

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

LH-RH誘導体
マイクロカプセル型徐放性製剤
注射用リュープロレリン酢酸塩

リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg [NP]

Leuprorelin Acetate SR for Injection Kits

剤形	持続性注射剤：粉末部（注射剤本体：用時懸濁）と液体部（水性の懸濁用液 1mL）からなるキット製品
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	1キット中 日本薬局方 リュープロレリン酢酸塩 11.25mg
一般名	和名：リュープロレリン酢酸塩（JAN） 洋名：Leuprorelin Acetate（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2025年8月15日 薬価基準収載年月日：2025年12月5日 販売開始年月日：2025年12月5日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL：0120-226-898 FAX：050-3535-8939 医療関係者向けホームページ： https://www.nipro.co.jp/

本IFは2025年8月作成の電子添文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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIF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（<https://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IF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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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、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。

IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDA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IFを作成・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利用者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、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、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDA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

IF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。IF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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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IF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、IFを利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	5. 臨床成績	12
1. 開発の経緯	1	
2. 製品の治療学的特性	1	
3. 製品の製剤学的特性	1	
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	
6. RMPの概要	2	
II. 名称に関する項目	VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	16
2. 一般名	2. 薬理作用	16
3. 構造式又は示性式	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	1. 血中濃度の推移	23
5. 化学名（命名法）又は本質	2. 薬物速度論的パラメータ	24
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3. 母集団（ポピュレーション）解析	25
III. 有効成分に関する項目	4. 吸収	25
1. 物理化学的性質	5. 分布	25
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6. 代謝	26
3. 有効成分の確認試験法，定量法	7. 排泄	26
IV. 製剤に関する項目	8. トランスポーターに関する情報	26
1. 剤形	9. 透析等による除去率	26
2. 製剤の組成	10. 特定の背景を有する患者	26
3. 添付溶解液の組成及び容量	11. その他	26
4. 力価	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
5. 混入する可能性のある夾雑物	1. 警告内容とその理由	27
6. 製剤の各種条件下における安定性	2. 禁忌内容とその理由	27
7. 調製法及び溶解後の安定性	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	27
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	27
9. 溶出性	5. 重要な基本的注意とその理由	27
10. 容器・包装	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	28
11. 別途提供される資材類	7. 相互作用	29
12. その他	8. 副作用	29
V. 治療に関する項目	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	32
1. 効能又は効果	10. 過量投与	32
2. 効能又は効果に関連する注意	11. 適用上の注意	32
3. 用法及び用量	12. その他の注意	33
4. 用法及び用量に関連する注意	IX. 非臨床試験に関する項目	
	1. 薬理試験	34
	2. 毒性試験	34
	X. 管理的事項に関する項目	
	1. 規制区分	35
	2. 有効期間	35

3. 包装状態での貯法	35	14. 保険給付上の注意	36
4. 取扱い上の注意	35		
5. 患者向け資材	35	X I . 文献	
6. 同一成分・同効薬	35	1. 引用文献	37
7. 国際誕生年月日	35	2. その他の参考文献	37
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	36	X II . 参考資料	
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	36	1. 主な外国での発売状況	38
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	36	2. 海外における臨床支援情報	38
11. 再審査期間	36	X III . 備考	
12. 投薬期間制限に関する情報	36	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	39
13. 各種コード	36	2. その他の関連資料	39

略語表

略語	略語内容
AL-P	alkaline phosphatase : アルカリホスファターゼ
ALT	alanine aminotransferase : アラニンアミノトランスフェラーゼ (=GPT)
AST	aspartate aminotransferase : アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (=GOT)
AUC	area under curve : 血中濃度-時間曲線下面積
BUN	blood urea nitrogen : 血液尿素窒素
CA15-3	carbohydrate antigen 15-3 : 糖鎖抗原 15-3
CEA	carcinoembryonic antigen : 癌胎児性抗原
C_{max}	最高血漿中濃度
FSH	follicle-stimulating hormone : 卵胞刺激ホルモン
γ -GTP	gamma-glutamyl transpeptidase : γ グルタミルトランスペプチダーゼ
LDH	lactate dehydrogenase : 乳酸デヒドロゲナーゼ、乳酸脱水素酵素
LDL	low-density lipoprotein : 低密度リポ蛋白 [質]
LH	luteinizing hormone : 黄体形成 (黄体化) ホルモン
PSA	prostate-specific antigen : 前立腺特異抗原
RMP	Risk Management Plan : 医薬品リスク管理計画
S. D.	standard deviation : 標準偏差
T_{max}	Time to reach maximum concentration in plasma : 最高血漿中濃度到達時間

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

リュープロレリン酢酸塩は、LH-RH（黄体形成ホルモン放出ホルモン）誘導体であり、製剤として本邦では 1992 年に前立腺癌治療薬（徐放性製剤）として上市されている。

1 キット中にリュープロレリン酢酸塩を 11.25mg 含有するリュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」は、ニプロ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、長期保存試験、生物学的同等性試験を実施し、2025 年 8 月に承認を取得、2025 年 12 月に販売を開始した。なお、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」は後発医薬品として、ニプロ株式会社、あすか製薬株式会社の 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

2. 製品の治療学的特性

- 黄体形成ホルモン放出ホルモン（LH-RH）誘導体であるリュープロレリン酢酸塩のマイクロカプセル型徐放性製剤で、12 週に 1 回の皮下投与で持続的な性腺ホルモン濃度抑制効果が得られる。
- 本剤の投与で下垂体において性腺刺激ホルモンの産生－放出が低下し、更に精巣及び卵巣の性腺刺激ホルモンに対する反応性が低下し、性ホルモン産生機能が低下する¹⁾。
- 臨床的には、前立腺癌、閉経前乳癌に有用性が認められている。
- 重大な副作用としては、
 - ・ 効能共通：間質性肺炎、アナフィラキシー、肝機能障害、黄疸、糖尿病の発症又は増悪、下垂体卒中、心筋梗塞、脳梗塞、静脈血栓症、肺塞栓症等の血栓塞栓症
 - ・ 前立腺癌：うつ状態、骨疼痛の一過性増悪、尿路閉塞あるいは脊髄圧迫、心不全
 - ・ 閉経前乳癌：更年期障害様のうつ状態が報告されている。（VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

- 清潔で簡便・スピーディーな懸濁操作ができるダブルチャンバー型キット（プレフィルドシリンジ）であり、投与しやすさ（持ちやすさ・押しやすさ）を考慮したシリンジ形状である。
- 23 ゲージ注射針、ガラスバレルを使用。
- シリンジには 2 層ラベルを採用し、識別性向上のため、上層ラベルをはがした後も、下層に有効成分名の表示が残るようにした。

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	タイトル、参照先
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

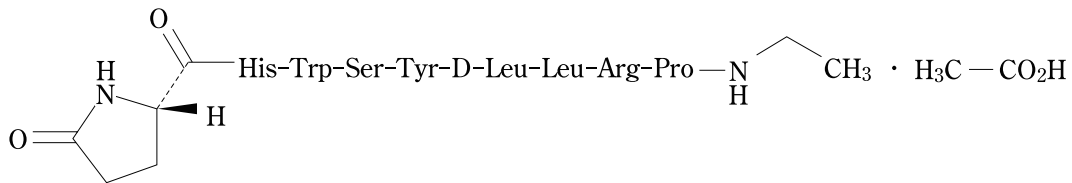
1. 販売名

- (1) 和 名 : リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」
(2) 洋 名 : Leuprorelin Acetate SR for Injection Kits
(3) 名称の由来 : 有効成分であるリュープロレリン酢酸塩に剤形及び含量、Sustained Release (放出を持続させる : 徐放性製剤) より SR を記載し、NIPRO から「NP」を付した。

2. 一般名

- (1) 和 名(命名法) : リュープロレリン酢酸塩 (JAN)
(2) 洋 名(命名法) : Leuprorelin Acetate (JAN)
(3) ステム (stem) : pituitary hormone-release stimulating peptides : -relin

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $\text{C}_{59}\text{H}_{84}\text{N}_{16}\text{O}_{12} \cdot \text{C}_2\text{H}_4\text{O}_2$

分子量 : 1269.45

5. 化学名(命名法)又は本質

5-Oxo-L-prolyl-L-histidyl-L-tryptophyl-L-seryl-L-tyrosyl-D-leucyl-L-leucyl-L-arginyl-N-ethyl-L-prolinamide monoacetate (JAN)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～帯黄白色の粉末である。

(2) 溶解性

水又は酢酸 (100) に極めて溶けやすく、メタノールに溶けやすく、エタノール (99.5) にやや溶けにくい。

(3) 吸湿性

吸湿性である。

(4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点²⁾

140℃付近から発泡し始め、170℃付近で融解するものの、発泡するため明確な融点の測定はできなかった。

(5) 酸塩基解離定数²⁾

$pK_{a1} = 5.9$ 、 $pK_{a2} = 10.0$

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値¹⁾

旋光度： $[\alpha]_D^{20}$ ： $-38 \sim -41^\circ$ (脱水及び脱酢酸物に換算したもの 0.25g、薄めた酢酸 (100) (1→100)、25mL、100mm)。

pH：本品 0.10g を水 10mL に溶かした液の pH は 5.5～7.5 である。

水分：5.0%以下 (0.1g、電量滴定法)。

強熱残分：0.2%以下 (0.5g)。

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¹⁾

確認試験法

日本薬局方の医薬品各条の「リュープロレリン酢酸塩」確認試験法による。

定量法

日本薬局方の医薬品各条の「リュープロレリン酢酸塩」定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

持続性注射剤

粉末部（注射剤本体：用時懸濁）と液体部（水性の懸濁用液 1mL）からなるキット製品（コンビネーション製品）

(2) 製剤の外観及び性状

外観	
性状	粉末部：白色の粉末、懸濁用液：無色澄明の液

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH：6.0～7.1

浸透圧比：約 1（生理食塩液に対する比）
（添付の懸濁用液 1mL で懸濁した場合）

(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	粉末部		液体部
	有効成分	添加剤	懸濁用液
リュープロレリン 酢酸塩 SR 注射用 キット 11.25mg 「NP」	1 キット中 日本薬局方 リュープロレリン 酢酸塩 11.25mg	1 キット中 乳酸重合体 99.3mg D-マンニトール 19.45mg	1 キット (1mL) 中 D-マンニトール 50mg カルメロースナトリウム 5mg ポリソルベート 80 1mg 水酸化ナトリウム 適量 塩酸 適量

(2) 電解質等の濃度

懸濁用液（1mL）に添加剤としてカルメロースナトリウム 5mg を含有する。

(Na：0.03～0.04mEq)

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

「IV. 2. (1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤」の項参照。

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験³⁾

試験条件：40±1℃、75±5%RH

包装形態（ダブルチャンバーシリンジ）

[粉末部]

項目及び規格	開始時	2 カ月	4 カ月	6 カ月
性状（白色の粉末）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合
含量〈リュープロレリン酢酸塩〉 (95.0~105.0%)	99.5	98.9	99.0	100.0
	100.4	99.7	99.7	100.4
	99.5	99.0	98.8	100.1

1ロット (n=3)、3ロット

[液体部]

項目及び規格	開始時	2 カ月	4 カ月	6 カ月
性状（無色澄明の液）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合
不溶性異物検査	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	適合	適合	適合	適合
含量〈D-マンニトール〉 (95.0~105.0%)	98.2	98.5	99.5	99.3
	98.7	99.3	99.3	99.7
	98.9	99.3	99.2	99.8

1ロット (n=3)、3ロット

[キット品]

項目及び規格	開始時	2 カ月	4 カ月	6 カ月
浸透圧比 (1.2~1.6)	1.4	1.4	1.4	1.5
	1.4	1.4	1.4	1.4
	1.4	1.4	1.4	1.4
pH (6.0~7.1)	6.5	6.6	6.6	6.5
	6.5	6.6	6.6	6.5
	6.6	6.6	6.6	6.5
採取容量試験	適合	適合	適合	適合
無菌試験	適合	—	—	適合

1 ロット (n=3)、3 ロット

長期保存試験⁴⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

包装形態 (ダブルチャンバーシリンジ)

[粉末部]

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	36 カ月
性状 (白色の粉末)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	適合
含量 (リユープロレリン 酢酸塩) (95.0~105.0%)	101.3	100.0	99.8	99.6	100.2	100.2	99.9	100.5
	100.7	100.5	99.7	99.9	99.5	99.6	99.4	100.1
	99.3	99.3	99.1	99.2	99.1	99.2	99.0	99.3

1 ロット (n=3)、3 ロット

[液体部]

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	36 カ月
性状 (無色澄明の液)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	適合
不溶性異物検査	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (D-マンニトール) (95.0~105.0%)	99.1	98.8	99.0	99.1	99.2	99.6	100.2	99.8
	98.7	98.9	98.9	99.0	99.2	99.6	100.2	100.0
	98.8	98.3	98.5	98.8	99.3	99.2	99.8	99.7

1 ロット (n=3)、3 ロット

[キット品]

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	36 カ月
浸透圧比 (1.2~1.6)	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4
	1.4	1.5	1.4	1.4	1.4	1.5	1.5	1.4
	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4	1.4
pH (6.0~7.1)	6.4	6.5	6.6	6.6	6.6	6.7	6.6	6.4
	6.4	6.5	6.5	6.6	6.7	6.6	6.6	6.4
	6.4	6.5	6.6	6.6	6.6	6.7	6.6	6.4
採取容量試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	適合
無菌試験	適合	—	—	—	—	—	—	適合

1 ロット (n=3)、3 ロット

長期保存試験 (25℃、相対湿度 60%、3 年間) の結果、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。

光に対する安定性⁵⁾

試験条件 : D65 ランプ 2000lx

総照度 : 120 万 lx・hr

包装形態 ①曝光 無色ガラスバイアル

②遮光 無色ガラスバイアル+アルミ包装

[粉末部]

試験項目	保存形態	試料	総照度		
			開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性状	①曝光	1	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
	②遮光	1	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量 (残存率) (%)	①曝光	1	—	99.1	98.3
		2	—	99.0	98.1
		3	—	98.6	98.1
	②遮光	1	—	99.7	99.4
		2	—	99.5	99.6
		3	—	99.4	99.3

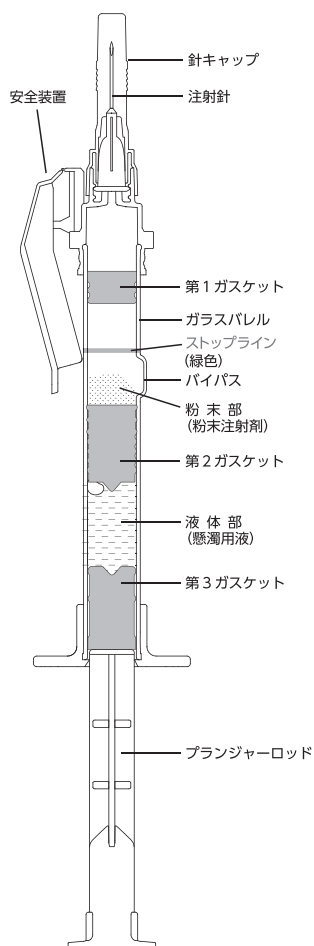
1 ロット

7. 調製法及び溶解後の安定性

「VIII. 11. 適用上の注意」の項参照。

本品の調製中は、針キャップ側を上に向けてください。
プランジャーロッドの引き戻しは決して行わないでください。

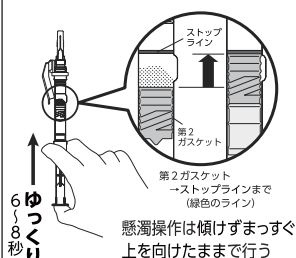
使用方法



① シリンジを軽く指先ではじく

キット内に粉末の塊を認める場合がありますので、シリンジを軽く指先ではじいて粉末をほぐします。

② プランジャーロッドを押し上げる

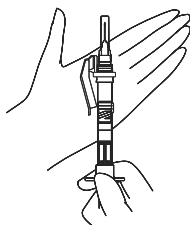


懸濁用液を移動させます。針キャップ側を傾けずまっすぐ上に向けプランジャーロッドをゆっくり押し上げて（6～8秒）第2ガスケットの先端を緑色のストップラインまで動かしてください。

[注意]

- ・針キャップを下に向けると、液漏れの原因となります。
- ・プランジャーロッドを急に押し込んだり、押しすぎてストップラインを越えると、注射針から液漏れしたり、又は粉末注射剤が分散しにくくなるので、避けてください。

③ 手のひらに軽く打ちつける

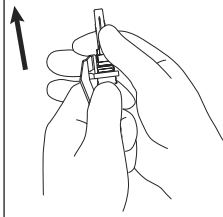


粉末を懸濁します。針キャップを上に向けたまま、手のひらに軽く打ちつけて、十分に懸濁してください。

[注意]

- ・強い懸濁操作は泡立ちおよび注射針からの液漏れの原因になりますので、避けてください。
- ・懸濁後は針キャップ側を高くして置いてください。

④針キャップをはずす



回転方向に
引き抜く

注射筒と針キャップの根元部を持ち、針先に十分注意して、針キャップを回さずまっすぐ引き抜いてください。

[注意]

- ・注射針を反時計回りに回すと、注射針の接合状態が緩み、液漏れの原因となりますので、避けてください。

⑤気泡を抜いて使用する

プランジャーロッドをゆっくり押し、気泡を抜いて直ちに使用してください。

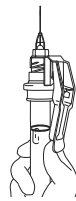
[注意]

- ・プランジャーロッドが固く感じた場合でもプランジャーロッドから指を離さずにゆっくりと押し続けてください。

安全装置の使用法

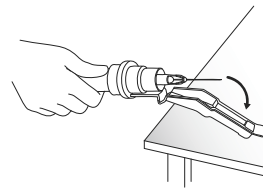
針刺し事故を防止するための装置です。
必ず投与終了後に使用してください。
注射後、針先が完全に隠れるように安全装置に収納ください。
※「カチッ」と音がすれば完了です。

①



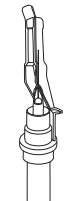
下から固定されている装置をはずす

②



固定された机などを利用し、収納する

③



収納完了図

懸濁後の安定性⁶⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

試験検体（開始時検体及び加速条件下〔40±2℃/75±5%RH〕6カ月保存検体）

包装形態（ダブルチャンバーシリンジ）

試験項目	試験検体	試験回数	保存時間			
			懸濁直後	3時間	6時間	24時間
性状	開始時	3	白色の懸濁液	白色の沈降物	白色の沈降物	白色の沈降物
	6カ月	3	白色の懸濁液	白色の沈降物	白色の沈降物	白色の沈降物
pH	開始時	3	6.5	6.4	6.3	6.0
	6カ月	3	6.5	6.4	6.3	6.1
通針性	開始時	3	目詰まりなし	目詰まりなし	目詰まりなし	目詰まりなし
	6カ月	3	目詰まりなし	目詰まりなし	目詰まりなし	目詰まりなし

試験項目	試験検体	試験回数	保存時間			
			懸濁直後	3 時間	6 時間	24 時間
再分散性	開始時	3	—	容易に懸濁	容易に懸濁	容易に懸濁
	6 カ月	3	—	容易に懸濁	容易に懸濁	容易に懸濁
含量 (残存率) (%)	開始時	1	100.0	100.2	100.6	99.7
	6 カ月	1	100.0	100.5	100.7	99.8

1 ロット

(含量 (残存率) : 10 キット使用)

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

該当しない

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

該当しない

(2) 包装

22. 包装

1 キット [23 ゲージ注射針付き]

(3) 予備容量

該当資料なし

(4) 容器の材質

注射針部分 : ポリプロピレン、ステンレス

バレル : 無色ガラス

フランジ : ポリプロピレン

プランジャーロッド : ポリプロピレン

ガスケット : ブチルゴム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能・効果

- 前立腺癌
- 閉経前乳癌

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能・効果に関連する注意

〈閉経前乳癌〉

本剤の使用開始にあたっては、原則としてホルモン受容体の発現の有無を確認し、ホルモン受容体が陰性と判断された場合には本剤を使用しないこと。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法・用量

通常、成人には12週に1回リュープロレリン酢酸塩として11.25mgを皮下に投与する。投与に際しては、注射針を上にしてプランジャーロッドを押して、懸濁用液全量を粉末部に移動させて、泡立てないように注意しながら、十分に懸濁して用いる。

(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・用量に関連する注意

本剤は12週間持続の徐放性製剤であり、12週を超える間隔で投与すると下垂体-性腺系刺激作用により性腺ホルモン濃度が再度上昇し、臨床所見が一過性に悪化するおそれがあるので、12週に1回の用法を遵守すること。

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

〈前立腺癌〉

17.1.1 前立腺癌患者を対象に、12週に1回、リュープロレリン酢酸塩として11.25mgを皮下投与した国内第Ⅱ相非盲検群間比較試験及び国内第Ⅱ相非対照試験における抗腫瘍効果（奏効率）及び血清テストステロン濃度の去勢レベル維持率は以下のとおりであった。

抗腫瘍効果（奏効率）及び血清テストステロン濃度の去勢レベル維持率

対象患者	投与回数	投与・観察期間	抗腫瘍効果 (奏効率) ^{注2)}	去勢レベル 維持率 ^{注3)}
未治療例	1回	12週	100% (10/10例)	100% (10/10例)
既治療例 ^{注1)}	2回	24週	80.4% (41/51例)	100% (46/46例)

注1) リュープロレリン酢酸塩注射用3.75mgの投与により抗腫瘍効果が安定して得られている患者。

注2) 観察期間終了時における「前立腺癌の非観血的治療効果判定基準」による評価。

奏効率は、未治療例ではCR + PR、既治療例ではS以上の症例の割合を示す（CR：Complete Response、PR：Partial Response、S：Stable）。

注3) 観察期間終了時における血清テストステロン濃度が去勢レベル（100ng/dL）以下の症例の割合を示す。

副作用の発現頻度は、既治療例を対象とした国内第Ⅱ相非盲検群間比較試験で23.5%（12/51例）であり、主な症状は発汗、ほてり及び注射部位硬結（注射部疼痛性硬結を含む）であった。未治療例を対象とした国内第Ⅱ相非対照試験では副作用はみられなかった⁷⁾。

〈閉経前乳癌〉

17.1.2 閉経前乳癌患者を対象に、12週に1回、リュープロレリン酢酸塩として11.25mgを皮下投与（タモキシフェンクエン酸塩を併用投与）した国内第Ⅱ相非盲検群間比較試験及び国内第Ⅱ相非対照試験における抗腫瘍効果（奏効率）及び血清エストラジオール濃度の閉経期レベル抑制率は以下のとおりであった。

抗腫瘍効果（奏効率）及び血清エストラジオール濃度の閉経期レベル抑制率

対象患者	投与回数	投与・観察期間	抗腫瘍効果 (奏効率) 注1)	閉経期レベル への抑制率注2)
閉経前進行・ 再発乳癌	2回	24週	22.7% (5/22例)	—
閉経前乳癌術後	2回	24週	—	96.8% (60/62例)

注1) 24週間における「進行・再発乳癌患者における治療効果の判定基準」による評価 (Best Response)。

奏効率は、CR + PR の症例の割合を示す (CR : Complete Response、PR : Partial Response)

注2) 初回投与後 4~24週の血清エストラジオール濃度が 4週毎の全ての測定時点で閉経期レベル (30pg/mL 未満) まで抑制された症例の割合。

また、外国 (欧州) においてリンパ節転移陽性の閉経前及び閉経周辺期乳癌術後患者を対象に、リュープロレリン酢酸塩の投与又は CMF 療法を行った海外第Ⅲ相無作為割付群間比較試験における無再発生存率は以下のとおりであった。

無再発生存率

投与薬剤	用法用量	投与開始 2 年後 の無再発生存率 (主要評価項目)	投与開始 5 年後 の無再発生存率 (副次評価項目)
リュープロレリン酢酸塩 11.25mg	3 ヶ月に 1 回皮下投与・ 24 ヶ月間投与	83.0% (224/270 例)	60.5% (153/253 例)
CMF 療法 シクロホスファミド 500mg/m ² 、 メトトレキサート 40mg/m ² 、 フルオロウラシル 600mg/m ²	各薬剤を 1 ヶ月毎に 2 回 (1 日目及び 8 日目) 静脈内投与することを 1 サイクルとし、6 サイ クル (6 ヶ月間) 投与	80.9% (207/256 例)	60.6% (146/241 例)

有害事象の発現頻度は、ホルモン動態及び安全性に関する国内第Ⅱ相非盲検群間比較試験では 97.2% (69/71 例) であり、主な症状は熱感、頭重 (感)、発汗、悪心、注射部位硬結及び注射部疼痛であった。国内第Ⅱ相非対照試験では 100% (22/22 例) であり、主な症状は熱感、頭重 (感)、頭痛、発汗、腰痛であった。海外第Ⅲ相無作為割付群間比較試験では 97.6% (287/294 例) であり、主な症状はほてり、体重増加、多汗であった⁸⁾。

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

該当資料なし

(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

LH-RH (GnRH) アゴニスト (ゴセレリン酢酸塩、ブセレリン酢酸塩、酢酸ナファレリン)

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

高用量の LH-RH 又は高活性 LH-RH 誘導体であるリュープロレリン酢酸塩を反復投与すると、初回投与直後一過性に下垂体－性腺系刺激作用（急性作用）がみられた後、下垂体においては性腺刺激ホルモンの産生・放出が低下する。更に、精巣及び卵巣の性腺刺激ホルモンに対する反応性が低下し、テストステロン及びエストラジオール産生能が低下する（慢性作用）。リュープロレリン酢酸塩の LH 放出活性は LH-RH の約 100 倍であり、その下垂体－性腺機能抑制作用は LH-RH より強い。リュープロレリン酢酸塩が高活性 LH-RH 誘導体であり、下垂体－性腺機能抑制作用が強い理由は、リュープロレリン酢酸塩が、LH-RH と比較して蛋白分解酵素に対する抵抗性が高いこと、LH-RH リセプターに対する親和性が高いことなどによる。更に、本剤は徐放性製剤であるので、常時血中にリュープロレリン酢酸塩を放出して効果的に精巣及び卵巣の反応性低下をもたらし、下垂体－性腺機能抑制作用を示す^{9)~13)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 性腺ホルモン濃度抑制作用

18.2.1 前立腺癌患者において 12 週に 1 回の皮下投与により血清テストステロン濃度が持続的に去勢レベル以下に低下し、薬物的去勢作用が認められる¹⁴⁾。

18.2.2 閉経前乳癌患者において 12 週に 1 回の皮下投与により血清エストラジオール濃度は概ね閉経期レベル以下に低下し、卵巣機能抑制作用を認め、通常排卵は抑制され、月経は停止する⁸⁾。

生物学的同等性試験（薬力学的試験）

〈前立腺癌〉

①主要評価項目

未治療前立腺癌患者を対象とした並行群間比較試験において、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 又はリュープリン SR 注射用キット 11.25mg を、リュープロレリン酢酸塩として 11.25mg 単回皮下投与した。投与 4 週後の血清中テストステロン濃度は以下のとおりであった。投与群間の平均値の差の 95%信頼区間は、同等性の判定基準とした $\pm 20\text{ng/dL}$ の範囲内であった。

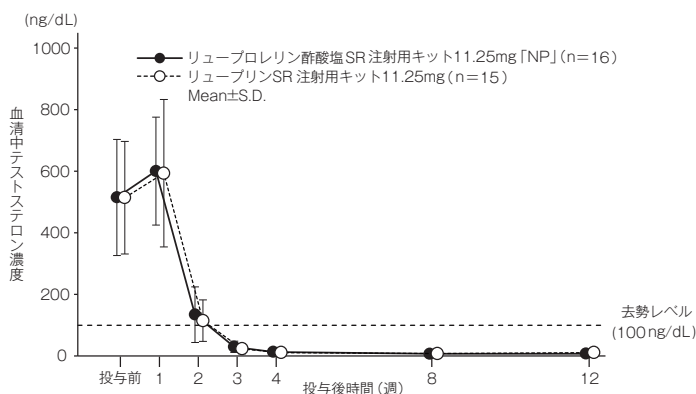
投与4週後の血清中テストステロン濃度の平均値

	n	投与4週後の血清中テストステロン濃度の平均値 (ng/dL) (両側95%信頼区間)	平均値の差 (ng/dL) (両側95%信頼区間)
リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」	16	13.2 (7.5, 18.9)	1.9 (-6.5, 10.2)
リュープリン SR 注射用キット 11.25mg	15	11.3 (4.8, 17.9)	

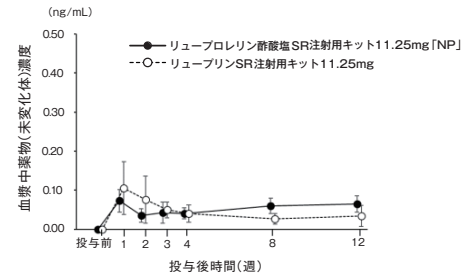
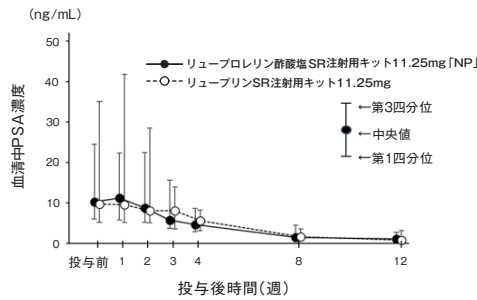
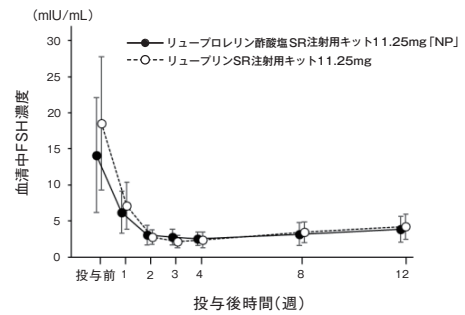
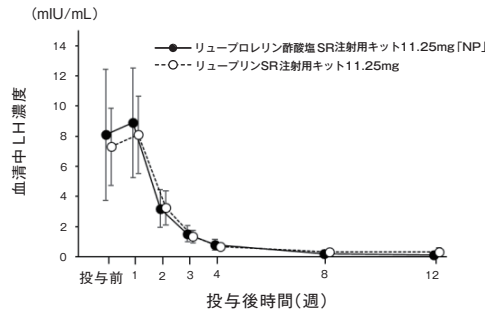
副作用発現頻度は、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 投与群で56.3% (9/16例)であった。主な副作用は、ほてり43.8% (7/16例)であった¹⁵⁾。

副次的評価項目

有効性の副次的評価項目のうち、血清中テストステロン濃度は両投与群とも投与3週後には去勢レベル以下 (100ng/dL以下)に達し、投与12週後まで去勢レベル以下を維持した。血清中テストステロン濃度以外のホルモン動態や、抗腫瘍効果に関する評価でも、同様な結果であった。定常放出相 (1~12週)の薬物動態は、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 投与群とリュープリン SR 注射用キット 11.25mg 投与群とで血漿中薬物 (未変化体)濃度に違いが認められる時点があった。薬物動態は、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 投与群とリュープリン SR 注射用キット 11.25mg 投与群で一致しなかったが、主要評価項目及び有効性の副次的評価項目の結果から、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」の有効性はリュープリン SR 注射用キット 11.25mg と相違ないことが示された。



血清中テストステロン濃度の推移



血清中 LH、FSH 及び PSA 濃度ならびに血漿中薬物（未変化体）濃度の推移

（リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」：n=16、

リュープリン SR 注射用キット 11.25mg：n=14~15、平均値±標準偏差（PSA 除く）

②主要評価項目

未治療前立腺癌患者を対象とした並行群間比較試験において、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」又はリュープリン SR 注射用キット 11.25mg を、リュープロレリン酢酸塩として 11.25mg 単回皮下投与した。投与 4 週後から 12 週後に血清中テストステロン濃度が去勢レベル（50ng/dL）以下となった被験者の割合は以下のとおりであった。投与群間の割合の差の 95%信頼区間の下側信頼限界は、非劣性マージンとした-15%を上回った。

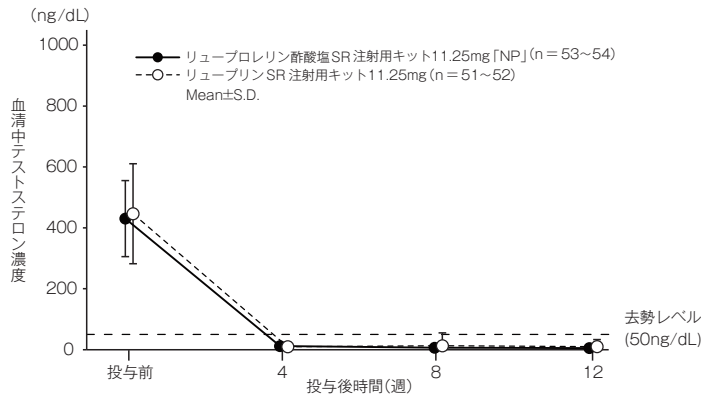
投与 4 週後から 12 週後に血清中テストステロン濃度が去勢レベル（50ng/dL）以下となった被験者の割合

	n	血清中テストステロン濃度が去勢レベル（50ng/dL）以下となった被験者の割合	割合の差（両側 95%信頼区間）
リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」	54	100.0%（54/54 例）	3.8% （-3.4, 13.0）
リュープリン SR 注射用キット 11.25mg	52	96.2%（50/52 例）	

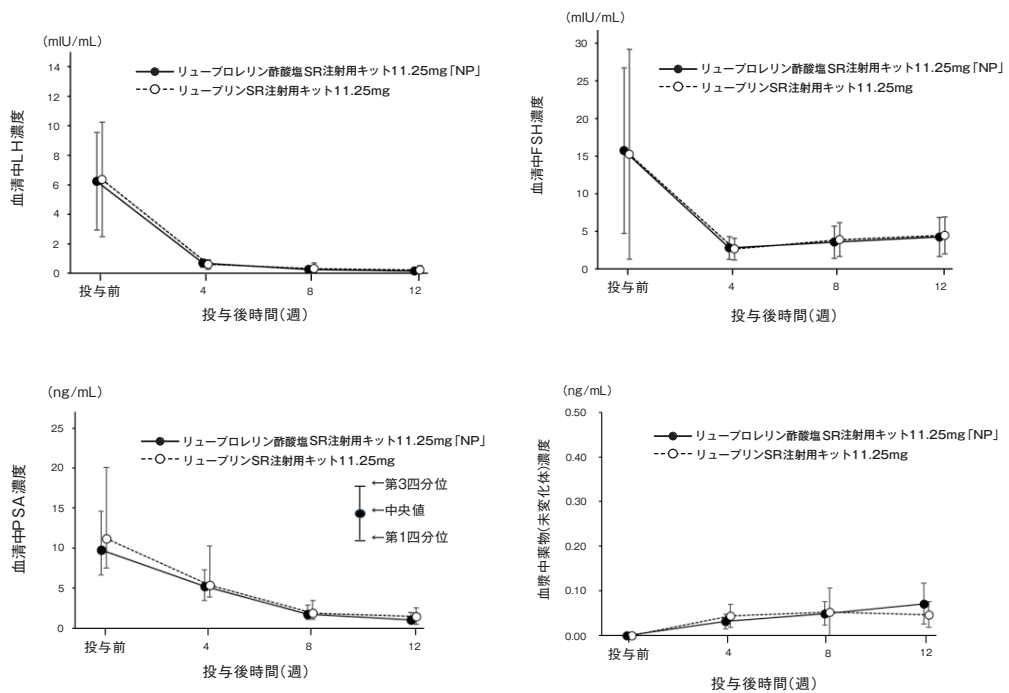
副作用発現頻度は、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」投与群で 40.7%（22/54 例）であった。主な副作用は、ほてり 18.5%（10/54 例）であった¹⁶⁾。

副次的評価項目

血清中テストステロン濃度は、両投与群ともに投与4週後に去勢レベル（50ng/dL）以下に達し、その後、投与12週後まで維持した。血清中LH及びFSH濃度は、両投与群ともに投与4週後に低下を示し、その後、投与12週後まで低下した状態を維持した。PSA濃度は両投与群ともに投与4週後に低下を示し、投与12週後まで低下し続けた。血漿中薬物（未変化体）濃度については、リュープロレリン酢酸塩SR注射用キット11.25mg「NP」投与群の方がリュープロリンSR注射用キット11.25mg投与群に比べて投与12週後に高くなる傾向にあった。



血清中テストステロン濃度の推移



血清中LH、FSH及びPSA濃度ならびに血漿中薬物（未変化体）濃度の推移

（リュープロレリン酢酸塩SR注射用キット11.25mg「NP」：n=53~54、

リュープロリンSR注射用キット11.25mg：n=51~52、平均値±標準偏差（PSA除く）

〈閉経前乳癌〉

主要評価項目

閉経前乳癌術後患者（ホルモン療法未治療）を対象とした並行群間比較試験において、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 又はリュープリン SR 注射用キット 11.25mg を、リュープロレリン酢酸塩として 11.25mg 単回皮下投与（タモキシフェンクエン酸塩 20mg/日を併用投与）した。投与 4 週後から 12 週後に血清中エストラジオール濃度が閉経期レベル（30pg/mL）以下となった被験者の割合は以下のとおりであった。投与群間の割合の差の 95%信頼区間の下側信頼限界は、非劣性マージンとした-15%を上回った。

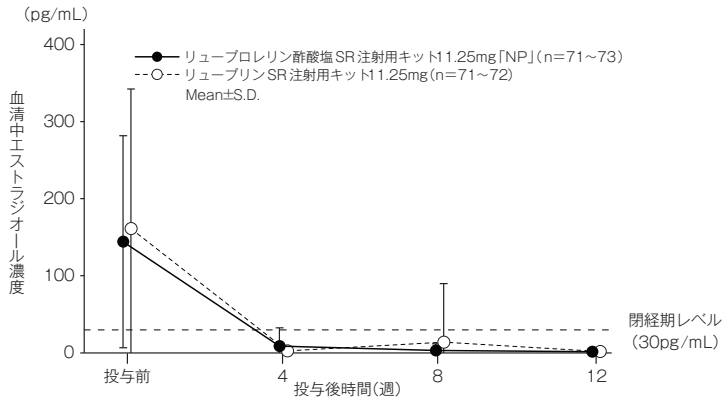
投与 4 週後から 12 週後に血清中エストラジオール濃度が閉経期レベル（30pg/mL）以下となった被験者の割合

	n	血清中エストラジオール濃度が閉経期レベル（30pg/mL）以下となった被験者の割合	割合の差 （両側 95%信頼区間）
リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」	73	93.2%（68/73 例）	-2.7% （-11.3, 5.7）
リュープリン SR 注射用キット 11.25mg	72	95.8%（69/72 例）	

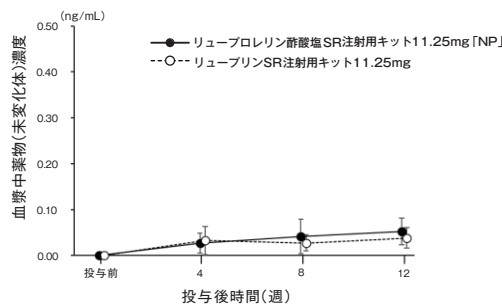
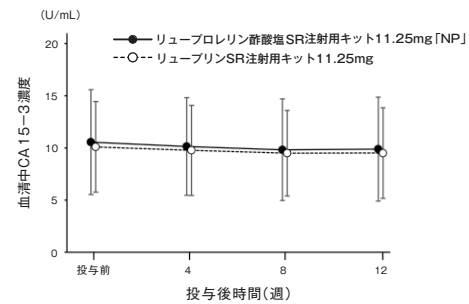
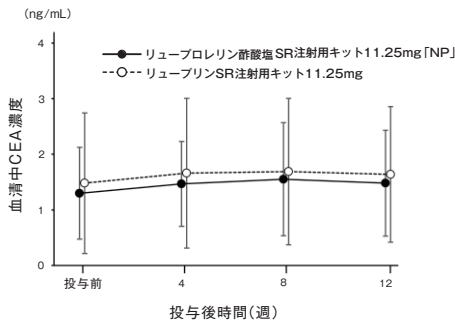
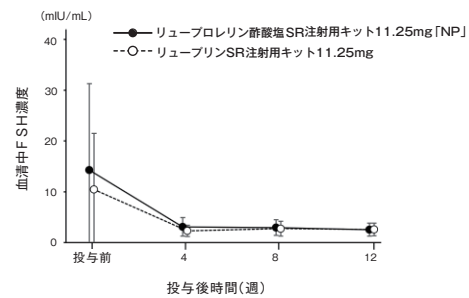
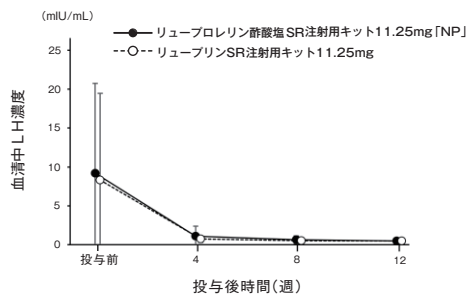
副作用発現頻度は、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 投与群で 61.6%（45/73 例）であった。主な副作用は、ほてり 38.4%（28/73 例）、倦怠感 6.8%（5/73 例）、注射部位疼痛 6.8%（5/73 例）であった¹⁷⁾。

副次的評価項目

血清中エストラジオール濃度は、両投与群ともに投与 4 週後に閉経期レベル（30pg/mL）以下に達し、その後、投与 12 週後まで維持した。血清中 LH、FSH、CEA 及び CA15-3 濃度は両群とも同様に推移した。血漿中薬物（未変化体）濃度については、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 投与群の方がリュープリン SR 注射用キット 11.25mg 投与群に比べて投与後 8 週及び投与 12 週後に高くなる傾向にあった。月経状況に関する評価でも、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 投与群とリュープリン SR 注射用キット 11.25mg 投与群は同様の結果であった。



血清中エストラジオール濃度の推移



血清中 LH、FSH、CEA 及び CA15-3 濃度ならびに血漿中薬物（未変化体）濃度の推移
 (リスペロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」: n=71~73、
 リスペロレリン SR 注射用キット 11.25mg : n=71~72、平均値±標準偏差)

月経状況の頻度集計

評価時点	リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用 キット 11.25mg 「NP」			リュープリン SR 注射用キット 11.25mg		
	n	月経あり	月経なし	n	月経あり	月経なし
投与前	73	66 (90.4)	7 (9.6)	72	67 (93.1)	5 (6.9)
4 週	71	48 (67.6)	23 (32.4)	72	55 (76.4)	17 (23.6)
8 週	72	3 (4.2)	69 (95.8)	72	1 (1.4)	71 (98.6)
12 週	71	2 (2.8)	69 (97.2)	71	1 (1.4)	70 (98.6)

n 及び数字は被験者数、括弧内は被験者割合 (%)

(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

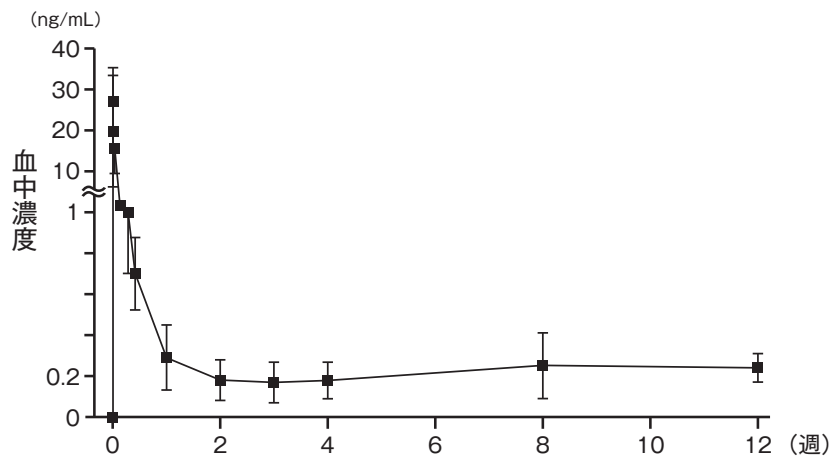
(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

〈前立腺癌〉

前立腺癌患者（未治療例）に、リュープロレリン酢酸塩として 11.25mg を単回皮下投与した場合の血中濃度〔代謝物 M-I（Tyr-D-Leu-Leu-Arg-Pro-NHC₂H₅）を含む〕は以下のとおりであった¹⁸⁾。



平均値（標準偏差）、n=10

血中濃度推移（代謝物 M-I を含む）

16.1.2 反復投与

〈前立腺癌〉

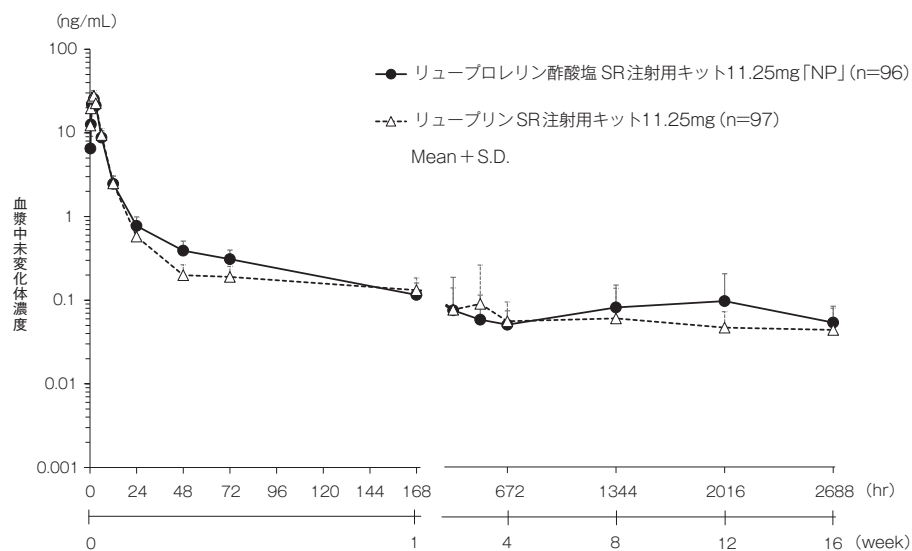
前立腺癌既治療患者（リュープロレリン酢酸塩注射用 3.75mg の投与により抗腫瘍効果が安定して得られている患者）51 例を対象に、リュープロレリン酢酸塩として 11.25mg を 12 週ごとに 2 回皮下投与した時の血中濃度（代謝物 M-I を含む）は、投与 24 週後までほぼ 0.2~0.3ng/mL で推移した。血中濃度の推移からみて蓄積性はないと考えられる¹⁹⁾。

〈閉経前乳癌〉

閉経前乳癌患者（術後患者）に、リュープロレリン酢酸塩として 11.25mg を 12 週ごとに 2 回皮下投与（タモキシフェンクエン酸塩を併用投与）した時の血中濃度（代謝物 M-I を含む）は、定常状態に達した投与 16 週後以降、投与 24 週後までほぼ 0.1~0.2ng/mL で推移した⁸⁾。

生物学的同等性試験²⁰⁾

閉経後健康成人女性を対象とした並行群間比較試験において、リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」又はリュープリン SR 注射用キット 11.25mg を、リュープロレリン酢酸塩として 11.25mg 絶食下单回皮下投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータについて 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、主要評価項目である $AUC_{0\rightarrow 16w}$ 及び C_{max} は $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であった。



	薬物動態パラメータ			
	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0\rightarrow 16w}$ (ng·hr/mL)	$AUC_{1\rightarrow 12w}$ (ng·hr/mL)	T_{max} (hr)
リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 ^{注1)}	25.969 ±4.743	389.653 ±113.957	139.730 ±68.217	1.88 ±0.39
リュープリン SR 注射用キット 11.25mg ^{注2)}	28.614 ±4.069	349.059 ±92.022	117.732 ±71.800	1.66 ±0.48

(Mean±S.D.、注1) n=96、注2) n=97)

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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) 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

〈参考〉

「VIII. 6. (6) 授乳婦」の項参照。

(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) 代謝に關与する酵素（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 本剤の成分又は合成 LH-RH、LH-RH 誘導体に対して、過敏症の既往歴のある患者

2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性[9.5 参照]

2.3 授乳中の患者[9.6 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V.2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V.4. 用法及び用量に関連する注意」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

〈効能共通〉

8.1 本剤は内分泌療法剤であり、がん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、本剤による治療が適切と判断される患者についてのみ使用すること。

8.2 本剤は12週間持続性の製剤であり、徐放性の薬剤が注射部位に長くとどまり、硬結等の注射部位反応が発現することがあるので、注射部位を毎回変更し、注射部位をもまないように患者に説明するなど十分注意して投与すること。[14.2.2 参照]

8.3 本剤は徐放性製剤であるので、最終投与後も薬効持続期間中は患者の状態を観察すること。

8.4 アナフィラキシーがあらわれることがあるので、問診を十分に行うこと。[11.1.2 参照]

〈前立腺癌〉

8.5 初回投与初期に、高活性 LH-RH 誘導体としての下垂体-性腺系刺激作用による血清テストステロン濃度の上昇に伴って骨疼痛の一過性増悪がみられることがある。また、尿路閉塞あるいは脊髄圧迫のみられるおそれがあるので慎重に投与し、投与開始1ヵ月間は十分観察を行うこと。[11.1.8 参照]

〈閉経前乳癌〉

8.6 初回投与初期に、高活性 LH-RH 誘導体としての下垂体-性腺系刺激作用による血清エストロゲン濃度の上昇に伴って骨疼痛の一過性増悪等がみられることがある。

8.7 本剤で抗腫瘍効果が得られず進行を認めた場合は、投与を中止すること。

8.8 エストロゲン低下作用に基づく骨塩量の低下がみられることがあるので、長期にわたり投与する場合には、可能な限り骨塩量の検査を行い慎重に投与すること。

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

〈前立腺癌〉

9.1.1 脊髄圧迫又は尿路閉塞による腎障害を既に呈している患者又は新たに発生するおそれのある患者

初回投与初期の血清テストステロン濃度の上昇に伴い、原疾患の症状が悪化する可能性がある。

〈閉経前乳癌〉

9.1.2 粘膜下筋腫のある患者

出血症状が増悪することがある。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

9.4 生殖能を有する者

治療に際しては妊娠していないことを確認し、治療期間中は非ホルモン性の避妊をさせること。[9.5 参照]

(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。LH-RH 誘導体による流産の報告があり、本剤の動物試験で胎児死亡の増加及び胎児体重の低値（ラット、ウサギ）²¹⁾並びに骨格異常の増加傾向（ウサギ）²¹⁾がみられている。[2.2、9.4 参照]

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

投与しないこと。ラットで乳汁への移行がみられている。[2.3 参照]

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

設定されていない

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

設定されていない

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

<効能共通>

11.1.1 間質性肺炎 (0.1%未満)

発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、患者の状態を十分に観察し、異常が認められた場合には、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

11.1.2 アナフィラキシー (0.1%未満)

[8.4 参照]

11.1.3 肝機能障害、黄疸 (いずれも頻度不明)

AST、ALT 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。

11.1.4 糖尿病の発症又は増悪 (頻度不明)

11.1.5 下垂体卒中 (頻度不明)

下垂体卒中が下垂体腺腫患者で報告されているので、初回投与直後に頭痛、視力・視野障害等があらわれた場合には、検査のうえ外科的治療等の適切な処置を行うこと。

11.1.6 心筋梗塞、脳梗塞、静脈血栓症、肺塞栓症等の血栓塞栓症 (頻度不明)

<前立腺癌>

11.1.7 うつ状態 (0.1%未満)

11.1.8 骨疼痛の一過性増悪、尿路閉塞あるいは脊髄圧迫 (5%以上)

下垂体-性腺系刺激作用による血清テストステロン濃度の上昇に伴って骨疼痛の一過性増悪、尿路閉塞あるいは脊髄圧迫がみられることがある。[8.5 参照]

11.1.9 心不全 (0.1~5%未満)

<閉経前乳癌>

11.1.10 更年期障害様のうつ状態 (0.1~5%未満)

エストロゲン低下作用に基づく更年期障害様のうつ状態があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用				
〈前立腺癌〉				
	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
肝臓	LDH 上昇	黄疸、AST、ALT、 γ -GTP、AL-P の上昇		
内分泌系	ほてり、熱感	頭痛、不眠、顔面潮紅、めまい、発汗、性欲減退、勃起障害、女性化乳房、睾丸萎縮、会陰部不快感		
筋・骨格系		関節痛、骨疼痛、肩・腰・四肢等の疼痛、歩行困難、手指等のこわばり	筋肉痛、骨塩量の低下	
皮膚		皮膚炎、頭部発毛		
泌尿器系		頻尿、血尿、BUN の上昇		
循環器		心電図異常、心胸比増大		
血液		貧血、血小板減少		
消化器		悪心、嘔吐、食欲不振、便秘	下痢	
過敏症		発疹、そう痒		
投与部位	硬結	疼痛、発赤		膿瘍、腫脹、潰瘍、そう痒、肉芽腫、腫瘤、熱感、壊死等の注射部位反応
その他		浮腫、胸部圧迫感、悪寒、倦怠感、口唇・四肢のしびれ、体重増加、知覚異常、難聴、耳鳴、発熱、総コレステロール上昇、トリグリセライド上昇、尿酸上昇、高カリウム血症、血糖値上昇	脱力感	痙攣

〈閉経前乳癌〉

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
低エストロゲン症状	ほてり、熱感、のぼせ、肩こり、頭痛、不眠、めまい、発汗	性欲減退、冷感、視覚障害、情緒不安定		
女性生殖器		不正出血、膣乾燥、性交痛、膣炎、帯下増加、卵巣過剰刺激症状、乳房の疼痛・緊満感・萎縮		
筋・骨格系	関節痛、骨疼痛等の疼痛	手指等のこわばり、腰痛、筋肉痛、筋痙攣、骨塩量の低下、血清リン上昇、高カルシウム血症		
皮膚		ざ瘡、皮膚乾燥、脱毛、多毛、爪の異常		
精神神経系		眠気、いらいら感、記憶力低下、注意力低下、知覚異常		
過敏症		発疹、そう痒		
肝臓		AST、ALT、AL-P、LDH、 γ -GTP、ビリルビンの上昇	黄疸	
消化器		悪心、嘔吐、食欲不振、腹痛、腹部膨満感、下痢、便秘、口内炎、口渇		
循環器		心悸亢進、血圧上昇		
血液		赤血球増多、貧血、白血球減少、血小板減少、部分トロンボプラスチン時間延長		
泌尿器系		頻尿、排尿困難、BUNの上昇		

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
投与部位	硬結	疼痛、発赤		膿瘍、腫脹、潰瘍、そう痒、肉芽腫、腫瘤、熱感、壊死等の注射部位反応
その他		疲労、倦怠感、脱力感、口唇・四肢のしびれ、手根管症候群、耳鳴、難聴、胸部不快感、浮腫、体重増加、下肢痛、息苦しさ、発熱、総コレステロール上昇、LDL コレステロール上昇、トリグリセライド上昇、高カリウム血症	体重減少、味覚異常、甲状腺機能異常	痙攣

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

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

14.1.1 用時調製し、懸濁後は直ちに使用すること。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 皮下注射のみに使用すること。静脈注射により血栓症を誘発するおそれがある。

14.2.2 皮下注射にあたっては下記の点に注意すること。[8.2 参照]

(1) 注射部位は上腕部、腹部、臀部の皮下とすること。

(2) 注射部位は毎回変更し、同一部位への反復注射は行わないこと。

(3) 注射針が血管内に入っていないことを確認すること。

(4) 注射部位をもまないように患者に指示すること。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

15. その他の注意

15.2 非臨床試験に基づく情報

ラットにリュープロレリン酢酸塩として4週間持続の徐放性製剤0.8、3.6及び16mg/kg/4週を1年間、並びにリュープロレリン酢酸塩水溶液注射剤0.6、1.5及び4mg/kg/日を2年間それぞれ皮下投与した試験で、良性下垂体腺腫が認められたとの報告がある²²⁾。

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」の項参照。

(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

〈参考〉

「VIII. 12. (2)非臨床試験に基づく情報」の項参照。

(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

〈参考〉

「VIII. 6. (5)妊婦」の項参照。

(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：リュープロレリン酢酸塩 SR 注射用キット 11.25mg 「NP」 劇薬、処方箋医薬品^{注)}

有効成分：日本薬局方 リュープロレリン酢酸塩 劇薬

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 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

該当しない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド : あり

くすりのしおり : なし

その他の患者向け資材：○リュープロレリン酢酸塩「NP」での前立腺がん治療を受けられる患者さんへ

○リュープロレリン酢酸塩「NP」の治療を受ける患者さんへ（乳がん編）

○リュープロレリン酢酸塩「NP」治療日カレンダー

○リュープロレリン酢酸塩注射用キット「NP」/SR注射用キット「NP」治療記録

○リュープロレリン酢酸塩注射用キット「NP」/SR注射用キット「NP」次回治療日お知らせメモ

「XⅢ.2.その他の関連資料」の項参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：リュープリン注射用キット 1.88mg、同キット 3.75mg、リュープリン SR 注射用キット 11.25mg（武田薬品工業） 他

同 効 薬：LH-RH (GnRH) アゴニスト（ゴセレリン酢酸塩、プセレリン酢酸塩、酢酸ナファレリン 等）

7. 国際誕生年月日

該当しない

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

製造販売承認年月日：2025年8月15日

承認番号：30700AMX00191000

薬価基準収載年月日：2025年12月5日

販売開始年月日：2025年12月5日

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(9桁)番号	レセプト電算処理 システム用コード
リュープロレリン 酢酸塩 SR 注射用 キット 11.25mg 「NP」	2499407G3049	2499407G3049	130011601	623001101

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十八改正 日本薬局方 解説書 (廣川書店) C-6160(2021)
- 2) 日本薬剤師研修センター編：日本薬局方 医薬品情報 2021 (じほう) 837(2021)
- 3) ニプロ(株)社内資料：加速安定性試験
- 4) ニプロ(株)社内資料：長期保存試験
- 5) ニプロ(株)社内資料：光安定性試験
- 6) ニプロ(株)社内資料：懸濁後の安定性試験
- 7) 国内における臨床試験 (リュープリン SR 注射用キット：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ト. 1. 1) (L20250040)
- 8) 臨床試験の試験成績に関する資料 (リュープリン SR 注射用キット：2005 年 8 月 18 日承認、審査報告書) (L20230820)
- 9) 須藤勝一, 他. 薬理と治療. 1990 ; 18(Suppl. 3) : 515-520. (L20220686)
- 10) 前多敬一郎, 他. 薬理と治療. 1990 ; 18 : 2615-2629. (L20220687)
- 11) 山崎巖, 他. 武田研究所報. 1977 ; 36 : 64-70. (L20220688)
- 12) 須藤勝一, 他. 薬理と治療. 1990 ; 18(Suppl. 3) : 521-528. (L20220689)
- 13) 薬理試験の概要文のまとめ (リュープリン PRO 注射用キット：2015 年 9 月 28 日承認、CTD2. 6. 2. 1) (L20230821)
- 14) ホルモン動態 (リュープリン SR 注射用キット：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ト. 3. (1)) (L20250041)
- 15) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験 (薬力学的試験) 〈前立腺癌〉①
- 16) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験 (薬力学的試験) 〈前立腺癌〉②
- 17) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験 (薬力学的試験) 〈閉経前乳癌〉
- 18) 単回投与時の前立腺癌患者における検討 (リュープリン SR 注射用キット：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ. 2. 1、略号一覧表) (L20250038)
- 19) 反復投与時の前立腺癌患者における検討 (リュープリン SR 注射用キット：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ. 2. 2) (L20250039)
- 20) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験
- 21) 大島洋次郎, 他. 薬理と治療. 1990 ; 18(Suppl. 3) : 589-607, 609-623, 625-631, 633-639. (L20230818)
- 22) 茶谷文雄, 他. 薬理と治療. 1990 ; 18(Suppl. 3) : 575-588. (L20220665)

2. その他の参考文献

該当資料なし

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

妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリア分類とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。LH-RH 誘導体による流産の報告があり、本剤の動物試験で胎児死亡の増加及び胎児体重の低値（ラット、ウサギ）²¹⁾並びに骨格異常の増加傾向（ウサギ）²¹⁾がみられている。[2.2、9.4 参照]

9.6 授乳婦

投与しないこと。ラットで乳汁への移行がみられている。[2.3 参照]

	分類
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	D*

* : Prescribing medicines in pregnancy database (Australian Government)

<<https://www.tga.gov.au/australian-categorisation-system-prescribing-medicines-pregnancy>> (2025年12月アクセス)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類：

D: Drugs which have caused, are suspected to have caused or may be expected to cause, an increased incidence of human fetal malformations or irreversible damage. These drugs may also have adverse pharmacological effects. Accompanying texts should be consulted for further details.

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

(1) 粉碎

該当しない

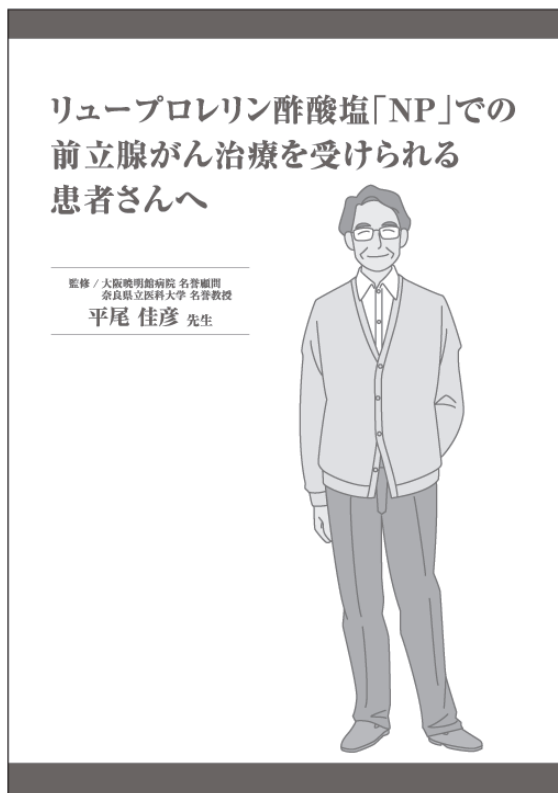
(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

患者向け資料

- リュープロレリン酢酸塩「NP」での前立腺がん治療を受けられる患者さんへ
- リュープロレリン酢酸塩「NP」の治療を受ける患者さんへ（乳がん編）



○リュープロレリン酢酸塩「NP」治療日カレンダー

2026年リュープロレリン酢酸塩「NP」治療日カレンダー

様

病院名

次の来院の際に、このカレンダーを必ずご持参ください
祝日については法律改正等で変更になる場合がありますのでご注意ください。

2026年1月 January

日	月	火	水	木	金	土
				1	2	3
4	5	6	7	8	9	10
11	12	13	14	15	16	17
18	19	20	21	22	23	24
25	26	27	28	29	30	31

MEMO

2026年2月 February

日	月	火	水	木	金	土
1	2	3	4	5	6	7
8	9	10	11	12	13	14
15	16	17	18	19	20	21
22	23	24	25	26	27	28

MEMO

○リュープロレリン酢酸塩注射用キット「NP」/
SR注射用キット「NP」治療記録

リュープロレリン酢酸塩
注射用キット「NP」
SR注射用キット「NP」


治療記録

No. _____

年 月 日 ~ 年 月 日

お名前

○リュープロレリン酢酸塩注射用キット「NP」/
SR注射用キット「NP」次回治療日お知らせ
メモ

 **NIPRO**

リュープロレリン酢酸塩
注射用キット「NP」
SR注射用キット「NP」

次回治療日お知らせメモ

1.88mg(4週間製剤)

3.75mg(4週間製剤)

SR11.25mg(12週間製剤)

2025年12月作成(TS)
【審2509251814】

【MEMO】

ニフ.オ株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号