

## 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2013に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤

# オキサトミド錠30mg「EMEC」

## Oxatomide tab.30mg「EMEC」

&lt;オキサトミド錠&gt;

剤形	素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中 オキサトミド 30mg 含有
一般名	和名：オキサトミド (JAN) 洋名：Oxatomide (JAN、INN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2008年3月6日 薬価基準収載年月日：2008年6月20日 発売年月日：2000年7月25日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売会社：サンノーバ株式会社 発売会社：エルメッド株式会社 販売会社：日医工株式会社
医薬情報担当者 の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.nichiiko.co.jp/">http://www.nichiiko.co.jp/</a>

本IFは2019年4月改訂の添付文書（第10版）の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

## 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、医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 IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）<sup>注1）</sup> から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 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<sup>注2)</sup>・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、一色刷りとする。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「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）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「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 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 2013」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

「IF 記載要領 2013」においては、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ある。

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<sup>注1)</sup>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に留意すべきである。

### 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<sup>注2)</sup>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、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法<sup>注2)</sup>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。

(2013 年 4 月改訂)

注 1) 現 (独) 医薬品医療機器総合機構ホームページ (<http://www.pmda.go.jp/>)

注 2) 現 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

# 目 次

I. 概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	
1. 販売名	2
(1) 和名	2
(2) 洋名	2
(3) 名称の由来	2
2. 一般名	2
(1) 和名 (命名法)	2
(2) 洋名 (命名法)	2
(3) ステム (stem)	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名 (命名法)	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
(1) 外観・性状	3
(2) 溶解性	3
(3) 吸湿性	3
(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点	3
(5) 酸塩基解離定数	3
(6) 分配係数	3
(7) その他の主な示性値	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	4
(1) 剤形の区別、外観及び性状	4
(2) 製剤の物性	4
(3) 識別コード	4
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等	4
2. 製剤の組成	4
(1) 有効成分 (活性成分) の含量	4
(2) 添加物	4
(3) その他	4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4
4. 製剤の各種条件下における安定性	5
5. 調製法及び溶解後の安定性	5
6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)	5
7. 溶出性	6
(1) 公的溶出規格への適合性	6
(2) 本剤と標準製剤の溶出挙動	6
8. 生物学的試験法	7
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8
10. 製剤中の有効成分の定量法	8
11. 力価	8
12. 混入する可能性のある夾雑物	8
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8
14. その他	8
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9
3. 臨床成績	9
(1) 臨床データパッケージ	9
(2) 臨床効果	9
(3) 臨床薬理試験	9
(4) 探索的試験	9
(5) 検証的試験	9
(6) 治療的使用	9
VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10
2. 薬理作用	10
(1) 作用部位・作用機序	10
(2) 薬効を裏付ける試験成績	10
(3) 作用発現時間・持続時間	10
VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	11
(1) 治療上有効な血中濃度	11
(2) 最高血中濃度到達時間	11
(3) 臨床試験で確認された血中濃度	11
(4) 中毒域	11
(5) 食事・併用薬の影響	11
(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	11
2. 薬物速度論的パラメータ	11
(1) 解析方法	11
(2) 吸収速度定数	11
(3) バイオアベイラビリティ	12
(4) 消失速度定数	12
(5) クリアランス	12
(6) 分布容積	12
(7) 血漿蛋白結合率	12
3. 吸収	12
4. 分布	12
(1) 血液-脳関門通過性	12
(2) 血液-胎盤関門通過性	12
(3) 乳汁への移行性	12
(4) 髄液への移行性	12

(5) その他の組織への移行性	12
5. 代謝	12
(1) 代謝部位及び代謝経路	12
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	13
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	13
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	13
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	13
6. 排泄	13
(1) 排泄部位及び経路	13
(2) 排泄率	13
(3) 排泄速度	13
7. トランスポーターに関する情報	13
8. 透析等による除去率	13

## 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	14
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	14
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
5. 慎重投与内容とその理由	14
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14
7. 相互作用	14
(1) 併用禁忌とその理由	14
(2) 併用注意とその理由	15
8. 副作用	15
(1) 副作用の概要	15
(2) 重大な副作用と初期症状	15
(3) その他の副作用	15
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	15
(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	15
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	16
9. 高齢者への投与	16
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
11. 小児等への投与	16
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
13. 過量投与	16
14. 適用上の注意	16
15. その他の注意	17
16. その他	17

## IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	18
(1) 薬効薬理試験 (「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)	18
(2) 副次的薬理試験	18
(3) 安全性薬理試験	18
(4) その他の薬理試験	18
2. 毒性試験	18
(1) 単回投与毒性試験	18

(2) 反復投与毒性試験	18
(3) 生殖発生毒性試験	18
(4) その他の特殊毒性	18

## X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	19
2. 有効期間又は使用期限	19
3. 貯法・保存条件	19
4. 薬剤取扱い上の注意点	19
(1) 薬局での取扱い上の留意点について	19
(2) 薬剤交付時の取扱いについて (患者等に留意すべき必須事項等)	19
(3) 調剤時の留意点について	19
5. 承認条件等	19
6. 包装	19
7. 容器の材質	19
8. 同一成分・同効薬	19
9. 国際誕生年月日	20
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	20
11. 薬価基準収載年月日	20
12. 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	20
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
14. 再審査期間	20
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	20
16. 各種コード	20
17. 保険給付上の注意	20

## XI. 文献

1. 引用文献	21
2. その他の参考文献	21

## XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	22
2. 海外における臨床支援情報	22

## XIII. 備考

その他の関連資料	23
----------	----

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

オキサトミドは、ベルギーにて開発された抗アレルギー作用をもつ benzimidazolone 系化合物であり、本邦では 1987 年に上市された。

サンノーバ株式会社は、オキサトミド錠「EMEC」を後発医薬品として、薬審第 718 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験及び生物学的同等性試験を実施し、2000 年 2 月に承認を得て、2000 年 7 月にエルメッド エーザイ株式会社より発売に至った。

本剤は、医薬品の販売名等に起因した医療事故を防止するための諸通知\*に基づき、2008 年 3 月に新たな販売名『オキサトミド錠 30mg「EMEC」』として承認され、2008 年 6 月発売に至った。

2019 年 4 月 1 日にエルメッド エーザイ株式会社からエルメッド株式会社に社名変更され、日医工株式会社が販売することとなった。

\*2004 年 6 月 2 日 薬食発第 0602009 号「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について」

2005 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

#### (1) 治療学的特性

オキサトミドは、アレルギー反応によって誘発される細胞内カルシウム濃度の上昇を抑制する作用等で化学伝達物質遊離を抑制し、加えて化学伝達物質等に拮抗することで、各種アレルギー性疾患の症状を抑えられている。

#### (2) 製剤学的特性

本剤は、白色の割線入りの素錠である。

#### (3) 重大な副作用

肝炎、肝機能障害、黄疸、ショック、アナフィラキシー、中毒性表皮壊死融解症 (Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson 症候群)、血小板減少が報告されている (頻度不明)。

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

(1) 和名

オキサトミド錠 30mg「EMEC」

(2) 洋名

Oxatomide tab. 30mg「EMEC」

(3) 名称の由来

成分名を名称の一部とした。

### 2. 一般名

(1) 和名（命名法）

オキサトミド（JAN）

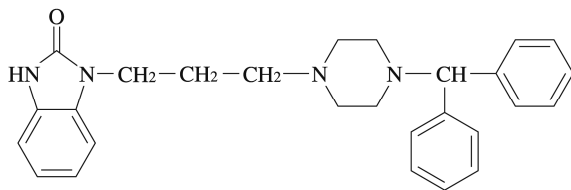
(2) 洋名（命名法）

Oxatomide（JAN、INN）

(3) ステム（stem）

不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O

分子量：426.55

### 5. 化学名（命名法）

1-[3-[4-(Diphenylmethyl)-1-piperazinyl]propyl]-2-benzimidazol-2(3H)-one

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

### 7. CAS 登録番号

60607-34-3

### 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～微黄白色の結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

溶 媒	日本薬局方の溶解度表記
酢酸 (100)	溶けやすい
クロロホルム	溶けやすい
エタノール (95)	やや溶けにくい
ジエチルエーテル	溶けにくい
水	ほとんど溶けない

溶解度 (37℃) : pH1.2 : 6.6mg/mL、pH5.5 : 0.048mg/mL、pH6.8 : 0.0031mg/mL、  
水 : 0.0061mg/mL

(①)

##### (3) 吸湿性

乾燥減量 : 0.5%以下 (1g、減圧、五酸化リン、80℃、4時間)

##### (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点 : 155～161℃

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa<sub>1</sub> : 3.56 (滴定法、ピペラジン環 (4位N))

pKa<sub>2</sub> : 7.20 (滴定法、ピペラジン環 (1位N))

(①)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

強熱残分 : 0.10%以下 (1g)

#### 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

局外規 オキサトミドの確認試験による。

(1) 第3級アミンの確認法

(2) 紫外可視吸光度測定法

(3) 赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

#### 4. 有効成分の定量法

局外規 オキサトミドの定量法による。

電位差滴定法



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	性状・剤形	外形		
		表	裏	側面
オキサトミド錠 30mg 「EMEC」	白色の割線入り の素錠			
		直径 (mm) ・ 質量 (mg) ・ 厚さ (mm) 6.0                      80                      2.6		

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

EE53

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1錠中 オキサトミド 30mg 含有

#### (2) 添加物

カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース

#### (3) その他

該当資料なし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

なし

## IV. 製剤に関する項目

### 4. 製剤の各種条件下における安定性

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃・60%RH、36 ヶ月）の結果、オキサトミド錠 30mg「EMEC」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。 (2)

試験方法	保存条件	包装形態	保存期間	試験項目	試験結果	
					試験開始時	試験終了時
加速試験	40℃・75%RH	・PTP 包装品（ポリプロピレン袋に充てんし、紙箱に入れた状態）	6 ヶ月	性状	白色の割線入りの素錠	白色の割線入りの素錠
				確認試験*	適合	適合
				重量偏差試験	適合	適合
				溶出性 (%)	73.1~101.0	90.8~105.4
			含量 (%)	96.4~101.2	96.5~100.8	
長期保存試験	25℃・60%RH		36 ヶ月	性状	白色の割線入りの素錠	白色の割線入りの素錠
				確認試験*	適合	適合
				溶出性 (%)	76~89	72~76
				含量 (%)	97.1~98.1	96.9~104.2

\* 「IV.-9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

### 5. 調製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

## IV. 製剤に関する項目

### 7. 溶出性

本剤は 2001 年 4 月に品質再評価が終了し、医療用医薬品品質情報集 No.8 に掲載されている。

#### (1) 公的溶出規格への適合性

局外規第三部オキサトミド錠に従い試験するとき、45 分間の溶出率が 70%以上（回転数：50rpm、試験液：pH5.5）であった。

#### (2) 本剤と標準製剤の溶出挙動〔品質再評価における溶出挙動〕

(3)

##### 1) 試験方法

日本薬局方（JP13）一般試験法 溶出試験法第 2 法

##### 2) 試験条件

- ・試験回数：6 ベッセル
- ・装置：パドル法
- ・試験液量：900mL
- ・試験液：pH1.2 日本薬局方 崩壊試験法 第 1 液  
pH5.5 薄めた McIlvaine の緩衝液  
pH6.8 日本薬局方 崩壊試験法 第 2 液  
水 日本薬局方 精製水
- ・回転数：50rpm
- ・判定時点：

試験液	判定時点
pH1.2	15 分、45 分、60 分
pH5.5	5 分、10 分、30 分
pH6.8	5 分、360 分
水	5 分、360 分

##### 3) 判定基準

###### ①pH1.2（標準製剤の平均溶出率が 30 分以内に 85%に達しない）

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

###### ②pH5.5（標準製剤が 15 分～30 分に平均 85%以上溶出する）

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

###### ③pH6.8（標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に 85%に達しない）

標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。

###### ④水（標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に 85%に達しない）

標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。

#### IV. 製剤に関する項目

##### 4) 結果

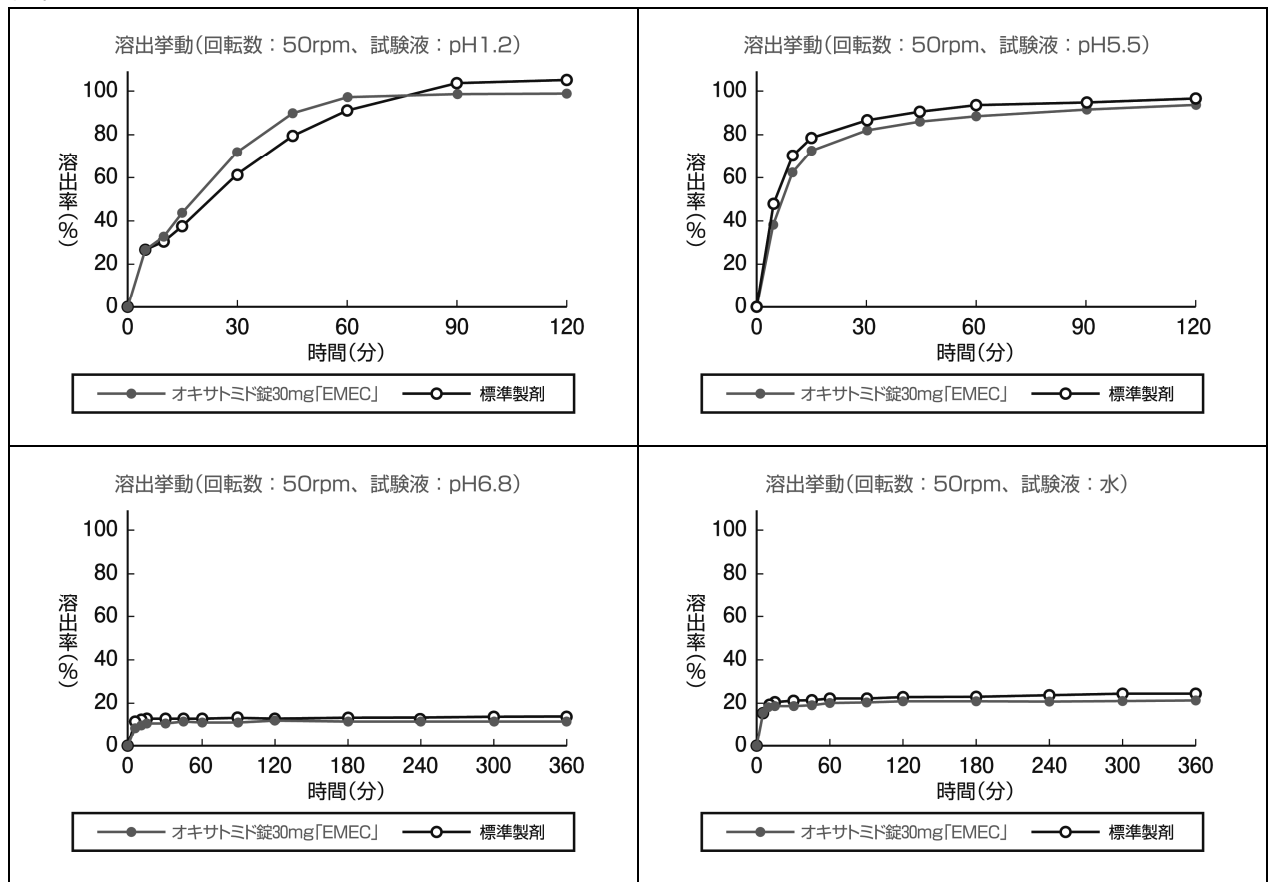


表 オキサトミド錠 30mg「EMEC」の溶出挙動における同等性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

方法	試験条件			平均溶出率 (%)		判定
	回転数	試験液	溶出時間 (判定時点)	試験製剤	標準製剤	
溶出試験法 (パドル法)	50rpm	pH1.2	15分	43.4	37.2	適合
			45分	89.7	79.2	
			60分	96.6	91.1	
		pH5.5	5分	38.3	47.8	適合
			10分	62.3	70.4	
			30分	81.9	86.8	
	pH6.8	5分	8.6	11.4	適合	
		360分	11.8	13.7		
	水	5分	15.6	15.5	適合	
		360分	21.1	24.0		

以上より、試験製剤と標準製剤の溶出挙動は同等と判断された。

##### 8. 生物学的試験法

なし

## IV. 製剤に関する項目

---

### 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 第3級アミンの確認法
- (2) 紫外吸収スペクトル法
- (3) 薄層クロマトグラフィー

### 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

### 11. 力価

該当資料なし

### 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

### 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

### 14. その他

なし

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 効能又は効果

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚掻痒症、湿疹・皮膚炎、痒疹

### 2. 用法及び用量

通常、成人には1回オキサトミドとして30mg（1錠）を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。  
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

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

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）

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

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

アゼラスチン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、ジフェンヒドラミン塩酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、デスロラタジン、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、ビラスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、フマル酸エメダスチン、プロメタジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ホモクロルシクリジン塩酸塩、メキタジン、ルパタジンフマル酸、レボセチリジン塩酸塩、ロラタジン

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

オキサトミドは、アレルギー反応によって誘発される細胞内カルシウム濃度の上昇を抑制する作用等で化学伝達物質遊離を抑制し、加えて化学伝達物質等に拮抗することで、各種アレルギー性疾患の症状を抑えると考えられている。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

<参考>

(4)

##### 細胞内カルシウム制御作用

アレルギー反応によって誘発される細胞内カルシウム濃度の上昇抑制作用、いわゆる細胞内カルシウム制御作用を有する(ラット腹腔肥満細胞)。このカルシウム制御作用により、アレルギー反応性細胞におけるケミカルメディエータの遊離抑制作用を発現すると考えられる。なお、心筋細胞内へのカルシウム流入抑制作用は弱い。

##### ケミカルメディエータの遊離抑制作用

ヒスタミン遊離抑制作用(ラット腹腔肥満細胞、ヒト白血球、アナフィラキシー反応時のラット皮膚)、ロイコトリエンの遊離抑制(ヒト肺、ヒト白血球、ヒト好中球、ヒト好酸球、ラット腹腔肥満細胞)、ロイコトリエンの合成酵素 5-lipoxygenase に対する阻害作用を示す。

##### ケミカルメディエータ拮抗作用

ロイコトリエン、ヒスタミン、セロトニン、アセチルコリン、ブラジキニンに対する拮抗作用(ラット皮膚、モルモットの摘出回腸、摘出気管支)。血小板活性化因子(PAF)によるモルモット気道抵抗上昇に対しても、抑制作用を示す。

##### 実験的アレルギー反応の抑制効果

アレルギー反応モデルの、抗原投与時のモルモット気道収縮反応、抗原投与時のイヌ気管縮小反応、ラット受身皮膚アナフィラキシー反応、モルモット摘出回腸および気管のシュルツ・デール反応等を抑制。

#### (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

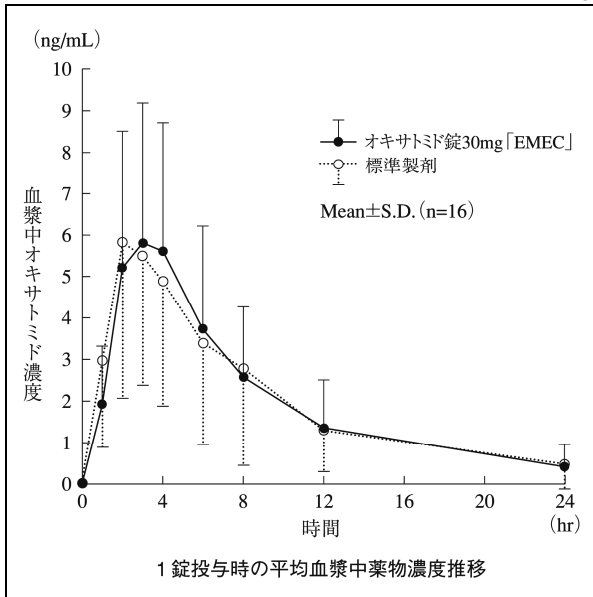
(5)

販売名	対象	投与量	投与方法	最高血漿中濃度到達時間
オキサトミド錠 30mg 「EMEC」	健康成人 男性 16名	1錠 (オキサトミドとして 30mg)	絶食下单回 経口投与	投与後約 2.9 時間

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

「生物学的同等性試験に関する試験基準 (昭和 55 年 5 月 30 日薬審 718 号)」に従って、健康成人男性 16 名にクロスオーバー法にて本剤と標準製剤 (同一成分含有錠剤) を 1 錠 (オキサトミドとして 30mg)、絶食下单回経口投与した。薬物動態パラメータを比較した結果、 $AUC_{0-24hr}$  及び  $C_{max}$  について、本剤と標準製剤間に有意な差は認められず、また試験精度も基準を満足するものであったことから、両製剤は生物学的に同等と判断された。(5)

#### ● 本剤と標準製剤を 1 錠 (オキサトミドとして 30mg) 投与時の平均血漿中濃度推移



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0-24hr}$ (ng·hr/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$T_{max}$ (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
本 剤	49.84±32.53	6.41±3.21	2.9±0.72	5.24±1.66
標準製剤	50.57±30.74	6.76±3.43	2.9±1.57	5.31±1.93

(Mean±S.D., n=16)

\* 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。

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

「VIII.-7. 相互作用」の項参照

#### (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

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし



## VII. 薬物動態に関する項目

---

- (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  
4%ヒト血清アルブミンに対する結合率を平衡透析法により検討した結果、27ng/mL から 2.4µg/mL の 7 段階のオキサトミド濃度で、93.3~98.7%の結合率であった。(6)

### 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  
<参考>  
動物実験(ラット)で口蓋裂、合指症、指骨の形成不全等の催奇形作用が報告されている。[「VIII.-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照]
- (3) 乳汁への移行性  
<参考>  
動物実験(イヌ)で乳汁移行が認められている。[「VIII.-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」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  
<参考>  
ラットに<sup>14</sup>C-オキサトミド 10mg/kg を経口投与後 30 分で、肝臓、腎臓、腸間膜リンパ節、肺、副腎の順で高い分布を示し、投与後 1、2 および 6 時間においても前記組織で高い放射活性が認められたが、24 時間では放射能の残存する組織は少なく、96 時間にはほとんどの組織で検出限界以下。(4)

### 5. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路  
代謝部位：主として肝臓  
代謝経路：ヒトで確認された代謝経路は、piperazine および benzimidazolone の N 位の酸化的脱アルキル化および benzimidazolone の芳香環水酸化である。(6)

## VII. 薬物動態に関する項目

---

- (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  
benzimidazolone の芳香環 6 位が水酸化され生じる代謝物はオキサトミドと同程度の薬理活性を有する（外国人のデータ）。 (6)
- (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  
尿中及び糞中 (4)
- (2) 排泄率  
健常成人に  $^{14}\text{C}$ -オキサトミド 60mg 経口投与時の排泄率は 24 時間までに尿中 36.5%、糞中 50.3%、96 時間までに尿・糞中 94.2%。 (4)
- (3) 排泄速度  
該当資料なし

### 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

### 8. 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

なし

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

#### 【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人  
〔VIII.-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与〕の項参照〕

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

なし

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

なし

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 肝障害又はその既往歴のある患者  
〔肝障害が悪化又は再燃するおそれがある。〕
- (2) 幼児〔VIII.-11. 小児等への投与〕の項参照〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

#### 重要な基本的注意

- (1) 眠気を催すことがあるので、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十分注意すること。
- (2) 本剤は気管支拡張剤並びに全身性ステロイド剤と異なり、既に起こっている喘息発作を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことは患者に十分注意しておく必要がある。
- (3) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (4) 本剤により、末梢血中好酸球が増加することがあるので、このような場合には経過観察を十分に行うこと。
- (5) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (2) 併用注意とその理由

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
アルコール性飲料 中枢神経抑制剤 麻薬性鎮痛剤、 鎮静剤、 催眠剤等	眠気、倦怠感等が強くあらわれるおそれがある。	相加的に作用する。

## 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。以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### 重大な副作用（頻度不明）

- 1) 肝炎、肝機能障害、黄疸 AST (GOT)、ALT (GPT)、 $\gamma$ -GTP、ビリルビン、Al-P、LDH の著しい上昇等を伴う肝炎、肝機能障害、黄疸（初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気・嘔吐等）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。
- 2) ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、全身紅潮、咽頭・喉頭浮腫等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 3) 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）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。
- 4) 血小板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。

### (3) その他の副作用

下記のような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減量・休薬等の適切な処置を行うこと。

なお、太字で記載の副作用については投与を中止すること。また、錐体外路症状が発現した場合には、必要に応じて抗パーキンソン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
錐体外路症状	硬直（口周囲、四肢）、眼球偏位、後屈頸、攣縮、振戦
過 敏 症	発疹、浮腫（顔面、手足等）
内 分 泌	女性化乳房、月経障害、乳房痛
精神神経系	眠気、倦怠感、口渇、頭痛・頭重、めまい・ふらつき・立ちくらみ、しびれ感
泌 尿 器	膀胱炎様症状（頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等）、排尿困難
消 化 器	嘔気・嘔吐、胃部不快感、下痢、便秘、胃痛、腹痛、食欲不振、食欲亢進、にがみ、腹部不快感、口内炎、舌のあれ
循 環 器	動悸
そ の 他	発熱、好酸球増多、ほてり、鼻出血

### (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

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

#### 【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

#### 重大な副作用（頻度不明）

- 2) ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、全身紅潮、咽頭・喉頭浮腫等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

#### その他の副作用

下記のような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減量・休薬等の適切な処置を行うこと。

なお、太字で記載の副作用については投与を中止すること。また、錐体外路症状が発現した場合には、必要に応じて抗パーキンソン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過 敏 症	発疹、浮腫（顔面、手足等）

### 9. 高齢者への投与

本剤は、主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能が低下していることが多いので、慎重に投与すること。

### 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は投与しないこと。  
〔動物実験（ラット）で口蓋裂、合指症、指骨の形成不全等の催奇形作用が報告されている。〕
- (2) 授乳婦に投与する場合には、授乳を中止させること。  
〔動物実験（イヌ）で乳汁移行が認められている。〕

### 11. 小児等への投与

幼児（特に2歳以下）において錐体外路症状が発現するおそれがあるため、過量投与を避けること。

### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与は、アレルギー皮膚内反応を抑制し、アレルギーの確認に支障を来すので、アレルギー皮膚内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。

### 13. 過量投与

頸部硬直等の錐体外路症状、痙攣、意識障害、傾眠、血圧低下、洞性徐脈、縮瞳等が発現した例があるので、過量に服用した場合には、支持・対症療法等適切な処置を行うこと。

### 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）

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

---

### 15. その他の注意

なし

### 16. その他

なし

## 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) 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

製 剤：なし

有効成分：オキサトミド 劇薬

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年間（安定性試験結果に基づく。「IV.-4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

くすりのしおり：有り

「VIII.-6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項及び「VIII.-14. 適用上の注意」の項参照

#### (3) 調剤時の留意点について

なし

### 5. 承認条件等

なし

### 6. 包装

100錠（PTP）

### 7. 容器の材質

PTP シート	ピロー	箱
ポリ塩化ビニル アルミニウム	ポリエチレン ポリプロピレン	紙

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：セルテクト錠 30、ドライシロップ 2%

同 効 薬：アゼラスチン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、ジフェンヒドラミン塩酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、デスロラタジン、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンプモ酸塩、ピラスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、フマル酸エメダスチン、プロメタジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ホモクロルシクリジン塩酸塩、メキタジン、ルパタジンフマル酸、レボセチリジン塩酸塩、ロラタジン



## X. 管理的事項に関する項目

---

### 9. 国際誕生年月日

なし

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
オキサトミド錠 30mg「EMEC」	2008年3月6日	22000AMX00329000

注) 旧販売名：オキサトミド錠「EMEC」 承認年月日：2000年2月18日

### 11. 薬価基準収載年月日

2008年6月20日

### 12. 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

なし

### 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

なし

### 14. 再審査期間

なし

### 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

### 16. 各種コード

販売名	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
オキサトミド錠 30mg「EMEC」	113357802	4490005F1433	620006874

### 17. 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 医療用医薬品 品質情報集 No.8 (薬事日報社) 135 (2001)
- ② 安定性に関する資料 (サンノーバ株式会社 社内資料)
- ③ 溶出性に関する資料 (サンノーバ株式会社 社内資料)
- ④ 日本医薬情報センター編：日本医薬品集 2015
- ⑤ 生物学的同等性に関する資料 (サンノーバ株式会社 社内資料)
- ⑥ 日本薬剤師研修センター編：医薬品服薬指導情報集 [薬効別] 下

### 2. その他の参考文献

日本局方外医薬品規格 2002

## XII. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

本剤は外国で発売されていない（オキサトミド製剤としては、海外で販売されている）。

### 2. 海外における臨床支援情報

なし

## XII. 備考

---

その他の関連資料

なし







製造販売元  **サンノーバ株式会社**  
群馬県太田市世良田町 3038-2

発 売 元  **エルメッド株式会社**  
NICHIIKO 富山市総曲輪1丁目6番21

販 売 元  **日医工株式会社**  
NICHIIKO 富山市総曲輪1丁目6番21