

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会 IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成（一部記載要領 2013 に準拠）

徐放性ドパミン D<sub>2</sub> 受容体系作動薬

ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」

ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」

ROPINIROLE CR TABLETS 「KMP」

<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（徐放錠）
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	ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」：1 錠中ロピニロール塩酸塩 2.28mg（ロピニロールとして 2mg）を含有 ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」：1 錠中ロピニロール塩酸塩 9.12mg（ロピニロールとして 8mg）を含有
一般名	和名：ロピニロール塩酸塩（JAN） 洋名：Ropinirole Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2019 年 1 月 22 日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2023 年 6 月 16 日（販売名変更による） 販売開始年月日：2018 年 3 月 1 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：共創未来ファーマ株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室 TEL 050-3383-3846 受付時間：9 時～17 時（土、日、祝祭日、弊社休日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html">http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html</a>

本 IF は 2023 年 6 月作成（第 4 版）の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページ

（<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>）で確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会― (2020 年 4 月改訂)

## 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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I F と略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第 2 小委員会が I F の位置付け、I F 記載様式、I F 記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会が I F 記載要領の改訂を行ってきた。

I F 記載要領 2008 以降、I F は P D F 等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加した I F が速やかに提供されることとなった。最新版の I F は、医薬品医療機器総合機構（以下、P M D A）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品の I F の情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、I F 記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

I F に記載する項目配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F 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 I F は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。I F の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

## 3. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、P M D A の医療用医薬品情報検索の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 I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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利用者自らが内容を充実させ、I F 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、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を P M D A の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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

I F を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いただきたい。I F は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>
1. 開発の経緯 .....	1
2. 製品の治療学的特性 .....	1
3. 製品の製剤学的特性 .....	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 .....	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 .....	1
6. RMPの概要 .....	1
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>
1. 販売名 .....	2
2. 一般名 .....	2
3. 構造式又は示性式 .....	2
4. 分子式及び分子量 .....	2
5. 化学名（命名法）又は本質 .....	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>
1. 物理化学的性質 .....	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4
3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....	4
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>
1. 剤形 .....	5
2. 製剤の組成 .....	5
3. 添付溶解液の組成及び容量 .....	6
4. 力価 .....	6
5. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7
6. 製剤の各種条件下における安定性 .....	8
7. 調製法及び溶解後の安定性 .....	9
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	9
9. 溶出性 .....	9
10. 容器・包装 .....	17
11. 別途提供される資材類 .....	17
12. その他 .....	17
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>18</b>
1. 効能又は効果 .....	18
2. 効能又は効果に関連する注意 .....	18
3. 用法及び用量 .....	18
4. 用法及び用量に関連する注意 .....	18
5. 臨床成績 .....	18
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>20</b>
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .....	20
2. 薬理作用 .....	20
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>21</b>
1. 血中濃度の推移 .....	21
2. 薬物速度論的パラメータ .....	23
3. 母集団（ポピュレーション）解析 .....	23
4. 吸収 .....	23
5. 分布 .....	23
6. 代謝 .....	24
7. 排泄 .....	24

8. トランスポーターに関する情報 .....	24
9. 透析等による除去率 .....	24
10. 特定の背景を有する患者 .....	24
11. その他 .....	24
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 .....</b>	<b>25</b>
1. 警告内容とその理由 .....	25
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	25
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	25
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	25
5. 慎重投与内容とその理由 .....	25
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	26
7. 相互作用 .....	26
8. 副作用 .....	27
9. 高齢者への投与 .....	28
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 .....	28
11. 小児等への投与 .....	28
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	28
13. 過量投与 .....	28
14. 適用上の注意 .....	28
15. その他の注意 .....	29
16. その他 .....	29
<b>IX. 非臨床試験に関する項目 .....</b>	<b>30</b>
1. 薬理試験 .....	30
2. 毒性試験 .....	30
<b>X. 管理的事項に関する項目 .....</b>	<b>31</b>
1. 規制区分 .....	31
2. 有効期間 .....	31
3. 包装状態での貯法 .....	31
4. 取扱い上の注意 .....	31
5. 患者向け資材 .....	31
6. 同一成分・同効薬 .....	31
7. 国際誕生年月日 .....	31
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 .....	32
9. 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 .....	32
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 .....	32
11. 再審査期間 .....	32
12. 投薬期間制限に関する情報 .....	32
13. 各種コード .....	32
14. 保険給付上の注意 .....	32
<b>XI. 文献 .....</b>	<b>33</b>
1. 引用文献 .....	33
2. その他の参考文献 .....	33
<b>XII. 参考資料 .....</b>	<b>34</b>
1. 主な外国での発売状況 .....	34
2. 海外における臨床支援情報 .....	34
<b>XIII. 備考 .....</b>	<b>35</b>
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 .....	35
2. その他の関連資料 .....	36

## 略語表

なし（個別に各項目において解説する。）

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ロピニロール徐放錠 2mg「共創未来」及びロピニロール徐放錠 8mg「共創未来」は、共創未来ファーマ株式会社が発行医薬品として薬食発 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、2017 年 8 月に承認を取得し、2018 年 3 月に上市した。販売名変更のため、2019 年 1 月にロピニロール徐放錠 2mg「KMP」及びロピニロール徐放錠 8mg「KMP」の製造販売承認を取得、2023 年 6 月に上市した。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、D<sub>2</sub>クラス部位 (D<sub>2</sub>及び D<sub>3</sub>受容体に特異的) に対し高い親和性を示し、選択的に刺激することにより抗パーキンソン病作用を発現する。 (「VI.薬効薬理に関する項目 2.薬理作用」を参照)
- (2) 重大な副作用 (頻度不明) 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。 (「VIII.安全性 (使用上の注意等) に関する項目 8.副作用」を参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

- (1) 本剤はシングルユニット型の放出制御製剤であり、放出制御機構はマトリックスタイプである。 (「IV.製剤に関する項目 1.剤形」を参照)
- (2) 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。 (「VIII.安全性 (使用上の注意等) に関する項目 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」を参照)

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有 無	タイトル、参照先
医薬品リスク管理計画 (以下 RMP)	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### (1)承認条件

該当しない

#### (2)流通・使用上の制限事項

該当しない

### 6. RMP の概要

該当しない

## 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 「KMP」

ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」

(2) 洋名

ROPINIROLE CR TABLETS 2mg 「KMP」

ROPINIROLE CR TABLETS 8mg 「KMP」

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格（含量）＋「会社名（屋号）」

薬食審査発第 0922001 号（平成 17 年 9 月 22 日）に基づく

### 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）

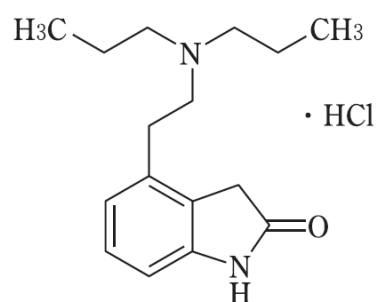
Ropinirole Hydrochloride（JAN）

(3) ステム（stem）

不明

### 3. 構造式又は示性式

構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O · HCl

分子量：296.84

### 5. 化学名（命名法）又は本質

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



6. 慣用名、別名、略号、記号番号  
該当資料なし

### 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

1) 各種溶媒における溶解度：水にやや溶けやすく、エタノール（99.5）に溶けにくい。

2) 各種 pH 溶媒に対する溶解度：該当資料なし

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点（分解点）：約 241℃

(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、定量法

確認試験法：(1) 赤外吸収スペクトル測定法（ATR 法）

(2) 塩化物の定性反応(2)

定量法：液体クロマトグラフィー







## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠（徐放錠：本剤はシングルユニット型の放出制御製剤であり、放出制御機構はマトリックスタイプである。）

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	色・剤形	外形			サイズ			
		表面	裏面	側面	長径 (mm)	短径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
ロピニロール徐放錠 2mg「KMP」	淡紅白色の楕円形のフィルムコーティング錠				12.6	6.9	6.4	438
ロピニロール徐放錠 8mg「KMP」	赤褐色の楕円形のフィルムコーティング錠				12.6	6.9	6.4	438

#### (3) 識別コード

該当資料なし

#### (4) 製剤の物性<sup>(1),(2)</sup>

販売名	ロピニロール徐放錠 2mg「KMP」	ロピニロール徐放錠 8mg「KMP」
硬度 (N)	206	210

#### (5) その他

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	ロピニロール徐放錠 2mg「KMP」	ロピニロール徐放錠 8mg「KMP」
有効成分 (1錠中)	ロピニロール塩酸塩・・・2.28mg (ロピニロールとして 2mg)	ロピニロール塩酸塩・・・9.12mg (ロピニロールとして 8mg)
添加剤	乳糖水和物、グリセリン脂肪酸エステル、カルメロース Na、エチルセルロース、ヒプロメロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄	乳糖水和物、グリセリン脂肪酸エステル、カルメロース Na、エチルセルロース、ヒプロメロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、黒酸化鉄

添加剤添加目的

添加剤	添加目的
乳糖水和物	賦形剤
グリセリン脂肪酸エステル	滑沢剤
カルメロース Na	マトリックス基剤
エチルセルロース	結合剤
ヒプロメロース	素錠部：マトリックス基剤 コーティング部：コーティング剤
軽質無水ケイ酸	滑沢剤
ステアリン酸 Mg	滑沢剤
マクロゴール 6000	コーティング剤
タルク	コーティング剤
酸化チタン	コーティング剤
三二酸化鉄	着色剤
黄色三二酸化鉄	着色剤
黒酸化鉄 (8mg のみ)	着色剤

(2) 電解質等の濃度  
該当しない

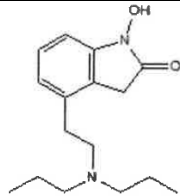
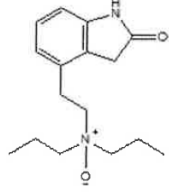
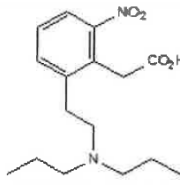
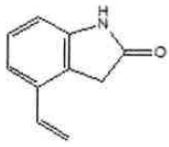
(3) 熱量  
該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量  
該当しない

4. 力価  
該当しない

## 5. 混入する可能性のある夾雑物

名称・化合物名	化学式	構造式	起源
類縁物質 A (open ring nitro derivative)	2-[2-[2-(Dipropylamino)ethyl]-6-nitrophenyl]acetic acid hydrochloride		副生成物
類縁物質 B (Monopropyl ropinirole)	4-[2-(Propylamino)ethyl]indolin-2-one hydrochloride		副生成物、 分解生成物
類縁物質 C (N-hydroxy ropinirole)	4-[2-(Dipropylamino)ethyl]-1-hydroxyindolin-2-one hydrochloride		副生成物
類縁物質 D (Ropinirole related compound B)	4-[2-(dipropylamino)ethyl]-1H-indol-2,3-dione hydrochloride		副生成物、 分解生成物
Monopropyl Ropinirole	4-[2-(Propylamino)ethyl]-1,3-dihydro-2H-indol-2-one		原薬製造工程由来
Compound A	4-(2-Hydroxyethyl)-1,3-dihydro-2H-indol-2-one		酸化分解生成物
Compound B	4-[2-(Dipropylamino)ethyl]-1H-indol-2,3-dione		原薬製造工程由来 副生成物
3-Hydroxymethyl Ropinirole	4-[2-(Dipropylamino)ethyl]-3-hydroxymethyl-1,3-dihydro-2H-indol-2-one		副生成物

N-Hydroxy Ropinirole	4-[2-(Dipropylamino)ethyl]-1-hydroxy-1,3-dihydro-2H-indol-2-one		原薬製造工程由来
Ropinirole N-Oxide	N-[2-(2-oxo-1,3-dihydro-2H-indol-4-yl)ethyl]-N-propyl-propan-1-amino oxide		酸化分解生成物
Nitro Ropinirole	{2-[2-(Dipropylamino)ethyl]-6-nitrophenyl}acetic acid		原薬製造工程由来
4-Ethenyl-1,3-dihydro-2H-indol-2-one	4-Ethenyl-1,3-dihydro-2H-indol-2-one		副生成物

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

### (1) ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」<sup>(1)</sup>

加速試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
40±1℃、75±5%RH	PTP 包装 (PTP+アルミピロー包装 (乾燥剤入り))	6 ヶ月	純度試験：規格外
40±1℃、75±5%RH	バラ包装 (ポリエチレン瓶 (乾燥剤入り))	6 ヶ月	純度試験：規格外

項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、含量

長期保存試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
25±2℃、60±5%RH	PTP 包装 (PTP+アルミピロー包装 (乾燥剤入り))	24 ヶ月	規格内
25±2℃、60±5%RH	バラ包装 (ポリエチレン瓶 (乾燥剤入り))	24 ヶ月	規格内

項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、含量

無包装状態における安定性：

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加温	40℃	PTP+アルミピロー包装	3 ヶ月	変化なし
加湿	25℃、75%RH	シャーレ (開放)	1 ヶ月	錠厚：6.32mm→6.85mm
			3 ヶ月	錠厚：6.32mm→6.87mm
曝光	D65 蛍光灯 4000Lux 25℃、60%RH	シャーレ (ラップ)	120 万 Lux・hr	変化なし

項目：性状、溶出性、含量、硬度 (参考値)

(2) ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」<sup>②</sup>

加速試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
40±1℃、75±5%RH	PTP 包装 (PTP+アルミピロー包装 (乾燥剤入り))	6 ヶ月	規格内
40±1℃、75±5%RH	バラ包装 (ポリエチレン瓶 (乾燥剤入り))	6 ヶ月	規格内

項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、含量

無包装状態における安定性：

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加温	40℃	PTP+アルミピロー包装	3 ヶ月	変化なし
加湿	25℃、75%RH	シャーレ (開放)	1 ヶ月	錠厚：6.33mm→6.91mm
			3 ヶ月	錠厚：6.33mm→6.87mm
曝光	D65 蛍光灯 4000Lux 25℃、60%RH	シャーレ (ラップ)	120 万 Lux・hr	変化なし

項目：性状、溶出性、含量、硬度 (参考値)

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当資料なし

9. 溶出性

(1) 規格及び試験方法

ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」及びロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法 (回転バスケット法)

試験液：溶出試験第 2 液 900mL

回転数：100rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：4.5 時間、9 時間及び 24 時間後の溶出率がそれぞれ 13～37%、33～57%、70%以上のときは適合とする。

(2) 生物学的同等性試験

・ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」<sup>③</sup>

ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」について、「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) に従い溶出試験を行った。

<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH3.0、pH6.8、水  
pH6.8(1.0%ポリソルベート80含有)

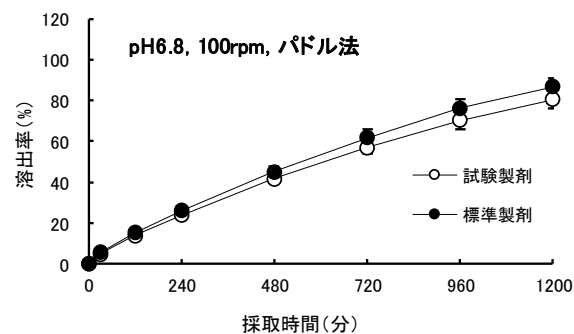
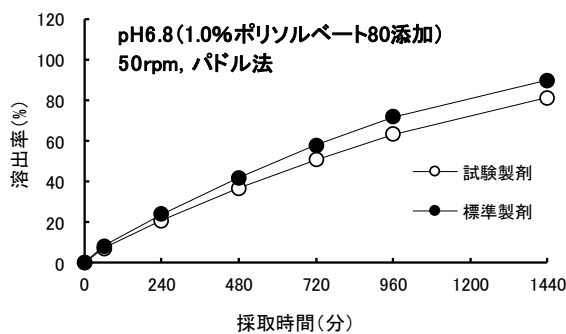
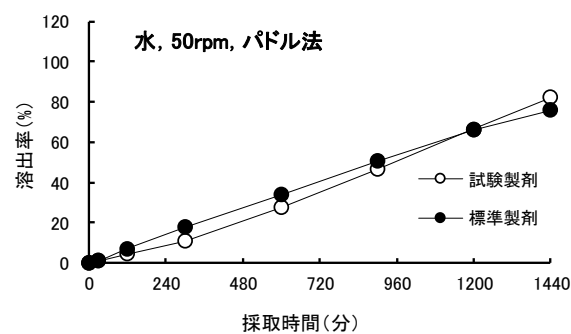
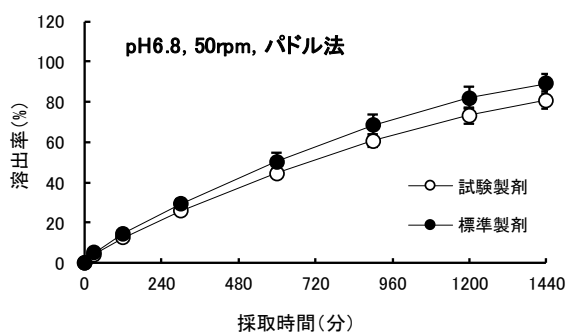
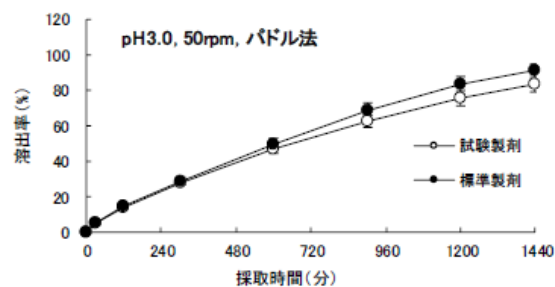
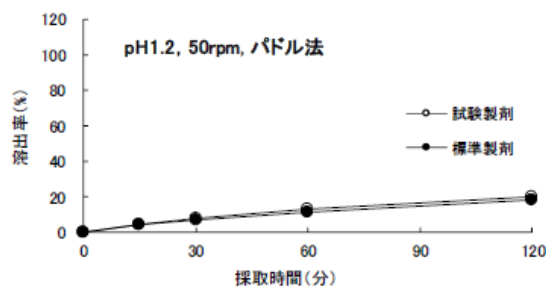
回転数 : 50rpm、100rpm、200rpm

試験製剤 : ロビニロール徐放錠2mg「KMP」

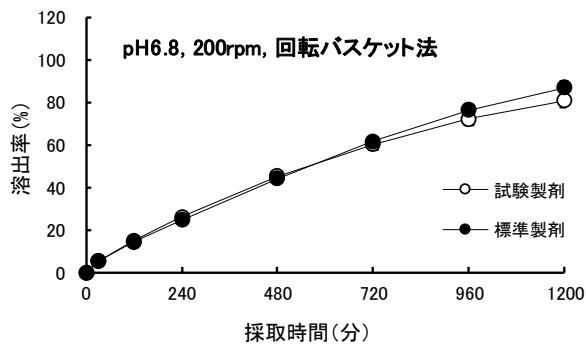
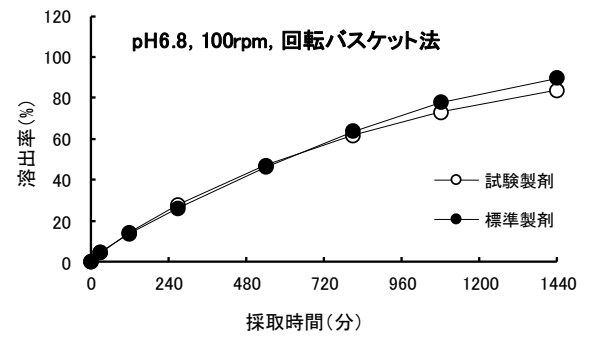
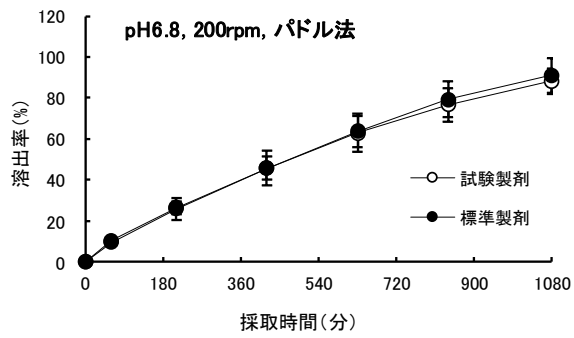
検体数 : n=12

試験法 : パドル法、回転バスケット法

標準製剤 : 錠剤、2mg







試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験法	試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	同等性の判定基準	判定
	回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験製剤	標準製剤			
パドル法	50	pH 1.2	30	7.9	7.3	0.6	標準製剤の平均溶出率の $\pm 6\%$ 以内	適
			120	20.5	18.2	2.3		
		pH 3.0	300	28.1	29.2	-1.1	標準製剤の平均溶出率の $\pm 10\%$ 以内	適
			600	47.2	50.0	-2.8		
			1200	76.0	83.5	-7.5		
		pH 6.8	300	25.8	29.2	-3.4		適
			600	44.6	50.3	-5.7		
			1200	73.3	82.0	-8.7		
		水	600	27.6	34.0	-6.4	標準製剤の平均溶出率の $\pm 8\%$ 以内	適
			1440	82.3	75.9	6.4		
		pH 6.8 +1.0%PS*	240	20.9	24.0	-3.1	標準製剤の平均溶出率の $\pm 10\%$ 以内	適
			720	50.8	57.8	-7.0		
			960	63.3	71.7	-8.4		
	100	pH 6.8	240	24.0	26.1	-2.1		適
			480	41.6	45.0	-3.4		
			960	70.3	76.3	-6.0		
	200	pH 6.8	210	25.9	26.5	-0.6		適
			420	45.8	45.9	-0.1		
			840	76.8	79.3	-2.5		
回転バスケット法	100	pH 6.8	270	28.0	26.2	1.8	標準製剤の平均溶出率の $\pm 10\%$ 以内	適
			540	47.2	46.4	0.8		
			1080	73.2	77.8	-4.6		
	200	pH 6.8	240	26.1	24.7	1.4		適
			480	45.1	44.1	1.0		
			960	72.0	76.4	-4.4		

\*PS : ポリソルベート 80

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。従って、ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」と標準製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

・ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」 ④

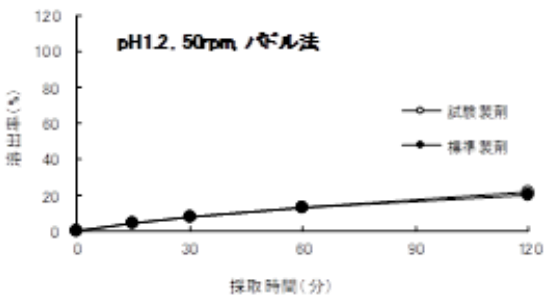
ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」 について、「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号）（以下、ガイドライン）に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」 を標準製剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験製剤の処方変更水準は、ガイドラインにより B 水準に該当した。

＜測定条件＞

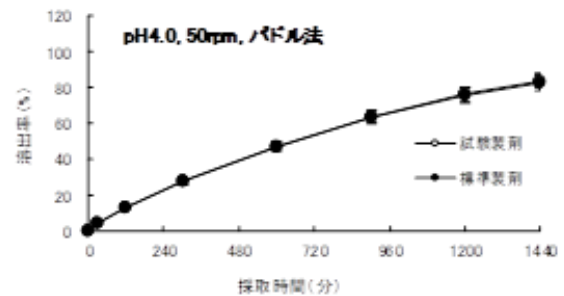
試験液： pH1.2、pH4.0、pH6.8、水  
pH6.8(1.0%ポリソルベート80 含有)  
回転数： 50rpm、100rpm、200rpm  
試験製剤： ロピニロール徐放錠8mg「KMP」

検体数： n=12

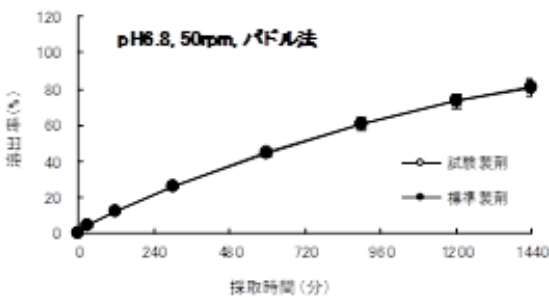
試験法： バドル法、回転バスケット法  
標準製剤： ロピニロール徐放錠2mg「KMP」



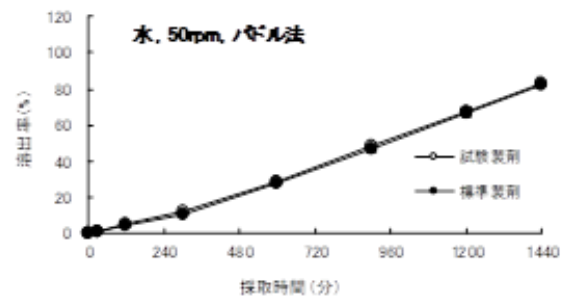
時間(分)	0	15	30	60	120
試験製剤	0	4.9	8.3	13.6	21.7
標準製剤	0	0.2	0.2	0.3	0.4
標準製剤	0	4.8	7.9	12.9	20.5
標準偏差	0	0.2	0.3	0.4	0.5



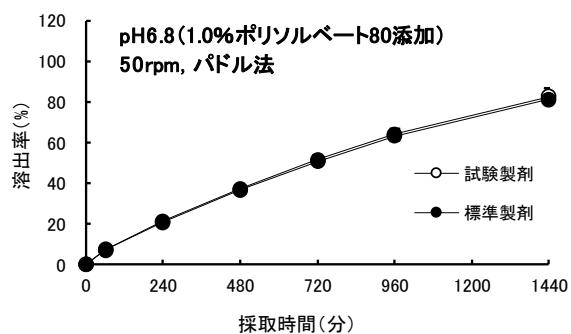
時間(分)	0	30	120	300	600	900	1200	1440
試験製剤	0	4.7	13.6	27.7	47.4	63.8	76.4	84.1
標準製剤	0	0.1	0.4	1.0	2.2	3.5	4.1	4.2
標準製剤	0	4.8	13.7	27.7	47.4	63.4	75.8	83.0
標準偏差	0	0.3	0.6	1.2	2.4	3.5	4.2	4.2



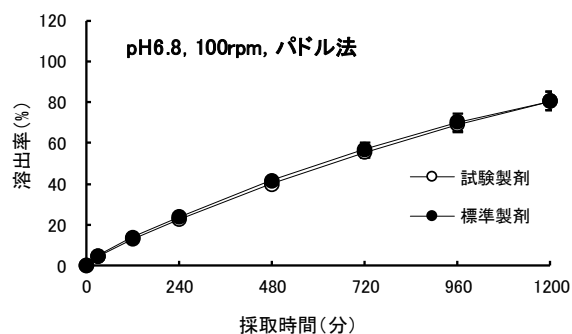
時間(分)	0	30	120	300	600	900	1200	1440
試験製剤	0	4.3	12.5	25.8	44.9	61.0	73.9	81.8
標準製剤	0	0.2	0.3	0.6	1.4	2.3	3.1	3.3
標準製剤	0	4.4	12.6	25.8	44.6	60.7	73.3	80.9
標準偏差	0	0.2	0.4	0.9	2.0	3.3	4.1	4.4



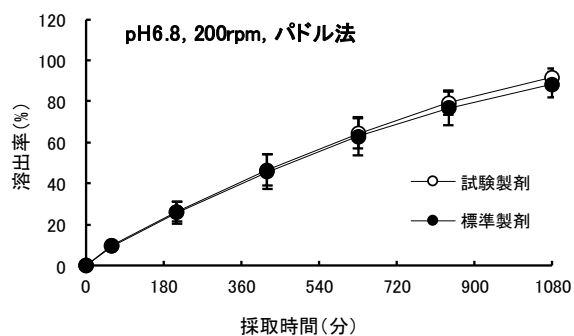
時間(分)	0	30	120	300	600	900	1200	1440
試験製剤	0	1.0	5.2	12.3	29.0	48.2	67.8	83.5
標準製剤	0	0.3	0.3	0.6	1.3	2.1	2.7	2.8
標準製剤	0	1.1	4.5	10.9	27.6	46.5	66.5	82.3
標準偏差	0	0.3	0.2	0.4	0.8	1.1	1.7	2.1



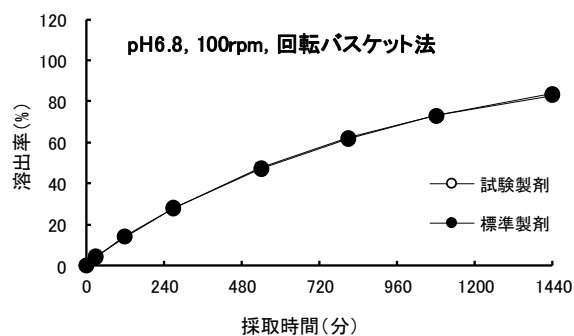
時間(分)	0	60	240	480	720	960	1440
試験製剤	0	7.3	21.3	37.3	51.5	64.0	82.5
標準偏差	0	0.2	0.5	1.2	2.1	3.0	4.0
標準製剤	0	7.2	20.9	36.7	50.8	63.3	81.2
標準偏差	0	0.2	0.4	0.8	1.3	2.1	2.0



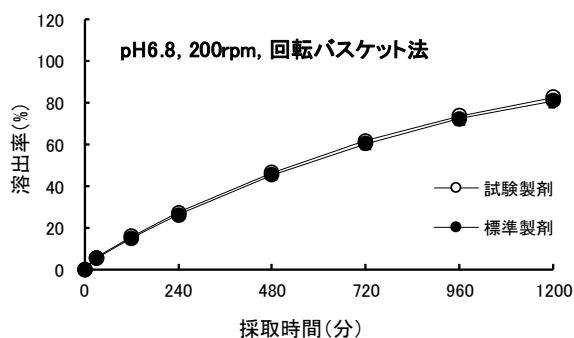
時間(分)	0	30	120	240	480	720	960	1200
試験製剤	0	4.6	13.1	22.6	39.9	55.6	69.3	80.6
標準偏差	0	0.2	0.4	0.7	1.7	2.8	3.7	4.5
標準製剤	0	5.0	14.0	24.0	41.6	57.1	70.3	80.6
標準偏差	0	0.2	0.5	0.8	1.8	3.0	4.1	4.5



時間(分)	0	60	210	420	630	840	1080
試験製剤	0	9.9	26.4	46.7	64.4	79.4	91.8
標準偏差	0	1.3	5.0	7.6	7.3	6.1	4.2
標準製剤	0	9.6	25.9	45.8	63.0	76.8	88.2
標準偏差	0	1.3	5.2	8.3	9.2	8.1	6.3



時間(分)	0	30	120	270	540	810	1080	1440
試験製剤	0	4.2	14.2	28.4	47.8	62.4	73.1	83.0
標準偏差	0	0.6	0.6	1.1	1.8	1.7	1.5	1.1
標準製剤	0	4.7	14.6	28.0	47.2	61.9	73.2	83.7
標準偏差	0	0.3	0.3	0.4	1.2	1.7	1.8	1.8



時間(分)	0	30	120	240	480	720	960	1200
試験製剤	0	5.5	15.7	27.1	46.4	61.7	73.5	82.5
標準偏差	0	0.2	0.6	0.9	0.8	1.4	1.9	2.1
標準製剤	0	5.1	15.0	26.1	45.1	60.3	72.0	80.6
標準偏差	0	0.3	0.8	1.1	1.9	2.5	3.0	3.1

① 試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件				平均溶出率(%)		平均 溶出率 の差 (%)	同等性の 判定基準	判定
試験法	回転数 (rpm)	試験液	採取 時間 (分)	試験 製剤	標準 製剤			
パドル法	50	pH 1.2	30	8.3	7.9	0.4	標準製剤の平均溶出率 の±6%以内	適
			120	21.7	20.5	1.2		
		pH 4.0	300	27.7	27.7	0.0	標準製剤の平均溶出率 の±10%以内	適
			600	47.4	47.4	0.0		
			1440	84.1	83.0	1.1		
		pH 6.8	300	25.8	25.8	0.0		適
			600	44.9	44.6	0.3		
			1440	81.8	80.9	0.9		
		水	600	29.0	27.6	1.4		適
			900	48.2	46.5	1.7		
			1440	83.5	82.3	1.2		
		pH 6.8 +1.0%PS*	480	37.3	36.7	0.6		適
			720	51.5	50.8	0.7		
			1440	82.5	81.2	1.3		
	100	pH 6.8	240	22.6	24.0	-1.4		適
			720	55.6	57.1	-1.5		
			1200	80.6	80.6	0.0		
	200	pH 6.8	210	26.4	25.9	0.5		適
			420	46.7	45.8	0.9		
			840	79.4	76.8	2.6		
回転バスケット法	100	pH 6.8	270	28.4	28.0	0.4		適
			540	47.8	47.2	0.6		
			1440	83.0	83.7	-0.7		
	200	pH 6.8	240	27.1	26.1	1.0		適
			480	46.4	45.1	1.3		
			1200	82.5	80.6	1.9		

\*PS : ポリソルベート 80

(n=12)

②-1 最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率

試験条件				(a) 最小値 ～最大値 (%)	(b) 平均溶出 率±9%の 範囲(%)	(a)が(b) を超え た数	同等性の 判定基準	判定
試験法	回転数 (rpm)	試験液	採取 時間 (分)					
パドル法	50	pH 1.2	120	21.0 ～22.3	12.7 ～30.7	0	最終比較時点における 個々の溶出率について、 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 のがない	適

(n=12)

②-2 最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率

試験条件				(a) 最小値～ 最大値 (%)	(b) 平均溶出 率±15% の範囲 (%)	(a)が(b) を超えた 数	同等性の 判定基準	判定
試験法	回転数 (rpm)	試験液	採取 時間 (分)					
パドル法	50	pH 4.0	1440	73.6 ～90.1	69.1 ～99.1	0	最終比較時点におけ る個々の溶出率につ いて、試験製剤の平均 溶出率±15%の範囲 を超えるものが12個 中1個以下で、±25% の範囲を超えるもの がない	適
		pH 6.8	1440	73.2 ～86.9	66.8 ～96.8	0		適
		水	1440	79.6 ～89.7	68.5 ～98.5	0		適
		pH 6.8 +1.0% PS*	1440	70.6 ～86.8	67.5 ～97.5	0		適
	100	pH 6.8	1200	68.8 ～85.6	65.6 ～95.6	0		適
	200	pH 6.8	840	68.8 ～91.3	64.4 ～94.4	0		適
回転バスケット法	100	pH 6.8	1440	81.9 ～85.6	68.0 ～98.0	0	最終比較時点におけ る個々の溶出率につ いて、試験製剤の平均 溶出率±15%の範囲 を超えるものが12個 中1個以下で、±25% の範囲を超えるもの がない	適
	200	pH 6.8	1200	79.7 ～85.8	67.5 ～97.5	0		適

\*PS：ポリソルベート 80

(n=12)

①②の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。従って、ロピニロール徐放錠 8mg「KMP」と標準製剤（ロピニロール徐放錠 2mg「KMP」）は、生物学的に同等であるとみなされた。

## 10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報  
該当しない

### (2) 包装

ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」：56 錠 (PTP14 錠×4)  
100 錠 (バラ)

ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」：56 錠 (PTP14 錠×4)  
100 錠 (バラ)

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTP 包装

PTP：ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔

アルミピロー：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム (乾燥剤入り (合成ゼオライト))

バラ包装

瓶：ポリエチレン

蓋：ポリエチレン (乾燥剤入り (合成ゼオライト))

## 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

## 12. その他

錠剤等の一包化調剤に用いる自動調剤分包機での落下耐久性等の各種調剤機器適合性：有  
(「XⅢ.備考 2.その他の関連資料」を参照)

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果 パーキンソン病

### 2. 効能又は効果に関連する注意 設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

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。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠 該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### <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) 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。

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ 該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験 該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験 該当資料なし

#### (4) 検証的試験 1) 有効性検証試験 該当資料なし



- 2) 安全性試験  
該当資料なし
- (5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容  
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調査・試験の概要  
該当資料なし
- (7) その他  
該当資料なし

## 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

ドパミン、ブロモクリプチンメシル酸塩、ペルゴリドメシル酸塩、カベルゴリン、タリペキソール塩酸塩、プラミペキソール塩酸塩水和物

注意：関連のある化合物の効能・効果等は最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>⑤</sup>

D<sub>2</sub>クラス部位（D<sub>2</sub>及びD<sub>3</sub>受容体に特異的）に対し高い親和性を示し、選択的に刺激することにより抗パーキンソン病作用を発現する。

#### (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

#### (1) 治療上有効な血中濃度

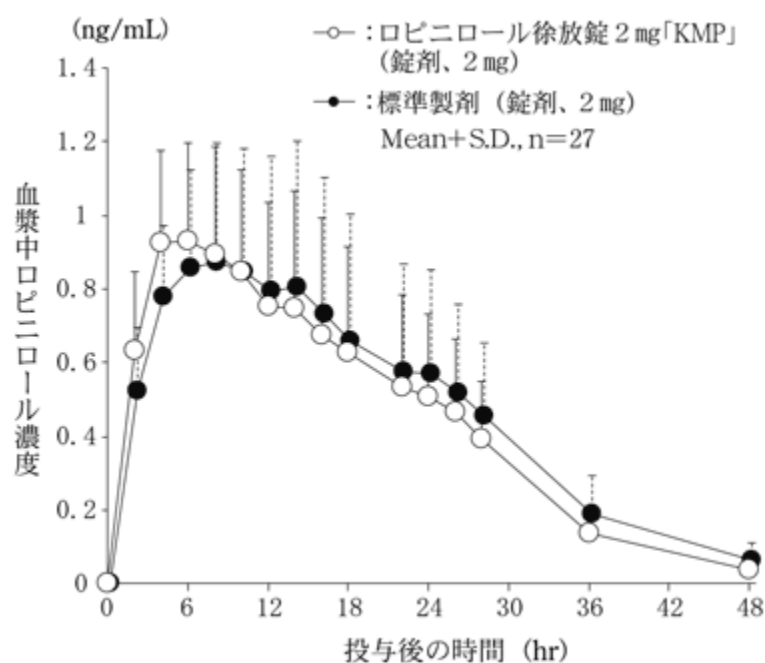
該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 1) ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」<sup>⑥</sup>

ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」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 2mg）健康成人男子に絶食（n=27）及び食後（n=28）経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C<sub>max</sub>）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。

##### ① 絶食投与



②

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>48</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」 (錠剤, 2mg)	21.83 ± 6.74	1.0373 ± 0.3122	6.4 ± 3.2	6.28 ± 2.12
標準製剤 (錠剤, 2mg)	22.87 ± 8.31	0.9629 ± 0.3594	8.3 ± 3.8	6.99 ± 2.56

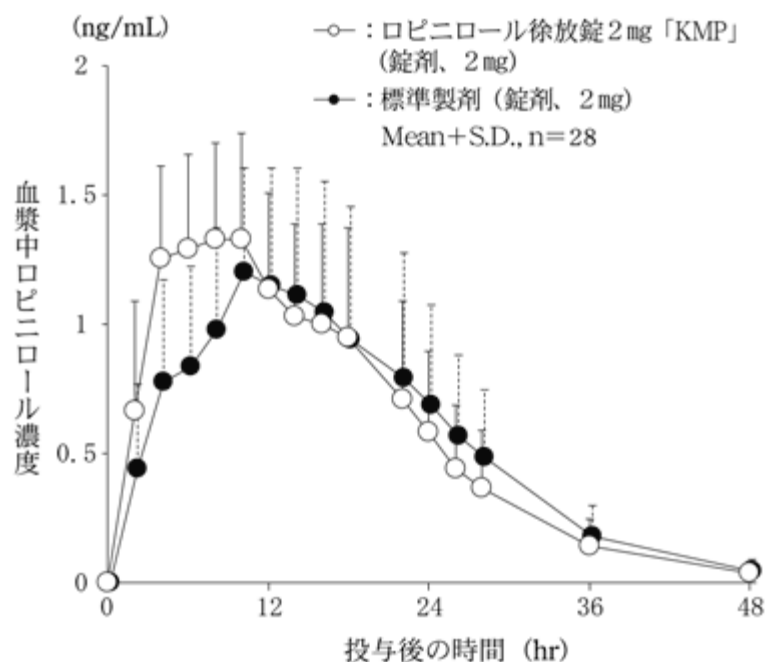
(Mean ± S.D., n=27)

血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 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。

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

パラメータ	AUC <sub>48</sub>	Cmax
平均値の差	0.9609	1.0878
平均値の差の90%信頼区間	log(0.8797)~log(1.0495)	log(1.0180)~log(1.1623)

③ 食後投与



④

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>48</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」 (錠剤、2mg)	28.63 ± 9.39	1.5080 ± 0.3667	7.2 ± 2.9	6.17 ± 1.52
標準製剤 (錠剤、2mg)	27.40 ± 10.73	1.3387 ± 0.4494	10.6 ± 4.0	6.19 ± 1.58

(Mean ± S.D., n=28)

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。

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

パラメータ	AUC <sub>48</sub>	Cmax
平均値の差	log(1.0656)	log(1.1547)
平均値の差の90%信頼区間	log(1.0045)~log(1.1305)	log(1.0803)~log(1.2342)

2) ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」

ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」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、ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」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.製剤に関する項目 9.溶出性」を参照)

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「VIII.安全性(使用上の注意等)に関する項目 7.相互作用」を参照

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) 消失速度定数

1) 絶食投与  $kel : 0.1207 \pm 0.0351 \text{ hr}^{-1}$  (健康成人男子、絶食経口投与)

2) 食後投与  $kel : 0.1184 \pm 0.0274 \text{ hr}^{-1}$  (健康成人男子、食後経口投与)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 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

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

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

本剤は主として肝臓で代謝される。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

本剤は主に CYP1A2 により代謝される。

(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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

本剤は主として腎臓で排泄される。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

血液透析による除去の効果については不明である。

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

（インタビューフォーム記載要領 2013 に準拠）

### 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女性（「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

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

#### ＜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) 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。

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 1. 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もある。〕
- (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「ロピニロール塩酸塩錠 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

### 2. 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「ロピニロール塩酸塩錠 0.25mg、同 1 mg、同 2 mg」と同一であるが、用法・用量が異なることに注意すること。また、ロピニロール塩酸塩錠（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  
設定されていない

- (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。
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	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	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。



フルボキサミン等	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。	
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）

- 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）
- 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。
- 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。

### (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、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 <sup>注)</sup> （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

9. 高齢者への投与

5. 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

6. 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女性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) 授乳中の女性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ロピニロール塩酸塩製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

7. 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

8. 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

9. 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、嚙んだり、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

### 10. 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

該当資料なし

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験  
該当資料なし
- (2) 安全性薬理試験  
該当資料なし
- (3) 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) 遺伝毒性試験  
該当資料なし
- (4) がん原性試験  
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験  
該当資料なし
- (7) 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

製 剤：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）

有効成分：劇薬

### 2. 有効期間

ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」 有効期間：2 年

ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」 有効期間：3 年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

#### 【取扱い上の注意】

##### 安定性試験

##### (1) ロピニロール徐放錠 2 mg 「KMP」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、2 年）及び加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）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<sup>4)</sup>。

##### (2) ロピニロール徐放錠 8 mg 「KMP」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された<sup>5)</sup>。

### 5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：有、くすりのしおり：有

その他の患者向け資料：有（「XⅢ.備考 2.その他の関連資料」を参照）

### 6. 同一成分・同効薬

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

同 効 薬：ブロモクリプチンメシル酸塩、ペルゴリドメシル酸塩、カベルゴリン、プラミペキソール塩酸塩水和物、プラミペキソール塩酸塩水和物徐放錠

### 7. 国際誕生年月日

1996 年 7 月 8 日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

(1) ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
製造販売承認	2017 年 8 月 15 日	22900AMX00907000	2017 年 12 月 8 日	2018 年 3 月 1 日
製造販売承認 (販売名変更)	2019 年 1 月 22 日	23100AMX00117000	2023 年 6 月 16 日	〃

旧販売名：ロピニロール徐放錠 2mg 「共創未来」 経過措置期間満了：2024 年 3 月 31 日

(2) ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
製造販売承認	2017 年 8 月 15 日	22900AMX00908000	2017 年 12 月 8 日	2018 年 3 月 1 日
製造販売承認 (販売名変更)	2019 年 1 月 22 日	23100AMX00125000	2023 年 6 月 16 日	〃

旧販売名：ロピニロール徐放錠 8mg 「共創未来」 経過措置期間満了：2024 年 3 月 31 日

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」	1169013G1065	〃	125834901	622583402
ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」	1169013G2061	〃	125835601	622583502

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## X I. 文献

### 1. 引用文献

- (1) 共創未来ファーマ(株)社内資料：安定性試験（錠 2mg）
- (2) 共創未来ファーマ(株)社内資料：安定性試験（錠 8mg）
- (3) 共創未来ファーマ(株)社内資料：溶出試験（錠 2mg）
- (4) 共創未来ファーマ(株)社内資料：溶出試験（錠 8mg）
- (5) グッドマン・ギルマン薬理書 第 12 版, 770, 2013
- (6) 共創未来ファーマ(株)社内資料：生物学的同等性試験（錠 2mg）
- (7) 共創未来ファーマ(株)社内資料：全自動分包機落下試験

### 2. その他の参考文献

添付文書主要文献

- |  |
|--|
| <ol style="list-style-type: none"><li>1) 共創未来ファーマ(株)社内資料：生物学的同等性試験（錠 2mg）</li><li>2) 共創未来ファーマ(株)社内資料：生物学的同等性試験（錠 8mg）</li><li>3) グッドマン・ギルマン薬理書 第 12 版, 770, 2013</li><li>4) 共創未来ファーマ(株)社内資料：安定性試験（錠 2mg）</li><li>5) 共創未来ファーマ(株)社内資料：安定性試験（錠 8mg）</li></ol> |
|--|

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし



## XIII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

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。

掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について（その 3）」（令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

#### (1) 粉砕

該当資料なし（ロピニロール徐放錠「KMP」は徐放性製剤であり、粉砕した場合、放出制御機能が損なわれてしまうため、粉砕は避けること。）

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし（ロピニロール徐放錠「KMP」は徐放性製剤であり、温湯を吸い取り崩壊させることにより徐放性が損なわれる可能性があることから簡易懸濁法対象外とした。）

（参考） 添付文書記載事項

#### 【使用上の注意】

### 9. 適用上の注意

(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。

## 2. その他の関連資料

### (1) 錠剤等の一包化調剤に用いる自動調剤分包機での落下耐久性等の各種調剤機器適合性<sup>7)</sup>

#### 1) ロピニロール徐放錠 2mg 「KMP」

機器名	型式	メーカー名	一包化条件	結果
全自動錠剤分包機 PROUD	YS-TR-260FDS II	株式会社湯山製作所	カセット位置：最上段 1包中の錠剤数：5錠	割れ・欠けは認められなかった。
全自動錠剤分包機 Eser	HP-j128HS-GP	株式会社タカゾノ	分包数：50包 錠剤数：250錠	割れ・欠けは認められなかった。

#### 2) ロピニロール徐放錠 8mg 「KMP」

機器名	型式	メーカー名	一包化条件	結果
全自動錠剤分包機 PROUD	YS-TR-260FDS II	株式会社湯山製作所	カセット位置：最上段 1包中の錠剤数：5錠	割れ・欠けは認められなかった。
全自動錠剤分包機 Eser	HP-j128HS-GP	株式会社タカゾノ	分包数：50包 錠剤数：250錠	割れ・欠けは認められなかった。

### (2) その他の患者向け資料

- ・ロピニロール徐放錠 2mg/8mg 「KMP」 を服用される方とご家族の方へ  
販売名（屋号）変更「共創未来」→「KMP」版は現在作成中です。

**ロピニロール徐放錠2mg/8mg「共創未来」  
を服用される方とご家族の方へ**

この薬を正しく服用するため、飲む前に必ずお読みください。

●この薬を飲むと、眠くなったり、前兆もなく急に眠り込んでしまうこと（突発的睡眠）があります。  
自動車の運転、危険を伴う機械の操作、高いところでの作業などは避けてください

**突発的睡眠について**  
食事中や会話の最中などにも急に眠り込んでしまうことがあります。また、このような症状は、薬を飲み始めて1年以上経過してから見られる場合もあります。

●衝動制御障害や、以下のようなことが起こったら、すぐに医師または薬剤師に連絡してください。  
・急激な眠りこみ ・発熱や意識がぼんやりした状態  
・幻覚や妄想 ・筋肉のこわばりがひどい状態  
・めまいや立ちくらみ（ふらつき）

**衝動制御障害（病的賭博、強迫性購買、病的性欲亢進、暴食等）**  
社会的に不利な結果を招くにもかかわらず、ギャンブルや過剰で無計画な買い物を取り戻したり、病的に性欲や食欲が亢進したりすること。

●この薬はゆっくり溶け出し、長時間血中に留まるように設計されているので、割ったり砕いたりしないで、そのまま崩さずに飲んでください。  
●飲み方は、必ず医師の指示に従ってください。自分の判断で飲む量を変えたり、飲むのを止めたりしないでください。また、できるだけ毎日同じ時間帯にお飲みください。  
●この他にも、気になることやわからないことがある場合は、医師または薬剤師に相談してください。

製造販売元  
**共創未来ファーマ株式会社**

2019年4月19日  
A000000042

- ・共創未来ファーマ株式会社 製品情報ホームページ「医療関係者の方へ」  
<http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html>

- ・「X I.文献」に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。  
共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室  
〒155-8655 東京都世田谷区代沢 5-2-1  
TEL 050-3383-3846

製造販売元  
**共創未来ファーマ株式会社**  
東京都品川区広町 1-4-4