2024 年 3 月改訂（第 15 版）

日本標準商品分類番号
871169

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（一部 2018 に準拠）

ドパミンD_1、D_2作動性パーキンソン病治療剤

ペルゴリドメシル酸塩錠

ペルゴリド錠50μg 「VTRS」
ペルゴリド錠250μg「VTRS」

PERGOLIDE Tablets

剤形	素錠
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	ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」 1 錠中 ペルゴリドメシル酸塩 65.3μg （ペルゴリドとして 50μg） ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」 1 錠中 ペルゴリドメシル酸塩 327μg （ペルゴリドとして 250μg）
一般名	和名：ペルゴリドメシル酸塩（JAN） 洋名：Pergolide Mesilate（JAN）
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：2014年 2月12日 （販売名変更） 薬価基準収載年月日：2022年 4月 1日 （販売名変更） 発 売 年 月 日：2004年 7月12日
開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販 売 元：ヴィアトリス製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 https://www.viatris-e-channel.com/

本 IF は 2024 年 2 月改訂の電子化された添付文書の記載に基づき改訂した。最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要　－日本病院薬剤師会－

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

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

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

最新版の e-IF は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」(https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する PMDA ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

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

2. IF とは

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

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

［IF の様式］

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

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

［IF の作成］

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

［IF の発行］

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

3. IF の利用にあたって

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

電子媒体の IF については、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」に掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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） …… 2
6．慣用名、別名、略号、記号番号 …… 2
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 …… 9
6．他剤との配合変化(物理化学的変化) …… 10
7．溶出性 …… 10
8．生物学的試験法 …… 13
9．製剤中の有効成分の確認試験法 …… 14
10．製剤中の有効成分の定量法 …… 14
11．力価 …… 14
12．混入する可能性のある夾雑物 …… 14
13．注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 …… 14
14．その他 …… 14

Ⅴ．治療に関する項目 …… 15
1．効能又は効果 …… 15
2．効能又は効果に関連する注意 …… 15
3．用法及び用量 …… 15
4．用法及び用量に関連する注意 …… 15
5．臨床成績 …… 15

Ⅵ．薬効薬理に関する項目 …… 18
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 18
2．薬理作用 …… 18

Ⅶ．薬物動態に関する項目 …… 19
1．血中濃度の推移・測定法 …… 19
2．薬物速度論的パラメータ …… 21
3．吸収 …… 21
4．分布 …… 21
5．代謝 …… 22
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 …… 23

Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目 …… 24
1．警告内容とその理由 …… 24
2．禁忌内容とその理由 …… 24
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 24
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 24
5．重要な基本的注意とその理由 …… 24
6．特定の背景を有する患者に関する注意 …… 25
7．相互作用 …… 26
8．副作用 …… 27
9．臨床検査結果に及ぼす影響 …… 29
10．過量投与 …… 29
11．適用上の注意 …… 29
12．その他の注意 …… 29

Ⅸ．非臨床試験に関する項目 …… 31
1．薬理試験 …… 31
2．毒性試験 …… 31

Ⅹ．管理的事項に関する項目 …… 32
1．規制区分 …… 32
2．有効期間又は使用期限 …… 32
3．貯法・保存条件 …… 32
4．薬剤取扱い上の注意点 …… 32
5．承認条件等 …… 32
6．包装 …… 32
7．容器の材質 …… 33
8．同一成分・同効薬 …… 33
9．国際誕生年月日 …… 33
10．製造販売承認年月日及び承認番号 …… 33
11．薬価基準収載年月日 …… 33
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 …… 33
13．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 …… 33
14．再審査期間 …… 33
15．投薬期間制限医薬品に関する情報 …… 33
16．各種コード …… 34
17．保険給付上の注意 …… 34

XI．文献 …… 35
1．引用文献 …… 35
2．その他の参考文献 …… 35

XII．参考資料 …… 36
1．主な外国での発売状況 …… 36
2．海外における臨床支援情報 …… 36

XIII．備考 …… 37
その他の関連資料 …… 37

Ⅰ．概要に関する項目

1. 開発の経緯

ペルゴリドメシル酸塩は、麦角アルカロイドの誘導体で、ドパミン作動薬のパーキンソン病治療剤であり、本邦では、1994 年に上市されている。

メシル酸ペルゴリド錠 50μg「メルク」及びメシル酸ペルゴリド錠 250μg「メルク」は、マイラン製薬が後発医薬品として開発を企画し、医薬発第 481 号（平成 11 年 4 月 8 日）に基づき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し、2004 年 2 月に承認を取得した。

その後、販売名を、2008 年 2 月にメシル酸ペルゴリド錠 50μg「マイラン」及びメシル酸ペルゴリド錠 250μg「マイラン」、2014 年 2 月にペルゴリド錠 50μg「ファイザー」及びペルゴリド錠 250μg「ファイザー」に変更した。

2022 年 4 月、マイラン製薬株式会社からマイラン EPD 合同会社（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社）へ製造販売移管したため、販売名をペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」及びペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. シナプス後ドパミン D_1、D_2 受容体を直接刺激することにより、ドパミン神経系の伝達を活性化し、パーキンソン病によるふるえやこわばりを改善する[1)]。
2. 重大な副作用として、悪性症候群（Syndrome malin）、間質性肺炎、胸膜炎、胸水、胸膜線維症、肺線維症、心膜炎、心膜滲出液、心臓弁膜症、後腹膜線維症、突発的睡眠、幻覚、妄想、せん妄、腸閉塞、意識障害、失神、肝機能障害、黄疸、血小板減少があらわれることがあるので、使用上の注意に留意すること。
3. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み
   1）包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている[2)～4)]。
   2）規格取り違えを防ぐための試みとして、複数規格の製剤は、上の規格（高用量）がある場合、記載含量の上に▲を配置し、下の規格（低用量）がある場合は、記載含量の下に▼を配置している。
   3）PTP シートや錠剤のデザインを工夫することで識別性を高めている。

＊「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名

（1）和名

ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」
ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」

（2）洋名

PERGOLIDE Tablets

（3）名称の由来

有効成分であるペルゴリドに剤形、含量及び「ＶＴＲＳ」を付した。

2．一般名

（1）和名（命名法）

ペルゴリドメシル酸塩　(JAN)

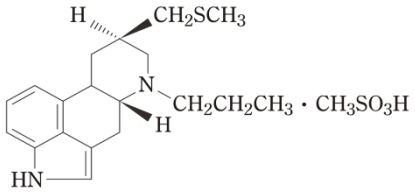
（2）洋名（命名法）

Pergolide Mesilate　(JAN)
Pergolide　(INN)

（3）ステム

dopamine receptor agonist　抗パーキンソン剤：　-golide

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：$C_{20}H_{30}N_2O_3S_2$
分子量：410.60

5．化学名（命名法）

(-)-8β-[(Methylthio)methyl]-6-propylergoline monomethanesulfonate（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

66104-22-1（Pergolide）

66104-23-2（Pergolide Mesilate）

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～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

（2）溶解性

N, N-ジメチルホルムアミド又はメタノールにやや溶けにくく、水又はエタノール（99.5）に溶けにくく、ジエチルエーテルにはほとんど溶けない。

0.01mol/L 塩酸・メタノール混液（1：1）にやや溶けにくい。

（3）吸湿性

該当資料なし

（4）融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

（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

旋光度〔α〕$^{20}_{D}$：-18～-23°

（脱水分換算、0.25g、*N, N*-ジメチルホルムアミド、25.0mL、100mm）

2．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3．有効成分の確認試験法

（1）4-ジメチルアミノベンズアルデヒド・塩化鉄（Ⅲ）試液による呈色反応

（2）紫外線照射による蛍光の確認

（3）赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

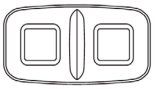
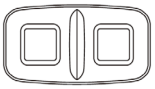
4．有効成分の定量法

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、外観及び性状

販売名	外形				色調等
	上面	下面	側面		
ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」					うすい黄色 割線入り 素錠
	長径 11.7 mm	短径 6.4 mm	厚さ 3.8 mm	重量 300 mg	
ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」					うすい緑色 割線入り 素錠
	長径 11.7 mm	短径 6.4 mm	厚さ 3.8 mm	重量 300 mg	

（2）製剤の物性

該当資料なし

（3）識別コード

ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」：MH792
ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」：MH793

（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

ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」
1錠中　ペルゴリドメシル酸塩　65.3μg
（ペルゴリドとして50μg）
ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」
1錠中　ペルゴリドメシル酸塩　327μg
（ペルゴリドとして250μg）

（2）添加物

ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」
結晶セルロース、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、アミノアルキルメタクリレートコポリマーE、メタクリル酸コポリマーL、カルメロースカルシウム、L-メチオニン、黄色三二酸化鉄、ステアリン酸マグネシウム
ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」
結晶セルロース、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、アミノアルキルメタクリレートコポリマーE、メタクリル酸コポリマーL、カルメロースカルシウム、銅クロロフィリンナトリウム、黄色三二酸化鉄、ステアリン酸マグネシウム

(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

1）加速試験[5)、6)]

試験条件：40±1℃、75±5%RH

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヵ月）の結果、ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」及びペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」は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。

①ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」

包装形態：PTP 包装（アルミピロー）

Lot.	試験項目	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
A	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験（1）（2）（3）	適合	適合*	適合*	適合*
	純度試験（%）	2.86～3.11	—	—	—
	製剤均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験（%）	87.2～96.3	—	—	—
	定量試験（%）	99.0～102.3	98.1～99.0	95.8～98.4	95.6～96.0
	(参考) 崩壊試験（分.秒）	4.15～9.30	4.29～9.08	4.35～9.26	3.33～9.00
B	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験（1）（2）（3）	適合	適合*	適合*	適合*
	純度試験（%）	2.92～3.13	—	—	—
	製剤均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験（%）	97.0～104.8	—	—	—
	定量試験（%）	97.7～99.6	97.1～100.1	98.5～101.0	95.7～96.5
	(参考) 崩壊試験（分.秒）	0.48～9.00	5.10～10.13	1.13～9.30	1.47～7.51
C	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験（1）（2）（3）	適合	適合*	適合*	適合*
	純度試験（%）	2.97～3.10	—	—	—
	製剤均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験（%）	88.6～94.5	—	—	—
	定量試験（%）	98.6～100.3	96.7～97.4	96.6～100.8	95.4～96.4
	(参考) 崩壊試験（分.秒）	3.30～9.16	6.07～8.34	2.02～8.47	3.34～8.31

*確認試験（3）は未実施

[判定値]
性状：割線入りのうすい黄色の素錠
確認試験（1）：4－ジメチルアミノベンズアルデヒド・塩化鉄（Ⅲ）試液による呈色反応（液は暗紫青色）
確認試験（2）：紫外可視吸光度測定法（波長 278～282nm に吸収の極大を、波長 286～290nm 付近に吸収の肩を示す）
確認試験（3）：定性反応（波長 366nm の紫外線を照射するとき、うすい帯青白色の蛍光を発する）
純度試験：スルホキシド体（6.0%以下）
製剤均一性試験：日局「含量均一性試験」に適合（判定値は 15.0%を超えない）
溶出試験：崩壊試験第 1 液、900mL、パドル法、50 回転で実施した時の 30 分間の溶出率は 75%以上である。
定量試験：93～107%

②ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」
包装形態：PTP 包装（アルミピロー）

Lot.	試験項目	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
A	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験（1）（2）（3）	適合	適合*	適合*	適合*
	純度試験（%）	1.17～1.18	—	—	—
	製剤均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験（%）	95.8～102.9	—	—	—
	定量試験（%）	98.6～101.0	97.4～101.4	98.3～103.7	97.3～100.2
	(参考) 崩壊試験（分.秒）	5.01～8.55	3.26～7.33	4.36～7.56	3.15～8.35
B	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験（1）（2）（3）	適合	適合*	適合*	適合*
	純度試験（%）	1.17～1.21	—	—	—
	製剤均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験（%）	94.0～106.9	—	—	—
	定量試験（%）	99.0～101.2	98.6～99.7	98.6～99.6	100.1～101.6
	(参考) 崩壊試験（分.秒）	1.10～7.42	0.34～7.43	1.31～7.25	3.06～8.55
C	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験（1）（2）（3）	適合	適合*	適合*	適合*
	純度試験（%）	1.16～1.20	—	—	—
	製剤均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験（%）	95.9～102.4	—	—	—
	定量試験（%）	97.3～100.4	96.6～97.3	98.8～102.3	99.7～102.4
	(参考) 崩壊試験（分.秒）	1.57～8.35	2.32～8.16	3.04～7.53	3.24～8.45

*確認試験（3）は未実施

［判定値］
性状：割線入りのうすい緑色の素錠
確認試験（1）：4－ジメチルアミノベンズアルデヒド・塩化鉄（Ⅲ）試液による呈色反応（液は暗紫青色）
確認試験（2）：紫外可視吸光度測定法（波長 278～282nm に吸収の極大を、波長 286～290nm 付近に吸収の肩を示す）
確認試験（3）：定性反応（波長 366nm の紫外線を照射するとき、うすい帯青白色の蛍光を発する）
純度試験：スルホキシド体（6.0%以下）
製剤均一性試験： 日局「含量均一性試験」に適合（判定値は 15.0%を超えない）
溶出試験：崩壊試験第 1 液、900mL、パドル法、50 回転で実施した時の 30 分間の溶出率は 75%以上である。
定量試験：93～107%

2）無包装状態の安定性[7)、8)]
【試験方法】保存条件：①温度 ：40℃ 遮光瓶（密閉）
②湿度 ：30℃/75%RH シャーレ開放
③光 ：2000lx（総照射量 134 万 lx・hr）シャーレ開放
測定時期：開始時、1、2、4 週間
試験項目：性状、含量、溶出性
試験回数：性状 3 回、含量 3 回、溶出性 1 回（6 ベッセル）

【試験結果】
製品名：ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」
① 温度に対する安定性試験［40℃］

測定項目	測定時期			
	開始時	1週間	2週間	4週間
性状	割線入りのうすい黄色の素錠	割線入りのうすい黄色の素錠	割線入りのうすい黄色の素錠	割線入りのうすい黄色の素錠
含量（%）［対開始時（%）］	98.4［100.0］	98.0［99.6］	97.4［99.0］	97.8［99.4］
溶出性（%）［最小－最大（%）］	101.3［98.7-103.3］			100.6［95.7-106.6］

② 湿度に対する安定性試験［30℃、75%RH］

測定項目	測定時期			
	開始時	1週間	2週間	4週間
性状	割線入りのうすい黄色の素錠	割線入りのうすい黄色の素錠	割線入りのうすい黄色の素錠	割線入りのうすい黄色の素錠
含量（%）［対開始時（%）］	98.4［100.0］	99.0［100.6］	98.7［100.3］	98.6［100.2］
溶出性（%）［最小－最大（%）］	101.3［98.7-103.3］			104.1［99.5-108.2］

③ 光に対する安定性試験［2000lx］

測定項目	測定時期			
	開始時	1週間	2週間	4週間
性状	割線入りの うすい黄色の素錠	割線入りの うすい黄色の素錠	割線入りの うすい黄色の素錠	割線入りの うすい黄色の素錠
含量（%） ［対開始時（%）］	98.4 ［100.0］	97.5 ［99.1］	96.5 ［98.1］	95.8 ［97.4］
溶出性（%） ［最小－最大（%）］	101.3 ［98.7-103.3］			99.9 ［94.6-105.6］

製品名：ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」

①温度に対する安定性試験［40℃］

測定項目	測定時期			
	開始時	1週間	2週間	4週間
性状	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠
含量（%） ［対開始時（%）］	99.3 ［100.0］	98.5 ［99.2］	98.5 ［99.2］	98.8 ［99.5］
溶出性（%） ［最小－最大（%）］	97.6 ［94.2-102.2］			95.2 ［88.5-98.0］

②湿度に対する安定性試験［30℃、75%RH］

測定項目	測定時期			
	開始時	1週間	2週間	4週間
性状	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠
含量（%） ［対開始時（%）］	99.3 ［100.0］	99.5 ［100.2］	98.9 ［99.6］	99.4 ［100.1］
溶出性（%） ［最小－最大（%）］	97.6 ［94.2-102.2］			93.6 ［85.7-98.5］

③光に対する安定性試験［2000lx］

測定項目	測定時期			
	開始時	1週間	2週間	4週間
性状	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠	割線入りの うすい緑色の素錠
含量（%） ［対開始時（%）］	99.3 ［100.0］	96.7 ［97.4］	94.6 ［95.3］	95.7 ［96.4］
溶出性（%） ［最小－最大（%）］	97.6 ［94.2-102.2］			92.1 ［87.3-103.4］

※本剤の無包装状態での保存は弊社としては推奨していない。

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）

該当しない

7. 溶出性

溶出挙動[9)、10)]

①ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」

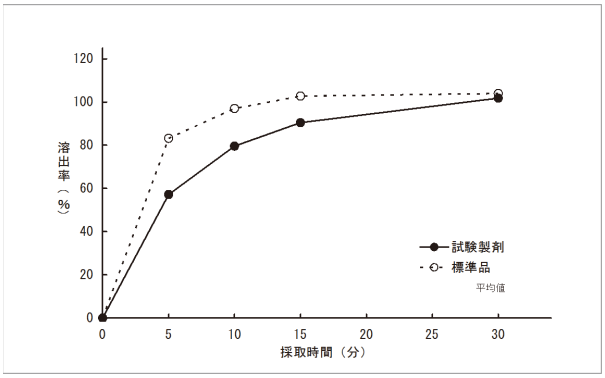
ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」と標準品の溶出試験を実施した結果、ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

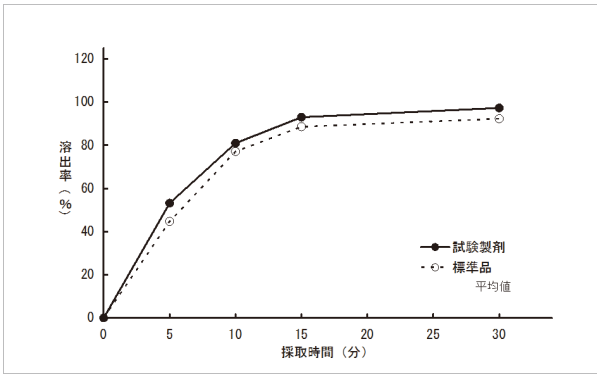
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2（日本薬局方溶出試験第 1 液） pH4.0（薄めた McIlvaine 緩衝液） pH6.8（日本薬局方溶出試験第 2 液） 水	900mL	50rpm

n=6

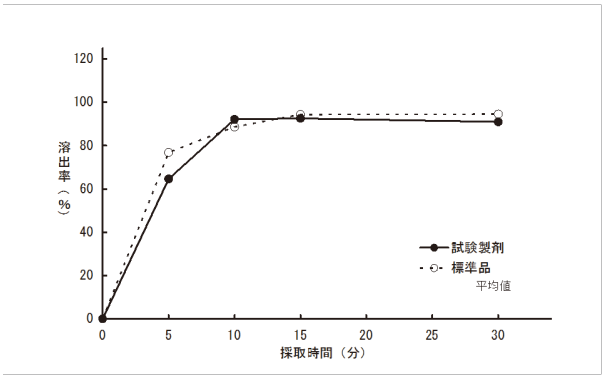
pH1.2（50rpm）



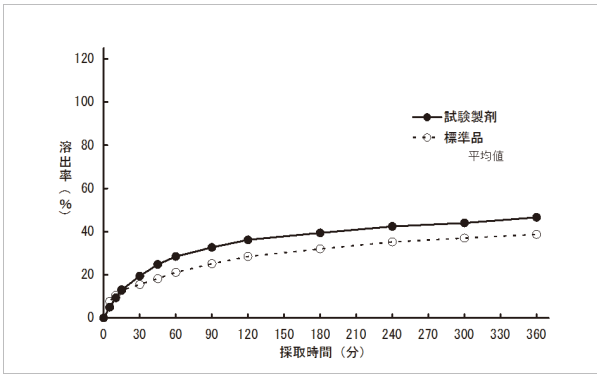
pH4.0（50rpm）



pH6.8（50rpm）



水（50rpm）



試験条件	薬剤	溶出率（%）											
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	90分	120分	180分	240分	300分	360分
pH1.2 50rpm	ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」	57.2 ±11.4	79.6 ±6.3	90.5 ±3.4	101.8 ±2.5	－	－	－	－	－	－	－	－
	標準品	83.2 ±17.1	97.0 ±7.9	102.8 ±2.2	104.0 ±1.7	－	－	－	－	－	－	－	－
pH4.0 50rpm	ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」	53.2 ±5.7	81.0 ±2.9	93.0 ±1.7	97.3 ±1.4	－	－	－	－	－	－	－	－
	標準品	44.7 ±7.5	77.1 ±6.7	88.6 ±3.0	92.3 ±2.5	－	－	－	－	－	－	－	－
pH6.8 50rpm	ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」	64.6 ±1.0	92.2 ±0.9	92.6 ±1.3	91.0 ±1.1	－	－	－	－	－	－	－	－
	標準品	76.9 ±5.9	88.7 ±3.7	94.4 ±1.8	94.6 ±1.2	－	－	－	－	－	－	－	－
水 50rpm	ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」	5.0 ±0.4	9.3 ±0.7	13.1 ±1.2	19.4 ±1.7	24.8 ±2.2	28.5 ±2.3	32.7 ±2.3	36.2 ±2.3	39.4 ±2.5	42.4 ±2.6	44.0 ±2.4	46.6 ±2.9
	標準品	7.7 ±0.7	10.5 ±0.5	12.8 ±0.6	15.5 ±0.8	18.2 ±0.9	21.1 ±1.3	25.1 ±1.2	28.5 ±1.4	32.0 ±1.9	35.2 ±2.1	37.0 ±2.1	38.7 ±2.1

平均値±標準偏差　n=6

公的溶出試験

ペルゴリド錠50μg「ＶＴＲＳ」は、局外規に定められたメシル酸ペルゴリド錠50μg錠の溶出規格の試験液において、15分間の溶出率が85%以上であり、判定基準に適合した。

試験液	判定時点	溶出率（%）		
		ロットA	ロットB	ロットC
溶出試験第2液	15分	90.8～101.4	95.5～103.2	96.4～104.1
判定		適合	適合	適合

各ロット　n=12

②ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」

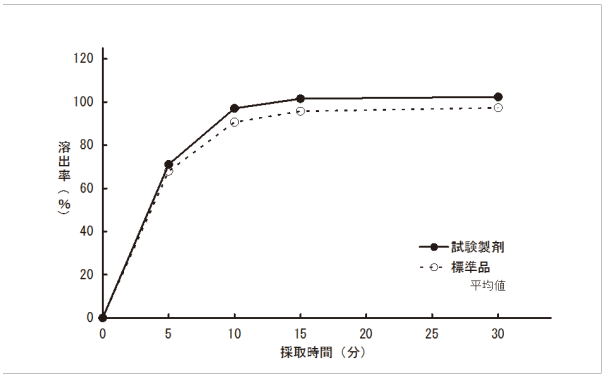
ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」と標準品の溶出試験を実施した結果、ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

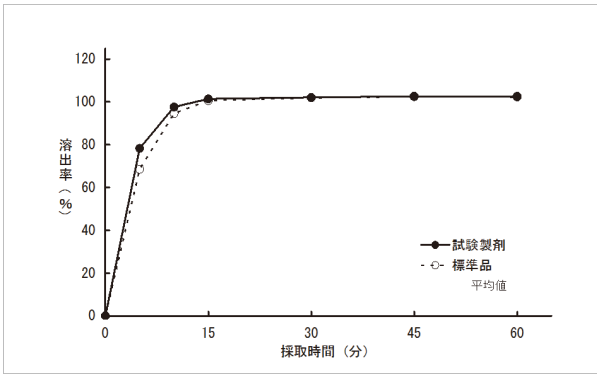
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2（日本薬局方崩壊試験第1液） pH5.0（薄めたMcIlvaine緩衝液） pH6.8（日本薬局方崩壊試験第2液） 水	900mL	50rpm
	pH6.8（日本薬局方崩壊試験第2液）	900mL	100rpm

n=12

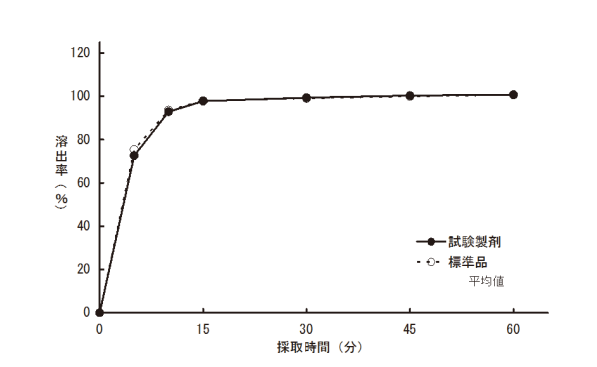
pH1.2（50rpm）



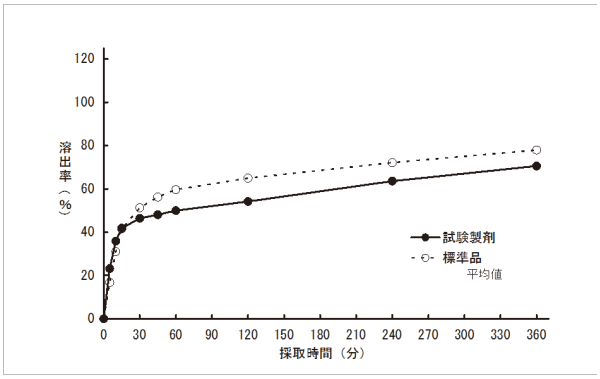
pH5.0（50rpm）



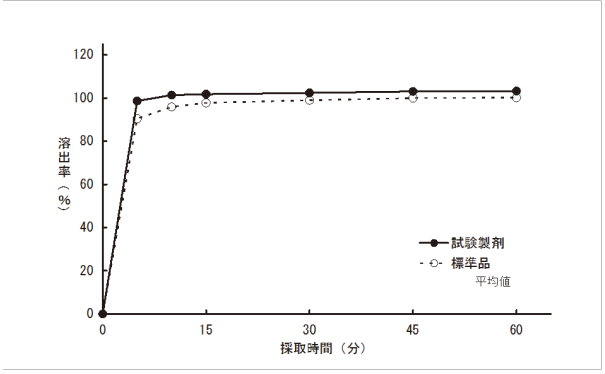
pH6.8（50rpm）



水（50rpm）



pH6.8（100rpm）



試験条件	薬剤	溶出率（%）								
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	120分	240分	360分
pH1.2 50rpm	ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」	71.1 ±19.1	97.1 ±6.6	101.6 ±5.0	102.4 ±4.8	－	－	－	－	－
	標準品	68.0 ±21.4	90.7 ±9.9	95.8 ±5.8	97.4 ±4.3	－	－	－	－	－
pH5.0 50rpm	ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」	78.3 ±8.6	97.6 ±3.8	101.4 ±2.6	102.1 ±2.6	102.6 ±2.7	102.3 ±2.7	－	－	－
	標準品	68.5 ±6.9	94.6 ±4.3	100.6 ±3.3	101.9 ±2.9	102.4 ±2.3	102.6 ±2.1	－	－	－
pH6.8 50rpm	ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」	72.6 ±6.9	92.9 ±3.7	97.8 ±2.6	99.4 ±2.0	100.4 ±1.8	100.8 ±1.9	－	－	－
	標準品	75.4 ±7.1	93.6 ±3.4	98.0 ±2.3	99.1 ±1.8	100.0 ±1.9	100.7 ±1.8	－	－	－
水 50rpm	ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」	23.2 ±6.6	35.9 ±5.6	41.9 ±3.7	46.4 ±3.2	48.1 ±2.5	50.0 ±2.1	54.2 ±2.0	63.6 ±2.3	70.6 ±2.4
	標準品	16.8 ±7.1	31.0 ±6.1	41.5 ±3.2	51.3 ±2.9	56.3 ±6.6	59.7 ±9.5	65.0 ±11.9	72.2 ±8.7	78.0 ±6.6
pH6.8 100rpm	ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」	98.7 ±5.0	101.4 ±3.1	101.8 ±2.5	102.4 ±2.2	103.1 ±1.8	103.3 ±2.0	－	－	－
	標準品	90.5 ±7.6	95.9 ±5.1	97.8 ±4.0	99.0 ±3.7	100.0 ±3.5	100.2 ±4.0	－	－	－

平均値±標準偏差　n=12

公的溶出試験

ペルゴリド錠250μg「ＶＴＲＳ」は、局外規に定められたメシル酸ペルゴリド錠250μg錠の溶出規格の試験液において、15分間の溶出率が85%以上であり、判定基準に適合した。

試験液	判定時点	溶出率（%）		
		ロットA	ロットB	ロットC
溶出試験第2液	15分	90.5～103.2	90.4～102.1	91.1～102.3
判定		適合	適合	適合

各ロット　n=12

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) 4-ジメチルアミノベンズアルデヒド・塩化鉄（Ⅲ）試液による呈色反応
(2) 紫外可視吸光度測定法
(3) 紫外線照射による蛍光の確認

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

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

4．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

5．効能又は効果に関連する注意
非麦角製剤の治療効果が不十分又は忍容性に問題があると考えられる患者のみに投与すること。［8.1 参照］

3．用法及び用量

（1）用法及び用量の解説

6．用法及び用量
本剤は通常、L-dopa 製剤と併用する。
通常、ペルゴリドとして 1 日 1 回 50μg を夕食直後 2 日間投与する。以後、2 ないし 3 日ごと、1 日用量として 50μg ずつ増量し、第 1 週末には 1 日用量として 150μg を投与する。
第 2 週目は 1 日用量として 300μg より開始し、2 ないし 3 日ごと 1 日用量として 150μg ずつ増量する。第 2 週末には 1 日用量として 600μg を投与する。1 日用量 100μg の場合は朝食及び夕食直後に、1 日用量 150μg 以上の場合は毎食直後に分けて経口投与する。
第 3 週目は 1 日用量 750μg より開始し、以後有効性及び安全性を考慮しつつ増量し、維持量（標準 1 日 750～1250μg）を定める。
なお、上に定める投与量増量速度は随伴症状、年齢等により適宜増減する。

（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

設定されていない

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
該当しない

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
該当しない

(7) その他
1) 国内後期第Ⅱ相試験

パーキンソン病（若年性パーキンソニズムを含む）の患者 317 例に 8 週間の L-dopa 併用オープン試験を行った。原則として投与開始の最初の 2 日間はペルゴリドを 1 日 50μg から始め、2 日ごとに 50～150μg ずつ増量した。投与開始後 2 週間で 750μg まで増量し、その後、適宜増減した。

ペルゴリドの 1 日最終投与量は 897±30μg（平均±標準誤差、n=314、最大 3900μg）であった。その結果、症状別評価スコアにおいては、全 29 の調査症状中 28 症状に有意な改善が認められた[11)]。

疾患名	有効率（%） （中等度改善以上）
パーキンソン病	52.9 （166/314例）

また、併用した L-dopa/DCI 投与量が下表のように低下した。

疾患名	L-dopa/DCI投与量 （L-dopaとして、mg/日）（n=299）	
	開始時	終了時
パーキンソン病	430±29	407±28

（平均±標準誤差）

副作用発現頻度は 42.6%（135/317 例）であった。主な副作用は、悪心・嘔気・嘔吐で 17.0%（54/317 例）、胃部不快感・もたれ 7.3%（23/317 例）、ジスキネジア 7.3%（23/317 例）、幻覚・幻視・幻聴 6.6%（21/317 例）、めまい・ふらつき 5.4%（17/317 例）、食欲不振 5.0%（16/317 例）、妄想 1.6%（5/317 例）であった。

注）本剤の承認された標準維持量は 1 日 750～1250μg である。

2）国内長期試験

パーキンソン病（若年性パーキンソニズムを含む）の患者 314 例に最長投与期間 2 年 10 ヵ月の L-dopa 併用長期試験を行った。原則として投与開始の最初の 2 日間はペルゴリドを 1 日 50μg から始め、2 日ごとに 50～150μg ずつ増量した。投与開始後 2 週間で 750μg まで増量し、その後、適宜増減した。

ペルゴリドの 1 日最終投与量は 1 年未満治療例で 852±78μg（平均±標準誤差、n=59）、1 年以上治療例で 1069±38μg（平均±標準誤差、n=255）であった。その結果、症状別評価スコアにおいては、1 年以上長期治療例において全 29 の調査症状中 27 症状に有意な改善が認められた[12]。

疾患名	治療例	有効率（%）[a] （中等度改善以上）
パーキンソン病	1年未満	34.2 （13/38例）
	1年以上	51.4 （126/245例）

a）症例数の分母には判定不能例を含まない。

また、併用した L-dopa/DCI 投与量が下表のように低下した。

疾患名	治療例	L-dopa/DCI投与量 （L-dopaとして、mg/日）（n=298）	
		開始時	終了時
パーキンソン病	1年未満	425±11	382±22 （n=55）
	1年以上		423±12 （n=243）

（平均±標準誤差）

主な副作用は、ジスキネジア 14.6%（46/314 例）、幻覚 13.4%（42/314 例）、嘔気・悪心 13.1%（41/314 例）、胃部不快感 11.5%（36/314 例）、食欲不振 9.9%（31/314 例）、めまい・ふらつき 7.0%（22/314 例）、妄想及び不安・興奮 各 5.4%（17/314 例）であった。

3）第Ⅲ相臨床試験

パーキンソン病（若年性パーキンソニズムを含む）の患者 228 例を対象にブロモクリプチンを対照薬とする 8 週間の L-dopa 併用二重盲検比較試験を実施した。最終 1 日平均投与量はペルゴリド 1258±60μg、ブロモクリプチン 14.6±0.6μg であった。その結果、有用性評価（有用以上）はペルゴリド群 48.5%（50/103 例）、ブロモクリプチン群 41.3%（43/104 例）と同等性が認められた[13]。副作用発現頻度はペルゴリド群 50.5%（55/109 例）、ブロモクリプチン群 42.2%（49/116 例）であった。ペルゴリド群の主な副作用は、胃部不快感 21.1%（23/109 例）、悪心・嘔気・むかつき 20.2%（22/109 例）、食欲不振・食欲低下 19.3%（21/109 例）、幻覚・幻視・幻聴・幻臭及び便秘 各 7.3%（8/109 例）、嘔吐及び口渇 各 5.5%（6/109 例）であった。

注）本剤の承認された標準維持量は 1 日 750～1250μg である。

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

ブロモクチプリンメシル酸塩、カベルゴリン、タリペキソール塩酸塩、レボドパ
注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、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[1)]

ペルゴリドは線条体におけるシナプス後ドパミン受容体を直接刺激することによりパーキンソン病に対する治療効果を発現すると考えられている。
ウシ脳より抽出した脳線条体膜において、脳内ドパミン D_1 及び D_2 両受容体に親和性を有する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 常同行動の誘発作用
ラットにおいて用量依存的に常同行動の誘発作用を示した[14)]。

2) 回転運動の誘発作用
黒質線条体片側破壊ラット（Ungerstedt モデル）において強い持続性の反側回転運動の誘発運動を示した[15)]。
また、同処置ラットにおいてα-methyl-paratyrosine の前処置を行っても、ペルゴリドによる反側回転運動は軽度しか抑制されなかった[16)]。

3) 抗振戦作用
腹内側被蓋野（VMT）を障害したサルにおいて生じる体位性振戦に対し、強い抗振戦作用を示した[17)]。

4) 黒質線条体ドパミン神経に及ぼす影響
ラットへの長期投与（2 年間）により、黒質線条体ドパミン神経の加齢に伴う変性の防止作用を示した[18)]。

5) ドパミン代謝回転率に及ぼす影響
ラットの脳内 3,4-dihydroxyphenyl acetic acid（DOPAC）含量を減少させ、ドパミン代謝回転率を減少させたが、セロトニン、ノルアドレナリンの代謝に対する影響は弱かった[19)]。

(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

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目」の「1.(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 血中濃度[20)]

外国人健康成人男性 3 例に ^{14}C-ペルゴリドメシル酸塩 138μg を単回経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった。

健康成人男性に単回経口投与したときの薬物動態パラメータ

投与量 (μg/人)	t_{max} (h)	C_{max} (ng eq/mL)	$t_{1/2,\beta}$ (h)
138	1～3	1.8[a)]	15～42

n=3

a) 平均値

2) 生物学的同等性試験[21)、22)]

①ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」

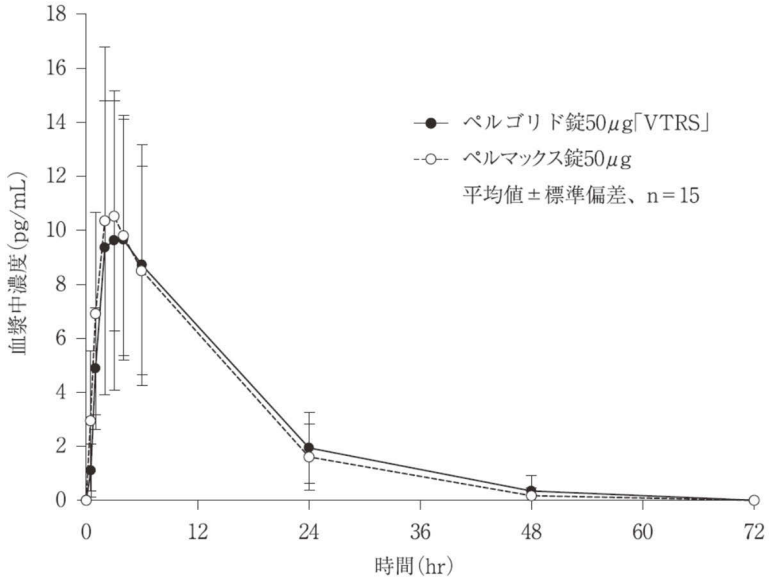
ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」とペルマックス錠 50μg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠(ペルゴリドとして 50μg)健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中ペルゴリド濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

血漿中ペルゴリドの薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_t (pg・hr/mL)	C_{max} (pg/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」	173.9±93.4	11.1±4.9	3.6±1.5	9.3±3.3
ペルマックス錠50μg	164.6±82.4	11.7±5.8	2.9±1.1	8.8±3.4

（平均値±標準偏差、n=15）

血漿中ペルゴリドの濃度推移



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」

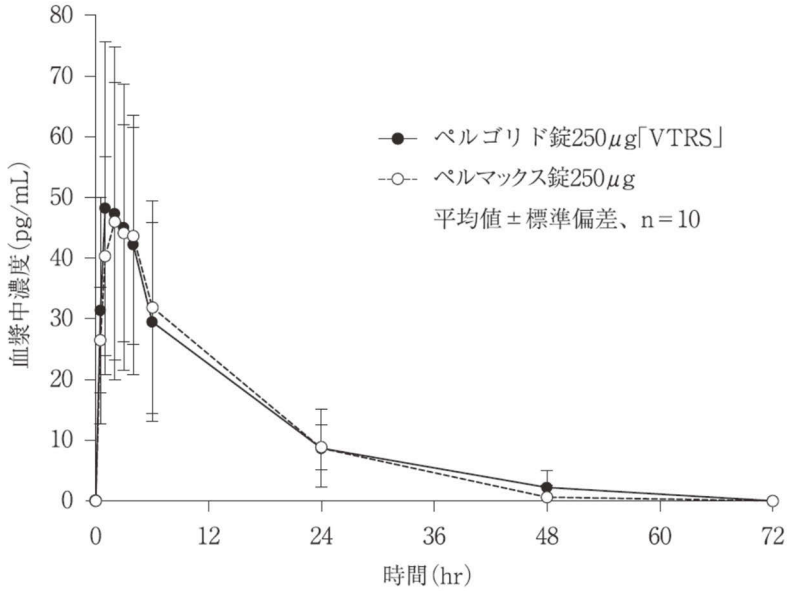
ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」とペルマックス錠 250μg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ペルゴリドとして 250μg）健康成人男子に食後単回経口投与して血漿中ペルゴリド濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

血漿中ペルゴリドの薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_t (pg・hr/mL)	C_{max} (pg/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」	758.5±453.5	54.4±28.8	3.1±1.1	10.7±4.1
ペルマックス錠250μg	736.0±365.2	52.6±22.3	3.6±1.3	9.0±1.4

（平均値±標準偏差、n=10）

血漿中ペルゴリドの濃度推移



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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

（健康成人男子に本剤を 1 錠単回経口投与した場合）

ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」: 0.0831±0.0280 h^{-1}

ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」: 0.0736±0.0284 h^{-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

ヒト血漿蛋白結合率は 97.1%であった。また、L-dopa 存在下でのペルゴリドメシル酸塩のヒト血漿蛋白結合率は 98.6%と変化は認められなかった[23]（*in vitro*）。

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

妊娠 12 日目のラットに ^{14}C-ペルゴリドメシル酸塩 2mg/kg を投与したときの胎児内の放射能濃度は、投与後 2 時間で最高濃度を示し、母体血漿中濃度の 50%であった[23]。

(3) 乳汁への移行性

授乳期ラットに ^{14}C-ペルゴリドメシル酸塩 2mg/kg を投与したときの乳汁中放射能濃度は、最高値でその時の血漿中濃度の 14 倍を示し、乳汁中移行性は高かった[23]。

(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

該当資料なし

(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

外国人健康成人男性 3 例に ^{14}C-ペルゴリドメシル酸塩 138μg を単回経口投与したときの放射能の排泄率は、尿中 55%、糞中 40%及び呼気 5%であった[23]。

(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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 麦角製剤に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 心エコー検査により、心臓弁尖肥厚、心臓弁可動制限及びこれらに伴う狭窄等の心臓弁膜の病変が確認された患者及びその既往のある患者［症状を悪化させるおそれがある。］［8.3、11.1.4 参照］

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「Ⅴ．治療に関する項目」の「2．効能又は効果に関連する注意」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 非麦角製剤と比較して、本剤を含む麦角製剤投与中の心臓弁膜症、線維症の報告が多いので、パーキンソン病に対する薬物療法について十分な知識・経験を持つ医師のもとで本剤の投与を開始するとともに、投与継続中はリスクとベネフィットを考慮すること。［5.、9.1.3、11.1.4 参照］

8.2 本剤の投与は、少量から開始し、消化器症状（悪心、嘔吐等）、血圧等の観察を十分に行い、慎重に維持量まで増量すること。

8.3 本剤の長期投与において心臓弁膜症があらわれることがあるので、投与前・投与中に以下の検査を行い、十分な観察を行うこと。なお、投与中止により改善がみられたとの報告例もある。［2.2、11.1.4 参照］

・本剤投与開始に際しては、聴診等の身体所見の観察、心エコー検査により潜在する心臓弁膜症の有無を確認すること。

・本剤投与中は、投与開始後 3～6 ヵ月以内に、それ以降は少なくとも 6～12 ヵ月ごとに心エコー検査を行うこと。また、十分な観察（聴診等の身体所見、胸部 X 線、CT 等）を定期的に行うこと。

8.4 線維症があらわれることがあるので、本剤投与中は十分な観察（身体所見、X 線、心エコー、CT 等）を適宜行うこと。［11.1.3、11.1.5 参照］

8.5 間質性肺炎があらわれることがあるので、患者に対し、本剤の投与中に発熱、咳嗽、呼吸困難等があらわれた場合には、本剤の服用を中止し、直ちに連絡するよう指導すること。［11.1.2 参照］

8.6 体位性ないし持続性の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開始し、血圧等の観察を十分に行い、慎重に投与すること。

8.7 前兆のない突発的睡眠、傾眠がみられることがあるので、自動車の運転、高所での作業等、危険を伴う作業には従事させないように注意すること。[11.1.6 参照]

8.8 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。

8.9 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、悪性症候群を誘発することがある。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、疼痛などの症状を特徴とする）があらわれることがある。[11.1.1 参照]

8.10 中止する際には漸減すること。本剤を長期にわたり服用している患者で、投与を突然中止すると幻覚を誘発するおそれがある。[11.1.7 参照]

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 精神病又はその既往のある患者

ドパミン受容体作動性のため統合失調症の症状である幻覚、妄想等を悪化させる可能性がある。

9.1.2 不整脈又はその既往のある患者

心房性期外収縮、洞性頻脈発症例の増加が報告されている。

9.1.3 胸膜炎、胸水、胸膜線維症、肺線維症、心膜炎、心膜滲出液、後腹膜線維症又はその既往のある患者

特に、麦角製剤投与中にこれらの疾患・症状を発現したことのある患者では、これらを悪化させる可能性がある。[8.1 参照]

9.1.4 レイノー病の患者

末梢血管障害を悪化させるおそれがある。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 腎障害又はその既往歴のある患者

腎障害等の症状が悪化することがある。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 肝障害又はその既往歴のある患者

国内臨床試験では除外されている。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

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が望ましい。外国で本剤の投与を受けた女性の一部が妊娠し、33 妊娠例で健児を出産したが、6 妊娠例では先天異常（重度 3 例、軽度 3 例）が認められたとの報告がある。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト乳汁移行の有無は不明であるが、薬理作用より乳汁分泌を抑制する可能性がある。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

用量に留意して患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。本剤は主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがある。

7. 相互作用

(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

10.2 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
降圧作用を有する薬剤	血圧低下がみられることがある。	本剤は降圧作用を有するため、血圧降下剤の作用を増強する可能性が考えられる[24]。
ドパミン拮抗剤 （フェノチアジン系薬剤、ブチロフェノン系薬剤、メトクロプラミド等）	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る。
蛋白結合に影響することが判明している薬剤	本剤の作用が増強することがある。	本剤は90%以上が血漿蛋白と結合するため、非結合型の血中濃度が上昇する可能性がある[20]。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 悪性症候群（頻度不明）

高熱、意識障害、高度の筋硬直、不随意運動、血清 CK の上昇等があらわれることがある。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。[8.9 参照]

11.1.2 間質性肺炎（0.1%未満）

発熱、咳嗽、呼吸困難、肺音の異常（捻髪音）等があらわれた場合には、速やかに胸部 X 線検査を実施し、異常が認められた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤投与等の適切な処置を行うこと。[8.5 参照]

11.1.3 胸膜炎、胸水、胸膜線維症、肺線維症、心膜炎、心膜滲出液（いずれも頻度不明）

胸痛、呼吸器症状等があらわれた場合には、速やかに胸部 X 線検査を実施し、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。[8.4 参照]

11.1.4 心臓弁膜症（頻度不明）

心雑音の発現又は増悪等があらわれた場合には、速やかに胸部 X 線検査、心エコー検査等を実施すること。心エコー検査等により、心臓弁尖肥厚、心臓弁可動制限及びこれらに伴う狭窄等の心臓弁膜の病変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。[2.2、8.1、8.3 参照]

11.1.5 後腹膜線維症（頻度不明）

背部痛、下肢浮腫、腎機能障害等があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。[8.4 参照]

11.1.6 突発的睡眠（頻度不明）
前兆のない突発的睡眠があらわれることがある。[8.7 参照]
11.1.7 幻覚、妄想（5%以上）**、せん妄**（0.1～5%未満）
[8.10 参照]
11.1.8 腸閉塞（0.1～5%未満）
11.1.9 意識障害（0.1%未満）**、失神**（頻度不明）
過度の血圧低下を起こし、一過性の意識障害、失神があらわれることがある。
11.1.10 肝機能障害（0.1%未満）**、黄疸**（頻度不明）
AST、ALT、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。
11.1.11 血小板減少（0.1～5%未満）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症		発疹、紅斑等		
精神神経系	不安・興奮・焦燥感、ジスキネジア、めまい・ふらつき	傾眠・ねむけ、頭がボーッとする、不眠、徘徊、夜間驚愕・夜間発声、うつ状態、性欲亢進等の精神症状、頭痛・頭重感、口内異和感、四肢のしびれ、すくみ足、振戦、無動、ジストニア、味覚障害、眼瞼痙攣、硬直感等の神経症状	錯乱	強剛
消化器	悪心、嘔吐、胃部不快感・胸やけ、食欲不振	便秘、口渇、胃痛・心窩部痛、腹部膨満感、口内炎・口中のあれ、下痢等	消化性潰瘍	
肝臓		肝機能異常（AST、ALT、Al-P、γ-GTP、LDH、ビリルビン）		
循環器		立ちくらみ・起立性低血圧、動悸、不整脈、徐脈、前胸部圧迫感、血圧上昇、血圧低下		レイノー現象
呼吸器		呼吸困難感・息切れ、鼻閉		しゃっくり
血液		白血球減少、貧血		
腎臓		浮腫、尿蛋白、尿潜血		BUN上昇、クレアチニン上昇
泌尿器		排尿障害	尿閉、尿失禁	
その他		全身けん怠感、脱力感、熱感、発汗・冷汗、月経停止、摂食異常、耳痛、脱毛	視覚異常	嚥下性肺炎、発熱、CK上昇、疼痛、紅痛症（四肢の熱感・発赤・痛みを伴う腫れ）、薬剤離脱症候群（無感情、不安、うつ、疲労感、発汗、疼痛など）[a]

a）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。
注）発現頻度は使用成績調査を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

1 回量 60mg を故意に服用した患者で嘔吐、低血圧、興奮が、また、処方量 1 日当たり 7mg のかわりに 1 日当たり 19mg を誤って 3 日間服用した患者では、重篤な幻覚が、更に、処方量 0.7mg のかわりに不注意で 7mg を投与された患者では動悸、低血圧、心室性期外収縮が認められている。

13.2 処置

活性炭の使用も考慮する。多くの例において催吐、胃洗浄よりも有効である。抗不整脈剤、フェノチアジン、ブチロフェノン系の抗精神病薬の投与も必要に応じ考慮する。透析、血液灌流の効果は確立されていない。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

14.2 薬剤投与時の注意

動物試験で眼刺激性及び吸入毒性が認められており、また、本剤の粉砕時に眼刺激、異臭、頭重感等が認められたとの報告があるので、以下の点に注意すること。

・粉砕は避けること。

・本剤は服薬直前に包装より取り出すこと。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 本剤による治療中、原因不明の突然死が報告されている。

15.1.2 外国の研究において、1 日 3000μg より多い投与量では、線維化による心臓弁膜症のリスクが高いとの報告がある。

（2）非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

動物実験（ラット及びマウス）で、長期大量投与により、子宮内膜腫瘍が低率で発生したとの報告がある。

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：ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」
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）
ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」
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：ペルゴリドメシル酸塩　劇薬

2．有効期間又は使用期限

有効期間：3 年
（「Ⅳ．製剤に関する項目」の「4．製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

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

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「11．適用上の注意」の項参照

（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．安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「11．適用上の注意」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

〈ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」〉
100 錠［10 錠（PTP）×10］
〈ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」〉
100 錠［10 錠（PTP）×10］

7. 容器の材質

PTP シート：ポリ塩化ビニル、アルミ

8. 同一成分・同効薬

同 一 成 分：ペルマックス錠 50μg・250μg （協和キリン株式会社）
同　効　薬：ブロモクリプチンメシル酸塩、カベルゴリン、タリペキソール塩酸塩、レボドパ

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

ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」
　製造販売承認年月日：2014 年 2 月 12 日（販売名変更による）
　承認番号：22600AMX00216
ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」
　製造販売承認年月日：2014 年 2 月 12 日（販売名変更による）
　承認番号：22600AMX00215

11. 薬価基準収載年月日

ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」：2022 年 4 月 1 日
ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」：2022 年 4 月 1 日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等（平成 18 年厚生労働省告示第 107 号）の一部を改正した平成 20 年厚生労働省告示第 97 号（平成 20 年 3 月 19 日付）の「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（13 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
ペルゴリド錠 50μg 「ＶＴＲＳ」	1164206040101	統一名：1169008F1018 個　別：1169008F1093	統一名：622711100 個　別：621642004
ペルゴリド錠 250μg 「ＶＴＲＳ」	1164213050101	統一名：1169008F2014 個　別：1169008F2090	統一名：622711200 個　別：621642105

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI．文献

1. 引用文献

1）Wong DT, et al.：Arzneim.-Forsch./Drug Res. 43(4)：409-412, 1993
2）中野泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（1）
－明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較－」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：25，2009
3）新井哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（2）
－低視力状態での可視性の比較－」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：29，2009
4）山本亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（3）
－低コントラスト状態での可視性の比較－」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：33，2009
5）社内資料：安定性試験（加速試験）（ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」）
6）社内資料：安定性試験（加速試験）（ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」）
7）社内資料：無包装状態の安定性（ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」）
8）社内資料：無包装状態の安定性（ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」）
9）社内資料：溶出試験（ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」）
10）社内資料：溶出試験（ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」）
11）楢林博太郎ほか：臨床医薬. 7：151-192，1991
12）楢林博太郎ほか：医学と薬学. 27：471-534，1992
13）楢林博太郎ほか：医学と薬学. 27：147-211，1992
14）Koller WC,et al.：Neuropharmacology. 19：831-837，1980
15）Clemens JA,et al.：Arz-Forsch. 43：281-286，1993
16）Duvoisin RC,et al.：Neurology. 32：1387-1391，1982
17）Goldstein M,et al.：Adv Neurol. 24：247-252，1979
18）Felten DL,et al.：Neurobiol Aging. 13：339-351，1992
19）Fuller RW,et al.：Life Sciences. 24：375-382，1979
20）Rubin A,et al.：Clin Pharmacol Ther. 30：258-265，1981
21）社内資料：生物学的同等性試験（ペルゴリド錠 50μg「ＶＴＲＳ」）
22）社内資料：生物学的同等性試験（ペルゴリド錠 250μg「ＶＴＲＳ」）
23）江角凱夫ほか：薬物動態. 7：61-69，1992
24）Yen TT,et al.：Life Sciences. 25：209-216，1979

2. その他の参考文献

参考文献 1）藤島 一郎 監修：内服薬経管投与ハンドブック第 2 版：37-43、東京、じほう、2006

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

その他の関連資料

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

本剤の簡易懸濁法試験（崩壊懸濁試験及び通過性試験）の報告を以下に示す。
なお、本剤を簡易懸濁しての投与は、承認された剤形での投与ではなく、適正使用の観点から、弊社としては推奨していない。
本剤を簡易懸濁しての投与については、各医療担当者の裁量と判断により行うこと。

【崩壊懸濁試験】
試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第 2 版」[参考文献 1)]に準じて実施。
・ディスペンサー内に薬剤を入れ 55℃の温湯 20mL を吸い取り、筒先の蓋をして 5 分間自然放置する。
・5 分後にディスペンサーを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。
・5 分後に崩壊しない場合、更に 5 分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止する。
・中止した錠剤はコーティング破壊をしてから同様に試験を行う。コーティング破壊はシートの上から錠剤を乳棒で数回叩いて行う。

【通過性試験】
試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第 2 版」[参考文献 1)]に準じて実施。
・崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をサイズ 8Fr.（フレンチ）の経管チューブに約 2～3mL／秒の速度で注入し、通過性を観察する。
・懸濁液を注入した後に適量の水を同じ注入器で吸い取り、注入してチューブ内を洗う時、チューブ内に薬が残存していなければ通過性に問題なしとする。

【試験結果】

剤型	簡易懸濁法				通過性試験
	水（約55℃）		破壊→水		通過サイズ
	5分	10分	5分	10分	
ペルゴリド錠50μg「VTRS」	×	○			8Fr.
ペルゴリド錠250μg「VTRS」	×	○			8Fr.

○：崩壊または懸濁した
×：崩壊または懸濁しない

文献請求先･製品情報お問い合わせ先

ヴィアトリス製薬株式会社　メディカルインフォメーション部
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号
フリーダイヤル　0120-419-043

製造販売元

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

販売元

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

VIATRIS

MIF13D113H