**2023年10月改訂（第11版）D12
*2022年４月改訂

| 日本標準商品分類番号 |
|---|
| 871179 |

抗精神病剤

# リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」
# リスペリドンOD錠1mg「ヨシトミ」
# リスペリドンOD錠2mg「ヨシトミ」
# リスペリドンOD錠3mg「ヨシトミ」

リスペリドン口腔内崩壊錠

**Risperidone *OD* TABLETS「YOSHITOMI」**

劇薬
処方箋医薬品(注)

| | 承認番号 | 薬価収載 | 販売開始 | 効能追加 |
|---|---|---|---|---|
| OD錠0.5mg | 22400AMX01131 | 2013年６月 | 2013年７月 | 2020年８月 |
| OD錠1mg | 22300AMX00197 | 2013年６月 | 2013年７月 | 2020年８月 |
| OD錠2mg | 22300AMX00198 | 2013年６月 | 2013年７月 | 2020年８月 |
| OD錠3mg | 22300AMX00196 | 2013年６月 | 2013年７月 | － |

**貯　　法**：気密容器，室温保存
開封後は湿気を避けて保存すること
**使用期限**：外箱及びラベルに表示の使用期限内に使用すること
注）注意－医師等の処方箋により使用すること

## 【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，又は歯科領域における浸潤麻酔もしくは伝達麻酔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】

| | OD錠0.5mg | | | OD錠１mg | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 有効成分（１錠中） | 日局 リスペリドン0.5mg | | | 日局 リスペリドン１mg | | |
| 添加物 | D-マンニトール，トウモロコシデンプン，無水リン酸水素カルシウム，カルメロース，カルメロースカルシウム，ヒドロキシプロピルセルロース，軽質無水ケイ酸，ステアリン酸マグネシウム，アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物），l-メントール，香料 | | | | | |
| 性状・剤形 | 白色・素錠（口腔内崩壊錠） | | | 白色・割線入り素錠（口腔内崩壊錠） | | |
| 外形 | Y RD | 0.5 | | Y RD1 | | |
| 規格 | 直径(mm) 5.0 | 厚さ(mm) 2.4 | 重量(mg) 約50 | 直径(mm) 6.5 | 厚さ(mm) 2.3 | 重量(mg) 約100 |
| 識別コード | Y-RD0.5 | | | Y-RD1 | | |

| | OD錠２mg | | | OD錠３mg | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 有効成分（１錠中） | 日局 リスペリドン２mg | | | 日局 リスペリドン３mg | | |
| 添加物 | D-マンニトール，トウモロコシデンプン，無水リン酸水素カルシウム，カルメロース，カルメロースカルシウム，ヒドロキシプロピルセルロース，軽質無水ケイ酸，ステアリン酸マグネシウム，アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物），l-メントール，香料 | | | | | |
| 性状・剤形 | 白色・素錠（口腔内崩壊錠） | | | 白色・素錠（口腔内崩壊錠） | | |
| 外形 | Y RD2 | 2 | | Y RD3 | 3 | |
| 規格 | 直径(mm) 7.0 | 厚さ(mm) 2.6 | 重量(mg) 約130 | 直径(mm) 8.0 | 厚さ(mm) 3.1 | 重量(mg) 約200 |
| 識別コード | Y-RD2 | | | Y-RD3 | | |

## 【効能・効果】

**リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」，リスペリドンOD錠1mg「ヨシトミ」，リスペリドンOD錠2mg「ヨシトミ」**
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「ヨシトミ」**
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.

## 【用法・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.

## 【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)

(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.(「重要な基本的注意」,「重大な副作用」の項参照)〕

(9)高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

(10)小児(「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.〕

### 2. 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.(「慎重投与」,「重大な副作用」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.(「重大な副作用」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.(「慎重投与」,「重大な副作用」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.(「重大な副作用」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.

### 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.

**(1)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，又は歯科領域における浸潤麻酔もしくは伝達麻酔に使用する場合を除く)<br>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(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，フェニトイン，リファンピシン，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. |
| ** **アドレナリン含有歯科麻酔剤(リドカイン・アドレナリン)** | 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おそれがある. |

### 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.

**(1)重大な副作用**(頻度不明)

**1)**悪性症候群**：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．

**(2)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．

| 種類＼頻度 | 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 |
| **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 |
| **臨床検査** | 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，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 |
| **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．
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**

（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．〕

**7. 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)．

**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**

（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．

**10. 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$\alpha_1$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．

## 【薬物動態】

**生物学的同等性試験**[1)]

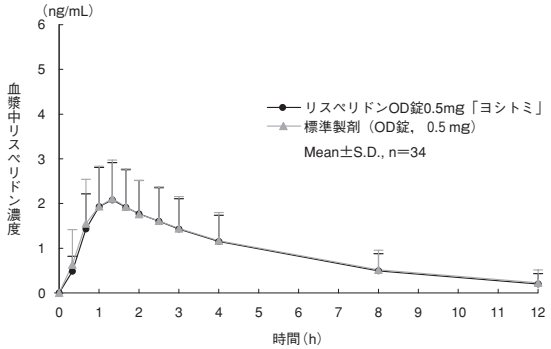
○リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」

リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」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0.5mg）健康成人男子に絶食後，水なし（n=34）及び水あり（n=20）単回経口投与して血漿中リスペリドン濃度を測定し，得られた薬物動態パラメータ（AUC，Cmax）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．

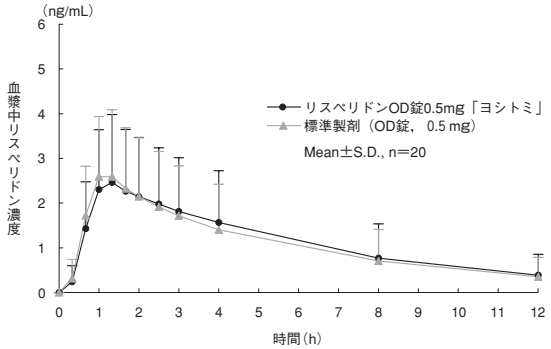
| | | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | AUC $_{(0\to12)}$ (ng・h/mL) | Cmax (ng/mL) | tmax (h) | $t_{1/2}$ (h) |
| 水なし投与 | リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」 | 10.47±5.20 | 2.21±0.93 | 1.2±0.3 | 3.1±1.1 |
| | 標準製剤（OD錠，0.5mg） | 10.77±5.65 | 2.34±1.01 | 1.2±0.5 | 3.1±1.2 |
| 水あり投与 | リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」 | 13.93±10.19 | 2.75±1.50 | 1.4±0.6 | 3.4±1.3 |
| | 標準製剤（OD錠，0.5mg） | 13.39±9.75 | 2.79±1.43 | 1.2±0.3 | 3.4±1.3 |

（水なし投与：Mean±S.D., n＝34）
（水あり投与：Mean±S.D., n＝20）

**①水なし投与**




**②水あり投与**




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１mg「ヨシトミ」，同OD錠２mg「ヨシトミ」及び同OD錠３mg「ヨシトミ」

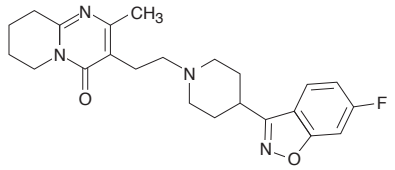
リスペリドンOD錠１mg「ヨシトミ」，同OD錠２mg「ヨシトミ」及び同OD錠３mg「ヨシトミ」は，「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成18年11月24日付　薬食審査発第1124004号）」に基づき，リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」を標準製剤としたとき，溶出挙動が等しく，生物学的に同等とみなされた．

## 【薬効薬理】[2,3]

1. リスペリドンは，ベンズイソオキサゾール系の抗精神病薬である．
2. ドパミン$D_2$受容体親和性は，ハロペリドールとほぼ同等である（拮抗作用　*in vitro*）．
3. セロトニン5-$HT_{2A}$受容体に対する親和性は，ハロペリドールの100倍以上である（拮抗作用　ラット）．
4. ドパミン$D_2$受容体よりもセロトニン5-$HT_{2A}$受容体に対する親和性が高く，Serotonin-dopamine antagonist（SDA）と呼ばれる．

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：リスペリドン，Risperidone（JAN）
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. 小児の手の届かない所に保管すること．
2. **安定性試験**[4～7]
   最終包装製品を用いた加速試験（40℃，相対湿度75%，6ヵ月）の結果，リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」，同OD錠1mg「ヨシトミ」，同OD錠2mg「ヨシトミ」及び同OD錠3mg「ヨシトミ」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．

## 【包　装】

**リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」**：100錠（10錠×10）
**リスペリドンOD錠1mg「ヨシトミ」**：100錠（10錠×10），500錠（バラ）
**リスペリドンOD錠2mg「ヨシトミ」**：100錠（10錠×10），500錠（バラ）
**リスペリドンOD錠3mg「ヨシトミ」**：100錠（10錠×10），200錠（バラ）

## 【主要文献及び文献請求先】

**1. 主要文献**


1）竹内譲：医学と薬学 2013；**69**(6)：939-953
2）渡辺昌祐，江原嵩：抗精神病薬の選び方と用い方，新興医学出版社 2000；244-251
3）大月三郎監修：抗精神病薬の使い方，日本アクセル・シュプリンガー出版 1996；30
4）全星薬品工業(株)：リスペリドンOD錠0.5mg「ヨシトミ」の安定性試験に関する資料（社内資料）
5）全星薬品工業(株)：リスペリドンOD錠1mg「ヨシトミ」の安定性試験に関する資料（社内資料）
6）全星薬品工業(株)：リスペリドンOD錠2mg「ヨシトミ」の安定性試験に関する資料（社内資料）
7）全星薬品工業(株)：リスペリドンOD錠3mg「ヨシトミ」の安定性試験に関する資料（社内資料）


**2. 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下さい．
田辺三菱製薬株式会社　くすり相談センター
〒541-8505　大阪市中央区道修町3－2－10
電話　0120−753−280


販売
田辺三菱製薬株式会社
大阪市中央区道修町3-2-10

プロモーション提携
吉富薬品株式会社
大阪市中央区道修町3-2-10

製造販売元
全星薬品工業株式会社
大阪市阿倍野区旭町1-2-7