※※2018年12月改訂（第18版）
※2018年４月改訂

抗精神病剤

劇薬、処方箋医薬品注）

日本標準商品分類番号
871179

日本薬局方　リスペリドン錠
リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」
リスペリドン錠1mg「ファイザー」
リスペリドン錠2mg「ファイザー」
リスペリドン錠3mg「ファイザー」

RISPERIDONE Tablets 0.5mg・1mg・2mg・3mg [Pfizer]

日本薬局方　リスペリドン細粒
リスペリドン細粒1%「ファイザー」

RISPERIDONE Fine Granules 1% [Pfizer]

貯　　法：気密容器、室温保存
使用期限：最終年月を外箱等に記載
（取扱い上の注意参照）

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

	0.5mg	1mg	2mg	3mg	細粒
承認番号	22400AMX01160	21900AMX00270	21900AMX00272	22100AMX00046	21900AMX00271
薬価収載	2013年４月				
販売開始	2012年12月	2007年７月		2009年５月	2007年７月

【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）［「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

【組成・性状】

1.組成

１錠中：

販売名 / 成分	リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」	リスペリドン錠1mg「ファイザー」	リスペリドン錠2mg「ファイザー」	リスペリドン錠3mg「ファイザー」
有効成分	日局　リスペリドン 0.5mg	日局　リスペリドン 1.00mg	日局　リスペリドン 2.00mg	日局　リスペリドン 3.00mg
添加物	乳糖水和物、ヒプロメロース、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、マクロゴール6000、酸化チタン、カルナウバロウ			

１g中：

販売名 / 成分	リスペリドン細粒１％「ファイザー」
有効成分	日局　リスペリドン　10.0mg
添加物	乳糖水和物、ヒプロメロース、軽質無水ケイ酸

2.性状

販売名	外形 上面	外形 下面	外形 側面	識別コード	色調等
リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」	M 941			M941	白色 フィルムコーティング錠
	直径 5.1mm	厚さ 2.5mm	重量 52mg		
リスペリドン錠1mg「ファイザー」	M 905			M905	白色 割線入り フィルムコーティング錠
	直径 6.6mm	厚さ 3.3mm	重量 104mg		
リスペリドン錠2mg「ファイザー」	M 906			M906	白色 フィルムコーティング錠
	直径 7.1mm	厚さ 3.9mm	重量 135mg		
リスペリドン錠3mg「ファイザー」	M 914			M914	白色 フィルムコーティング錠
	直径 8.2mm	厚さ 4.4mm	重量 200mg		

販売名	外形 上面	外形 下面	外形 側面	識別コード	色調等
リスペリドン細粒１％「ファイザー」	—			—	白色 細粒剤
	—				

【効能・効果】

統合失調症

【用法・用量】

通常、成人にはリスペリドンとして１回１mg１日２回より始め、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をこえないこと。

［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。

【使用上の注意】

1.慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

⑴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。］
⑵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。］
⑶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。］
⑷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。］
⑸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。］
⑹肝障害のある患者［肝障害を悪化させるおそれがある。］
⑺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。］
⑻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（「重要な基本的注意」、「重大な副作用」の項参照）。］

⑼高齢者［「高齢者への投与」の項参照］

⑽小児［「小児等への投与」の項参照］

⑾薬物過敏症の患者

⑿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。］

2.重要な基本的注意

⑴**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。

⑵**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。

⑶**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。

⑷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。［「慎重投与」、「重大な副作用」の項参照］

⑸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。［「重大な副作用」の項参照］

⑹本剤の投与に際し、あらかじめ上記⑷及び⑸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。［「慎重投与」、「重大な副作用」の項参照］

⑺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。［「重大な副作用」の項参照］

3.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。

⑴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。

⑵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[1]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[2] フェニトイン リファンピシン[3] 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[4]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。

4.副作用

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。

⑴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。［「慎重投与」、「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。［「重要な基本的注意」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。［「重要な基本的注意」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。

⑵**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	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、気管支炎、鼻咽頭炎、咽頭炎、肺炎
血液およびリンパ系障害	好中球減少症、貧血、血小板減少症
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	高尿酸血症、水中毒、食欲不振、高脂血症、食欲亢進、多飲症、食欲減退
※※精神障害	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、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
神経系障害[注2]	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、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
眼障害	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、調節障害、眼球回転発作、眼瞼痙攣、視力低下
耳および迷路障害	耳痛、回転性めまい、耳鳴
心臓障害[注3]	徐脈、左脚ブロック、洞性徐脈、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
血管障害[注4]	末梢循環不全、起立性低血圧、低血圧、高血圧、末梢冷感、潮紅
呼吸器、胸郭および縦隔障害	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、鼻閉
胃腸障害	腸閉塞、膵炎、歯痛、糞塊充塞、便失禁、口唇炎、舌腫脹、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
肝胆道系障害[注1]	肝機能異常
皮膚および皮下組織障害	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、多汗症、発疹、そう痒症、湿疹、過角化、紅斑
筋骨格系および結合組織障害	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、筋固縮、筋肉痛、斜頚、筋攣縮、関節硬直、筋力低下
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	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、膣分泌物異常、乳房腫大、乳房分泌、月経障害、無月経、乳汁漏出症、不規則月経、射精障害
全身障害および投与局所様態	浮腫、低体温、インフルエンザ様疾患、悪寒、薬剤離脱症候群、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
臨床検査	心電図T波逆転[注3]、血中尿酸増加、尿中血陽性、肝酵素上昇、尿糖陽性、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[注3]、心電図QT延長[注3]、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
傷害、中毒および処置合併症	引っかき傷、処置による疼痛、転倒・転落

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。
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。
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。
注4：増量は徐々に行うなど慎重に投与すること。
注5：異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。

5.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。

6.妊婦、産婦、授乳婦等への投与

⑴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。]

⑵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。][5]

7.小児等への投与

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）。

8.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。

9.適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

10.その他の注意

⑴本剤による治療中、原因不明の突然死が報告されている。

⑵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。

⑶本剤を含むα1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。

⑷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。

⑸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。

【薬物動態】

1.生物学的同等性試験

⑴**リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」**[6]

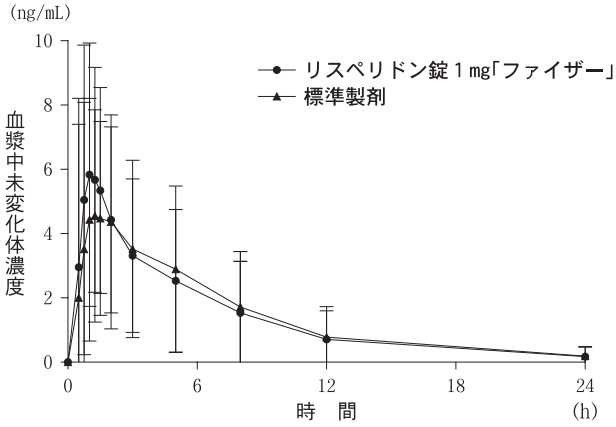
リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成18年11月24日　薬食審査発第1124004号）」に基づき、リスペリドン錠1mg「ファイザー」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

⑵**リスペリドン錠1mg「ファイザー」**[7]

リスペリドン錠1mg「ファイザー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（リスペリドンとして1mg）健康成人男子19名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{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。

	C_{max} (ng/mL)	AUC_{0-24} (ng・h/mL)	T_{max} (h)	$T_{1/2}$ (h)
リスペリドン錠1mg「ファイザー」	7.03±4.95	33.88±30.10	1.15±0.40	3.54±1.69
標準製剤	6.36±4.93	34.64±31.82	1.49±0.98	3.55±1.55

（平均値±標準偏差、n=19）



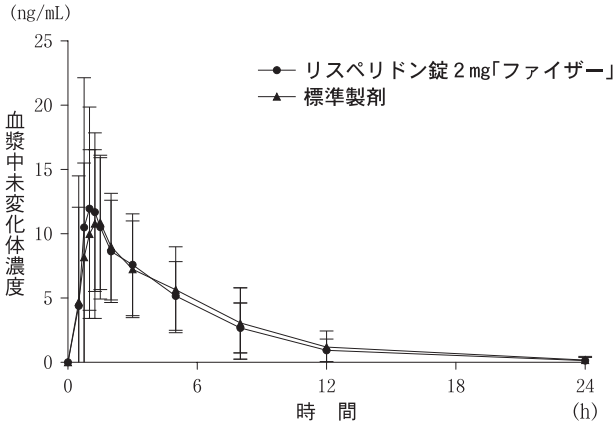
血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

⑶リスペリドン錠2mg「ファイザー」[8)]

リスペリドン錠2mg「ファイザー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（リスペリドンとして2mg）健康成人男子20名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{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。

	C_{max} (ng/mL)	AUC_{0-24} (ng・h/mL)	T_{max} (h)	$T_{1/2}$ (h)
リスペリドン錠2mg「ファイザー」	15.89±9.08	62.43±28.78	1.29±0.66	2.92±1.04
標準製剤	14.53±8.00	65.78±40.27	1.23±0.54	3.14±1.16

（平均値±標準偏差、n=20）



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。

⑷リスペリドン錠3mg「ファイザー」[9)]

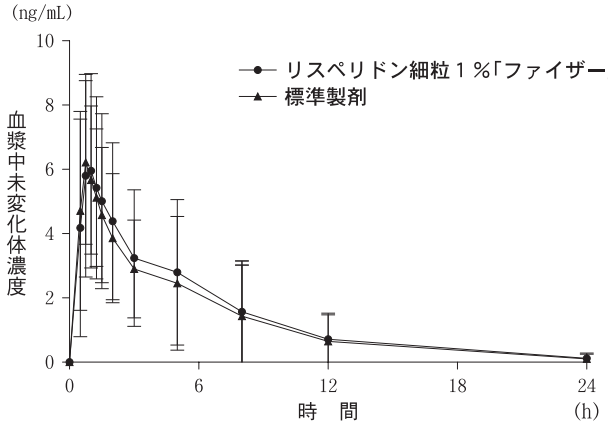
リスペリドン錠3mg「ファイザー」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成18年11月24日　薬食審査発第1124004号）」に基づき、リスペリドン錠1mg「ファイザー」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

⑸リスペリドン細粒1%「ファイザー」[10)]

リスペリドン細粒1%「ファイザー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ100mg（リスペリドンとして1mg）健康成人男子10名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{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。

	C_{max} (ng/mL)	AUC_{0-24} (ng・h/mL)	T_{max} (h)	$T_{1/2}$ (h)
リスペリドン細粒1%「ファイザー」	6.35±3.12	34.72±25.64	0.90±0.27	3.36±1.14
標準製剤	6.54±2.47	31.84±24.18	0.83±0.31	3.35±1.16

（平均値±標準偏差、n=10）



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.溶出挙動[6,9,11-13)]

リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」、リスペリドン錠1mg「ファイザー」、リスペリドン錠2mg「ファイザー」、リスペリドン錠3mg「ファイザー」及びリスペリドン細粒1%「ファイザー」は、日本薬局方医薬品各条に定められたリスペリドン錠及びリスペリドン細粒の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

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[14)]。

【有効成分に関する理化学的知見】

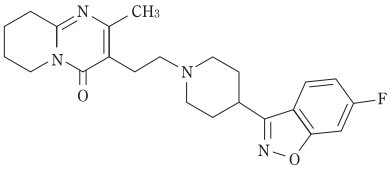
一般名：リスペリドン（Risperidone）

化学名：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

分子式：$C_{23}H_{27}FN_4O_2$

分子量：410.48

構造式：



性　状：白色～微黄白色の結晶性の粉末である。
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。

融　点：169～173℃

【取扱い上の注意】

1.湿気を避けて保管すること。

2.小児の手の届かない所に保管すること。

3.**安定性試験**

⑴リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」、リスペリドン錠1mg「ファイザー」、リスペリドン錠2mg「ファイザー」、リスペリドン細粒1%「ファイザー」[15-18)]

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」、リスペリドン錠1mg「ファイザー」、リスペリドン錠2mg「ファイザー」及びリスペリドン細粒1%「ファイザー」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。

⑵リスペリドン錠３mg「ファイザー」[19]

長期保存試験（25℃、相対湿度60％、36ヵ月）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、リスペリドン錠３mg「ファイザー」は通常の市場流通下において３年間安定であることが確認された。

【包　　装】

リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」：100錠（PTP）
リスペリドン錠１mg「ファイザー」：100錠、1000錠（PTP）
1000錠（バラ）
リスペリドン錠２mg「ファイザー」：100錠、1000錠（PTP）
1000錠（バラ）
リスペリドン錠３mg「ファイザー」：100錠（PTP）、1000錠（バラ）
リスペリドン細粒１％「ファイザー」：100g、500g

【主要文献】

1）Saito, M., et al.：J. Clin. Psychopharmacol., 25, 527, 2005 [L20150227008]
2）Spina E., et al.：Ther. Drug Monit. 22：481, 2000 [L20130528037]
3）Mahatthanatrakul W., et al.：J. Clin. Pharm. Ther. 32：161, 2007 [L20130528038]
4）Jung, S. M., et al.：Clin. Pharmacol. Ther., 78, 520, 2005 [L20150227009]
5）Hill R C., et al.：J. Clin. Psychopharmacol. 20：285, 2000 [L20130528039]
6）社内資料：溶出試験（リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」） [L20130508013]
7）社内資料：生物学的同等性試験（リスペリドン錠１mg「ファイザー」） [L20130508017]
8）社内資料：生物学的同等性試験（リスペリドン錠２mg「ファイザー」） [L20130508020]
9）社内資料：溶出試験（リスペリドン錠３mg「ファイザー」） [L20130508023]
10）社内資料：生物学的同等性試験（リスペリドン細粒１％「ファイザー」） [L20130508032]
11）社内資料：溶出試験（リスペリドン錠１mg「ファイザー」） [L20130508016]
12）社内資料：溶出試験（リスペリドン錠２mg「ファイザー」） [L20130508019]
13）社内資料：溶出試験（リスペリドン細粒１％「ファイザー」） [L20130508031]
14）第十七改正日本薬局方解説書　廣川書店：C-5753, 2016
15）社内資料：安定性試験（加速試験）（リスペリドン錠0.5mg「ファイザー」） [L20130508012]
16）社内資料：安定性試験（加速試験）（リスペリドン錠１mg「ファイザー」） [L20130508015]
17）社内資料：安定性試験（加速試験）（リスペリドン錠２mg「ファイザー」） [L20130508018]
18）社内資料：安定性試験（加速試験）（リスペリドン細粒１％「ファイザー」） [L20130508030]
19）社内資料：安定性試験（長期保存試験）（リスペリドン錠３mg「ファイザー」） [L20130508022]

【文献請求先】

「主要文献」に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ファイザー株式会社　製品情報センター
〒151-8589　東京都渋谷区代々木3-22-7
学術情報ダイヤル　0120-664-467
FAX　03-3379-3053

【製造販売】
ファイザー株式会社
東京都渋谷区代々木3-22-7
【提携】
マイラン製薬株式会社
大阪市中央区本町2丁目6番8号

006
PAA119436