考) (粉碎前の状態)	試験開始時	30万lux・hr	
光	性状	(1)	淡黄緑色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	
	純度試験	(2)	適合	不適合	
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	98.3 100 ⁽³⁾	98.9 99.5	

(1)淡黄緑色のフィルムコーティング錠、(2)類縁物質: 試料溶液のロピニロールに対する相対保持時間約0.2、0.5、0.9、1.2及び1.4のピーク面積は、標準溶液のロピニロールのピーク面積の0.5倍より大きくなく、ロピニロール及び上記のピーク以外のピーク面積は、標準溶液のロピニロールのピーク面積の0.2倍より大きくない。また、試料溶液のロピニロール以外のピークの合計面積は、標準溶液のロピニロールのピーク面積の1.5倍より大きくない、(3)試験開始時を100とした残存率で表示

錠 2mg

1.試験目的

ロビニロール錠2mg「JG」について、粉碎した検体を下記条件にて保存し、安定性を確認した。

2.保存条件

- ・温度に対する安定性試験: 40±2°C 4週間 [遮光・気密容器]
- ・湿度に対する安定性試験: 25±2°C/75±5%RH 4週間 [遮光・開放容器]
- ・光に対する安定性試験: 30万lux・hr(3000lux) 25±2°C/60±5%RH [密閉容器]

3.試験項目

性状、純度試験、定量試験

4.試験結果

		製剤の規格(参考) (粉碎前の状態)	試験開始時	2週間後	4週間後
温度	性状	(1)	淡紅白色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし
	純度試験	(2)	適合	適合	適合
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	100.4 100 ⁽³⁾	100.8 100.4	102.6 102.2
湿度	性状	(1)	淡紅白色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし
	純度試験	(2)	適合	適合	適合
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	100.4 100 ⁽³⁾	100.5 100.1	102.9 102.5
		製剤の規格(参考) (粉碎前の状態)	試験開始時	30万lux・hr	
光	性状	(1)	淡紅白色の微細なフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	
	純度試験	(2)	適合	不適合	
	定量試験(%)	95.0～ 105.0% 実測値 残存率	100.4 100 ⁽³⁾	100.8 100.4	

(1)淡紅白色のフィルムコーティング錠、(2)類縁物質: 試料溶液のロビニロールに対する相対保持時間約0.2、0.5、0.9、1.2及び1.4のピーク面積は、標準溶液のロビニロールのピーク面積の0.5倍より大きくなく、ロビニロール及び上記のピーク以外のピーク面積は、標準溶液のロビニロールのピーク面積の0.2倍より大きくない。また、試料溶液のロビニロール以外のピークの合計面積は、標準溶液のロビニロールのピーク面積の1.5倍より大きくない、(3)試験開始時を100とした残存率で表示

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性：

錠 0.25mg

1. 試験目的

ロピニロール錠 0.25mg「JG」について、崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性を確認するため試験を実施した。

2. 試験製剤

ロピニロール錠 0.25mg「JG」(フィルムコーティング錠)

3. 試験方法

・崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

・通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。チューブサイズは 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr.、と通過するまで変更する。

4. 試験結果

●崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ロピニロール錠 0.25mg「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

●通過性試験結果

品目名	通過性
ロピニロール錠 0.25mg「JG」	8Fr.のチューブを通過した。

錠 1mg

1.試験目的

ロピニロール錠 1mg「JG」について、崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性を確認するため試験を実施した。

2.試験製剤

ロピニロール錠 1mg「JG」(フィルムコーティング錠)

3.試験方法

・崩壊懸濁試験:

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55°Cの温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

・通過性試験:

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2~3mL/秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。チューブサイズは 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr.、と通過するまで変更する。

4.試験結果

●崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ロピニロール錠 1mg「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

●通過性試験結果

品目名	通過性
ロピニロール錠 1mg「JG」	8Fr.のチューブを通過した。

錠 2mg

1.試験目的

ロピニロール錠 2mg「JG」について、崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性を確認するため試験を実施した。

2.試験製剤

ロピニロール錠 2mg「JG」(フィルムコーティング錠)

3.試験方法

・崩壊懸濁試験:

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55°Cの温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

・通過性試験:

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2~3mL/秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。チューブサイズは 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr.、と通過するまで変更する。

4.試験結果

●崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ロピニロール錠 2mg「JG」	フィルムコーティング部の一部残留が認められたが、5 分以内に崩壊・懸濁した。

●通過性試験結果

品目名	通過性
ロピニロール錠 2mg「JG」	8Fr.のチューブを通過した。