2023年3月改訂（第17版）

日本標準商品分類番号
871179

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

精神神経用剤

ハロペリドール細粒1%「タカタ」

日本薬局方　ハロペリドール細粒

ハロペリドール錠1mg「タカタ」
ハロペリドール錠2mg「タカタ」

日本薬局方　ハロペリドール錠

HALOPERIDOL

剤形	細粒剤、錠剤（裸錠）
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	ハロペリドール細粒1%「タカタ」：1g中 ハロペリドール10mg ハロペリドール錠1mg「タカタ」：1錠中 ハロペリドール1mg ハロペリドール錠2mg「タカタ」：1錠中 ハロペリドール2mg
一般名	和　名：ハロペリドール（JAN） 洋　名：Haloperidol（JAN、INN）
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7月9日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2018年12月14日（販売名変更による） 発売年月日：2018年12月14日（販売名変更による）
開発・製造販売(輸入) ・提携・販売会社名	製造販売元：高田製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社　TEL:0120-989-813　FAX:048-816-4183 医療関係者向けホームページ　https://www.takata-seiyaku.co.jp

本IFは2020年3月改訂(第21版)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、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医療機器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があり、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、今後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）

目　次

Ⅰ．概要に関する項目 1
1. 開発の経緯 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 1
Ⅱ．名称に関する項目 3
1. 販売名 3
2. 一般名 3
3. 構造式又は示性式 3
4. 分子式及び分子量 3
5. 化学名（命名法） 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 3
7. CAS 登録番号 4
Ⅲ．有効成分に関する項目 5
1. 物理化学的性質 5
2. 有効成分の各種条件下における安定性 5
3. 有効成分の確認試験法 5
4. 有効成分の定量法 5
Ⅳ．製剤に関する項目 6
1. 剤形 6
2. 製剤の組成 6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 7
4. 製剤の各種条件下における安定性 7
5. 調製法及び溶解後の安定性 14
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） 14
7. 溶出性 15
8. 生物学的試験法 15
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 15
10. 製剤中の有効成分の定量法 15
11. 力価 16
12. 混入する可能性のある夾雑物 16
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 16
14. その他 16
Ⅴ．治療に関する項目 17
1. 効能又は効果 17
2. 用法及び用量 17
3. 臨床成績 17
Ⅵ．薬効薬理に関する項目 19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 19
2. 薬理作用 19
Ⅶ．薬物動態に関する項目 20
1. 血中濃度の推移・測定法 20
2. 薬物速度論的パラメータ 20
3. 吸収 21
4. 分布 21
5. 代謝 21
6. 排泄 22
7. トランスポーターに関する情報 22
8. 透析等による除去率 22
Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目 23
1. 警告内容とその理由 23
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） 23
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 ..23
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 ..23
5. 慎重投与内容とその理由 23
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 24
7. 相互作用 24
8. 副作用 26
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 29
14. 適用上の注意 29
15. その他の注意 29
16. その他 29
Ⅸ．非臨床試験に関する項目 30
1. 薬理試験 30
2. 毒性試験 30
Ⅹ．管理的事項に関する項目 31
1. 規制区分 31
2. 有効期間又は使用期限 31
3. 貯法・保存条件 31
4. 薬剤取扱い上の注意点 31
5. 承認条件等 31
6. 包装 31
7. 容器の材質 31
8. 同一成分・同効薬 32
9. 国際誕生年月日 32
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 32
11. 薬価基準収載年月日 32
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 32
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 32
14. 再審査期間 32
15. 投与期間制限医薬品に関する情報 33
16. 各種コード 33
17. 保険給付上の注意 33
XI. 文献 34
1. 引用文献 34
2. その他の参考文献 34
XII. 参考資料 35
1. 主な外国での発売状況 35
2. 海外における臨床支援情報 35
XIII 備考 36
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 36
2. その他の関連資料 38

Ⅰ．概要に関する項目

1. 開発の経緯

ハロペリドールは1958年、ベルギーで合成されたブチロフェノン系抗精神病薬である。

1978年1月に、ハロステン細粒/錠1mg・2mgは塩野義製薬株式会社が承認を得た。

2006年8月に、医療事故防止対策に基づき、販売名をハロステン細粒からハロステン細粒1%に変更し承認を得た。

2012年8月に、塩野義製薬株式会社から高田製薬株式会社に承継した。

2018年7月に、医療事故防止対策に基づき、販売名をハロステン細粒1%からハロペリドール細粒1%「タカタ」に、ハロステン錠1mgからハロペリドール錠1mg「タカタ」に、ハロステン錠2mgからハロペリドール錠2mg「タカタ」にそれぞれ変更し承認を得た。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 薬理作用[1)]

項目			動物	ハロペリドール	クロルプロマジン
抗ドパミン作用	アンフェタミンによる運動亢進の抑制	ED_{50}	マウス	0.18 mg/kg *p.o.*	3.84 mg/kg *p.o.*
	アポモルフィンによるよじ登り行動の抑制	ED_{50}	マウス	0.17 mg/kg *p.o.*	1.97 mg/kg *p.o.*
	アポモルフィンによる嘔吐の抑制	ED_{50}	イヌ	0.15 mg/kg *p.o.*	3.27 mg/kg *p.o.*
	ドパミン受容体（D_2）への親和性	Ki	ラット線条体	0.8 nmol/L	8.6 nmol/L
抗ノルアドレナリン作用	ノルアドレナリンによる致死への拮抗	ED_{50}	マウス	37.39 mg/kg *p.o.*	5.67 mg/kg *p.o.*
	ノルアドレナリン受容体（α_1）への親和性	Ki	ラット大脳皮質	35 nmol/L	8 nmol/L
自発運動抑制作用		ED_{50}	マウス	0.40 mg/kg *p.o.*	4.39 mg/kg *p.o.*
抗セロトニン作用	トリプタミンによる首振り運動の抑制	ED_{50}	マウス	5.18 mg/kg *p.o.*	2.00 mg/kg *p.o.*
	セロトニン受容体（5-HT_2）への親和性	Ki	ラット大脳皮質	96 nmol/L	22 nmol/L
条件反射抑制作用		ED_{50}	ラット	0.97 mg/kg *p.o.*	15.09 mg/kg *p.o.*

ED_{50}：50%有効量、Ki：阻害定数

(2) 作用機序

ハロペリドールは、ブチロフェノン誘導体であるが、フェノチアジン系薬物と同様にドパミンD_2受容体遮断作用により統合失調症の陽性症状を改善する。[2)]

(3) 中枢神経系のドパミン受容体への親和性が高く、クロルプロマジンよりも強力な抗ドパミン作用を有する。[3)]

(4) 重大な副作用として、悪性症候群（Syndrome malin）、心室細動、心室頻拍、麻痺性イレウス、遅発性ジスキネジア、抗利尿ホルモン不適合分泌症候群（SIADH）、無顆粒球症、白血球減少、血小板減少、横紋筋融解症、肺塞栓症、深部静脈血栓症、肝機能障害、黄疸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」**参照）

Ⅱ．名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ハロペリドール細粒1%「タカタ」

ハロペリドール錠1mg「タカタ」

ハロペリドール錠2mg「タカタ」

(2) 洋名

Haloperidol Fine Granules 1% “TAKATA”

Haloperidol Tablets 1mg “TAKATA”

Haloperidol Tablets 2mg “TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ハロペリドール（JAN）

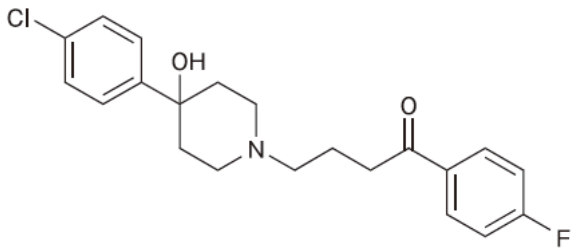
(2) 洋名（命名法）

Haloperidol（JAN、INN）

(3) ステム

抗精神病薬、ハロペリドール誘導体：－peridol

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{21}H_{23}ClFNO_2$

分子量：375.86

5. 化学名（命名法）

4-[4-(4-Chlorophenyl)-4-hydroxypiperidin-1-yl]-1-(4-fluorophenyl)butan-1-one（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

7. CAS 登録番号

52-86-8 (Haloperidol)

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～微黄色の結晶又は粉末である。

(2) 溶解性

酢酸（100）に溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、2-プロパノール又はエタノール（99.5）に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

認められない[3)]

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：150～154℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa=8.25（50%メタノール中で測定）[3)]

(6) 分配係数

52.2［*n*-オクタノール/リン酸緩衝液(pH7.4)］[4)]

(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

日局「ハロペリドール」の確認試験による。

4. 有効成分の定量法

日局「ハロペリドール」の定量法による。

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		ハロペリドール細粒 1%「タカタ」	ハロペリドール錠 1mg「タカタ」	ハロペリドール錠 2mg「タカタ」
性　状		白色～淡黄白色の細粒剤で、においはない。	白色の裸錠	白色の裸錠
外形	表面 直径	－	 約 5.0mm	 約 5.0mm
	裏面 重さ	－	 約 0.05g	 約 0.05g
	側面 厚さ	－	 約 2.3mm	 約 2.3mm
識別コード		－	TTS-051	TTS-052

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

「Ⅳ.1.(1) 剤形の区別、外観及び性状」参照

(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

ハロペリドール細粒 1%「タカタ」	1g中　ハロペリドール　10mg
ハロペリドール錠 1mg「タカタ」	1錠中　ハロペリドール　1mg
ハロペリドール錠 2mg「タカタ」	1 錠中　ハロペリドール　2mg

(2) 添加物

ハロペリドール細粒 1%「タカタ」	乳糖水和物、白糖、トウモロコシデンプン、メチルセルロース
ハロペリドール錠 1mg「タカタ」	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム
ハロペリドール錠 2mg「タカタ」	

(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

※必ず以下の留意点をご確認ください。
本剤の添付文書「貯法」の項に、以下の記載がございます。
「遮光・気密容器・室温保存」

(1) 長期保存試験

下記の保存条件において全て規格内であった。

●ハロペリドール細粒 1%「タカタ」[5)]

表 (3 ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
25℃ 60%RH / バラ包装 (プラスチック瓶/紙箱)	60 箇月	性状	白色の細粒剤で、においはない	白色の細粒剤で、においはない
		確認試験	適	適
		溶出性(%)	88-94	89-94
		定量法(%)	100.5-101.8	100.7-101.4

●ハロペリドール錠 1mg「タカタ」[6)]

表　　(3 ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
25℃ 60%RH / PTP 包装 (PTP/紙箱)	60 箇月	性状	白色の錠剤	白色の錠剤
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性(%)	90-100	90-101
		定量法(%)	98.4-99.7	98.5-99.3
25℃ 60%RH / バラ包装 (プラスチック瓶/紙箱)	60 箇月	性状	白色の錠剤	白色の錠剤
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性(%)	89-100	90-102
		定量法(%)	98.7-99.5	98.0-99.2

●ハロペリドール錠 2mg「タカタ」[7)]

表　　(3 ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
25℃ 60%RH / PTP 包装 (PTP/紙箱)	60 箇月	性状	白色の錠剤	白色の錠剤
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性(%)	92-102	94-101
		定量法(%)	95.7-97.7	98.5-100.1
25℃ 60%RH / バラ包装 (プラスチック瓶/紙箱)	60 箇月	性状	白色の錠剤	白色の錠剤
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性(%)	92-102	92-102
		定量法(%)	95.7-97.7	98.2-101.1

(2) 苛酷試験（製造販売後の試験結果）

本試験は、苛酷条件における安定性の結果（製造販売後）です。
最終包装形態以外の保存につきましては、医療機関様にてご判断いただきますよう、お願いします。

評価基準

【外観】

分類	評価基準	判定
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	◎
変化あり（規格内）	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場合	○
変化あり（規格外）	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合	△

【溶出性】又は【崩壊性】

分類	評価基準	判定
変化なし	規格値内の場合	◎
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

【含量】

分類	評価基準	判定
変化なし	含量低下が 3%未満の場合	◎
変化あり（規格内）	含量低下が 3%以上で、規格値内の場合	○
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

【硬度】

分類	評価基準	判定
変化なし	硬度変化が 30%未満の場合	◎
変化あり（規格内）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重以上の場合	○
変化あり（規格外）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重未満の場合	△

【その他の試験項目】

分類	評価基準	判定
変化なし	規格値内の場合	◎
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

平成 11 年 8 月 20 日付「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）」（日本病院薬剤師会）一部改変

●ハロペリドール細粒 1%「タカタ」[5)]

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1　　(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	外観	白色の細粒剤でにおいはない	白色の細粒剤でにおいはない		
	判定	－	◎		
	含量(%)	102.8	99.9	99.5	98.9
	判定	－	◎	○	○
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	白色の細粒剤でにおいはない	白色の細粒剤でにおいはない		
	判定	－	◎		
	含量(%)	102.8	99.9	100.5	100.5
	判定	－	◎	◎	◎

「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)に準じて判定した。
－：実施せず

表 2　　(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
室温 1000 lx / 気密	外観	白色の細粒剤でにおいはない	白色の細粒剤でにおいはない	
	判定	－	◎	
	含量(%)	102.8	99.4	99.6
	判定	－	○	○

「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)に準じて判定した。
－：実施せず

●ハロペリドール錠 1mg「タカタ」[6)]

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1　　(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ / 褐色ガラス瓶 気密	外観	白色の錠剤で、 においはない	白色の錠剤で、においはない		
	判定	－	◎		
	崩壊性(分)	3.1-5.4	2.0-3.4	2.6-3.8	2.3-3.8
	判定	－	◎	◎	◎
	含量(%)	98.2	102.2	101.5	101.6
	判定	－	◎	◎	◎
	硬度(kg 重)	2.5	2.4	2.3	2.3
	判定	－	◎	◎	◎
25℃ 75%RH / 開放	外観	白色の錠剤で、 においはない	白色の錠剤で、においはない		
	判定	－	◎		
	崩壊性(分)	3.1-5.4	1.3-2.3	2.3-3.5	2.8-4.6
	判定	－	◎	◎	◎
	含量(%)	98.2	101.9	102.5	102.3
	判定	－	◎	◎	◎
	硬度(kg 重)	2.5	1.9	1.8	1.8
	判定	－	◎	◎	◎

承認時の規格及び試験方法で試験を実施した。
「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)に準じて判定した。
－：実施せず

表 2　　(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果	
		試験開始時	60 万 lx・hr
25℃ 2500 lx / 気密	外観	白色の錠剤で、 においはない	白色の錠剤で、 においはない
	判定	―	◎
	崩壊性(分)	3.1-5.4	2.1-3.0
	判定	―	◎
	含量(%)	98.2	101.4
	判定	―	◎
	硬度(kg 重)	2.5	2.4
	判定	―	◎

承認時の規格及び試験方法で試験を実施した。
「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)に準じて判定した。
―：実施せず

●ハロペリドール錠 2mg「タカタ」[7)]

本剤は、「40℃、褐色ガラス瓶、気密」で 3 箇月間、「25℃、2500 lx、気密」で 60 万 lx・hr の保存条件では規格内であった。しかし、「25℃、75%RH、開放」で 3 箇月間の保存条件では硬度が規格外であったため、湿度に注意が必要である。

表 1 (1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ / 褐色ガラス瓶 気密	外観	白色の錠剤で、においはない	白色の錠剤で、においはない		
	判定	―	◎		
	崩壊性(分)	2.4-4.6	1.4-3.4	2.2-3.4	1.9-3.9
	判定	―	◎	◎	◎
	含量(%)	99.4	103.4	102.8	102.1
	判定	―	◎	◎	◎
	硬度(kg 重)	2.3	2.1	2.2	2.2
	判定	―	◎	◎	◎
25℃ 75%RH / 開放	外観	白色の錠剤で、においはない	白色の錠剤で、においはない		
	判定	―	◎		
	崩壊性(分)	2.4-4.6	2.0-3.0	1.9-2.2	2.5-4.2
	判定	―	◎	◎	◎
	含量(%)	99.4	102.7	102.7	101.8
	判定	―	◎	◎	◎
	硬度(kg 重)	2.3	1.7	1.7	1.6
	判定	―	◎	◎	△

承認時の規格及び試験方法で試験を実施した。
「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)に準じて判定した。
―：実施せず

表 2　　（1 ロット）

保存条件 ／ 保存形態	測定時期	結果	
		試験開始時	60 万 lx・hr
25℃ 2500 lx ／ 気密	外観	白色の錠剤で、 においはない	白色の錠剤で、 においはない
	判定	－	◎
	崩壊性(分)	2.4-4.6	2.3-4.1
	判定	－	◎
	含量(%)	99.4	102.9
	判定	－	◎
	硬度(kg 重)	2.3	2.2
	判定	－	◎

承認時の規格及び試験方法で試験を実施した。
「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)に準じて判定した。
－：実施せず

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（物理化学的変化）

●ハロペリドール細粒 1%「タカタ」：配合量（0.2g）

分類	販売名	配合量	実験条件	外観変化及び臭気発生の有無 観察時期 （直後、1日、3日、7日、14日）
薬 中枢神経用	ウインタミン細粒(10%)※1	1.5g	温度 25±2℃ 湿度 60±5%RH 照度 1000 lx	変化なし
	ヒルナミン細粒 10%※1	0.6g		
	ニューレプチル細粒 10%※1	0.2g		
	スルモンチール散 10%※1	0.6g		

<table>
<tr><th rowspan="3">分類</th><th rowspan="3">販売名</th><th rowspan="3">配合量</th><th rowspan="3">実験条件</th><th colspan="1">外観変化及び臭気発生の有無</th></tr>
<tr><th>観察時期</th></tr>
<tr><th>（直後、1日、3日、7日、14日）</th></tr>
<tr><td rowspan="2">アレルギー用薬</td><td>ピレチア細粒 10%※1</td><td>0.5g</td><td rowspan="3">温度 25±2℃
湿度 60±5%RH
照度 1000 lx</td><td rowspan="3">変化なし</td></tr>
<tr><td rowspan="6">消化器官用薬</td><td>コランチル配合顆粒※1</td><td>0.2g</td></tr>
<tr><td>ベリチーム配合顆粒</td><td>1.0g</td></tr>
<tr><td>アドソルビン原末</td><td>2.0g</td><td rowspan="5">温度 35±1℃
湿度 75%RH
照度 1000 lx</td><td rowspan="5">変化なし</td></tr>
<tr><td>酸化マグネシウム</td><td>0.5g</td></tr>
<tr><td>ジアスターゼ原末「マルイシ」</td><td>0.3g</td></tr>
<tr><td>炭酸水素ナトリウム</td><td>1.0g</td></tr>
<tr><td>ドグマチール細粒 50%※2</td><td>0.2g</td></tr>
</table>

※1：抗コリン作用を有する薬剤のため、本剤の使用上の注意に相互作用の記載がある。

※2：抗ドパミン作用を有する薬剤のため、本剤の使用上の注意に相互作用の記載がある。

7. 溶出性

(1) 公的溶出規格

●ハロペリドール細粒 1%「タカタ」

本剤は、日局「ハロペリドール細粒」の溶出規格に適合していることが確認されている。

●ハロペリドール錠 1mg・2mg「タカタ」

本剤は、局外規第 3 部に定められたハロペリドール錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

●ハロペリドール細粒 1%「タカタ」

日局「ハロペリドール細粒」の確認試験による。

●ハロペリドール錠 1mg・2mg「タカタ」

日局「ハロペリドール錠」の確認試験による。

10. 製剤中の有効成分の定量法

●ハロペリドール細粒 1%「タカタ」

日局「ハロペリドール細粒」の定量法による。

●ハロペリドール錠 1mg・2mg「タカタ」

日局「ハロペリドール錠」の定量法による。

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

統合失調症、そう病

2. 用法及び用量

通常、成人にはハロペリドールとして1日0.75～2.25mgからはじめ、徐々に増量する。

維持量として1日3～6mgを経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

本剤を増量する場合は慎重に行うこと。［本剤の急激な増量により悪性症候群（Syndrome malin）が起こることがある。］

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(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. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

ペルフェナジン、プロクロルペラジンマレイン酸塩、プロペリシアジン、クロルプロマジン塩酸塩、レボメプロマジンマレイン酸塩、フルフェナジンマレイン酸塩、ゾテピン[8)]

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ハロペリドールは、ブチロフェノン誘導体であるが、フェノチアジン系薬物と同様にドパミンD_2受容体遮断作用により統合失調症の陽性症状を改善する。[2)]

(2) 薬効を裏付ける試験成績

薬理作用[1)]

項目			動物	ハロペリドール	クロルプロマジン
抗ドパミン作用	アンフェタミンによる運動亢進の抑制	ED_{50}	マウス	0.18 mg/kg *p.o.*	3.84 mg/kg *p.o.*
	アポモルフィンによるよじ登り行動の抑制	ED_{50}	マウス	0.17 mg/kg *p.o.*	1.97 mg/kg *p.o.*
	アポモルフィンによる嘔吐の抑制	ED_{50}	イヌ	0.15 mg/kg *p.o.*	3.27 mg/kg *p.o.*
	ドパミン受容体（D_2）への親和性	Ki	ラット線条体	0.8 nmol/L	8.6 nmol/L
抗ノルアドレナリン作用	ノルアドレナリンによる致死への拮抗	ED_{50}	マウス	37.39 mg/kg *p.o.*	5.67 mg/kg *p.o.*
	ノルアドレナリン受容体（α_1）への親和性	Ki	ラット大脳皮質	35 nmol/L	8 nmol/L
自発運動抑制作用		ED_{50}	マウス	0.40 mg/kg *p.o.*	4.39 mg/kg *p.o.*
抗セロトニン作用	トリプタミンによる首振り運動の抑制	ED_{50}	マウス	5.18 mg/kg *p.o.*	2.00 mg/kg *p.o.*
	セロトニン受容体（5-HT_2）への親和性	Ki	ラット大脳皮質	96 nmol/L	22 nmol/L
条件反射抑制作用		ED_{50}	ラット	0.97 mg/kg *p.o.*	15.09 mg/kg *p.o.*

ED_{50}：50%有効量、Ki：阻害定数

(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

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

（参考）

健康成人7例にハロペリドール10mg（承認外用量）を単回経口投与したときの薬物動態パラメータは次のとおりである。[9]（外国人によるデータ）

（本剤の承認された維持量は1日3～6mgである。）

投与量 (mg)	*n*	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	AUC (ng・hr/mL)	$t_{1/2}$（β） (hr)
10	7	3.2±1.2	5.1±1.0	103.5±23.9	24.1±8.9

（測定法：ガスクロマトグラフィー）（mean±S.D.）

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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

生物学的利用率：約 60% [9]（外国人によるデータ）

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(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

血清蛋白結合率：92% [10]（外国人によるデータ）

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) 乳汁中への移行性

（参考）

ハロペリドール5mgを1日2回（承認外用量）投与したとき6日目の授乳婦の血漿中濃度は40ng/mL、母乳中濃度は23.5ng/mLであった。[11]（外国人によるデータ）

（本剤の承認された維持量は1日3～6mgである。）

(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

ハロペリドールは主に肝臓で代謝され、薬物代謝酵素CYP2D6及びCYP3A4が関与している。[12] その主代謝経路はピペリジン環水酸基のグルクロン酸抱合である。その他、ケトン基の還元による還元型ハロペリドールの生成、還元型ハロペリドールのフルオロベンゼン環2位の水酸化及びそのグルクロン酸抱合、硫酸抱合が主な経路である。

また、還元型ハロペリドールが酸化されて元のハロペリドールに再変換される経路も存在する。還元型ハロペリドールの2位水酸化にはCYP2D6が関与する。代謝物の還元型ハロペリドールには、ドパミン受容体（D_2）遮断作用はほとんどない。[13]

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

本剤は、主として薬物代謝酵素CYP2D6及びCYP3A4で代謝される。

(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

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

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

添付文書に記載なし

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. 昏睡状態にある患者［昏睡状態を悪化させるおそれがある。］
2. バルビツール酸誘導体等の中枢神経抑制剤の強い影響下にある患者［中枢神経抑制作用を増強させる。］
3. 重症の心不全患者［心筋に対する障害作用や血圧降下が報告されている。］
4. パーキンソン病又はレビー小体型認知症の患者［錐体外路症状が悪化するおそれがある。］
5. 本剤の成分又はブチロフェノン系化合物に対し過敏症の患者
6. アドレナリンを投与中の患者（アドレナリンをアナフィラキシーの救急治療に使用する場合を除く）（「Ⅷ.7. 相互作用」の項参照）
7. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人（「Ⅷ.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」を参照すること。

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) 肝障害のある患者［血中濃度が上昇するおそれがある。］
(2) 心・血管疾患、低血圧又はこれらの疑いのある患者［一過性の血圧降下があらわれることがある。］
(3) QT延長を起こしやすい患者［QT延長が発現するおそれがある。］
　1) QT延長を起こすことが知られている薬剤を投与中の患者
　2) 低カリウム血症のある患者 等
(4) てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者［痙攣閾値を低下させることがある。］
(5) 甲状腺機能亢進状態にある患者［錐体外路症状が起こりやすい。］
(6) 高齢者（「Ⅷ.9. 高齢者への投与」の項参照）
(7) 小児（「Ⅷ.11. 小児等への投与」の項参照）

(8) 薬物過敏症の患者

(9) 脱水・栄養不良状態等を伴う身体的疲弊のある患者、脳に器質的障害のある患者［悪性症候群（Syndrome malin）が起こりやすい。］

(10) 高温環境下にある患者［体温調節中枢を抑制するため、高熱反応が起こるおそれがある。］

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) 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、本剤投与中の患者には**自動車の運転等危険を伴う機械の操作**に従事させないように注意すること。

(2) 本剤は制吐作用を有するため、他の薬剤に基づく中毒、腸閉塞、脳腫瘍等による**嘔吐症状を不顕性化**することがあるので注意すること。

(3) 抗精神病薬において、肺塞栓症、静脈血栓症等の血栓塞栓症が報告されているので、不動状態、長期臥床、肥満、脱水状態等の危険因子を有する患者に投与する場合には、注意すること。

7. 相互作用

本剤は、主として薬物代謝酵素CYP2D6及びCYP3A4で代謝される。（**「Ⅶ. 薬物動態に関する項目」**の項参照）

(1) 併用禁忌とその理由

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アドレナリン （アナフィラキシーの救急治療に使用する場合を除く） ボスミン	アドレナリンの作用を逆転させ、血圧降下を起こすことがある。	アドレナリンのα作用が遮断され、β作用が優位になることがある。

(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
中枢神経抑制剤 バルビツール酸誘導体等	相互に中枢神経抑制作用を増強することがあるので、減量するなど注意すること。	ともに中枢神経抑制作用を有する。
アルコール	相互に中枢神経抑制作用を増強することがある。	ともに中枢神経抑制作用を有する。
リチウム	心電図変化、重症の錐体外路症状、持続性のジスキネジア、突発性の悪性症候群（Syndrome malin）、非可逆性の脳障害を起こすとの報告がある。 観察を十分に行い、慎重に投与すること。 なお、このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。	機序は不明
抗コリン作用を有する薬剤 抗コリン作動性抗パーキンソン剤、 フェノチアジン系化合物、 三環系抗うつ剤等	腸管麻痺等の抗コリン系の副作用が強くあらわれることがある。また、精神症状が悪化したとの報告がある。	ともに抗コリン作用を有する。
抗ドパミン作用を有する薬剤 ベンザミド系薬剤 メトクロプラミド、 スルピリド、 チアプリド等 ドンペリドン等	内分泌機能異常、錐体外路症状が発現することがある。	ともにドパミン受容体遮断作用を有する。
タンドスピロンクエン酸塩	錐体外路症状を増強するおそれがある。	タンドスピロンクエン酸塩は弱いドパミン受容体遮断作用を有する。
ドパミン作動薬 レボドパ製剤、 ブロモクリプチンメシル酸塩等	これらの薬剤のドパミン作動薬としての作用が減弱することがある。	本剤はドパミン受容体遮断作用を有する。
薬物代謝酵素（主にCYP3A4）を誘導する薬剤 カルバマゼピン、 リファンピシン等	本剤の作用を減弱するとの報告があるので、観察を十分に行い、慎重に投与すること。	薬物代謝酵素誘導作用により、本剤の代謝が促進され、血中濃度が低下する。
CYP3A4を阻害する薬剤 イトラコナゾール等	本剤の作用が増強し、副作用が発現するおそれがある。	薬物代謝酵素阻害作用により、本剤の血中濃度が上昇する。
CYP2D6を阻害する薬剤 キニジン、 プロメタジン、 クロルプロマジン等		

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

重大な副作用（頻度不明）

1) **悪性症候群（Syndrome malin）**　無動緘黙、強度の筋強剛、嚥下困難、頻脈、血圧の変動、発汗等が発現し、それに引き続き発熱がみられる場合は、投与を中止し、体冷却、水分補給等の全身管理とともに適切な処置を行うこと。本症発症時には、白血球の増加や血清 CK（CPK）の上昇がみられることが多く、また、ミオグロビン尿を伴う腎機能の低下や、筋強剛を伴う嚥下困難から嚥下性肺炎が出現することがある。
なお、高熱が持続し、意識障害、呼吸困難、循環虚脱、脱水症状、急性腎障害へと移行し、死亡した例が報告されている。
（**〈用法・用量に関連する使用上の注意〉**、**「Ⅷ.5. 慎重投与内容とその理由」**の項参照）

2) **心室細動、心室頻拍**　心室細動、心室頻拍（Torsades de pointes を含む。）、QT 延長があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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。

3) **麻痺性イレウス**　腸管麻痺（食欲不振、悪心・嘔吐、著しい便秘、腹部の膨満あるいは弛緩及び腸内容物のうっ滞等の症状）を来し、麻痺性イレウスに移行することがあるので、腸管麻痺があらわれた場合には、投与を中止すること。
なお、この悪心・嘔吐は、本剤の制吐作用により不顕性化することもあるので注意すること。

4) **遅発性ジスキネジア**　長期投与により、遅発性ジスキネジア（口周部の不随意運動、四肢の不随意運動等を伴うことがある。）があらわれ、投与中止後も持続することがある。抗パーキンソン剤を投与しても、症状が軽減しない場合があるので、このような症状があらわれた場合には、本剤の投与継続の必要性を、他の抗精神病薬への変更も考慮して慎重に判断すること。

5) **抗利尿ホルモン不適合分泌症候群（SIADH）**　低ナトリウム血症、低浸透圧血症、尿中ナトリウム排泄量の増加、高張尿、痙攣、意識障害等を伴う抗利尿ホルモン不適合分泌症候群があらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止し、水分摂取の制限等適切な処置を行うこと。

6) **無顆粒球症、白血球減少、血小板減少**　無顆粒球症、白血球減少（初期症状として発熱、咽頭痛、全身倦怠等）、血小板減少（初期症状として皮下・粘膜下出血等）があらわれることがあるので、異常があらわれた場合には、血液検査を行い、投与を中止するなど

適切な処置を行うこと。

7) **横紋筋融解症**　横紋筋融解症があらわれることがあるので、筋肉痛、脱力感、CK（CPK）上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

8) **肺塞栓症、深部静脈血栓症**　抗精神病薬において、肺塞栓症、静脈血栓症等の血栓塞栓症が報告されているので、観察を十分に行い、息切れ、胸痛、四肢の疼痛、浮腫等が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

9) **肝機能障害、黄疸**　AST（GOT）、ALT（GPT）、γ-GTP、Al-P、ビリルビン等の上昇を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

	頻度不明
循環器注1)	**血圧降下、起立性低血圧、心電図異常（QT間隔の延長、T波の変化等）、頻脈**
肝臓注2)	**肝機能異常**
錐体外路症状注3)	**パーキンソン症候群（振戦、筋強剛、流涎、寡動、歩行障害、仮面様顔貌、嚥下障害等）、アカシジア（静坐不能）、ジスキネジア（口周部、四肢等の不随意運動等）、ジストニア（痙攣性斜頸、顔面・咽頭・頸部の攣縮、後弓反張、眼球上転発作等）**
眼	眼の調節障害、長期又は大量投与による角膜・水晶体の混濁、角膜等の色素沈着
過敏症注2)	**発疹、蕁麻疹、瘙痒感、光線過敏症**
血液	貧血、白血球減少
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐、便秘、下痢、口渇
内分泌	月経異常、体重増加、女性型乳房、乳汁分泌、高プロラクチン血症、インポテンス、持続勃起
呼吸器注2)	**呼吸困難、喉頭攣縮**
精神神経系	不眠、焦躁感、神経過敏、眠気、眩暈、頭痛・頭重、不安、幻覚、興奮、痙攣、性欲異常、過鎮静、抑うつ、知覚変容発作
その他	脱力感・倦怠感・疲労感、発熱、発汗、潮紅、鼻閉、浮腫、排尿困難、体温調節障害

注1)　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。（太字）

注2)　症状（異常）が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。（太字）

注3)　異常が認められた場合には、必要に応じて抗パーキンソン剤投与等適切な処置を行うこと。（太字）

(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**

「**Ⅷ.2. 禁忌内容とその理由**」に以下の記載あり。

5. 本剤の成分又はブチロフェノン系化合物に対し過敏症の患者

「**Ⅷ.5. 慎重投与内容とその理由（原則禁忌を含む）**」に以下の記載あり。

(8) 薬物過敏症の患者

「**Ⅷ.8.(3)その他の副作用**」に以下の記載あり。

過敏症[注2)] **：発疹、蕁麻疹、瘙痒感、光線過敏症**

注 2) 症状（異常）が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。（太字）

9. 高齢者への投与

高齢者では、錐体外路症状等の副作用があらわれやすいので、少量から投与を開始するなど、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。［催奇形性を疑う症例がある。動物実験で口蓋裂（マウス）、脳奇形（ハムスター）等の催奇形性及び着床数の減少、胎児吸収の増加（マウス）、流産率の上昇（ラット）等の胎児毒性が報告されている。また、妊娠後期に抗精神病薬が投与されている場合、新生児に哺乳障害、傾眠、呼吸障害、振戦、筋緊張低下、易刺激性等の離脱症状や錐体外路症状があらわれたとの報告がある。］ (2) 授乳中の婦人に投与する場合には、授乳を中止させること。［ヒト母乳中へ移行し、哺乳中の児の血中に検出されたと報告されている。］

11. 小児等への投与

小児には、慎重に投与すること。［小児に抗精神病薬を投与した場合、錐体外路症状、特にジスキネジアが起こりやすいとの報告がある。］

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：主な症状は、低血圧、過度の鎮静、重症の錐体外路症状（筋強剛、振戦、ジストニア症状)等である。また、呼吸抑制及び低血圧を伴う昏睡状態や心電図異常(Torsades de pointesを含む。）があらわれることがある。
小児では血圧上昇があらわれたとの報告もある。
処置：特異的な解毒剤はないので、維持療法を行う。
呼吸抑制があらわれた場合には、気道の確保、人工呼吸等の適切な処置を行う。低血圧や循環虚脱があらわれた場合には、輸液、血漿製剤、アルブミン製剤、ノルアドレナリン等の昇圧剤（アドレナリンは禁忌）等の投与により血圧の確保等の処置を行う。また、QT延長、不整脈等の心電図異常に注意すること。
重症の錐体外路症状に対しては、抗パーキンソン剤を投与する。

14. 適用上の注意

（錠）
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、更には穿孔を起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

(1) 本剤による治療中、原因不明の突然死が報告されている。
(2) 雌マウスに長期間経口投与した試験において、臨床最大通常用量の10倍（1.25mg/kg/日）以上で乳腺腫瘍の発生頻度が、また、40倍（5 mg/kg/日）以上で下垂体腫瘍の発生頻度が、対照群に比し高いとの報告がある。
(3) 外国で実施された認知症に関連した精神病症状（承認外効能・効果）を有する高齢患者を対象とした17の臨床試験において、非定型抗精神病薬投与群はプラセボ投与群と比較して死亡率が1.6～1.7倍高かったとの報告がある。また、外国での疫学調査において、定型抗精神病薬も非定型抗精神病薬と同様に死亡率の上昇に関与するとの報告がある。

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（「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

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. 有効期間又は使用期限

使用期限：外箱等に表示（5 年）

3. 貯法・保存条件

遮光・気密容器・室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ.14. 適用上の注意」参照

くすりのしおり：有

患者向け医薬品ガイド：有

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

ハロペリドール細粒 1%「タカタ」	バラ包装：500g（プラスチック瓶）
ハロペリドール錠 1mg「タカタ」	PTP 包装：100 錠（10 錠×10） バラ包装：1000 錠（プラスチック瓶）
ハロペリドール錠 2mg「タカタ」	

7. 容器の材質

●ハロペリドール細粒 1%「タカタ」

バラ包装	瓶：ポリエチレン 中栓：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン 個装箱：紙

●ハロペリドール錠 1mg・2mg「タカタ」

PTP 包装	PTP：ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔 個装箱：紙

バラ包装	瓶：ポリエチレン キャップ：ブリキ 個装箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：セレネース細粒 1%/錠 0.75mg・1mg・1.5mg・3mg/内服液 0.2%/注 5mg

同　効　薬：ペルフェナジン塩酸塩、クロルプロマジン塩酸塩、レボメプロマジン塩酸塩、フルフェナジンデカン酸塩、チミペロン、スルピリド[8)]

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
ハロペリドール細粒 1%「タカタ」	2018 年 7 月 9 日 （販売名変更による）	23000AMX00509
ハロペリドール錠 1mg「タカタ」	2018 年 7 月 9 日 （販売名変更による）	23000AMX00507
ハロペリドール錠 2mg「タカタ」	2018 年 7 月 9 日 （販売名変更による）	23000AMX00508

注 1）旧販売名：ハロステン細粒　　承認年月日：1978 年 1 月 24 日

旧販売名：ハロステン錠 1mg　　承認年月日：1978 年 1 月 24 日

旧販売名：ハロステン錠 2mg　　承認年月日：1978 年 1 月 24 日

注 2）旧販売名：ハロステン細粒 1%　承認年月日：2006 年 8 月 17 日

11. 薬価基準収載年月日

ハロペリドール細粒 1%「タカタ」（新販売名）　：2018 年 12 月 14 日

［注］ハロステン細粒 1%（旧販売名）　：2006 年 12 月 8 日

ハロペリドール錠 1mg「タカタ」（新販売名）　：2018 年 12 月 14 日

［注］ハロステン錠 1mg（旧販売名）　：1978 年 4 月

ハロペリドール錠 2mg「タカタ」（新販売名）　：2018 年 12 月 14 日

［注］ハロステン錠 2mg（旧販売名）　：1978 年 4 月

経過措置期間終了：2019 年 9 月 30 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. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は投与期間制限医薬品に該当しない。

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
ハロペリドール細粒 1%「タカタ」	101419817	1179020C1302	620141917
ハロペリドール錠 1mg「タカタ」	101436502	1179020F2011	620143602
ハロペリドール錠 2mg「タカタ」	101451802	1179020F4014	620145102

17. 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。

XI. 文献

1. 引用文献

1) 塩見輝雄他：薬理と治療，12（10）：4419，1984.

2) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十七改正 日本薬局方解説書（廣川書店）C-4001，2016.

3) 財団法人 日本薬剤師研修センター編：日本薬局方 医薬品情報（株式会社じほう）1314，2006

4) 相本太刀夫他：薬学雑誌，99（1）：106，1979.

5) 高田製薬(株)社内資料（細粒1%：安定性）

6) 高田製薬(株)社内資料（錠1mg：安定性）

7) 高田製薬(株)社内資料（錠2mg：安定性）

8) 薬剤分類情報閲覧システム
＜http://www.iryohoken.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/＞（2023/2/21 アクセス）

9) Forsman, A., et al.：Curr. Ther. Res., 20（3）：319，1976.

10) Forsman, A., et al.：Curr. Ther. Res., 21（2）：245，1977.

11) Whalley, L. J., et al.：Brit. Med. J., 282：1746，1981.

12) Fang, J., et al.：Cell. Mol. Neurobiol., 17（2）：227，1997.

13) Young, D., et al.：Eur. J. Clin. Pharmacol., 44：433，1993.

14) 高田製薬(株)社内資料（錠1mg・2mg：粉砕後の安定性）

15) 高田製薬(株)社内資料（錠1mg・2mg：崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性）

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 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

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

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) 粉砕[14)]

●ハロペリドール錠 1mg「タカタ」

「25℃、45%RH、3000 lx、気密」で 120 万 lx・hr の保存条件では、含量は規格内であり、外観、水分は変化がなかった。

「25℃、75%RH、遮光、開放」で 3 箇月の保存条件では、含量は規格内であり、外観は変化がなかったが、14 日、1 箇月、2 箇月及び 3 箇月で水分に変化があった。

表 1 (1 ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	14日	1箇月	2箇月	3箇月
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	白色の粉末	白色の粉末			
	含量(%)	97.76	97.57	97.88	97.27	97.19
	水分(%)	6.39	7.54	7.76	7.61	7.26

≪参考≫
・製剤の規格値を用いて判定した項目：含量
・規格値を設定していない項目：外観、水分

表 2 (1 ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	30万lx・hr	60万lx・hr	120万lx・hr
25℃ 45%RH 3000 lx / 気密	外観	白色の粉末	白色の粉末		
	含量(%)	97.76	96.66	95.93	94.77
	水分(%)	6.39	6.21	6.42	6.50

≪参考≫
・製剤の規格値を用いて判定した項目：含量
・規格値を設定していない項目：外観、水分

●ハロペリドール錠2mg「タカタ」

「25℃、45%RH、3000 lx、気密」で120万lx・hrの保存条件では、含量は規格内であり、外観、水分は変化がなかった。

「25℃、75%RH、遮光、開放」で3箇月の保存条件では、含量は規格内であり、外観は変化がなかったが、14日、1箇月、2箇月及び3箇月で水分に変化があった。

表1　(1ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	14日	1箇月	2箇月	3箇月
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	白色の粉末	白色の粉末			
	含量(%)	98.35	97.72	97.54	97.34	97.77
	水分(%)	6.27	7.37	7.32	7.31	6.97

≪参考≫
・製剤の規格値を用いて判定した項目：含量
・規格値を設定していない項目：外観、水分

表2　(1ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	30万lx・hr	60万lx・hr	120万lx・hr
25℃ 45%RH 3000 lx / 気密	外観	白色の粉末	白色の粉末		
	含量(%)	98.35	97.35	96.55	95.92
	水分(%)	6.27	6.14	6.43	6.19

≪参考≫
・製剤の規格値を用いて判定した項目：含量
・規格値を設定していない項目：外観、水分

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性[15)]

1. 試験方法

(1) 崩壊懸濁試験

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に本剤（1 錠をそのまま又は 1 回量の粉末製剤）を入れてピストンを戻しディスペンサーに 55℃の温湯 20mL を吸い取り、筒先の蓋をして 5 分間自然放置後、崩壊・懸濁の状況を観察した。その後、ディスペンサーを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察した。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後、同様の操作を行うこととした。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止することとした。中止した場合、錠剤は粉砕又はコーティングを破壊してから、ディスペンサー内に入れて同様に実験を行うこととした。錠剤の粉砕又はコーティングの破壊は薬包紙の上から錠剤を乳棒で数回叩いて行うこととした。

(2) チューブ通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を、経管栄養チューブの注入端より約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは、ベッド上の患者様を想定し、体内挿入端から 2/3 を水平に、他端（注入端）を 30cm の高さにセットした。サイズは 8Fr.（フレンチ）を用いて通過性を観察した。8Fr. のチューブ通過性に問題がある場合、チューブのサイズを 12、14、16Fr. の順に替えて注入し、通過性を観察することとした。実施後、ディスペンサー内の状況を観察した。懸濁液を注入した後に適量の水を注入してチューブ内を洗う時、ディスペンサー内・チューブ内に薬剤が残存していなければ通過性に問題なしとした。

2. 試験製剤

ハロペリドール錠 1mg「タカタ」(1 錠)

ハロペリドール錠 2mg「タカタ」(1 錠)

3. 試験時期

2020 年 7 月 3 日

4. 試験結果

(1) 崩壊懸濁試験

いずれも 5 分以内に崩壊・懸濁した。

(2) チューブ通過性試験

いずれも 8Fr. のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし

MEMO

製造販売
高田製薬株式会社
さいたま市西区宮前町203番地1