

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2008 に準拠して作成

αβ 遮断性降圧剤

日本薬局方 ラベタロール塩酸塩錠

レスポリート®錠 50mg

レスポリート®錠 100mg

RESPORITO Tablets 50mg/100mg

剤形	50mg：白色フィルムコート錠 100mg：片面割線入り白色フィルムコート錠	
製剤の規制区分	劇薬、処方せん医薬品 (注意－医師等の処方せんにより使用すること)	
規格・含量	50mg：1錠中ラベタロール塩酸塩 50mg を含有する 100mg：1錠中ラベタロール塩酸塩 100mg を含有する	
一般名	和名：ラベタロール塩酸塩 洋名：Labetalol hydrochloride	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	50mg	製造販売承認年月日：1990年8月30日 薬価基準収載年月日：1992年7月10日 販売年月日：1992年7月10日
	100mg	製造販売承認年月日：1991年6月21日 薬価基準収載年月日：1992年7月10日 販売年月日：1992年7月10日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：鶴原製薬株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	鶴原製薬株式会社 医薬情報部 TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252 医療関係者向けホームページ http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/	

本 I F は2013年9月改訂（第10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、医薬品医療機器情報提供ホームページ<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

I F 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年が経過した現在、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新たなIF記載要領が策定された。

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。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「IF 記載要領 2008」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「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）は、平成21年4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2008」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

「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、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、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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もあり、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、今後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。

(2008年9月)

目 次

[I] 概要に関する項目	1
[II] 名称に関する項目	2
[III] 有効成分に関する項目	3
[IV] 製剤に関する項目	4
[V] 治療に関する項目	13
[VI] 薬効薬理に関する項目	14
[VII] 薬物動態に関する項目	15
[VIII] 安全性(使用上の注意等)に関する項目	19
[IX] 非臨床試験に関する項目	24
[X] 管理的事項に関する項目	25
[X I] 文 献	27
[X II] 参考資料	27
[X III] 備 考	27

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レスポリート錠 50mg は、鶴原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、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1990年8月30日に承認を取得、1992年7月10日に上市した。

レスポリート錠 100mg は、鶴原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、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1991年6月21日に承認を取得、1992年7月10日に上市した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

心拍出量はほとんど不変のまま全末梢血管抵抗を減少し、血圧を降下させる。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

レスポリート錠 50mg

レスポリート錠 100mg

2) 洋名

RESPORITO Tablets50 mg

RESPORITO Tablets100 mg

3) 名称の由来：特になし

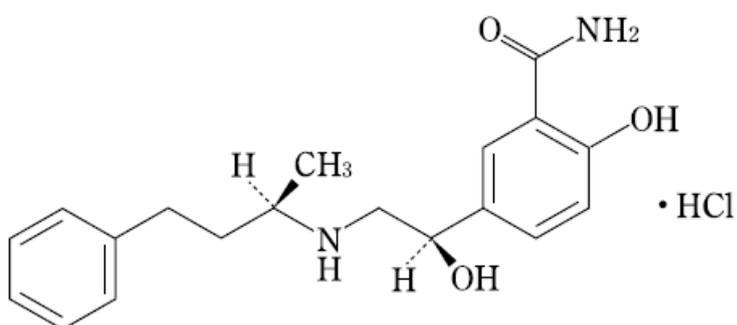
2. 一般名

1) 和名（命名法）：ラベタロール塩酸塩

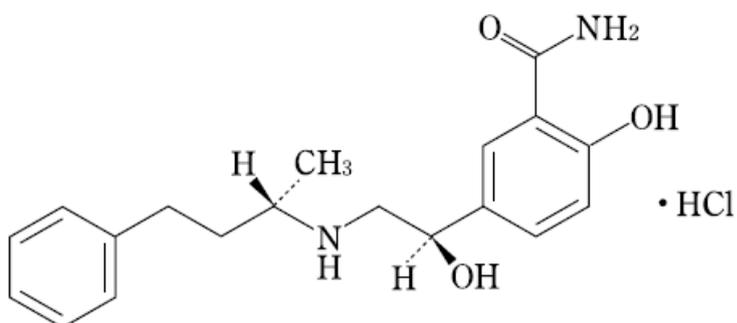
2) 洋名（命名法）：Labetalol hydrochloride

3) ステム：-alol： β -アドレナリン受容体拮抗薬

3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体



及び鏡像異性体

4. 分子式及び分子量

分子式： $C_{19}H_{24}N_2O_3 \cdot HCl$

分子量：364.87

5. 化学名（命名法）

2-Hydroxy-5-((1*RS*)-1-hydroxy-2-((1*RS*)-1-methyl-3-phenylpropylamino)ethyl)benzamide monohydrochloride

2-Hydroxy-5-((1*RS*)-1-hydroxy-2-((1*SR*)-1-methyl-3-phenylpropylamino)ethyl)benzamide monohydrochloride

6. 慣用名，別名，略号，記号番号

別名：塩酸ラベタロール

7. CAS登録番号

32780-64-6

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

1) 外観・性状：

本品は白色の結晶性の粉末である。

2) 溶解性：

メタノールに溶けやすく、水又はエタノール(99.5)にやや溶けにくい。

本品は 0.05mol/L 硫酸試液に溶ける。

3) 吸湿性

該当資料なし

4) 融点（分解点），沸点，凝固点

融点：約 181℃(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

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

日本薬局方「ラベタロール塩酸塩」の確認試験による

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「ラベタロール塩酸塩」の定量法による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別及び性状

レスポリート錠 50mg は直径約 6.1mm、厚さ約 3.0mm、質量約 80mg の白色フィルムコート錠である。

レスポリート錠 100mg は直径約 8.1mm、厚さ約 3.5mm、質量約 160mg の片面割線入り白色フィルムコート錠である。

2) 製剤の物性

該当資料なし

3) 識別コード

なし

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

レスポリート錠 50mg : 1 錠中ラベタロール塩酸塩 50mg

レスポリート錠 100mg : 1 錠中ラベタロール塩酸塩 100mg

2) 添加物

レスポリート錠 50mg : 乳糖水和物、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ

レスポリート錠 100mg : 乳糖水和物、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ

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

該当資料なし

4. 製剤の各種条件下における安定性

レスポリート錠 50mg 安定性

試験条件及び保管

保存条件・保存期間	試験期間	包装	試験項目
40° 75%RH	6ヶ月	①ポリエチレン袋に入れブリキ缶に入れる。(バラ) ②PTP包装し紙箱に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)崩壊試験 (4)定量 (5)分解物の有無
曝光下 20Wの蛍光灯を30cmの距離から照射する。 (2000ルクス)	1ヶ月	錠剤をシャーレに入れる	

保存条件・保存期間	試験期間	包装	試験項目
室温保存	5年	PTP包装しビニール袋に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)定量 (4)溶出試験

安定性に関する考察

(1)性状

いずれの条件においても変化は認められなかった

(2)確認試験

いずれの条件においても規格に適合した

(3)崩壊試験

いずれの条件においても変化は認められなかった

(4)定量

いずれの条件でもほとんど含量の低下は認められなかった

(5)分解物の有無

TLC法により検討したところ分解物は認められなかった

(6)溶出試験

室温5年において少し低下が認められたが規格内であった。

結 論

本品はその包装形態において、室温5年間は安定な製剤であると推定される。

レスポリート錠 100mg 安定性

試験条件及び保管

保存条件・保存期間	試験期間	包装	試験項目
40° 75%RH	6ヶ月	①ポリエチレン袋に入れブリキ缶に入れる。(バラ) ②PTP包装し紙箱に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)崩壊試験 (4)定量 (5)分解物の有無
曝光下 20Wの蛍光灯を30cmの距離から照射する。 (2000ルクス)	1ヶ月	錠剤をシャーレに入れる	

保存条件・保存期間	試験期間	包装	試験項目
室温保存	5年	PTP包装しビニール袋に入れる。	(1)性状 (2)確認試験 (3)定量 (4)溶出試験

安定性に関する考察

(1)性状

いずれの条件においても変化は認められなかった

(2)確認試験

いずれの条件においても規格に適合した

(3)崩壊試験

いずれの条件においても変化は認められなかった

(4)定量

いずれの条件でもほとんど含量の低下は認められなかった

(5)分解物の有無

TLC法により検討したところ分解物は認められなかった

(6)溶出試験

室温5年において少し低下が認められたが規格内であった。

結 論

本品はその包装形態において、室温5年間は安定な製剤であると推定される。

5. 調整法及び溶解後の安定性

該当資料なし

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性

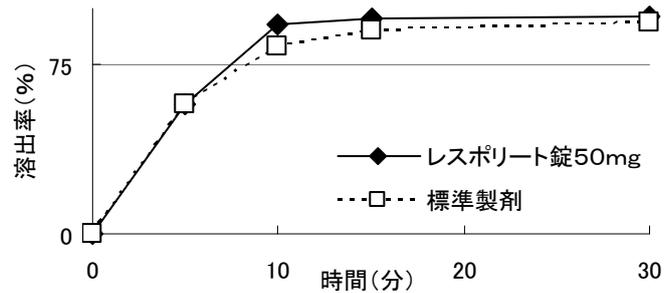
レスポリート錠50mgの溶出は、日本薬局方医薬品各条「ラベタロール塩酸塩錠」の判定基準に適合した。

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

回転数：毎分50回転

試験液：水

溶出規格：30分 75%以上

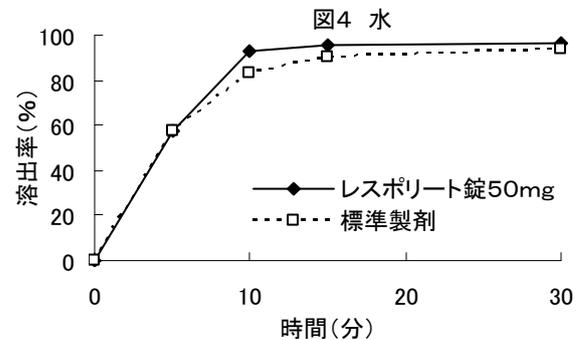
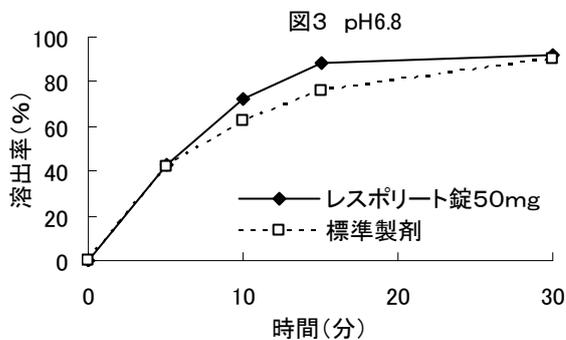
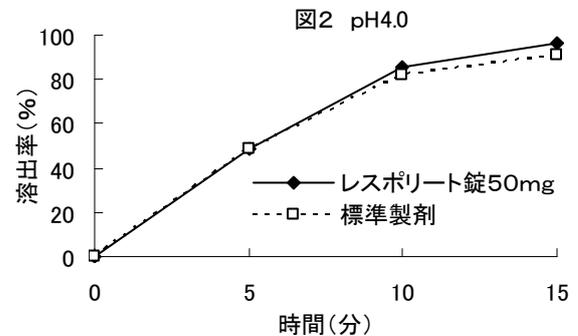
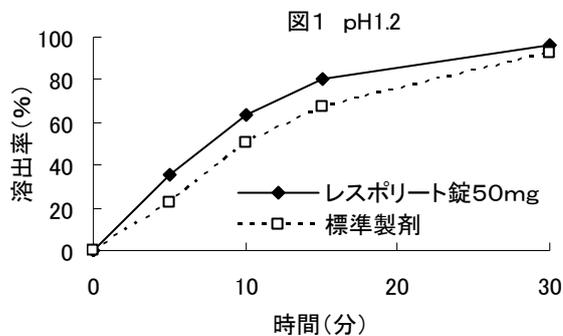


レスポリート錠50mgにつき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

試験結果

標準製剤を対照としたレスポリート錠50mgの溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。

レスポリート錠50mgの溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



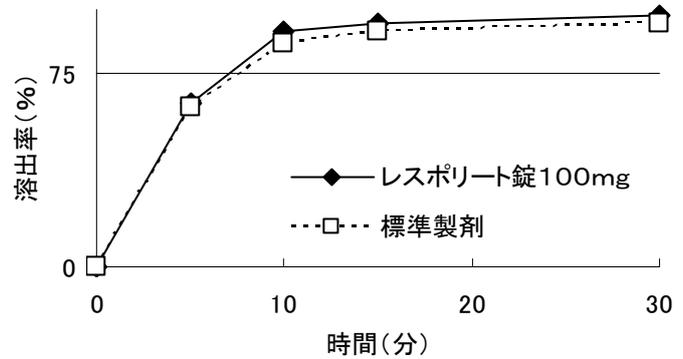
レスポリート錠100mgの溶出は、日本薬局方医薬品各条「ラベタロール塩酸塩錠」の判定基準に適合した。

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

回転数：毎分50回転

試験液：水

溶出規格：30分 75%以上

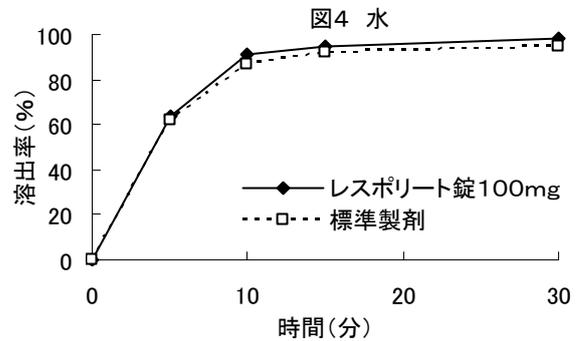
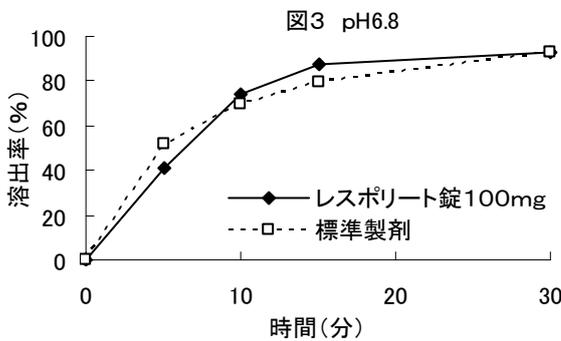
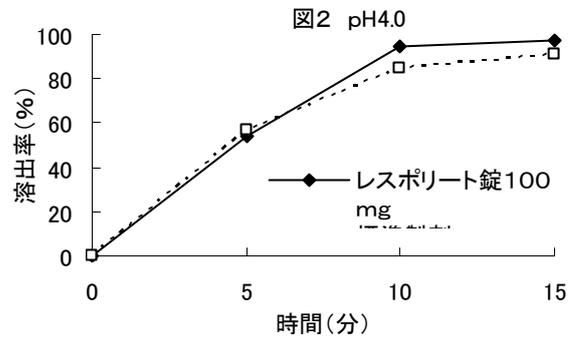
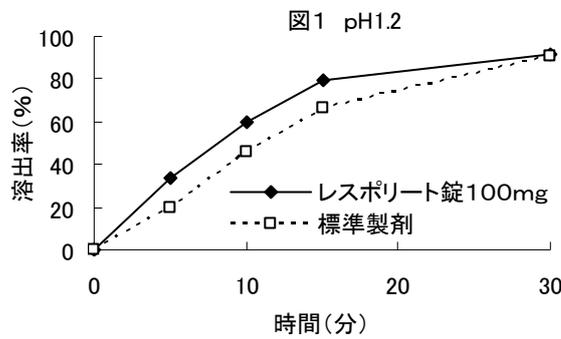


レスポリート錠100mgにつき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

試験結果

標準製剤を対照としたレスポリート錠100mgの溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。

レスポリート錠100mgの溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

レスポリート錠 50 mg

- (1) 塩化第二鉄試液による呈色反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 塩化物の定性反応
- (4) 薄層クロマトグラフィー

レスポリート錠 100 mg

- (1) 塩化第二鉄試液による呈色反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 塩化物の定性反応
- (4) 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

レスポリート錠 50 mg

紫外可視吸光度測定法

レスポリート錠 100 mg

紫外可視吸光度測定法

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. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

本態性高血圧症

褐色細胞腫による高血圧症

2. 用法及び用量

通常成人にはラベタロール塩酸塩として1日150mgより投与を開始し、効果不十分な場合には1日450mgまで漸増し、1日3回に分割、経口投与する。

なお、年齢・症状により適宜増減する。

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：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

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. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

α 、 β 遮断薬(アロチノロール、カルベジロール等)

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

α 、 β -受容体遮断作用

本剤の α 、 β 受容体遮断作用は特有の割合であり $\alpha : \beta = 1 : 3$ の割合で同時に遮断する。また、本剤の薬理的効果として β -受容体遮断作用をもつプロプラノロールと比較すると α 、 β 両方の効果を持つ本剤の方が降圧作用が強力であった。

血圧降下作用

本剤はプロプラノロールとヒドララジンの作用を兼ねそなえた薬剤であり、心拍出量は、ほとんど不変のままで全末梢血管抵抗を減少し、血圧を降下させる。

(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

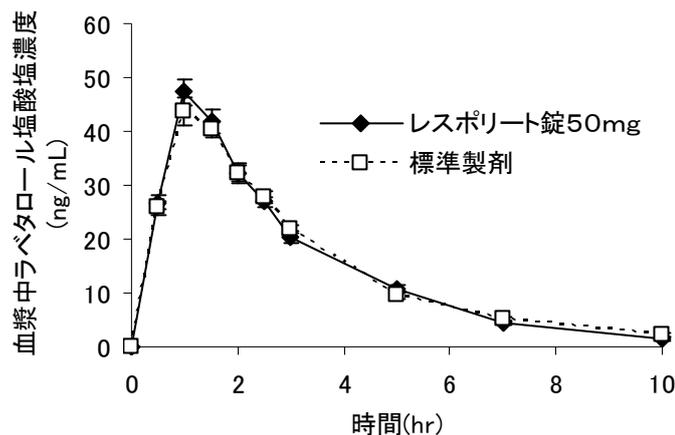
(2) 最高血中濃度到達時間

(「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

レスポリート錠 50mg

レスポリート錠 50mg と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、健康成人男子 12 名に同等と認められた両製剤 2 錠 (ラベタロール塩酸塩として 100mg) ずつを空腹時経口投与し、投与後の血漿中ラベタロール塩酸塩濃度推移を比較した。血漿中ラベタロール塩酸塩濃度は、投与後 1~1.5 時間で 26.7~55.8ng/mL の最高血漿中濃度に達した後、徐々に減少した。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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



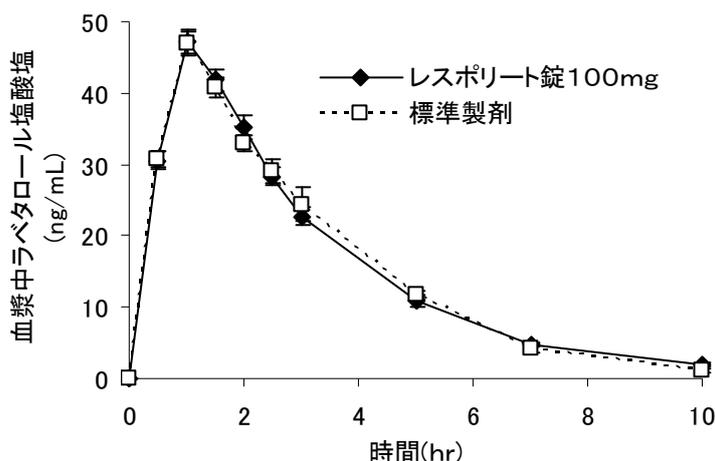
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₀ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レスポリート錠 50mg	147.5 ± 6.1	48.8 ± 2.3	1.1 ± 0.1	1.90 ± 0.12
標準製剤 (錠剤、50mg)	147.7 ± 4.3	46.6 ± 2.0	1.2 ± 0.1	1.85 ± 0.04

(Mean ± S.E., n=12)

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。

レスポリート錠 100mg

レスポリート錠 100mg と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、健康成人男子 12 名に同等と認められた両製剤 1 錠（ラベタロール塩酸塩として 100mg）ずつを空腹時経口投与し、投与後の血漿中ラベタロール塩酸塩濃度推移を比較した。血漿中ラベタロール塩酸塩濃度は、投与後 1～1.5 時間で 38.7～57.3ng/mL の最高血漿中濃度に達した後、徐々に減少した。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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ 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 ₀₋₁₀ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レスポリート錠 100mg	156.3 ± 5.0	48.6 ± 1.4	1.1 ± 0.1	1.82 ± 0.10
標準製剤（錠剤、100mg）	153.6 ± 3.7	48.1 ± 1.4	1.1 ± 0.1	1.94 ± 0.11

(Mean ± S.E., n=12)

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

(「Ⅷ. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 7.相互作用」の項を参照のこと)

(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ー

(1) コンパートメントモデル

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

該当資料なし

(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) 乳汁中への移行性

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

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

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 糖尿病性ケトアシドーシス、代謝性アシドーシスのある患者〔アシドーシスに基づく心収縮力の抑制を増強させるおそれがある。〕
- (2) 高度の徐脈（著しい洞性徐脈）、房室ブロック（II、III度）、洞房ブロックのある患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕
- (3) 1) 心原性ショックの患者
2) 肺高血圧による右心不全のある患者
3) うっ血性心不全のある患者
〔心機能を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。〕
- (4) 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- (5) 気管支喘息、気管支痙攣のおそれのある患者〔気管支を収縮させ、症状を誘発又は悪化させるおそれがある。〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

- (1) 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
 - 1) うっ血性心不全のおそれのある患者（観察を十分に行い、ジギタリス剤を併用するなど慎重に投与すること。）〔心機能を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。〕
 - 2) 房室ブロック（I度）のある患者〔β遮断剤において房室伝導時間が延長するとの報告がある。〕
 - 3) 末梢循環障害のある患者〔末梢循環障害の症状を悪化させるおそれがある。〕
 - 4) 低血糖症、コントロール不十分な糖尿病、長期間絶食状態の患者〔低血糖の前駆症状である頻脈等の交感神経系反応をマスクしやすいので血糖値に注意すること。〕
 - 5) 甲状腺中毒症の患者〔β遮断剤において中毒症状をマスクすることがあるとの報告がある。〕
 - 6) 肝障害のある患者〔本剤は主として肝臓で代謝されるので血中濃度が上昇するおそれがある。本剤を肝障害のある患者に投与する際は、本剤の代謝速度が低下するため、低用量から投与を開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら行うこと。〕
 - 7) 重篤な腎障害のある患者〔降圧に伴う腎灌流圧の低下により、症状を悪化させるおそれがある。また、腎臓は主要な排泄経路であるので、血中濃度が上昇するおそれがある。〕
 - 8) 小児及び高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- 1) 投与は少量より開始し、長期投与の場合は心機能検査（脈拍・血圧・心電図・X線等）を定期的に行うこと。特に徐脈になったとき及び低血圧を起こした場合には減量又は中止すること。また、必要に応じて対症療法を行うこと。なお、肝機能、腎機能、血液像等に注意すること。
- 2) 類似化合物（プロプラノロール塩酸塩）使用中の狭心症の患者で急に投与を中止したとき症状が悪化したり、心筋梗塞を起こした症例が報告されているので、休薬を要する場合は徐々に減量し、観察を十分に行うこと。また、患者に医師の指示なしに服薬を中止しないよう注意すること。狭心症以外の適用で投与する場合でも、特に高齢者においては同様の注意をすること。
- 3) 甲状腺中毒症の患者では急に投与を中止すると、症状を悪化させることがあるので、休薬を要する場合には徐々に減量し、観察を十分に行うこと。
- 4) 褐色細胞腫の手術時に使用する場合を除き、手術前 24 時間は投与しないことが望ましい。
- 5) めまい、ふらつきがあらわれることがあるので、本剤投与中の患者（特に投与初期）には、自動車の運転等危険を伴う機械の作業に注意させること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
交感神経系に抑制的に作用する他の薬剤 レセルピン等	過剰の交感神経抑制をきたすことがあるので、減量するなど注意する。	相加的に作用（交感神経抑制作用）を増強させる。
血糖降下剤 インスリン トルブタミド アセトヘキサミド等	血糖降下作用が増強することがある。また、低血糖症状（頻脈、発汗等）をマスクすることがあるので、血糖値に注意する。	低血糖に伴う交感神経系の症状をマスクしたり、β遮断作用により低血糖の回復を遅らせる。
麻酔剤 ハロタン等	過剰の交感神経抑制をきたすおそれがあるので、減量するなど注意する。又は麻酔の導入前にアトロピンを静脈内投与しておくこと。	相加的に作用（交感神経抑制作用）を増強させる。
カルシウム拮抗剤 ベラパミル塩酸塩 ジルチアゼム塩酸塩 等	徐脈、房室ブロック等の伝導障害、うっ血性心不全があらわれることがある。併用する場合には、用量に注意する。	相加的に作用（陰性変力作用、心刺激伝導抑制作用、降圧作用）を増強させる。
抗不整脈剤 ジソピラミド プロカインアミド アジマリン等	過度の心機能抑制があらわれることがあるので、減量するなど注意する。	相加的に作用（心機能抑制作用）を増強させる。
三環系抗うつ剤 イミプラミン アミトリプチリン デシプラミン等	併用により振戦があらわれやすいとの報告がある。	機序不明
シメチジン	併用により本剤の血中濃度が上昇したとの報告があるので、併用する場合には減量するなど慎重に投与すること。	シメチジンが本剤の肝での代謝を抑制し、本剤のクリアランスが減少し、血中濃度が上昇する。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジギタリス製剤 ジゴキシン等	心刺激伝導障害（徐脈、房室ブロック等）があらわれることがあるので注意すること。	相加的に作用（心刺激伝導抑制作用）を増強させる。
非ステロイド性抗炎症剤 インドメタシン等	本剤の降圧作用が減弱するおそれがある。併用する場合には、必要に応じて用量調整を行うこと。	非ステロイド性抗炎症剤は、血管拡張作用を有するプロスタグランジンの合成・遊離を阻害する。
交感神経刺激剤 アドレナリン等	本剤との相互作用により高血圧症、徐脈が発現するおそれがあるので注意すること。	本剤のβ遮断作用により交感神経刺激剤のα刺激作用が優位となる。

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. うっ血性心不全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。
2. 肝壊死等の重篤な肝障害、黄疸等があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には直ちに投与を中止し適切な処置を行うこと。なお、このような患者には再投与しないこと。
3. SLE 様症状（筋肉痛、関節痛、抗核抗体陽性）、乾癬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。
4. ミオパシー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。

(3) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
過 敏 症 *	発疹、瘙痒、発熱、呼吸困難、血管浮腫
皮 膚	苔癬様皮疹
精神神経系	頭痛、不眠、眠気、しびれ感、振戦、抑うつ
循 環 器	めまい・たちくらみ、徐脈、胸痛、房室ブロック、末梢循環障害（レイノー症状の悪化、冷感等）
呼 吸 器	喘息様症状、気管支痙攣
消 化 器	悪心・嘔吐、胃痛、腹痛、便秘、消化不良、口渇
泌 尿 器	尿閉
肝 臓	AST(GOT)の上昇、ALT(GPT)の上昇、γ-GTPの上昇、Al-Pの上昇
腎 臓	BUNの上昇
眼	霧視、また、β遮断剤の投与により、涙液分泌減少等があらわれたとの報告がある。**
そ の 他	頭皮異常感、倦怠感、浮腫、筋肉痛、CK(CPK)の上昇、陰萎、勃起不全、疲労感、鼻閉、発汗、悪寒、性欲減退、射精不能

*：このような場合には、投与を中止すること。

**：このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。（角膜潰瘍等の重篤な合併症を防止するため。）

(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

該当資料なし

9. 高齢者への投与

高齢者には、以下の点に注意し、少量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。

- 1) 高齢者では一般に過度の降圧は好ましくないとされている。〔脳梗塞等が起こるおそれがある。〕
- 2) 休薬を要する場合は、徐々に減量する。（「重要な基本的注意」の項参照。）

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投与する場合には、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。投与に際しては、母体及び胎児の状態を十分に観察し、過度の血圧低下とならないよう注意すること。胎児及び新生児に血圧低下、徐脈等の異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。〔妊婦への投与例において、胎児に徐脈等、新生児に血圧低下、徐脈等の症状が認められたとの報告がある。〕
- 2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむをえず投与する場合には授乳を中止させること。〔母乳中へ移行することが報告されている。〕

11. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

- 1) 本剤投与中の患者では、蛍光法を用いる血中及び尿中カテコールアミン、VMA (Vanillyl mandelic acid) の測定値をみかけ上増加させる可能性があるため、これらの検査は本剤投与前に行うこと。（本剤は、アルカリ溶液中にて励起波長 334nm で蛍光を発生し、その蛍光波長は 412nm である。）
- 2) 本剤投与中の患者において MIBG(metaiodobenzyl-guanidine)を用いた臨床検査 (シンチグラフィ) を実施したところ、MIBG の取り込みが阻害され、臨床検査結果に影響を与えたという報告があるので、本剤投与中の患者において MIBG を用いた臨床検査を実施する場合には注意すること。

13. 過量投与

徴候、症状：本剤の過量投与により、過度の起立性低血圧、徐脈などの重度の心血管系作用が発現する可能性がある。本剤の過量投与後の乏尿性腎不全が報告されている。

処置：下肢を挙上させ患者を仰臥位にし、必要に応じて次のような処置を行う。

- 1) 心不全：強心配糖体や利尿薬を投与する。
- 2) 気管支痙攣：吸入 β 2 刺激薬を投与する。

3) 徐脈：アトロピン硫酸塩水和物を静注する。

血液循環を改善させるため、反応をみながらノルアドレナリン投与を繰り返す。必要に応じて、心臓ペースングを適用すること。

なお、透析により血中から除去できるラベタロール塩酸塩は 1%以下である。

14. 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。)

15. その他の注意

- 1) 褐色細胞腫の患者に投与した場合に高血圧が悪化したとの報告がある。
- 2) 重篤なアナフィラキシーの既往歴のある患者では、 β 遮断剤服用により、アナフィラキシー反応がより重篤になることがあり、また、通常用量のアドレナリンによる治療に抵抗する場合がある。
- 3) α 遮断薬であるタムスロシンを服用中又は過去に服用経験のある患者において、白内障手術中に術中虹彩緊張低下症候群 (IFIS : 縮瞳型症候群の一種) があらわれるとの報告がある。IFIS の発現により白内障手術中の合併症が増加するおそれがあるため、本剤の服用又は服用歴について手術前に執刀医に伝えるよう指導すること。

16. その他

該当しない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

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

- 1) 製剤：劇薬、処方せん医薬品（注意一医師等の処方せんにより使用すること）
- 2) 有効成分：劇薬、処方せん医薬品

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：5年（安定性試験に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存（気密容器）

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱いについて

（「規制区分」及び「貯法・保存条件」の項を参照のこと）

（2）薬剤交付時の注意（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 14.適用上の注意」の項を参照のこと）

5. 承認条件等

なし

6. 包装

（PTP）100錠、1000錠

7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル アルミ箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分：トランデート錠 50mg、トランデート錠 100mg

同効薬：アモスラロール塩酸塩、アロチノロール塩酸塩、カルベジロール

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

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
レスポリート錠 50mg	1990年8月30日	20200AMZ00881000
レスポリート錠 100mg	1991年6月21日	20300AMZ00401000

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
レスポリート錠 50m g	1992年7月10日
レスポリート錠 100m g	1992年7月10日

12. 効能・効果追加，用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

なし

13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

2000年5月11日(品質再評価)

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

該当しない

16. 各種コード

製品名	HOT (9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
レスポリート錠 50m g	102894201	2149009F1073	612140693
レスポリート錠 100m g	102898001	2149009F2061	612140694

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。

X I . 文 献

1. 引用文献

2. その他の参考文献

第16改正 日本薬局方

X II . 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

該当しない

X III . 備 考

1. その他の関連資料

なし



製造販売元

鶴原製薬株式会社

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

文献請求先：鶴原製薬（株）医薬情報部