

## 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2018（2019年更新版）に準拠して作成

抗パーキンソン剤  
レボドパ・カルビドパ水和物錠  
レプリントン配合錠 L100  
LEPRINTON Combination Tablets

剤形	素錠
製剤の規制区分	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	1錠中にレボドパ 100mg、カルビドパ水和物 10.8mg（無水カルビドパとして 10mg）を含有する。
一般名	和名：レボドパ（JAN）、カルビドパ水和物（JAN） 洋名：Levodopa（JAN、INN）、Carbidopa Hydrate（JAN）
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日：2011年7月27日（販売名変更による）
薬価基準収載 ・販売開始年月日	薬価基準収載年月日：2012年6月22日（販売名変更による） 販売開始年月日：1994年9月6日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元 辰巳化学株式会社 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 <a href="https://www.viatris-e-channel.com/">https://www.viatris-e-channel.com/</a>

本IFは2024年2月改訂（第2版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要－日本病院薬剤師会－

(2020年4月改訂)

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。I F記載要領2008以降、I FはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

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

## 2. I Fとは

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

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・

判断・提供すべき事項等は I F の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された I F は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I F の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、PMD A の医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMD A の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

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

# 目次

I.	概要に関する項目	1	8.	トランスポーターに関する情報	17
1.	開発の経緯	1	9.	透析等による除去率	17
2.	製品の治療学的特性	1	10.	特定の背景を有する患者	17
3.	製品の製剤学的特性	1	11.	その他	17
4.	適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII.	安全性（使用上の注意等）に関する項目	18
5.	承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1.	警告内容とその理由	18
6.	RMP の概要	1	2.	禁忌内容とその理由	18
II.	名称に関する項目	2	3.	効能又は効果に関連する注意とその理由	18
1.	販売名	2	4.	用法及び用量に関連する注意とその理由	18
2.	一般名	2	5.	重要な基本的注意とその理由	18
3.	構造式又は示性式	2	6.	特定の背景を有する患者に関する注意	19
4.	分子式及び分子量	2	7.	相互作用	20
5.	化学名（命名法）又は本質	3	8.	副作用	21
6.	慣用名、別名、略号、記号番号	3	9.	臨床検査結果に及ぼす影響	23
III.	有効成分に関する項目	4	10.	過量投与	23
1.	物理化学的性質	4	11.	適用上の注意	23
2.	有効成分の各種条件下における安定性	4	12.	その他の注意	23
3.	有効成分の確認試験法、定量法	5	IX.	非臨床試験に関する項目	24
IV.	製剤に関する項目	6	1.	薬理試験	24
1.	剤形	6	2.	毒性試験	24
2.	製剤の組成	6	X.	管理的事項に関する項目	25
3.	添付溶解液の組成及び容量	6	1.	規制区分	25
4.	力価	7	2.	有効期間	25
5.	混入する可能性のある夾雑物	7	3.	包装状態での貯法	25
6.	製剤の各種条件下における安定性	7	4.	取扱い上の注意	25
7.	調製法及び溶解後の安定性	9	5.	患者向け資材	25
8.	他剤との配合変化（物理化学的変化）	9	6.	同一成分・同効薬	25
9.	溶出性	10	7.	国際誕生年月日	25
10.	容器・包装	12	8.	製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準取載年月日、販売開始年月日	25
11.	別途提供される資材類	12	9.	効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	25
12.	その他	12	10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	26
V.	治療に関する項目	13	11.	再審査期間	26
1.	効能又は効果	13	12.	投薬期間制限に関する情報	26
2.	効能又は効果に関連する注意	13	13.	各種コード	26
3.	用法及び用量	13	14.	保険給付上の注意	26
4.	用法及び用量に関連する注意	13	XI.	文献	27
5.	臨床成績	14	1.	引用文献	27
VI.	薬効薬理に関する項目	15	2.	その他の参考文献	27
1.	薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	XII.	参考資料	28
2.	薬理作用	15	1.	主な外国での発売状況	28
VII.	薬物動態に関する項目	16	2.	海外における臨床支援情報	28
1.	血中濃度の推移	16	XIII.	備考	29
2.	薬物速度論的パラメータ	16	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	29
3.	母集団（ポピュレーション）解析	16	2.	その他の関連資料	30
4.	吸収	16			
5.	分布	16			
6.	代謝	17			
7.	排泄	17			

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

レプリントン錠 100mg は、辰巳化学株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬発第 698 号（1980 年 5 月 30 日）に基づき、承認申請し、1993 年 5 月に承認を得て、1994 年 9 月発売に至った。

なお、医療事故防止対策に基づき、2011 年 7 月に販売名をレプリントン錠 100mg からレプリントン配合錠 L100 に変更した。

2022 年 6 月、ファイザー株式会社からヴィアトリス製薬株式会社へ販売移管した。

## 2. 製品の治療学的特性

本剤は、レボドパ及びカルビドパ水和物を有効成分とする抗パーキンソン剤である。

主な副作用として不随意運動、悪心、嘔吐、食欲不振がある。重大な副作用として、悪性症候群、錯乱、幻覚、抑うつ、溶血性貧血、血小板減少、突発的睡眠、閉塞隅角緑内障があらわれることがある。（「VIII. 8. 副作用」の項参照）

## 3. 製品の製剤学的特性

特になし

## 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として 作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

## 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

### (1) 承認条件

該当しない

### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

## 6. RMP の概要

該当しない

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

- (1) 和名：レプリントン配合錠 L100
- (2) 洋名：LEPRINTON Combination Tablets L100
- (3) 名称の由来  
特になし

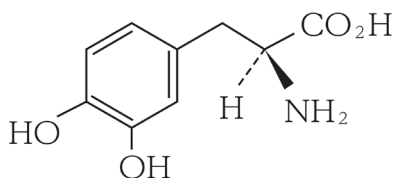
### 2. 一般名

- (1) 和名：レボドパ (JAN)  
カルビドパ水和物 (JAN)
- (2) 洋名：Levodopa (JAN、INN)  
Carbidopa Hydrate (JAN)  
Carbidopa (INN)
- (3) ステム：抗パーキンソン用剤／prolactin 阻害剤として用いられる dopamine 型の医薬品：  
-dopa

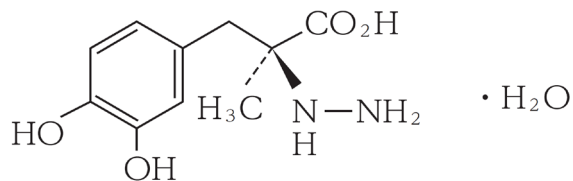
### 3. 構造式又は示性式

構造式：

#### ●レボドパ



#### ●カルビドパ水和物



### 4. 分子式及び分子量

#### ●レボドパ

分子式：C<sub>9</sub>H<sub>11</sub>NO<sub>4</sub>

分子量：197.19

●カルビドパ水和物

分子式： $C_{10}H_{14}N_2O_4 \cdot H_2O$

分子量：244.24

5. 化学名（命名法）又は本質

●レボドパ

3-Hydroxy-L-tyrosine (IUPAC)

●カルビドパ水和物

(2*S*)-2-(3,4-Dihydroxybenzyl)-2-hydrazinopropanoic acid monohydrate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

### III. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

###### ●レボドパ

白色又はわずかに灰色を帯びた白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

###### ●カルビドパ水和物

白色～帯黄白色の粉末である。

##### (2) 溶解性

###### ●レボドパ

ギ酸に溶けやすく、水に溶けにくく、エタノール (95) にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

###### ●カルビドパ水和物

メタノールにやや溶けにくく、水に溶けにくく、エタノール (95) に極めて溶けにくく、ジエチルエーテル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

###### ●レボドパ

融点：約 275°C (分解)

###### ●カルビドパ水和物

融点：約 197°C (分解)

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

###### ●レボドパ

飽和水溶液の pH は 5.0～6.5 である。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし



### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

#### 確認試験法

- レボドパ

日本薬局方による

- カルビドパ水和物

日本薬局方による

#### 定量法

- レボドパ

日本薬局方による

- カルビドパ水和物

日本薬局方による


## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

錠剤（素錠）

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	外形			色調 剤形
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)	
レプリントン配合錠 L100	 8.1	 4.3	 220	うす紅色 素錠 (割線入り)

#### (3) 識別コード

販売名	本体	包装材料
レプリントン配合錠 L100	TU-LP 100	Tu LP-100

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし

#### (5) その他

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分（1錠中）	添加剤
レプリントン配合錠 L100	レボドパ 100mg カルビドパ水和物 10.8mg (無水カルビドパとして 10mg)	トウモロコシデンプン、アルファ- 化デンプン、結晶セルロース、ヒド ロキシプロピルセルロース、低置換 度ヒドロキシプロピルセルロース、 含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マ グネシウム、黄色5号アルミニウム レーキ

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない

#### (3) 熱量

該当しない

### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

#### 4. 力価

該当しない

#### 5. 混入する可能性のある夾雑物

混入が予想される類縁物質としてメチルドパや 3-O-メチルカルビドパが日本薬局方医薬品各条で規定されている。

#### 6. 製剤の各種条件下における安定性

試験項目及び規格

試験項目	規 格
性状	うす紅色の割線入り錠剤
確認試験	(1) 呈色反応 規格：赤色を呈する（レボドパ） (2) 呈色反応 規格：濃緑色を経て直ちに褐色を呈する（カルビドパ水和物） (3) 呈色反応 規格：赤色を呈する（カルビドパ水和物） (4) 薄層クロマトグラフィー 規格：試料溶液及び標準溶液から得られたスポットの Rf 値は等しい
崩壊性	日本薬局方一般試験法の崩壊試験法
定量	表示量の 95～105%に対応するレボドパを含む 表示量の 93～107%に対応するカルビドパ水和物を含む

<加速試験><sup>1)</sup>

保管条件：40°C、75%RH

包装形態：PTP包装（PTP+アルミ袋）

試験結果：

		開始時	2カ月後	4カ月後	6カ月後
性状		うす紅色の 割線入り錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験		適合	適合	適合	適合
崩壊性		適合	適合	適合	適合
定量 (%)	※1	97.7	99.0	101.7	99.6
		98.0	98.9	102.0	97.0
		98.5	99.8	101.8	97.5
	※2	102.5	96.9	98.8	94.9
		101.8	97.3	97.9	96.6
		101.6	101.6	100.4	97.3

1ロット n=3 3ロット

※1：レボドパ、※2 カルビドパ

<無包装下の安定性>

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）を参考に、無包装状態の試験を行った。

保存条件	試験項目	規格	結果			
			開始時	1箇月	2箇月	3箇月
温度 40±2°C 遮光 気密容器	性状	うす紅色の 割線入り素錠	うす紅色の 割線入り素錠	適合*1	適合*1	適合*1
	硬度*2 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	4.9	3.6	4.0	3.9
	溶出性*3 (%)	レボドパ 15分間、80%以上 (最小値～最大値)	98.0～100.2	97.1～99.5	94.7～96.7	93.5～95.6
		カルビドパ水和物 15分間、80%以上 (最小値～最大値)	89.5～99.0	81.7～98.7	84.4～98.1	83.3～88.9
	定量*4 (%)	レボドパ 95%～105%	99.1	99.5	99.6	99.4
		カルビドパ水和物 93%～107%	101.2	97.5	97.5	96.8

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
湿度	25±1°C 75±5%RH 遮光 開放	性状	うす紅色の 割線入り素錠	うす紅色の 割線入り素錠	褐色に変化	褐色に変化	褐色に変化
		硬度* <sup>2</sup> (kg)	2.0kg 以上 (参考)	4.9	2.4	2.6	2.7
		溶出性* <sup>3</sup> (%)	レボドパ 15 分間、80%以上 (最小値～最大値)	98.0～100.2	98.1～99.1	94.8～98.5	93.9～97.0
			カルビドパ水和物 15 分間、80%以上 (最小値～最大値)	89.5～99.0	85.5～97.1	86.5～93.5	85.7～94.1
		定量* <sup>4</sup> (%)	レボドパ 95%～105%	99.1	100.8	100.3	99.8
			カルビドパ水和物 93%～107%	101.2	96.7	96.8	96.8

保存条件		試験項目	規格	結果	
				開始時	60 万 lx・hr
光	温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	うす紅色の 割線入り素錠	うす紅色の 割線入り素錠	褐色に変化
		硬度* <sup>2</sup> (kg)	2.0kg 以上 (参考)	4.9	3.7
		溶出性* <sup>3</sup> (%)	レボドパ 15 分間、80%以上 (最小値～最大値)	98.0～100.2	92.0～94.7
			カルビドパ水和物 15 分間、80%以上 (最小値～最大値)	89.5～99.0	85.7～91.8
		定量* <sup>4</sup> (%)	レボドパ 95%～105%	99.1	98.7
			カルビドパ水和物 93%～107%	101.2	99.9

\*1 わずかに退色した。

\*2 n=10 の平均値

\*3 n=6

\*4 n=3 の平均値

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 9. 溶出性

<溶出挙動における同等性><sup>2)</sup>

医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について（医薬発第 634 号、1998 年 7 月 15 日）に従いレプリントン配合錠 L100（試験製剤）とネオドバストン配合錠 L100（標準製剤）との溶出挙動の比較を行った結果、全ての溶出試験条件において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。

結果

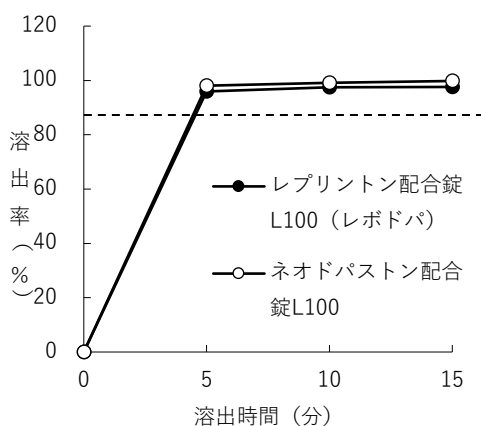
●レボドパ

○pH 1.2（毎分 50 回転）、pH 4.0（毎分 50 回転）、pH 6.8（毎分 50 回転）、水（毎分 50 回転）  
試験製剤及び標準製剤の平均溶出率は 15 分以内に 85%以上であった。

溶出試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		平均溶出率の 差 (%)
			ネオドバストン配合 錠 L100	レプリントン配合錠 L100	
pH 1.2	50 回転/分	15	99.8	97.6	範囲内
pH 4.0	50 回転/分	15	98.8	97.4	範囲内
pH 6.8	50 回転/分	15	98.7	97.9	範囲内
水	50 回転/分	15	101.8	93.4	範囲内

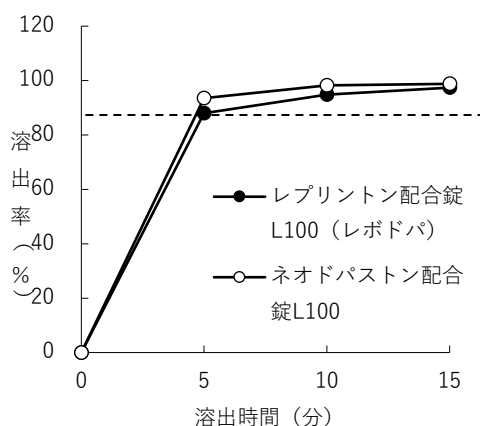
(n=6)

pH 1.2（毎分 50 回転）



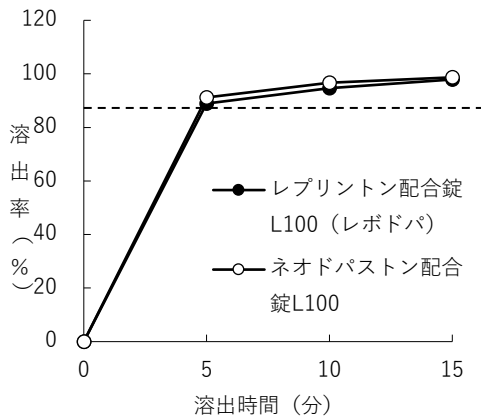
(n=6)

pH 4.0（毎分 50 回転）



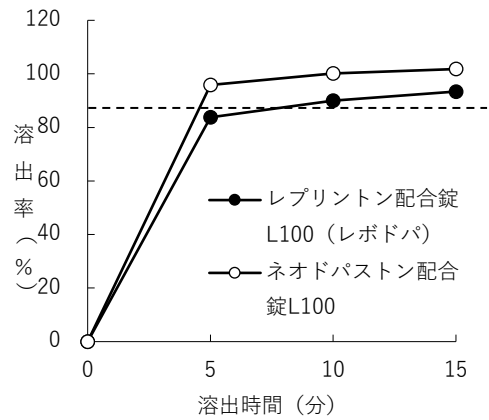
(n=6)

pH 6.8 (毎分 50 回転)



(n=6)

水 (毎分 50 回転)



(n=6)

--- 溶出率 85%

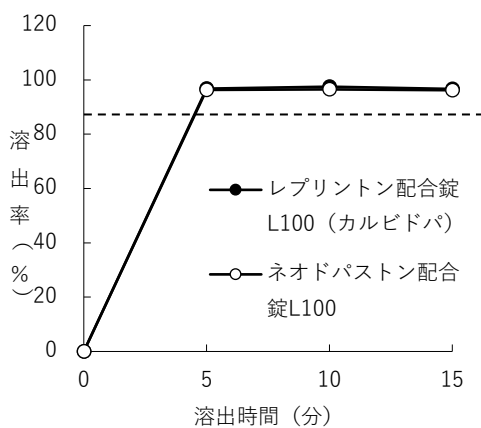
●カルビドバ

○pH 1.2 (毎分 50 回転)、pH 4.0 (毎分 50 回転)、pH 6.8 (毎分 50 回転)、水 (毎分 50 回転)  
試験製剤及び標準製剤の平均溶出率は 15 分以内に 85%以上であった。

溶出試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		平均溶出率の 差 (%)
			ネオドバトン配合 錠 L100	レプリントン配合錠 L100	
pH 1.2	50 回転/分	15	96.2	96.7	範囲内
pH 4.0	50 回転/分	15	97.1	96.8	範囲内
pH 6.8	50 回転/分	15	93.6	92.2	範囲内
水	50 回転/分	15	96.8	92.5	範囲内

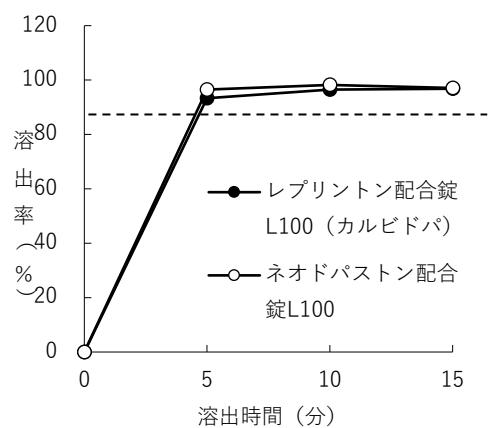
(n=6)

pH 1.2 (毎分 50 回転)



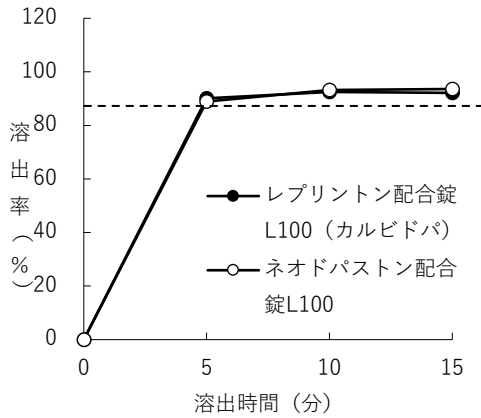
(n=6)

pH 4.0 (毎分 50 回転)



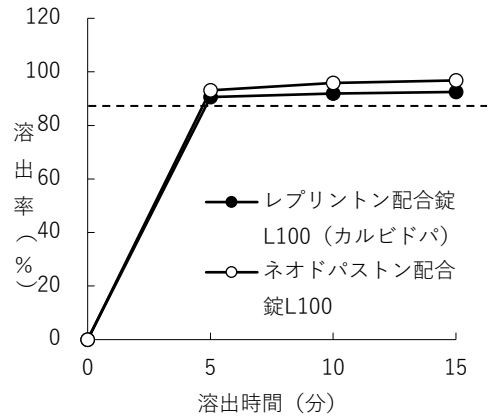
(n=6)

pH 6.8 (毎分 50 回転)



(n=6)

水 (毎分 50 回転)



(n=6)

---- 溶出率 85%

## 10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

(2) 包装

1,200 錠 (10 錠 (PTP) × 120)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

包装形態	材質
PTP 包装	ポリ塩化ビニルフィルム アルミニウム箔 アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

## 11. 別途提供される資材類

無し

## 12. 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

パーキンソン病、パーキンソン症候群

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

レボドパ未服用患者：

通常成人に対し、レボドパ量として1回100～125mg、1日100～300mg経口投与よりはじめ、毎日又は隔日にレボドパ量として100～125mg宛増量し、最適投与量を定め維持量（標準維持量はレボドパ量として1回200～250mg、1日3回）とする。

なお、症状により適宜増減するが、レボドパ量として1日1500mgを超えないこととする。

レボドパ既服用患者：

通常成人に対し、レボドパ単味製剤の服用後、少なくとも8時間の間隔をおいてから、レボドパ1日維持量の約1/5量に相当するレボドパ量を目安として初回量をきめ、1日3回に分けて経口投与する。以後、症状により適宜増減して最適投与量を定め維持量（標準維持量はレボドパ量として1回200～250mg、1日3回）とするが、レボドパ量として1日1500mgを超えないこととする。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### 7. 用法及び用量に関連する注意

##### 7.1 レボドパ未服用患者

レボドパ単味製剤の投与を受けていない患者に対して本剤を投与する場合には少量から開始し、観察を十分に行い、慎重に維持量まで増量すること。

レボドパ100mg・カルビドパ水和物  
10.8mg

1回1錠、1日1～3錠よりはじめ、毎日又は隔日に1錠宛増量し、最適量を定め維持量（標準；1回2錠、1日3回）とする。症状により適宜増減するが1日15錠を超えないこと。

## 7.2 レボドパ既服用患者

既にレボドパ単味製剤の投与を受けている患者に対して本剤を投与する場合には、レボドパの服用後少なくとも8時間の間隔をおいてから本剤を投与すること。ただし、その他の抗パーキンソン剤の投与を中止する必要はない。

レボドパ 100mg・カルビドパ水和物  
10.8mg

レボドパ単味製剤の服用後、少なくとも8時間の間隔をおいてから、1日維持量の約1/5量に相当するレボドパ量を目安として初回量をきめ、1日3回に分割投与する。以後、症状により適宜増減して最適量を定め維持量（標準；1回2錠、1日3回）とする。1日15錠を超えないこと。

## 5. 臨床成績

### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

### (4) 検証的試験

#### 1) 有効性検証試験

該当資料なし

#### 2) 安全性試験

該当資料なし

### (5) 患者・病態別試験

該当資料なし

### (6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後ベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

### (7) その他

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

レボドパとベンセラジド塩酸塩の合剤

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

カルビドパは末梢性ドパ脱炭酸酵素阻害薬である。パーキンソン病に対してレボドパを投与するとき、脳内移行前に末梢で代謝されドパミンとなると効果が大きく減弱するが、カルビドパをレボドパと併用すると、末梢での代謝が抑制されるので、レボドパが効率よく脳に移行し効果が高まり、レボドパの減量が可能となる。レボドパは血液脳関門を通過し、脳内に入り、ドパミン作動性神経に取り込まれて、ドパ脱炭酸酵素によりドパミンとなり神経終末から放出される<sup>3)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

「VIII. 7. 相互作用」の項を参照すること。

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) 消失速度定数

該当資料なし

#### (4) クリアランス

該当資料なし

#### (5) 分布容積

該当資料なし

#### (6) その他

該当資料なし

### 3. 母集団（ポピュレーション）解析

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) パラメータ変動要因

該当資料なし

### 4. 吸収

該当資料なし

### 5. 分布

#### (1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

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

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

該当資料なし

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

該当資料なし

## 10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

## 11. その他

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 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 閉塞隅角緑内障の患者 [眼圧上昇を起こし、症状が悪化するおそれがある。]

2.2 本剤の成分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注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

### 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 閉塞隅角緑内障のおそれのある場合は、隅角検査あるいは眼圧検査を行うことが望ましい。

8.2 レボドパ製剤の長期投与により、次のような現象があらわれることがあるので、適切な処置を行うこと。

8.2.1 wearing off (up and down) 現象があらわれた場合には、1日用量の範囲内で投与回数を増やす等の処置を行うこと。

8.2.2 on and off 現象があらわれた場合には、維持量の漸減又は休薬を行う。症状悪化に際しては、その他の抗パーキンソン剤の併用等の処置を行うこと。

8.3 前兆のない突発的睡眠、傾眠、調節障害及び注意力・集中力・反射機能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は従事させないよう注意すること。[11.1.4 参照]

8.4 セレギリン塩酸塩等（B型モノアミン酸化酵素阻害剤）との併用に際しては、使用前に必ずセレギリン塩酸塩等の電子添文を参照すること。

8.5 レボドパ又はドパミン受容体作動薬の投与により、病的賭博（個人的生活の崩壊等の社会的に不利な結果を招くにもかかわらず、持続的にギャンブルを繰り返す状態）、病的性欲亢進、強迫性購買、暴食等の衝動制御障害が報告されている。また、レボドパを投与された患者において、衝動制御障害に加えてレボドパを必要量を超えて求めるドパミン調節障害症候群が報告されている。患者及び家族等にこれらの症状について説明し、これらの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。

8.6 溶血性貧血、血小板減少があらわれることがあるので、定期的に血液検査を実施すること。[11.1.3 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 胃潰瘍、十二指腸潰瘍のある患者又はその既往歴のある患者  
症状の悪化があらわれることがある。

#### 9.1.2 糖尿病の患者

血糖値の上昇を誘発し、インスリン必要量を増大させるとの報告がある。

#### 9.1.3 重篤な心・肺疾患、気管支喘息又は内分泌系疾患のある患者

症状が悪化するおそれがある。

#### 9.1.4 慢性開放隅角緑内障の患者

眼圧上昇を起こし、症状が悪化するおそれがある。

#### 9.1.5 自殺傾向など精神症状のある患者

精神症状が悪化するおそれがある。

### (2) 腎機能障害患者

#### 9.2 腎機能障害患者

副作用の発現が増加するおそれがある。

### (3) 肝機能障害患者

#### 9.3 肝機能障害患者

副作用の発現が増加するおそれがある。

### (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。動物実験（ウサギ）で催奇形性が報告されている。

### (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。乳汁分泌が抑制されるおそれがある。また、動物実験（ラット）でレボドパの乳汁移行が報告されている。

### (7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

不安、不眠、幻覚、血圧低下等の副作用があらわれるおそれがある。一般に生理機能が低下していることが多い。

7. 相互作用

10. 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
レセルピン製剤 テトラベナジン	脳内ドパミンが減少し、本剤の作用が減弱するおそれがある。	脳内のドパミンを減少させてパーキンソン症状を悪化させる。
血圧降下剤 メチルドパ水和物、レセルピン、節遮断剤等	血圧降下剤の作用を増強することがある。	機序は不明であるが、レボドパに血圧降下作用があるためと考えられている。
抗精神病薬 フェノチアジン系薬剤 （クロルプロマジン等） ブチロフェノン系薬剤 （ハロペリドール等） その他 （ペロスピロン等）	本剤の作用が減弱することがある。	これらの薬剤によりドパミン受容体が遮断される。



薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
他の抗パーキンソン剤 抗コリン剤、アマ ンタジン塩酸塩、 ブロモクリプチ ンメシル酸塩	精神神経系の副作用が増強することがある。	併用によりレボドパの効果増加につながるが、同時に精神神経系の副作用が増強される可能性もある。
NMDA 受容体拮抗剤 メマンチン塩酸塩等	本剤の作用を増強するおそれがある。	これらの薬剤により、ドパミン遊離が促進する可能性がある。
パパベリン塩酸塩	本剤の作用が減弱するおそれがある。	パパベリン塩酸塩が線条体にあるドパミンレセプターをブロックする可能性がある。
鉄剤	本剤の作用が減弱するおそれがある。	キレートを形成し、本剤の吸収が減少するとの報告がある。
イソニアジド	本剤の作用が減弱するおそれがある。	機序は不明であるが、イソニアジドによりドパ脱炭酸酵素が阻害されると考えられている。
スピラマイシン	レボドパの血中濃度が低下し、本剤の作用が減弱するおそれがある。	カルビドパの吸収が阻害されることにより、レボドパの血中濃度が低下したとの報告がある。

## 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）

急激な減量又は投与中止により、高熱、意識障害、高度の筋硬直、不随意運動、ショック状態等があらわれることがあるので、このような場合には、再投与後、漸減し、体冷却、水分補給等適切な処置を行うこと。

###### 11.1.2 錯乱（頻度不明）、幻覚（頻度不明）、抑うつ（頻度不明）

###### 11.1.3 溶血性貧血（頻度不明）、血小板減少（頻度不明）

[8.6 参照]

11.1.4 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。[8.3 参照]

11.1.5 閉塞隅角緑内障（頻度不明）

急激な眼圧上昇を伴う閉塞隅角緑内障を起こすことがあるので、霧視、眼痛、充血、頭痛、嘔気等が認められた場合には、投与を中止し、直ちに適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	1%以上	1%未満	頻度不明
精神神経系	不随意運動（31.8%）、不眠、不安・焦燥感、めまい、頭痛、味覚異常、妄想	傾眠、倦怠感・脱力感、見当識喪失	病的賭博、病的性欲亢進、ドパミン調節障害症候群、歩行障害、興奮、振戦の増強、しびれ感
消化器	悪心（11.9%）、嘔吐、食欲不振、口渇、便秘、腹痛、下痢	腹部膨満感、腹部不快感、嚥下障害	胸やけ、唾液分泌過多、口内炎
泌尿器	—	—	排尿異常、尿路感染
血液	—	—	顆粒球減少、貧血
過敏症	—	—	発疹
循環器	—	不整脈	血圧上昇、起立性低血圧、心悸亢進、血圧低下
眼	—	—	視覚異常
肝臓 <sup>注)</sup>	—	—	AST 上昇、ALT 上昇、LDH 上昇、ALP 上昇
腎臓	—	—	浮腫、BUN 上昇
その他	のぼせ感、発汗	—	筋肉痛、体重減少、痰・口腔内粘膜・汗・尿・便・唾液等の変色（黒色等）、抗DNA 抗体の陽性例、クームス試験の陽性例、脱毛、嗄声

注) 投与中は定期的に肝機能検査を行うことが望ましい。

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

### 12. 臨床検査値に及ぼす影響

ニトロプルシドナトリウム水和物の検尿テープによる尿検査では、ケトン体反応が偽陽性になる場合がある。

## 10. 過量投与

### 13. 過量投与

#### 13.1 症状

異常な不随意運動、混乱、不眠、まれに嘔気、嘔吐、不整脈等が起こるおそれがある。

## 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。

## 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 抗パーキンソン剤はフェノチアジン系化合物、レセルピン誘導体等による口周部等の不随意運動（遅発性ジスキネジア）を通常軽減しない。場合によってはこのような症状を増悪顕性化させることがある。

15.1.2 悪性黒色腫が発現したとの報告がある。

15.1.3 高蛋白食によりレボドパの吸収が低下するとの報告がある。

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製剤：レプリントン配合錠 L100

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：レボドパ 処方箋医薬品

カルビドパ水和物 該当しない

### 2. 有効期間

有効期間：3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて遮光して保存すること。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り

くすりのしおり：有り

その他の患者用資料：レプリントン配合錠を服用される患者様とご家族の方へ

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ネオドバストン配合錠 L100／配合錠 L250、メネシット配合錠 100／配合錠 250

同効薬：レボドパ、アマンタジン塩酸塩、レボドパとベンセラジド塩酸塩の合剤など

### 7. 国際誕生年月日

該当資料なし

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
レプリントン錠 100mg	1993年5月14日	(05AM)0293	1994年7月8日	1994年9月6日
レプリントン配合錠 L100	2011年7月27日	22300AMX01148000	2012年6月22日	2012年6月

### 9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号 (9桁)	レセプト電算処理 システム用コード
レプリントン配合錠 L100	1169101F1014	1169101F1162	101244606	620124401

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) 第十八改正 日本薬局方解説書. 廣川書店. 2021 : C1401-C1405,C6254-C6259.

### 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

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし



## XIII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

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

#### (1) 粉碎

##### 粉碎時の安定性試験結果

保存条件	試験項目	規格	結果		
			開始時	2 週間	4 週間
室内散乱光 シャーレ開放	定量 (%)	レボドバ 95%~105%	98.6	99.3	98.6
		カルビドバ水和物 93%~107%	99.3	96.1	95.6

#### (2) 崩壊・懸濁性および経管投与チューブの通過性

「内服薬 経管投与ハンドブック 第二版(監修:藤島一郎、執筆:倉田なおみ)、じほう」を参考に、製剤の崩壊・懸濁性および経管投与チューブの通過性の試験を行った。

##### 試験方法

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製剤をそのまま1個入れてピストンを戻し、ディスペンサーに55°Cの温湯20mLを吸い取り、筒先に蓋をして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は、この方法を中止する。中止した製品は、破壊(乳棒で数回叩く)後、上述と同様の操作を行う。

得られた懸濁液を経管チューブの注入端より、約2~3mL/secの速度で注入し、通過性を観察する。体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30cmの高さにセットする。注入後に適量の水を注入して経管チューブ内を洗うとき、経管チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

## 判定方法

水（約 55°C）

製剤を 55°C の温湯 20mL に入れ、5 分または 10 分放置後に攪拌したときの通過性

破壊→水

製剤を破壊した後に、55°C の温湯 20mL に入れ、5 分または 10 分放置後に攪拌したときの通過性

○：経管チューブを通過

△：時間をかければ崩壊しそうな状況、または経管チューブを閉塞する危険性がある

×：通過困難

## 結果

経管チューブサイズ	水（約 55°C）		破壊→水	
	5 分	10 分	5 分	10 分
8Fr.	○			

## 2. その他の関連資料

該当資料なし

### 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

---

辰巳化学株式会社  
〒921-8164　石川県金沢市久安3丁目406番地

### 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