2022 年 4 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

抗精神病剤

リスペリドンOD錠0.5mg「タカタ」
リスペリドンOD錠1mg「タカタ」
リスペリドンOD錠2mg「タカタ」
リスペリドンOD錠3mg「タカタ」

リスペリドン口腔内崩壊錠

RISPERIDONE　OD

剤形	錠剤（口腔内崩壊錠）
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	リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」　:1 錠中　リスペリドン 0.5mg リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」　:1 錠中　リスペリドン 1mg リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」　:1 錠中　リスペリドン 2mg リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」　:1 錠中　リスペリドン 3mg
一般名	和　名：リスペリドン(JAN) 洋　名：Risperidone（JAN, INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載 発売年月日	2011 年 7 月 15 日（0.5mg）、2009 年 7 月 13 日（1mg/2mg/3mg） 2011 年 11 月 28 日（0.5mg）、2009 年 11 月 13 日（1mg/2mg/3mg） 2011 年 11 月 28 日（0.5mg）、2009 年 11 月 13 日（1mg/2mg/3mg）
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 2022 年 4 月改訂(第 15 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、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
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 2
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） 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 3
7. CAS登録番号 3
Ⅲ．有効成分に関する項目 4
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 4
4. 有効成分の定量法 4
Ⅳ．製剤に関する項目 5
1. 剤形 5
2. 製剤の組成 5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 6
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） 15
7. 溶出性 15
8. 生物学的試験法 21
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 21
10. 製剤中の有効成分の定量法 21
11. 力価 21
12. 混入する可能性のある夾雑物 21
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 21
14. その他 22
Ⅴ．治療に関する項目 23
1. 効能又は効果 23
2. 用法及び用量 23
3. 臨床成績 24
Ⅵ．薬効薬理に関する項目 25
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 25
2. 薬理作用 25
Ⅶ．薬物動態に関する項目 26
1. 血中濃度の推移・測定法 26
2. 薬物速度論的パラメータ 29
3. 吸収 29
4. 分布 29
5. 代謝 30
6. 排泄 30
7. トランスポーターに関する情報 30
8. 透析等による除去率 30
Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目 31
1. 警告内容とその理由 31
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） 31
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 31
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 31
5. 慎重投与内容とその理由 31
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 32
7. 相互作用 32
8. 副作用 33
9. 高齢者への投与 36
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 36
11. 小児等への投与 36
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 37
13. 過量投与 37
14. 適用上の注意 37
15. その他の注意 37
16. その他 38
Ⅸ．非臨床試験に関する項目 39
1. 薬理試験 39
2. 毒性試験 39
Ⅹ．管理的事項に関する項目 40
1. 規制区分 40
2. 有効期間又は使用期限 40
3. 貯法・保存条件 40
4. 薬剤取扱い上の注意点 40
5. 承認条件等 40
6. 包装 40
7. 容器の材質 41
8. 同一成分・同効薬 41
9. 国際誕生年月日 41
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 41
11. 薬価基準収載年月日 41
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 41
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 41
14. 再審査期間 41
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 41
16. 各種コード 42
17. 保険給付上の注意 42
XI. 文献 43
1. 引用文献 43
2. その他の参考文献 43
XII. 参考資料 44
1. 主な外国での発売状況 44
2. 海外における臨床支援情報 44
XIII 備考 45
1. その他の関連資料 45

Ⅰ．概要に関する項目

1. 開発の経緯

リスペリドンはベルギーにて合成された抗精神病薬である。本邦では1996年4月に細粒1%、錠1mg・2mg、2002年3月に内用液1mg/mL、2002年12月に錠3mg、2007年3月にOD錠1mg・2mg、2009年7月にOD錠0.5mgが承認されている。

リスペリドンOD錠1mg・2㎎・3㎎「タカタ」は、高田製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施、2009年7月に製造販売承認を得た。

2011年7月にOD錠0.5mgの規格を追加し、承認を得た。

更に、OD錠0.5mg・1mg・2mgには、2020年9月に小児期の自閉スペクトラム症に伴う易刺激性に対する「効能・効果」及び「用法・用量」が追加された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) リスペリドンは、セロトニン・ドパミン・アンタゴニスト(SDA:serotonin-dopamine antagonist)と呼ばれる非定型抗精神病薬で、5-HT_2受容体とD_2受容体拮抗作用を示す。両作用により統合失調症の陽性症状と陰性症状の両者に効果を発揮すると考えられている。[1)]

(2) 内用液 1mg/mL、細粒 1%、錠(1mg・2mg・3mg)、OD 錠(0.5mg・1mg・2mg・3mg)と剤形を用意している。

(3) 重大な副作用として悪性症候群(Syndrome malin)、遅発性ジスキネジア、麻痺性イレウス、抗利尿ホルモン不適合分泌症候群(SIADH)、肝機能障害、黄疸、横紋筋融解症、不整脈、脳血管障害、高血糖、糖尿病性ケトアシドーシス、糖尿病性昏睡、低血糖、無顆粒球症、白血球減少、肺塞栓症、深部静脈血栓症、持続勃起症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

リスペリドンOD錠0.5mg「タカタ」
リスペリドンOD錠1mg「タカタ」
リスペリドンOD錠2mg「タカタ」
リスペリドンOD錠3mg「タカタ」

(2) 洋名

Risperidone ODTablets 0.5mg“TAKATA”
Risperidone ODTablets 1mg“TAKATA”
Risperidone ODTablets 2mg“TAKATA”
Risperidone ODTablets 3mg“TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

リスペリドン（JAN）

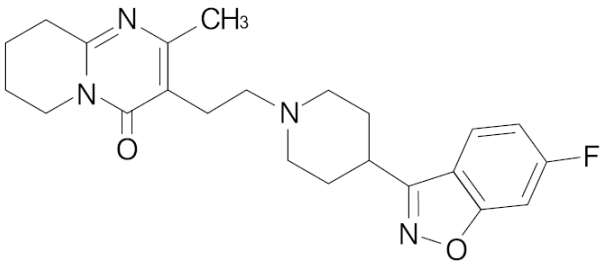
(2) 洋名（命名法）

Risperidone（JAN, INN）

(3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{23}H_{27}FN_4O_2$
分子量：410.48

5. 化学名（命名法）

3-{2-[4-(6-Fluoro-1,2-benzisoxazol-3-yl)piperidin-1-yl]ethyl}-2-methyl-6,7,8,9-tetrahydro-4*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin-4-one

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

106266-06-2

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～微黄白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

メタノール又はエタノール(99.5)にやや溶けにくく、2-プロパノールに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点:169～173℃

(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

日局「リスペリドン」の確認試験による。

(1)紫外可視吸光度測定法

(2)赤外吸収スペクトル吸収法(臭化カリウム錠剤法)

4. 有効成分の定量法

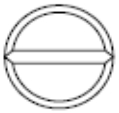
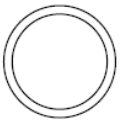
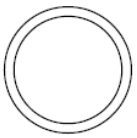
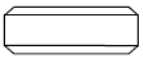
日局「リスペリドン」の定量法による。

電位差滴定法

Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

品　名		リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」	リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」	リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」	リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」
剤　形		白色の裸錠	片面に二分割線のある白色の裸錠	白色の裸錠	白色の裸錠
外形	表面				
	直径	約 5.0mm	約 6.5mm	約 7.0mm	約 8.0mm
	裏面				
	重さ	約 0.05g	約 0.1g	約 0.13g	約 0.195g
	側面				
	厚さ	約 2.0mm	約 2.2mm	約 2.4mm	約 2.8mm
識別コード		TTS-523	TTS-520	TTS-521	TTS-522

(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、規格及び性状」参照

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」	1 錠中にリスペリドンを 0.5mg 含有する
リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」	1 錠中にリスペリドンを 1mg 含有する
リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」	1 錠中にリスペリドンを 2mg 含有する
リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」	1 錠中にリスペリドンを 3mg 含有する

(2) 添加物

乳糖水和物、結晶セルロース、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、トウモロコシデンプン、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、キサンタンガム、香料

(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(室温、36 箇月)

●リスペリドン OD 錠 0.5 mg「タカタ」[2)]

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6 箇月)の結果、3 年間安定であることが推測された。

●リスペリドン OD 錠1mg「タカタ」、リスペリドン OD 錠 2 mg「タカタ」、リスペリドン OD 錠 3 mg「タカタ」[3~5)]

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、36 箇月)の結果、3 年間安定であることが確認された。

●リスペリドン OD 錠1mg「タカタ」[3)]

PTP

	開始時	12 箇月後	24 箇月後	36 箇月後
性状	片面に二分割線のある白色の裸錠			
確認試験①※1	適	−	−	適
確認試験②※1	適	−	−	適
純度試験 類縁物質(%)	0.00	0.12	0.24	0.11
崩壊性(秒)	0.75	0.86	0.93	0.76
溶出性(%)	88.7	85.6	84.0	85.1
残存率(%)	100.0	99.9	99.9	99.8
硬度試験(N)※2	81.3	88.3	90.7	85.1
水分(%)※2	5.3	5.0	5.4	5.1

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

ポリエチレン瓶 (2 ロットの結果のまとめ)

	開始時	12 箇月後	24 箇月後	36 箇月後
性状	片面に二分割線のある白色の裸錠			
確認試験①※1	適	−	−	適
確認試験②※1	適	−	−	適
純度試験 類縁物質(%)	0.00	0.04-0.09	0.18-0.19	0.23-0.31
崩壊性(秒)	0.78-0.81	1.09	1.03-1.14	0.96-0.98
溶出性(%)	84.5-85.8	86.4-89.3	85.3-86.1	79.8-87.2
残存率(%)	100.0	98.3	99.1-100.2	98.8-100.5
硬度試験(N) ※2	78.7-81.6	84.2-85.0	83.1-84.2	81.8-82.5
水分(%)※2	5.2-5.4	4.6	5.0-5.1	3.9-4.2

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

●リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」[4)]

PTP

	開始時	12 箇月後	24 箇月後	36 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	－	－	適
確認試験②※1	適	－	－	適
純度試験 類縁物質(%)	0.00	0.09	0.19	0.15
崩壊性(秒)	0.73	0.62	0.51	0.59
溶出性(%)	86.2	85.3	83.3	85.3
残存率(%)	100.0	98.8	99.1	100.0
硬度試験(N)※2	79.3	85.1	85.7	81.5
水分(%)※2	5.2	4.9	5.4	4.9

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

ポリエチレン瓶 (2 ロットの結果のまとめ)

	開始時	12 箇月後	24 箇月後	36 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	－	－	適
確認試験②※1	適	－	－	適
純度試験 類縁物質(%)	0.00-0.12	0.00	0.04-0.06	0.18-0.20
崩壊性(秒)	0.69-0.71	0.67-0.71	0.55-0.61	0.57-0.61
溶出性(%)	85.8-87.3	87.5-89.3	83.8-86.1	84.2-87.2
残存率(%)	100	98.9	99.3-99.7	98.7-99.5
硬度試験(N)※2	78.0-78.4	78.7-79.2	77.2-79.3	79.9-81.9
水分(%)※2	5.2-5.3	4.7	5.0-5.1	3.4-4.2

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

●リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」[5)]

PTP

	開始時	12 箇月後	24 箇月後	36 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	－	－	適
確認試験②※1	適	－	－	適
純度試験 類縁物質(%)	0.00	0.12	0.20	0.15
崩壊性(秒)	0.82	0.80	0.73	0.65
溶出性(%)	87.4	86.9	82.8	85.0
残存率(%)	100.0	101.5	101.1	101.6
硬度試験(N)※2	100.5	110.6	109.2	101.3
水分(%)※2	5.1	5.0	5.4	4.8

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

ポリエチレン瓶　　(2 ロットの結果のまとめ)

	開始時	12 箇月後	24 箇月後	36 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	−	−	適
確認試験②※1	適	−	−	適
純度試験 類縁物質(%)	0.00	0.00−0.10	0.17	0.20−0.22
崩壊性(秒)	0.83−0.87	0.80−0.84	0.69−0.70	0.68−0.74
溶出性(%)	85.1−85.8	86.1−88.5	85.2−83.7	85.7−86.4
残存率(%)	100.0	98.4−99.3	99.4−99.8	99.8−100.5
硬度試験(N)※2	95.5−98.1	102.5−103.3	97.4−98.6	100.9−101.3
水分(%)※2	5.1−5.2	4.8−4.9	4.8−5.2	3.7−4.3

※1　①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2　自主設定項目

(2) 加速試験(40℃±1℃　75±5%RH)

●リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」[2)]

PTP　　(3 ロットの結果のまとめ)

	開始時	1 箇月後	3 箇月後	6 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	適	適	適
確認試験②※1	適	適	適	適
純度試験 類縁物質(%)	0.09−0.10	0.20−0.23	0.29−0.35	0.43−0.45
製剤均一性	適	−	−	適
崩壊性(秒)	35−45	32−43	35−42	37−43
溶出性(%)	90.5−93.8	92.4−96.5	92.3−95.6	91.0−95.1
残存率(%)	100	99.4−99.7	100.2−100.4	98.9−100.1
水分(%)※2	4.52−4.55	4.34−4.38	4.56−4.59	4.49−4.58

※1　①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2　自主設定項目

●リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」[3)]

PTP　　(3 ロットの結果のまとめ)

	開始時	1 箇月後	3 箇月後	6 箇月後
性状	片面に二分割線のある白色の裸錠			
確認試験①※1	適	適	適	適
確認試験②※1	適	適	適	適
純度試験 類縁物質(%)	0.09－0.10	0.24－0.25	0.34－0.36	0.61－0.62
製剤均一性	適	－	－	適
崩壊性(秒)	48.3－50.7	50.7－60.3	49.0－55.3	49.3－57.7
溶出性(%)	97.5－99.1	96.8－97.7	99.0－100.4	98.2－98.9
残存率(%)	100	99.6－100.2	99.5－99.9	99.0－99.8
水分(%)※2	4.68－4.98	4.65－4.64	4.49－4.56	4.74－4.84

※1　①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2　自主設定項目

ポリエチレン瓶　　(3 ロットの結果のまとめ)

	開始時	1 箇月後	3 箇月後	6 箇月後
性状	片面に二分割線のある白色の裸錠			
確認試験①※1	適	適	適	適
確認試験②※1	適	適	適	適
純度試験 類縁物質(%)	0.06－0.10	0.08－0.12	0.16－0.28	0.29－0.35
製剤均一性	適	－	－	適
崩壊性(秒)	35－57	38－62	24－48	38－59
溶出性(%)	86.5－98.4	83.5－101.6	85.3－102.3	89.0－98.8
残存率(%)	100	99.5－99.9	99.9－100.1	99.9－100.2
水分(%)※2	4.94－5.06	4.85－4.92	4.93－5.11	4.70－4.89

※1　①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2　自主設定項目

●リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」[4)]

PTP (3 ロットの結果のまとめ)

	開始時	1 箇月後	3 箇月後	6 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	適	適	適
確認試験②※1	適	適	適	適
純度試験 類縁物質(%)	0.05－0.06	0.17－0.19	0.20－0.28	0.35－0.48
製剤均一性	適	－	－	適
崩壊性(秒)	39－76	53－70	50－74	38－70
溶出性(%)	82.2－102.7	82.5－99.6	84.8－104.3	81.2－102.5
残存率(%)	100	100.4－101.0	100.8－101.1	100.0－101.2
水分(%)※2	4.90－4.95	4.61－4.66	4.50－4.62	4.73－5.03

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

ポリエチレン瓶 (3 ロットの結果のまとめ)

	開始時	1 箇月後	3 箇月後	6 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	適	適	適
確認試験②※1	適	適	適	適
純度試験 類縁物質(%)	0.04－0.08	0.06－0.07	0.13－0.18	0.18－0.22
製剤均一性	適	－	－	適
崩壊性(秒)	36－62	41－59	34－54	43－64
溶出性(%)	80.1－103.2	84.2－98.0	81.9－99.41	82.4－101.3
残存率(%)	100	99.0－99.6	98.2－99.3	98.1－99.1
水分(%)※2	4.71－4.98	4.82－4.96	4.99－5.14	4.61－4.73

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

●リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」[5)]

PTP (3 ロットの結果のまとめ)

	開始時	1 箇月後	3 箇月後	6 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	適	適	適
確認試験②※1	適	適	適	適
純度試験 類縁物質(%)	0.08－0.12	0.18－0.21	0.26－0.29	0.44－0.50
製剤均一性	適	－	－	適
崩壊性(秒)	43－83	55－97	55－82	50－82
溶出性(%)	81.2－96.1	81.8－101.4	85.1－103.7	80.2－101.9
残存率(%)	100	100.1－100.5	100.4－101.0	99.7－101.1
水分(%)※2	4.88－4.95	4.61－4.67	4.54－4.77	4.95－5.06

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

ポリエチレン瓶 (3 ロットの結果のまとめ)

	開始時	1 箇月後	3 箇月後	6 箇月後
性状	白色の裸錠			
確認試験①※1	適	適	適	適
確認試験②※1	適	適	適	適
純度試験 類縁物質(%)	0.04－0.06	0.06－0.08	0.10－0.17	0.19－0.24
製剤均一性	適	－	－	適
崩壊性(秒)	46－69	37－75	17－56	44－78
溶出性(%)	80.1－100.0	80.9－96.5	80.9－96.5	84.6－96.6
残存率(%)	100	100.1－100.9	99.1－100.5	99.5－100.0
水分(%)※2	4.70－4.86	4.72－4.86	4.87－4.96	4.63－4.73

※1 ①クエン酸・酢酸試験液による呈色反応、②紫外可視吸光度測定法

※2 自主設定項目

(3) 無包装状態の安定性(参考資料)

●リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」[2)]

①温度:40℃(遮光・気密容器)

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
溶出性(%)	93.1-94.5	91.4-96.4	91.6-93.9	91.5-96.9
硬度(N)	36.6	36.1	36.9	37.3
残存率(%)	100	99.7	99.5	97.8

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 85%以上

②湿度:25℃/75%RH(遮光・開放)

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
溶出性(%)	93.1-94.5	89.7-98.2	88.2-95.8	89.2-93.6
硬度(N)	36.6	24.5	25.5	25.8
残存率(%)	100	100.1	100.4	97.6

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 85%以上

③昼光色蛍光ランプ　1000 lx(気密容器)

	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
溶出性(%)	93.1-94.5	92.2-94.3	91.8-94.3
硬度(N)	36.6	34.4	36.4
残存率(%)	100	99.3	98.6

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 85%以上

●リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」[3)]

①40℃±2℃(遮光・気密容器)

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
性　状	片面に二分割線のある白色の裸錠	変化なし		
溶出性(%)	81.2-86.2	85.7-89.1	86.6-90.7	88.1-92.4
硬度(N)	79.4	85.3	87.9	84.0
残存率(%)	100.0	100.3	99.7	98.7

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

②25℃±2℃/75%RH±5%RH(遮光・開放)

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
性　状	片面に二分割線のある白色の裸錠	変化なし		
溶出性(%)	81.2-86.2	84.1-89.0	85.9-87.4	86.9-89.1
硬度(N)	79.4	43.9	45.1	37.4
残存率(%)	100.0	99.2	100.1	99.8

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

③昼光色蛍光ランプ　1000 lx（気密容器）

	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性　状	片面に二分割線のある白色の裸錠	変化なし	
溶出性(%)	81.2-86.2	86.4-88.9	84.5-89.0
硬度(N)	79.4	79.2	79.8
残存率(%)	100.0	99.1	98.4

＊溶出規格：試験液（水）における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

●リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」[4)]

①40℃±2℃（遮光・気密容器）

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
性　状	白色の裸錠	変化なし		
溶出性(%)	85.0-93.4	76.6-90.0	78.0-90.2	79.5-87.6
硬度(N)	76.6	77.9	80.2	81.9
残存率(%)	100.0	98.9	99.9	99.5

＊溶出規格：試験液（水）における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

②25℃±2℃/75%RH±5%RH（遮光・開放）

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
性　状	白色の裸錠	変化なし		
溶出性(%)	85.0-93.4	81.7-84.5	80.8-83.6	82.1-88.0
硬度(N)	76.6	38.2	38.9	40.9
残存率(%)	100.0	98.3	99.7	99.5

＊溶出規格：試験液（水）における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

③昼光色蛍光ランプ　1000 lx（気密容器）

	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性　状	白色の裸錠	変化なし	
溶出性(%)	85.0-93.4	83.4-85.4	80.5-87.3
硬度(N)	76.6	74.7	73.6
残存率(%)	100.0	99.2	98.8

＊溶出規格：試験液（水）における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

●リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」[5)]

①40℃±2℃(遮光・気密容器)

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
性 状	白色の裸錠	変化なし		
溶出性(%)	83.1-88.4	80.9-86.2	80.4-86.8	74.2-86.3
硬度(N)	98.8	96.3	100.8	101.2
残存率(%)	100.0	99.5	99.5	99.0

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

②25℃±2℃/75%RH±5%RH(遮光・開放)

	開始時	1 箇月後	2 箇月後	3 箇月後
性 状	白色の裸錠	変化なし		
溶出性(%)	83.1-88.4	82.2-85.1	79.7-83.4	79.2-84.4
硬度(N)	98.8	46.5	48.8	48.8
残存率(%)	100.0	99.7	99.4	99.1

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

③昼光色蛍光ランプ 1000 lx(気密容器)

	開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性 状	白色の裸錠	変化なし	
溶出性(%)	83.1-88.4	79.6-84.9	82.4-87.9
硬度(N)	98.8	95.3	89.4
残存率(%)	100.0	99.4	100.3

＊溶出規格:試験液(水)における 15 分後の平均溶出率が 80%以上

※ 本剤の「無包装状態での安定性試験」[注)]においては、温度(40℃・遮光気密)、湿度(25℃・75%RH・遮光開放)、光(1000 lx・気密)のいずれの条件においても外観の変化は認められなかった。しかし、室内開放(室温 20℃～26℃、湿度 35%～65%、遮光)の条件で約 72 時間の保管実験を行ったところ、変色が生じることが確認された。また、室温(20℃)、成り行き湿度(50～60%RH)の条件下に無包装状態(開放下)で放置したところ、20 日間で外観の変化がみられた。

これらのことから、本剤は開放状態(無包装状態)で保管した場合、変色が認められることがあるので分包機での調剤後の残薬等、無包装での保存は避けること。

注)日本薬剤師会「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)に準じた試験

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）

該当資料なし

7. 溶出性

●リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」[6)]

本剤はリスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「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」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

溶出試験法：パドル法
試　験　液：水
回　転　数：50rpm
試 験 回 数：12 ベッセル
分　析　法：液体クロマトグラフィー

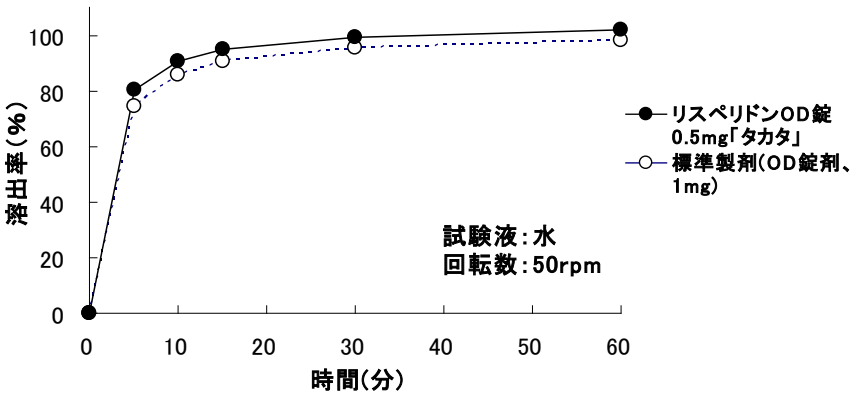
1）同等性の判定（平均溶出率）

回転数	試験液	判定溶出率	判定時間（分）	平均溶出率（%）		差(%)	判定
				試験製剤	標準製剤		
50rpm	水	85%以上	15	94.9	88.7	6.2	適合

2）同等性の判定（個々の溶出率）

回転数	試験液	個々の溶出率		
		判定基準		判定
		±15%（試験液水は±12%）：1 個以下	±25%（試験液水は±20%）：なし	
50rpm	水	0	0	適合

［水,50rpm］



● リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」[7)]

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日医薬審第 487 号）及び（平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）」並びに「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正（平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査第 1124004 号）」に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動が同等であることが確認された。

溶出試験法：パドル法

試　験　液：水、pH1.2、pH5.0、pH6.8

回　転　数：50rpm 及び 100rpm

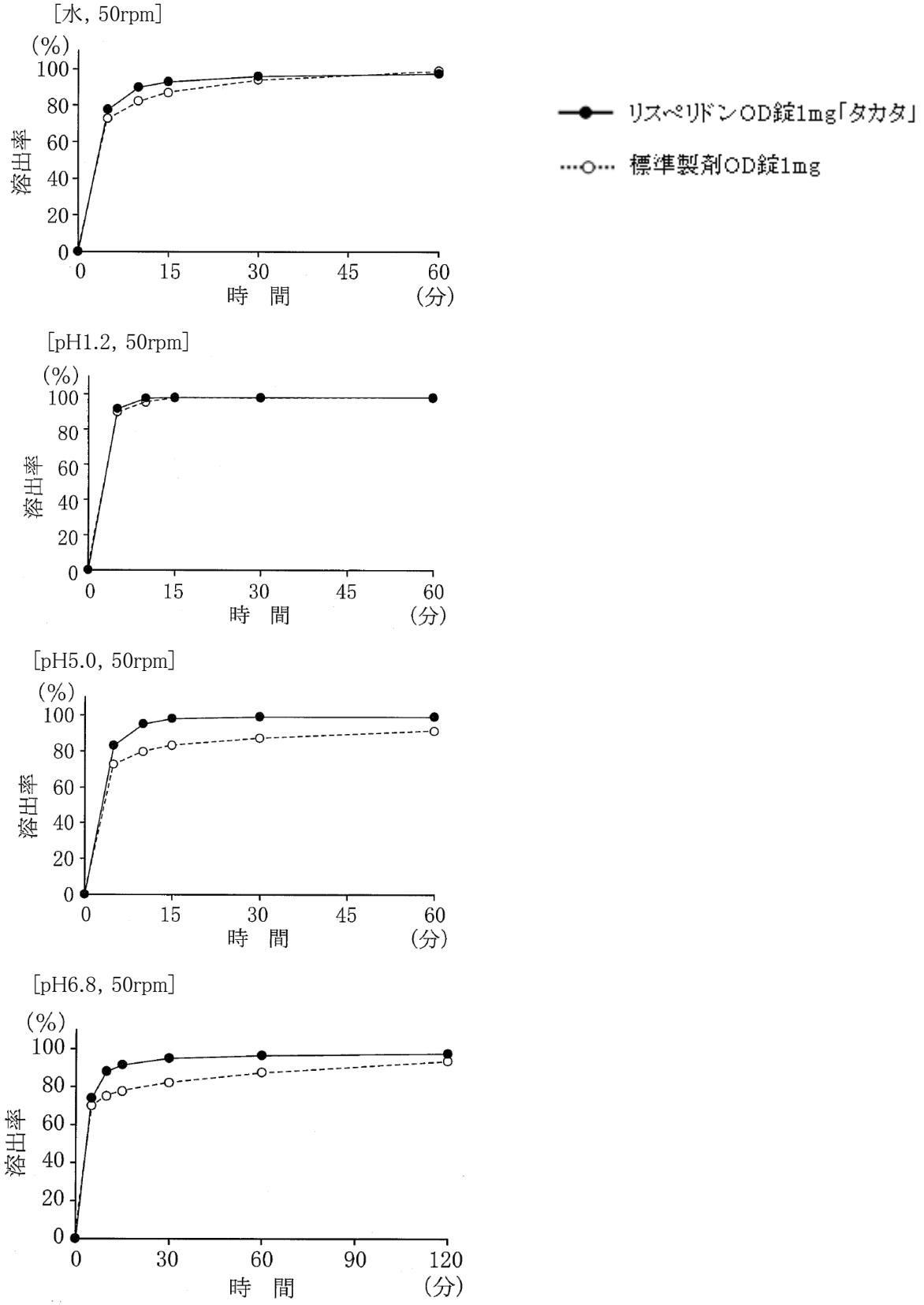
分　析　法：液体クロマトグラフィー

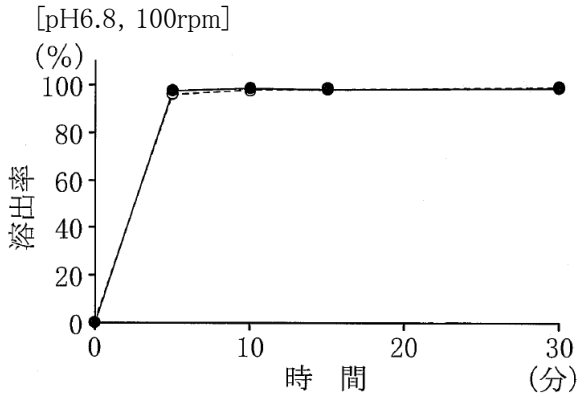
溶出挙動の類似性の判定基準：

回転数	試験液	判　定
50rpm	水	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±15%の範囲にある。
	pH1.2 溶出試験の第 1 液	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±15%の範囲にある。
	pH5.0 薄めた McIlvaine 緩衝液	標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点（5 分及び 15 分）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±15%の範囲にある。
	pH6.8 溶出試験の第 2 液	標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点（5 分及び 60 分）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±15%の範囲にある。
100rpm	pH6.8 溶出試験の第 2 液	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±15%の範囲にある。

判定結果：

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)			判定結果
試験方法	回転数	試験液	溶出率	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤	差	
パドル法	50rpm	水	85%以上	15	86.9	92.9	—	適合
		pH1.2	85%以上	15	97.3	97.9	—	適合
		pH5.0	±15%以内	5	72.3	82.9	10.6	適合
				15	83.1	97.7	14.6	適合
		pH6.8	±15%以内	5	69.9	73.9	4.0	適合
				60	87.3	96.4	9.1	適合
	100rpm	pH6.8	±15%以内	15	98.5	98.1	−0.4	適合


[水, 50rpm]
(%)
溶出率
100
80
60
40
20
0
0
15
30
45
60
時 間
(分)
[pH1.2, 50rpm]
(%)
溶出率
100
80
60
40
20
0
0
15
30
45
60
時 間
(分)
[pH5.0, 50rpm]
(%)
溶出率
100
80
60
40
20
0
0
15
30
45
60
時 間
(分)
[pH6.8, 50rpm]
(%)
溶出率
100
80
60
40
20
0
0
30
60
90
120
時 間
(分)
リスペリドンOD錠1mg「タカタ」
標準製剤OD錠1mg



● リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」[7)]

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日医薬審第 487 号)及び(平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号)」並びに「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正(平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査第 1124004 号)」に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動が同等であることが確認された。

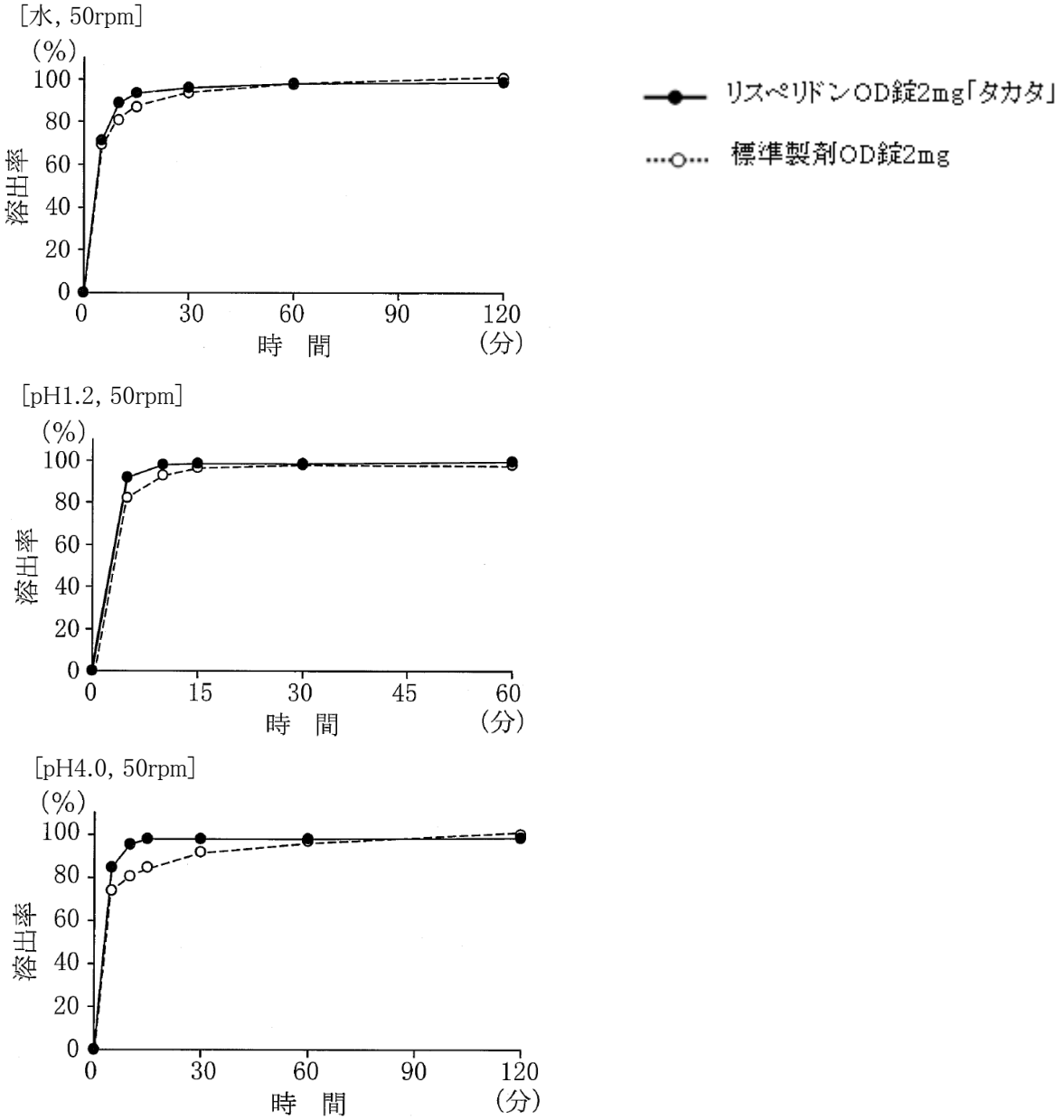
溶出試験法:パドル法
試　験　液:水、pH1.2、pH4.0、pH6.8
回　転　数:50rpm 及び 100rpm
分　析　法:液体クロマトグラフィー

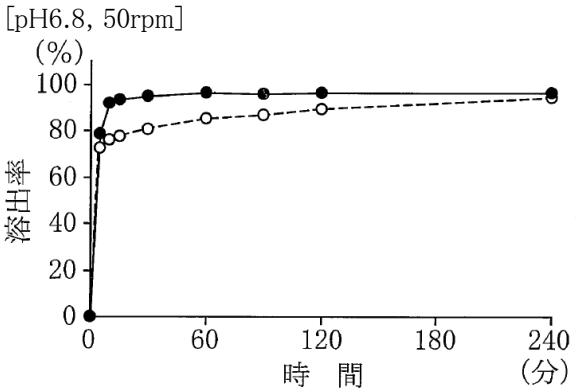
溶出挙動の類似性の判定基準:

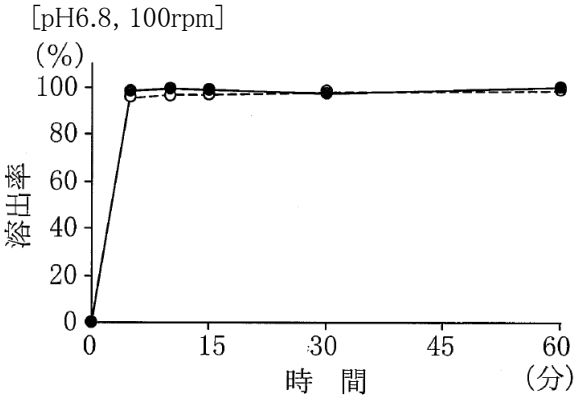
回転数	試験液	判　定
50rpm	水	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH1.2 溶出試験の第 1 液	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH4.0 薄めた McIlvaine 緩衝液	標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点(5 分及び 15 分)において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH6.8 溶出試験の第 2 液	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点(5 分及び 60 分)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±15%の範囲にある。
100rpm	pH6.8 溶出試験の第 2 液	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±15%の範囲にある。

判定結果：

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)			判定結果
試験方法	回転数	試験液	溶出率	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤	差	
パドル法	50rpm	水	85%以上	15	86.9	93.3	—	適合
		pH1.2	85%以上	15	96.5	98.2	—	適合
		pH4.0	±15%以内	5	73.6	84.5	10.9	適合
				15	84.6	97.8	13.2	適合
		pH6.8	±15%以内	5	72.7	78.7	6.0	適合
				60	85.1	96.5	11.4	適合
	100rpm	pH6.8	85%以上	15	96.8	98.7	—	適合







●リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」[7)]

本剤はリスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「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」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

溶出試験法:パドル法
試　験　液:水
回　転　数:50rpm
試 験 回 数:12 ベッセル
分　析　法:液体クロマトグラフィー

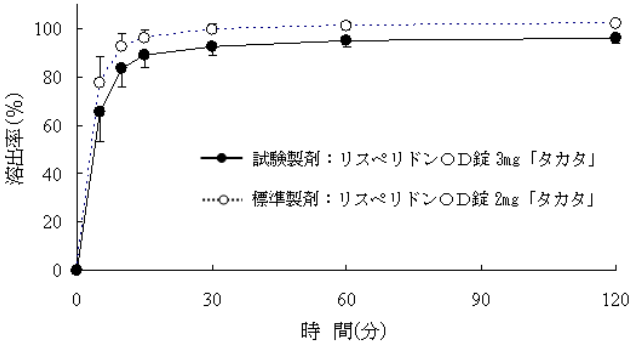
1)同等性の判定(平均溶出率)

回転数	試験液	判定溶出率	判定時間(分)	平均溶出率(%)		差(%)	判定
				試験製剤	標準製剤		
50rpm	水	85%以上	15	88.8	96.2	−7.4	適合

2）同等性の判定（個々の溶出率）

回転数	試験液	個々の溶出率		
		判定基準		判定
		±15%(試験液 水は±12%) :1 個以下	±25%(試験液 水は±20%) :なし	
50rpm	水	0	0	適合

[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)クエン酸・酢酸試液による呈色反応

(2)紫外線可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィーによる。

検出器:紫外吸光光度計 （測定波長:275nm）

カラム:内径 3.0mm、長さ 15cm のステンレス管に 3.5μm の液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲルを充填

移動相:水/アセトニトリル混液(4:1)にトリフルオロ酢酸 1.5mL を加えた後、アンモニア水(28)を加えて pH3.0 に調整する。

11. 力価

本剤は力価表示に該当しない。

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

＜リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」、リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」、リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」＞
統合失調症
小児期の自閉スペクトラム症に伴う易刺激性

＜リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」＞
統合失調症

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉
小児期の自閉スペクトラム症に伴う易刺激性に本剤を使用する場合は、原則として 5 歳以上 18 歳未満の患者に使用すること。

2. 用法及び用量

1.統合失調症
通常、成人にはリスペリドンとして 1 回 1mg1 日 2 回より開始し、徐々に増量する。維持量は通常 1 日 2～6mg を原則として 1 日 2 回に分けて経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。但し、1 日量は 12mg を超えないこと。
2.小児期の自閉スペクトラム症に伴う易刺激性
体重 15kg 以上 20kg 未満の患者：
通常、リスペリドンとして 1 日 1 回 0.25mg より開始し、4 日目より 1 日 0.5mg を 1 日 2 回に分けて経口投与する。症状により適宜増減するが、増量する場合は 1 週間以上の間隔をあけて 1 日量として 0.25mg ずつ増量する。但し、1 日量は 1mg を超えないこと。
体重 20kg 以上の患者：
通常、リスペリドンとして 1 日 1 回 0.5mg より開始し、4 日目より 1 日 1mg を 1 日 2 回に分けて経口投与する。症状により適宜増減するが、増量する場合は 1 週間以上の間隔をあけて 1 日量として 0.5mg ずつ増量する。但し、1 日量は、体重 20kg 以上 45kg 未満の場合は 2.5mg、45kg 以上の場合は 3mg を超えないこと。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉
本剤の活性代謝物はパリペリドンであり、パリペリドンとの併用により作用が増強するおそれがあるため、本剤とパリペリドンを含有する経口製剤との併用は、避けること。
（OD 錠のみの注意事項）
(1)0.25mg 単位での調節が必要な場合は、内用液又は細粒を使用すること。
(2)本剤は口腔内で速やかに崩壊することから唾液のみ（水なし）でも服用可能である。また、本剤は口腔粘膜からの吸収により効果発現を期待する製剤ではないため、崩壊後は唾液又は水で飲み込むこと。

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

ペロスピロン塩酸塩水和物、クエチアピンフマル酸塩、オランザピン、アリピプラゾール

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

リスペリドンは、セロトニン・ドパミン・アンタゴニスト（SDA：serotonin-dopamine antagonist）と呼ばれる非定型抗精神病薬で、5-HT_2 受容体と D_2 受容体拮抗作用を示す。両作用により統合失調症の陽性症状と陰性症状の両者に効果を発揮すると考えられている。[1)]

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

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[7)]

・リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」(水なしで服用):2.2±1.2 時間後(生物学的同等性試験より)

・リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」(水で服用):1.2±0.4 時間後(生物学的同等性試験より)

・リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」(水なしで服用):1.3±0.8 時間後(生物学的同等性試験より)

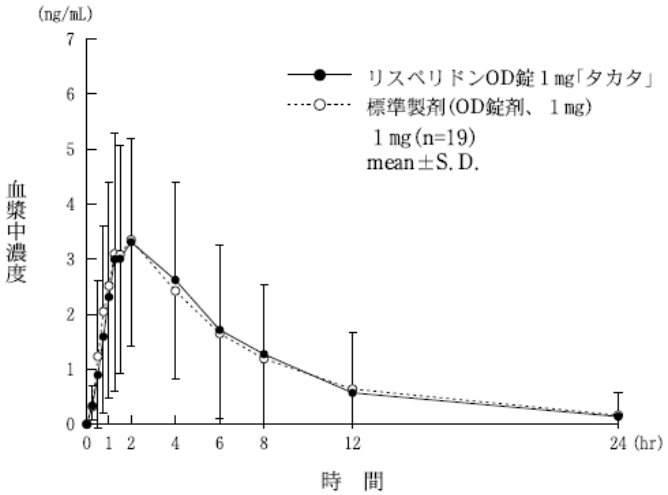
・リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」(水で服用):1.2±0.4 時間後(生物学的同等性試験より)

(3) 通常用量での血中濃度

●リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」[7)]

1) 水なしで服用

本剤と標準製剤(OD 錠剤、1mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子 19 名にそれぞれ1錠(リスペリドンとして1mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、4、6、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したリスペリドンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は log0.80～log1.25 の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



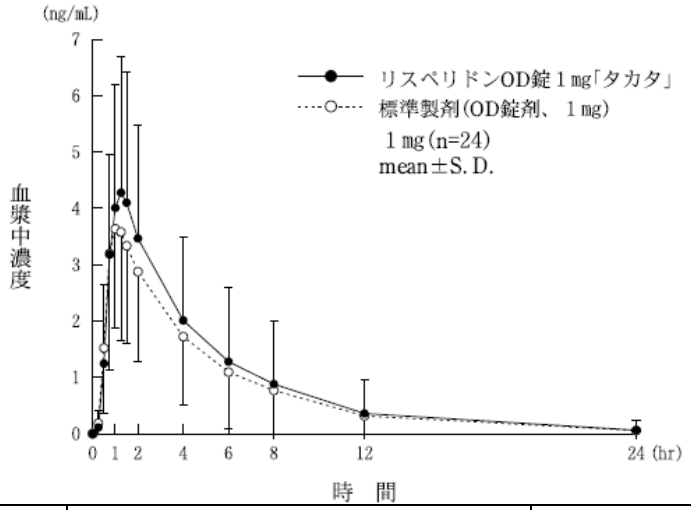
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	$t_{1/2}$(hr)
リスペリドンOD錠 1mg「タカタ」	25.16±22.78	4.03±2.13	2.2±1.2	3.4±1.8
標準製剤 (OD 錠剤、1mg)	25.42±23.93	3.93±2.19	1.7±1.0	3.6±2.1

(mean±S.D.)

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。

2) 水で服用

本剤と標準製剤(OD 錠剤、1mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子 24 名にそれぞれ1錠(リスペリドンとして1mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、4、6、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したリスペリドンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は log0.80～log1.25 の範囲にあり、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	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	$t_{1/2}$(hr)
リスペリドンOD錠 1mg「タカタ」	21.53±18.73	4.73±2.50	1.2±0.4	2.8±1.3
標準製剤 (OD 錠剤、1mg)	18.66±14.49	4.19±1.76	1.0±0.4	2.9±1.3

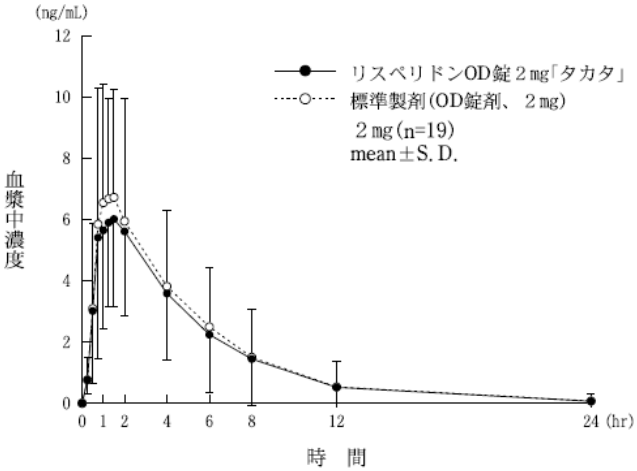
(mean±S.D.)

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。

●リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」[7)]

1) 水なしで服用

本剤と標準製剤(OD 錠剤、2mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子 19 名にそれぞれ1錠(リスペリドンとして 2mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、4、6、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したリスペリドンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は log0.80～log1.25 の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



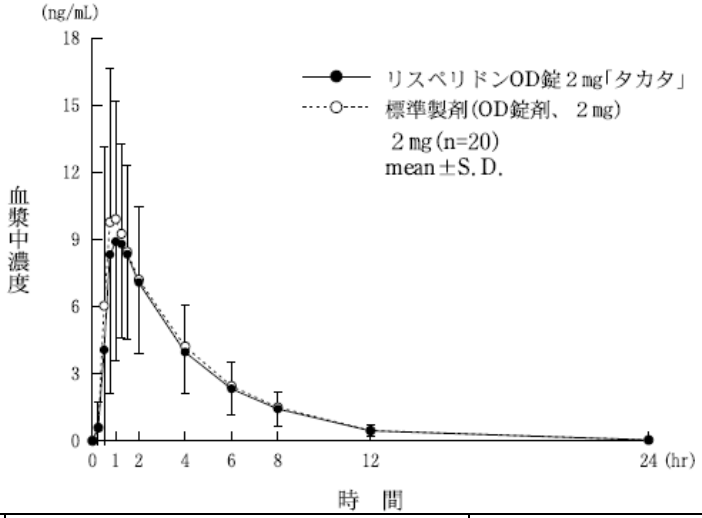
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	$t_{1/2}$(hr)
リスペリドンOD錠2mg「タカタ」	34.94±23.60	7.81±3.09	1.3±0.8	3.0±1.0
標準製剤(OD 錠剤、2mg)	37.49±25.96	8.13±3.99	1.4±0.9	2.8±1.0

(mean±S.D.)

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。

2) 水で服用

本剤と標準製剤(OD 錠剤、2mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子 20 名にそれぞれ1錠(リスペリドンとして 2mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、4、6、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したリスペリドンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は log0.80～log1.25 の範囲にあり、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	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	$t_{1/2}$(hr)
リスペリドンOD錠2mg「タカタ」	40.24±19.95	10.11±5.09	1.2±0.4	2.7±0.6
標準製剤(OD 錠剤、2mg)	42.74±19.94	11.14±6.02	1.0±0.2	2.7±0.7

(mean±S.D.)

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。

(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

該当資料なし

(4) 消失速度定数[7)]

・1mgOD 錠(水なしで服用):0.241±0.077(hr^{-1})
・1mgOD 錠(水で服用):0.287±0.090(hr^{-1})
・2mgOD 錠(水なしで服用):0.254±0.073(hr^{-1})
・2mgOD 錠(水で服用):0.265±0.057(hr^{-1})

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

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

該当資料なし

(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

CYP2D6、CYP3A4

(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

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. 昏睡状態の患者［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［中枢神経抑制作用が増強されることがある。］
3. 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）
4. 本剤の成分及びパリペリドンに対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果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。

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) 心・血管系疾患、低血圧、又はそ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。］

(2) 不整脈の既往歴のある患者、先天性 QT 延長症候群の患者又は 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［本剤の投与により QT が延長する可能性がある。］

(3) パーキンソン病又はレビー小体型認知症のある患者［悪性症候群（Syndrome malin）が起こりやすくなる。また、錐体外路症状の悪化に加えて、錯乱、意識レベルの低下、転倒を伴う体位不安定等の症状が発現するおそれがある。］

(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おそれがある。］

(5) 自殺企図の既往及び自殺念慮を有する患者［症状を悪化させるおそれがある。］

(6) 肝障害のある患者［肝障害を悪化させるおそれがある。］

(7) 腎障害のある患者［本剤の半減期の延長及び AUC が増大することがある。］

(8) 糖尿病又はその既往歴のある患者、あるいは糖尿病の家族歴、高血糖、肥満等の糖尿病の危険因子を有する患者［血糖値が上昇することがある。］（「Ⅷ. 6. 重要な基本的注意」、「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

(9) 高齢者(**「Ⅷ.9.高齢者への投与」**の項参照)
(10) 小児(**「Ⅷ.11.小児等への投与」**の項参照)
(11) 薬物過敏症の患者
(12) 脱水・栄養不良状態等を伴う身体的疲弊のある患者[悪性症候群が起こりやすい。]

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) **投与初期、再投与時、増量時**にα交感神経遮断作用に基づく**起立性低血圧**があらわれることがあるので、少量から徐々に増量し、低血圧があらわれた場合は減量等、適切な処置を行うこと。

(2) **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**よう注意すること。

(3) 統合失調症の患者においては、**興奮、誇大性、敵意等の陽性症状を悪化**させる可能性があるので観察を十分に行い、悪化がみられた場合には他の治療法に切り替えるなど適切な処置を行うこと。

(4) 本剤の投与により、高血糖や糖尿病の悪化があらわれ、糖尿病性ケトアシドーシス、糖尿病性昏睡に至ることがあるので、本剤投与中は、口渇、多飲、多尿、頻尿等の症状の発現に注意するとともに、特に糖尿病又はその既往歴あるいはその危険因子を有する患者については、血糖値の測定等の観察を十分に行うこと。(**「Ⅷ.5.慎重投与」**、**「Ⅷ.8.(2)重大な副作用と初期症状」**の項参照)

(5) 低血糖があらわれることがあるので、本剤投与中は、脱力感、倦怠感、冷汗、振戦、傾眠、意識障害等の低血糖症状に注意するとともに、血糖値の測定等の観察を十分に行うこと。(**「Ⅷ.8.(2)重大な副作用と初期症状」**の項参照)

(6) 本剤の投与に際し、あらかじめ上記(4)及び(5)の副作用が発現する場合があることを、患者及びその家族に十分に説明し、高血糖症状(口渇、多飲、多尿、頻尿等)、低血糖症状(脱力感、倦怠感、冷汗、振戦、傾眠、意識障害等)に注意し、このような症状があらわれた場合には、直ちに投与を中断し、医師の診察を受けるよう指導すること。(**「Ⅷ.5.慎重投与」**、**「Ⅷ.8.(2)重大な副作用と初期症状」**の項参照)

(7) 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。(**「Ⅷ.8.(2)重大な副作用と初期症状」**の項参照)

(8) 小児期の自閉スペクトラム症に伴う易刺激性に対して本剤を投与する場合は、定期的に安全性及び有効性を評価し、漫然と長期にわたり投与しないこと。

7. 相互作用

本剤は主として肝代謝酵素 CYP2D6 で代謝される。また、一部 CYP3A4 の関与も示唆される。

(1) 併用禁忌とその理由

併用禁忌(併用しないこと)

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。	アドレナリンはアドレナリン作動性α、β受容体の刺激剤であり、本剤のα受容体遮断作用によりβ受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される。

(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
中枢神経抑制剤 (バルビツール酸誘導体等)	相互に作用を増強することがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	本剤及びこれらの薬剤の中枢神経抑制作用による。
ドパミン作動薬	相互に作用を減弱することがある。	本剤はドパミン遮断作用を有していることから、ドパミン作動性神経において作用が拮抗する可能性がある。
降圧薬	降圧作用が増強することがある。	本剤及びこれらの薬剤の降圧作用による。
アルコール	相互に作用を増強することがある。	アルコールは中枢神経抑制作用を有する。
CYP2D6を阻害する薬剤 パロキセチン[8]等	本剤及び活性代謝物の血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤の薬物代謝酵素阻害作用による。
CYP3A4を誘導する薬剤 カルバマゼピン[9]、 フェニトイン、 リファンピシン[10]、 フェノバルビタール	本剤及び活性代謝物の血中濃度が低下することがある。	これらの薬剤のCYP3A4誘導作用による。
CYP3A4を阻害する薬剤 イトラコナゾール[11]等	本剤及び活性代謝物の血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤のCYP3A4阻害作用による。

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がみられることがある。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、死亡することがある。

(2) **遅発性ジスキネジア** 長期投与により、口周部等の不随意運動があらわれ、投与中止後も持

続することがある。

(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、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。なお、本剤は動物実験（イヌ）で制吐作用を有することから、悪心・嘔吐を不顕性化する可能性があるので注意すること。

(4) **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（SIADH）があらわれることがある。

(5) **肝機能障害、黄疸**　AST（GOT）、ALT（GPT）、γ-GTPの上昇等を伴う肝機能障害、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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(6) **横紋筋融解症**　筋肉痛、脱力感、CK（CPK）上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症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。

(7) **不整脈**　心房細動、心室性期外収縮等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するなど、適切な処置を行うこと。

(8) **脳血管障害**　脳血管障害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投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。

(9) **高血糖、糖尿病性ケトアシドーシス、糖尿病性昏睡**　高血糖や糖尿病の悪化があらわれ、糖尿病性ケトアシドーシス、糖尿病性昏睡に至ることがあるので、本剤投与中は、口渇、多飲、多尿、頻尿等の症状の発現に注意するとともに、血糖値の測定を行うなど十分な観察を行い、異常が認められた場合には、投与を中止し、インスリン製剤の投与等の適切な処置を行うこと。（**「Ⅷ.5.慎重投与」**、**「Ⅷ.6.重要な基本的注意」**の項参照）

(10) **低血糖**　低血糖があらわれることがあるので、脱力感、倦怠感、冷汗、振戦、傾眠、意識障害等の低血糖症状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。（**「Ⅷ.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」**の項参照）

(11) **無顆粒球症、白血球減少**　無顆粒球症、白血球減少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。

(12) **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。（**「Ⅷ.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」**の項参照）

(13) **持続勃起症**　α交感神経遮断作用に基づく持続勃起症があらわれることがあるので、このような場合には適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、適切な処置を行うこと。

	頻度不明
感染症および寄生虫症	気管支炎、鼻咽頭炎、咽頭炎、肺炎、胃腸炎、感染、膀胱炎、耳感染、インフルエンザ、限局性感染、気道感染、鼻炎、副鼻腔炎、皮下組織膿瘍、尿路感染、ウイルス感染、蜂巣炎、扁桃炎、眼感染、中耳炎、爪真菌症、ダニ皮膚炎

	頻度不明
血液およびリンパ系障害	貧血、血小板減少症、好中球減少症
免疫系障害注1)	**アナフィラキシー反応、過敏症**
内分泌障害	高プロラクチン血症
代謝および栄養障害	食欲不振、高脂血症、食欲亢進、多飲症、食欲減退、高尿酸血症、水中毒
精神障害	不眠症、不安、激越、妄想、うつ病、幻覚、抑うつ症状、躁病、被害妄想、精神症状、睡眠障害、緊張、自殺企図、錯乱状態、リビドー亢進、徘徊、リビドー減退、神経過敏、気力低下、情動鈍麻、無オルガズム症、悪夢、睡眠時遊行症
神経系障害注2)	**アカシジア、振戦、傾眠、構音障害、ふらつき、頭痛、ジストニー、鎮静、めまい、立ちくらみ、運動低下、ジスキネジア、パーキンソニズム、錐体外路障害、精神運動亢進、無動、痙攣、注意力障害、構語障害、しびれ感、よだれ、仮面状顔貌、頭部不快感、嗜眠、錯感覚、意識レベルの低下、会話障害（舌のもつれ等）、味覚異常、記憶障害、てんかん、末梢性ニューロパチー、協調運動異常、過眠症、弓なり緊張、失神、平衡障害、刺激無反応、運動障害、意識消失**
眼障害	調節障害、眼球回転発作、眼瞼痙攣、視力低下、眼脂、結膜炎、網膜動脈閉塞、霧視、眼充血、眼瞼縁痂皮、眼乾燥、流涙増加、羞明、緑内障、術中虹彩緊張低下症候群
耳および迷路障害	耳痛、回転性めまい、耳鳴
心臓障害注3)	**頻脈、洞性頻脈、動悸、心室性期外収縮、房室ブロック、右脚ブロック、上室性期外収縮、不整脈、徐脈、左脚ブロック、洞性徐脈**
血管障害注4)	**起立性低血圧、低血圧、高血圧、末梢冷感、潮紅、末梢循環不全**
呼吸器、胸郭および縦隔障害	鼻閉、呼吸困難、咳嗽、鼻漏、副鼻腔うっ血、睡眠時無呼吸症候群、口腔咽頭痛、鼻出血、肺うっ血、喘鳴、嚥下性肺炎、発声障害、気道うっ血、ラ音、呼吸障害、過換気
胃腸障害	便秘、流涎過多、悪心、嘔吐、嚥下障害、口内乾燥、胃不快感、下痢、胃炎、腹部膨満、腹痛、消化不良、上腹部痛、唾液欠乏、腸閉塞、膵炎、歯痛、糞塊充塞、便失禁、口唇炎、舌腫脹
肝胆道系障害注1)	**肝機能異常**
皮膚および皮下組織障害	多汗症、発疹、そう痒症、湿疹、過角化、紅斑、ざ瘡、脱毛症、血管浮腫、皮膚乾燥、頭部粃糠疹、脂漏性皮膚炎、皮膚変色、皮膚病変、蕁麻疹、水疱
筋骨格系および結合組織障害	筋固縮、筋肉痛、斜頸、筋攣縮、関節硬直、筋力低下、背部痛、四肢痛、関節痛、姿勢異常、筋骨格痛、頚部痛、筋骨格系胸痛、筋痙縮
腎および尿路障害注5)	**排尿困難、尿閉、頻尿、尿失禁**
生殖系および乳房障害	月経障害、無月経、乳汁漏出症、不規則月経、射精障害、女性化乳房、性機能不全、乳房不快感、勃起不全、月経遅延、希発月経、腟分泌物異常、乳房腫大、乳房分泌
全身障害および投与局所様態	易刺激性、倦怠感、口渇、無力症、疲労、歩行障害、発熱、気分不良、胸部不快感、胸痛、顔面浮腫、末梢性浮腫、疼痛、不活発、浮腫、低体温、インフルエンザ様疾患、悪寒、薬剤離脱症候群

	頻度不明
臨床検査[注3)]	ALT(GPT)増加、CK(CPK)増加、AST(GOT)増加、血中クレアチニン増加、血中ブドウ糖増加、LDH増加、血圧低下、血中プロラクチン増加、血中ナトリウム減少、血中トリグリセリド増加、血中尿素増加、**心電図異常、心電図QT延長、**好酸球数増加、γ-GTP増加、グリコヘモグロビン増加、血小板数減少、総蛋白減少、体重減少、体重増加、白血球数減少、白血球数増加、尿中蛋白陽性、Al-P増加、ヘマトクリット減少、**心電図T波逆転**、血中尿酸増加、尿中血陽性、肝酵素上昇、尿糖陽性
傷害、中毒および処置合併症	転倒・転落、引っかき傷、処置による疼痛

注1)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。(太字)
注2)症状があらわれた場合には必要に応じて減量又は抗パーキンソン薬の投与等、適切な処置を行うこと。(太字)
注3)心電図に異常があらわ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。(太字)
注4)増量は徐々に行うなど慎重に投与すること。(太字)
注5)異常が認められた場合には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。

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】
4.本剤の成分及びパリペリドンに対し過敏症の既往歴のある患者

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く、また、腎機能障害を有する患者では最高血漿中濃度が上昇し、半減期が延長することがあるので、少量(1回0.5mg)から投与するなど、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、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。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。[ヒトで乳汁移行が認められている[12)]。]

11. 小児等への投与

統合失調症:低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

小児期の自閉スペクトラム症に伴う易刺激性:低出生体重児、新生児、乳児、5 歳未満の幼児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

添付文書に記載なし

13. 過量投与

徴候、症状:一般に報告されている徴候、症状は、本剤の作用が過剰に発現したものであり、傾眠、鎮静、頻脈、低血圧、QT 延長、錐体外路症状等である。
処置:特別な解毒剤はないので、症状に対して一般的な対症療法を行うこと。必要に応じて、気道を確保し、酸素の供給及び換気を十分に行うこと。胃洗浄、活性炭及び緩下剤の投与等の実施を検討し、不整脈検出のための継続的な心・血管系のモニタリングを速やかに開始すること。

14. 適用上の注意

(1)**薬剤交付時**:PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。[PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]
(2)**服用時**
1)本剤は舌の上にのせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。
2)本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

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) 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、本剤を含む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。
(3) 本剤を含む α_1 アドレナリン拮抗作用のある薬剤を投与された患者において、白内障手術中に術中虹彩緊張低下症候群が報告されている。術中・術後に、眼合併症を生じる可能性があるので、術前に眼科医に本剤投与歴について伝えるよう指導すること。
(4) 本剤は動物実験(イヌ)で制吐作用を有することから、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可能性がある。
(5) げっ歯類(マウス、ラット)に臨床常用量の 4.7～75 倍(0.63～10mg/kg/日)を 18～25 ヵ月間経口投与したがん原性試験において、0.63mg/kg/日以上で乳腺腫瘍(マウス、ラット)、2.5mg/kg/日以上で下垂体腫瘍(マウス)及び膵臓内分泌部腫瘍(ラット)の発生頻度の上昇が報告されている。これらの所見は、プロラクチンに関連した変化として、げっ歯類ではよく知られている。

16. その他

【取り扱い上の注意】

1.高温多湿を避けて保管すること。

2.使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。

3.小児の手の届かない所に保管すること。

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) 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:

リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」: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)

リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」: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)

リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」: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)

リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」: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:リスペリドン:毒薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：外箱等に表示(3 年)

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

「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」、「Ⅷ.16.その他」の項参照。

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

	包　装
リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」	PTP 包装:　100 錠(10 錠×10)
リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」 リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」 リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」	PTP 包装:　100 錠(10 錠×10) バラ包装:　500 錠(プラスチック瓶)

7. 容器の材質

リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」	PTP:ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
リスペリドン OD 錠 1mg・2mg・3mg「タカタ」	PTP:ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔 バラ包装:ポリエチレン瓶、ポリプロピレンキャップ

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬: リスパダール錠 1mg・2mg・3mg、OD 錠 0.5mg・1mg・2mg、細粒 1%、内用液 1mg/mL
同　効　薬:ペロスピロン塩酸塩水和物、クエチアピンフマル酸塩、オランザピン、アリピプラゾール

9. 国際誕生年月日

1993 年 6 月 1 日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

	製造承認年月日	承認番号
リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」	2011 年 7 月 15 日	22300AMX00945
リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」	2008 年 7 月 13 日	22100AMX02103
リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」	2008 年 7 月 13 日	22100AMX02104
リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」	2008 年 7 月 13 日	22100AMX02105

11. 薬価基準収載年月日

リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」	2011 年 11 月 28 日
リスペリドン OD 錠 1mg・2mg・3mg「タカタ」	2009 年 11 月 13 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

2020 年 9 月 16 日:小児期の自閉スペクトラム症に伴う易刺激性(リスペリドン OD 錠 0.5mg・1mg・2mg「タカタ」)

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

厚生労働省告示第 97 号(平成 20 年 3 月 19 日付)で定められた「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT コード(9 桁)	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
リスペリドン OD 錠 0.5mg「タカタ」	120939601	1179038F7013	622093901
リスペリドン OD 錠 1mg「タカタ」	119440101	1179038F5010	621944001
リスペリドン OD 錠 2mg「タカタ」	119441801	1179038F6017	621944101
リスペリドン OD 錠 3mg「タカタ」	119442501	1179038F8010	621944201

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) 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-5756, 2016.

2) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 0.5mg:安定性試験)

3) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 1mg:安定性試験)

4) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 2mg:安定性試験)

5) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 3mg:安定性試験)

6) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 0.5mg:生物学的同等性試験)

7) 陶 易王 他:医学と薬学,62(3):535, 2009.

8) Saito, M., et al. : J. Clin. Psychopharmacol., 25, 527, 2005

9) Spina, E., et al. : Ther. Drug Monit., 22, 481, 2000

10) Mahatthanatrakul, W., et al. : J. Clin. Pharm. Ther., 32, 161, 2007

11) Jung, S. M., et al. : Clin. Pharmacol. Ther., 78, 520, 2005

12) Hill, R. C., et al. : J. Clin. Psychopharmacol., 20, 285, 2000

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. その他の関連資料

該当資料なし

MEMO

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

RISOD-1(21)