

# 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

## H<sub>2</sub>受容体拮抗剤

日本薬局方 ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル

**ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」**  
**ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」**

### ROXATIDINE ACETATE HYDROCHLORIDE

剤形	硬カプセル剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	徐放カプセル37.5mg：1カプセル中日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩37.5mg含有 徐放カプセル75mg：1カプセル中日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩75mg含有
一般名	和名：ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 洋名：Roxatidine Acetate Hydrochloride
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：2013年12月3日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：2014年6月20日(販売名変更) 発売年月日：2008年11月7日(徐放カプセル37.5mg) 2005年7月8日(徐放カプセル75mg)
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向けホームページ： <a href="https://med.sawai.co.jp">https://med.sawai.co.jp</a>

本IFは2017年11月改訂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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

# IF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、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/>)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・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、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。

(2013年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	24
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	24
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	24
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	24
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	24
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	24
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	24
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	24
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	25
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	26
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	26
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	26
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	26
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	27
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	27
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	27
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	27
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	28
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	28
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	2. 毒性試験	28
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	29
5. 調製法及び溶解後の安定性	8	1. 規制区分	29
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	2. 有効期間又は使用期限	29
7. 溶出性	9	3. 貯法・保存条件	29
8. 生物学的試験法	13	4. 薬剤取扱い上の注意点	29
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	13	5. 承認条件等	29
10. 製剤中の有効成分の定量法	13	6. 包装	29
11. 力価	13	7. 容器の材質	30
12. 混入する可能性のある夾雑物	14	8. 同一成分・同効薬	30
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	14	9. 国際誕生年月日	30
14. その他	14	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	30
V. 治療に関する項目	15	11. 薬価基準収載年月日	30
1. 効能又は効果	15	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	30
2. 用法及び用量	15	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	31
3. 臨床成績	16	14. 再審査期間	31
VI. 薬効薬理に関する項目	17	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	31
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	17	16. 各種コード	31
2. 薬理作用	17	17. 保険給付上の注意	31
VII. 薬物動態に関する項目	18	XI. 文献	32
1. 血中濃度の推移・測定法	18	1. 引用文献	32
2. 薬物速度論的パラメータ	21	2. その他の参考文献	32
3. 吸収	21	XII. 参考資料	33
4. 分布	22	1. 主な外国での発売状況	33
5. 代謝	22	2. 海外における臨床支援情報	33
6. 排泄	22	XIII. 備考	33
7. トランスポーターに関する情報	23	その他の関連資料	33
8. 透析等による除去率	23		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg/徐放カプセル75mg「サワイ」は、日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩を含有するH<sub>2</sub>受容体拮抗剤である。

H<sub>2</sub>受容体拮抗薬は強力な胃酸分泌抑制作用を示し消化器系潰瘍の治療体系に大きい変革をもたらしたが、ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩もその流れに属するものである。<sup>1)</sup>

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、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、承認を得て上市に至った。

	ロキタットカプセル37.5mg (旧販売名)	ロキタットカプセル75mg (旧販売名)
承認申請に際し 準拠した通知名	平成11年4月8日 医薬発第481号	
承認	2008年7月	2005年3月
上市	2008年11月	2005年7月

ロキタットカプセル37.5mg(旧販売名)は、「後発医薬品の必要な規格を揃えること等について」(平成18年3月10日付 医政発第0310001号)に基づき、上市に至った。

2014年6月に「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」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づき、『ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」』及び『ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」』に販売名を変更した。

2015年5月に小児に対する用法・用量が追加承認された。(X. -12. 参照)

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 識別性を考慮し、カプセル本体に成分名及び含量を表示している。
- 2) 徐放性顆粒を充てんしたカプセル剤である。
- 3) 胃粘膜壁細胞のH<sub>2</sub>受容体を選択的に遮断して、持続的な胃酸分泌抑制作用及びペプシン分泌抑制作用等を示す。
- 4) 速やかに吸収され、1日1～2回投与で胃・十二指腸潰瘍、胃炎等に治療効果を示す。
- 5) 重大な副作用として、ショック、再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少、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)、肝機能障害、黄疸、横紋筋融解症が報告されている(頻度不明)。また、他のH<sub>2</sub>受容体拮抗剤で、アナフィラキシー、間質性腎炎、房室ブロック等の心ブロック、不全収縮が報告されている。

## II. 名称に関する項目

---

### II. 名称に関する項目

---

#### 1. 販売名 .....

##### 1) 和名

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」

##### 2) 洋名

ROXATIDINE ACETATE HYDROCHLORIDE

##### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

#### 2. 一般名 .....

##### 1) 和名(命名法)

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩(JAN)

##### 2) 洋名(命名法)

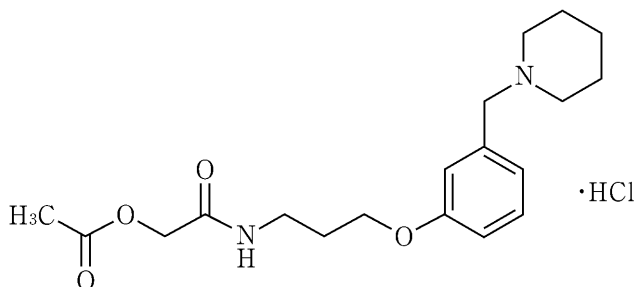
Roxatidine Acetate Hydrochloride(JAN)

Roxatidine(INN)

##### 3) ステム

-tidine : cimetidine系のH<sub>2</sub>受容体拮抗剤

#### 3. 構造式又は示性式 .....



#### 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 : C<sub>19</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> · HCl

分子量 : 384.90

5. 化学名(命名法) .....  
(3-{3-[(Piperidin-1-yl)methyl]phenoxy}propylcarbamoyl)methyl acetate  
monohydrochloride

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....  
別名：塩酸ロキサチジンアセタート

7. CAS登録番号 .....  
93793-83-0 [Roxatidine Acetate Hydrochloride]  
78273-80-0 [Roxatidine]

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

### 1. 物理化学的性質

#### 1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。

#### 2) 溶解性

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

溶媒	本品 1g を溶解するための溶媒量 <sup>1)</sup>
水	1 mL 以下
酢酸(100)	約1.5mL
エタノール(99.5)	約50mL
無水酢酸	約1000mL

溶解度(37°C)<sup>2)</sup> : pH1.2 : 2.20g/mL、pH4.0 : 2.11g/mL、pH6.8 : 2.15g/mL、水 : 2.11g/mL

#### 3) 吸湿性

乾燥減量 : 0.3% 以下 (1g、減圧、酸化リン(V)、4時間)

#### 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点 : 147~151°C (乾燥後)

#### 5) 酸塩基解離定数

pKa = 9.3 (滴定法)<sup>2)</sup>

#### 6) 分配係数

該当資料なし

#### 7) その他の主な示性値

比吸光度  $E_{1\text{cm}}^{1\%}$  (227nm) : 約57.4、 $E_{1\text{cm}}^{1\%}$  (284nm) : 約52.0 [本品のエタノール(99.5)溶液(1 → 10000)]<sup>1)</sup>

pH : 本品1.0gを水20mLに溶かした液のpHは4.0~6.0である。

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

水<sup>2)</sup> : 37°C、24時間で約1%分解する。

液性(pH)<sup>2)</sup> : pH1.2、37°C、3時間で約15%分解する。

pH4.0及びpH6.8、37°C、24時間で、それぞれ約1%及び約8%分解する。



3. 有効成分の確認試験法 .....

日局「ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法 .....

日局「ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩」の定量法に準ずる。(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

品名	剤形	外形			性状
		全長(mm)	重量(mg)	カプセル号数	
ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」	硬カプセル剤	14.2	約122	4	頭部：白色不透明 胴部：白色不透明 内容物：白色の徐放性顆粒
ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」	硬カプセル剤	15.8	約214	3	頭部：白色不透明 胴部：白色不透明 内容物：白色の徐放性顆粒

## 2) 製剤の物性

## ●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」

製剤均一性：日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、45分：10～40%、90分：35～65%、8時間：70%以上)

## ●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」

製剤均一性：日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、60分：20～50%、90分：35～65%、8時間：70%以上)

## 3) 識別コード

該当しない

## 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

## ●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」

1カプセル中に日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩37.5mgを含有する。

## ●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」

1カプセル中に日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩75mgを含有する。

## 2) 添加物

## ●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」

添加物として、エチルセルロース、セタノール、タルク、トウモロコシデンプン、トリアセチン、白糖、ラウリル硫酸Na、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Naを含有する。

## ●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」

添加物として、エチルセルロース、軽質無水ケイ酸、タルク、トウモロコシデンプン、白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Naを含有する。

## 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

該当しない

## 4. 製剤の各種条件下における安定性

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」<sup>3)</sup>

## 1) PTP包装品の安定性(加速試験)

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、紙箱に入れて封を施したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の徐放性顆粒を含む白色の硬カプセル剤であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.5	98.1

※：表示量に対する含有率(%)

## 2) 無包装下の安定性

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)
性 状	白色の徐放性顆粒を含む白色の硬カプセル剤	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.5	98.6	99.6

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」<sup>4)</sup>

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヶ月
性 状	白色の徐放性顆粒を含む白色不透明の硬カプセル剤であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.9	97.0

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

保存条件		イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3 ヶ月)
性 状	外 観	白色不透明の硬カプセル剤	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	内容物	白色顆粒	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験		問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※		100.0	99.6	100.1	99.7	99.7

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

5. 調製法及び溶解後の安定性 .....  
該当しない

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

本剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

＜溶出挙動における同等性及び類似性＞

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」<sup>5)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、5.0、6.8、水、pH6.8 ポリソルベート 80 1.0% (W/V) 添加)、 100rpm (pH6.8)、200rpm (pH6.8)
	回転バスケット法	100rpm (pH6.8)、200rpm (pH6.8)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

パドル法

＜50rpm：pH1.2＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び規定された試験時間 (120分) 付近の3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%の範囲にあった。

＜50rpm：pH5.0＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3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%の範囲にあった。

＜50rpm：pH6.8＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3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%の範囲にあった。

＜50rpm：水＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3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%の範囲にあった。

＜50rpm：pH6.8ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3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%の範囲にあった。

＜100rpm：pH6.8＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3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%の範囲にあった。

＜200rpm：pH6.8＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3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%の範囲にあった。

回転バスケット法

＜100rpm：pH6.8＞

標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3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%の範囲にあった。

＜200rpm：pH6.8＞

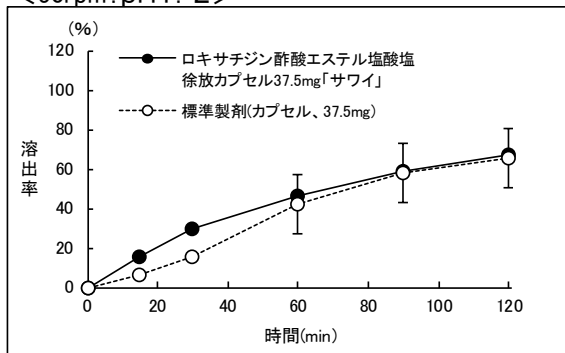
標準製剤の平均溶出率が30% (60分)、50% (90分) 及び80% (240分) 付近の3時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

IV. 製剤に関する項目

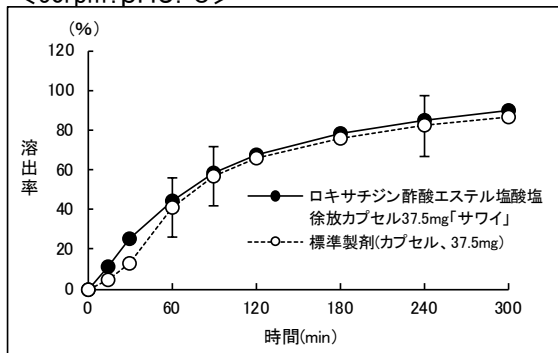
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)  
パドル法

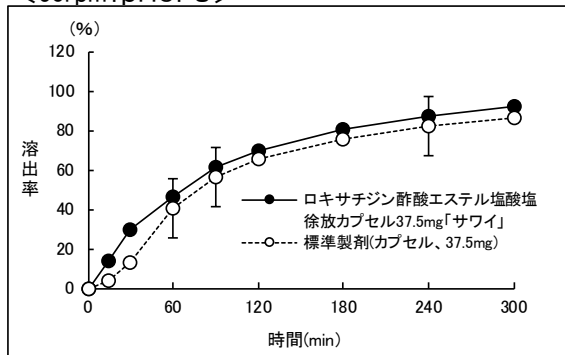
<50rpm:pH1.2>



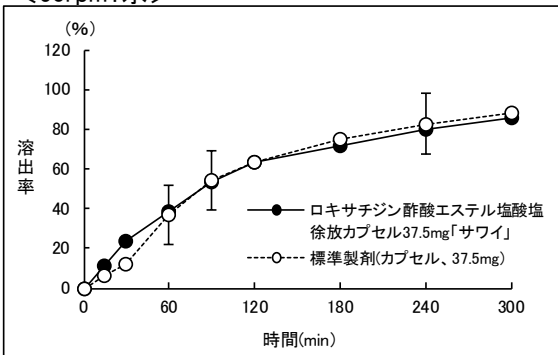
<50rpm:pH5.0>



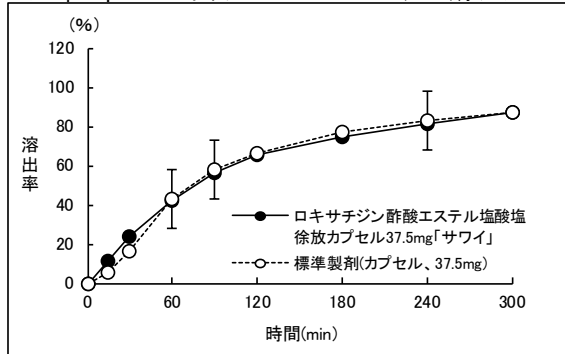
<50rpm:pH6.8>



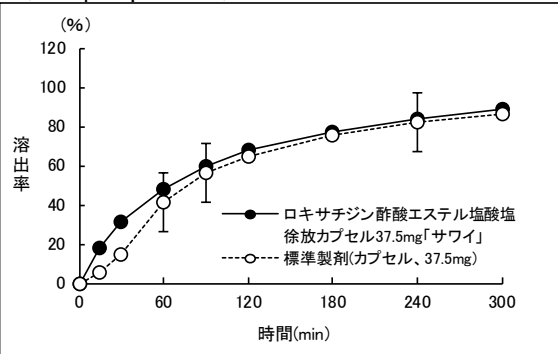
<50rpm:水>



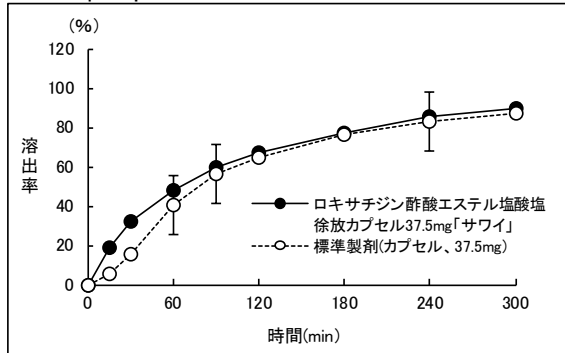
<50rpm:pH6.8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



<100rpm:pH6.8>

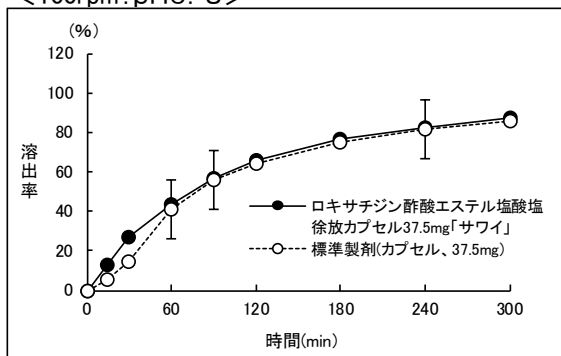


<200rpm:pH6.8>

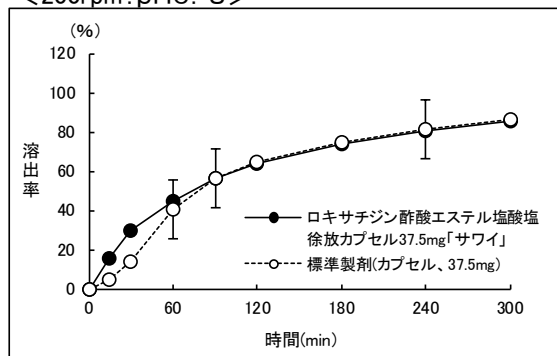


## 回転バスケット法

&lt;100rpm: pH6. 8&gt;



&lt;200rpm: pH6. 8&gt;



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」<sup>6)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、4. 0、6. 8、水、pH6. 8 ポリソルベート 80 1. 0% (W/V) 添加)、 100rpm (pH6. 8)、200rpm (pH6. 8)
	回転バスケット法	100rpm (pH6. 8)、200rpm (pH6. 8)
試験回数	12ベッセル	

## 【結果及び考察】

## パドル法

&lt;50rpm : pH1. 2&gt;

標準製剤の平均溶出率が30% (45分)、50% (90分) 及び規定された試験時間 (120分) 付近の3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%の範囲にあった。

&lt;50rpm : pH4. 0&gt;

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

&lt;50rpm : pH6. 8&gt;

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

&lt;50rpm : 水&gt;

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

&lt;50rpm : pH6. 8ポリソルベート80 1. 0% (W/V) 添加&gt;

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

&lt;100rpm : pH6. 8&gt;

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

&lt;200rpm : pH6. 8&gt;

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

#### IV. 製剤に関する項目

##### 回転バスケット法

<100rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

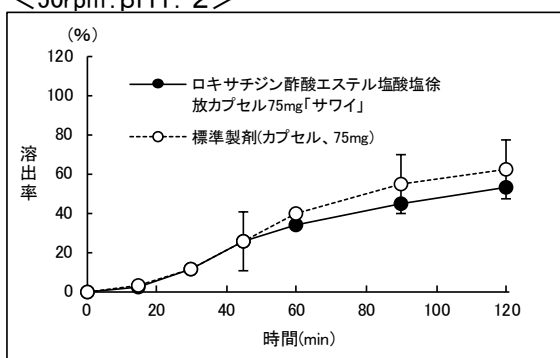
<200rpm : pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が30% (1時間)、50% (1.5時間) 及び80% (6時間) 付近の3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%の範囲にあった。

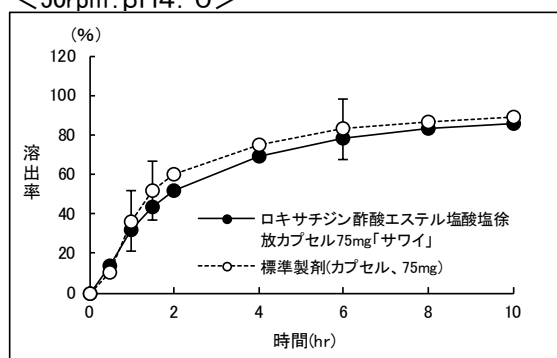
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

##### (溶出曲線) パドル法

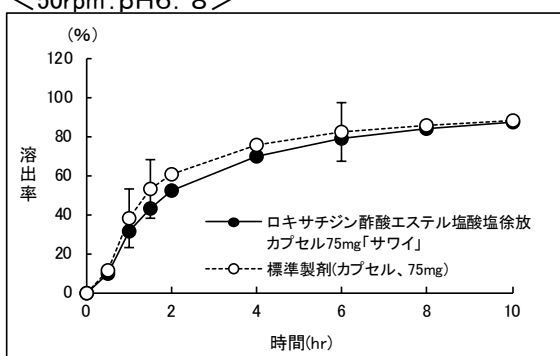
<50rpm : pH1.2>



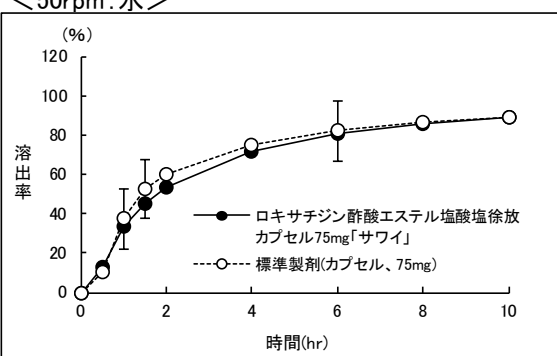
<50rpm : pH4.0>



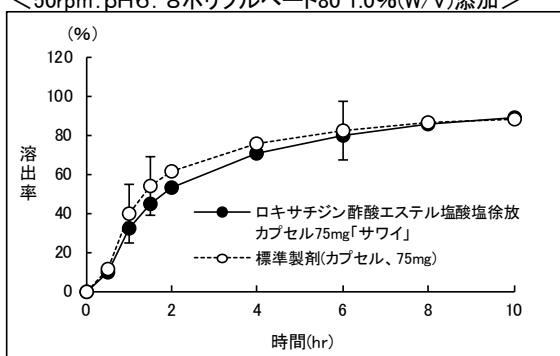
<50rpm : pH6.8>



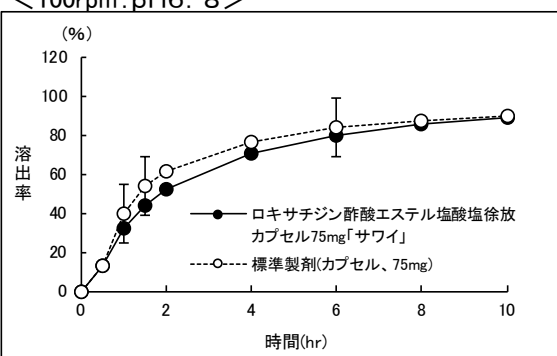
<50rpm : 水>



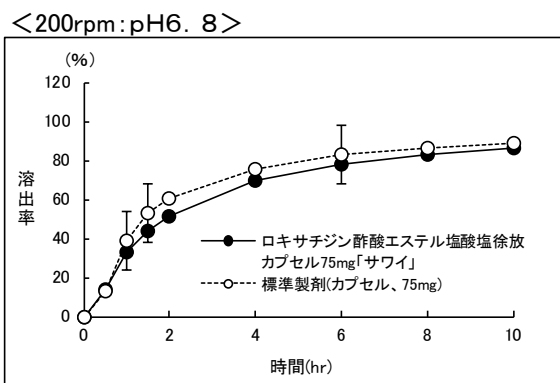
<50rpm : pH6.8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



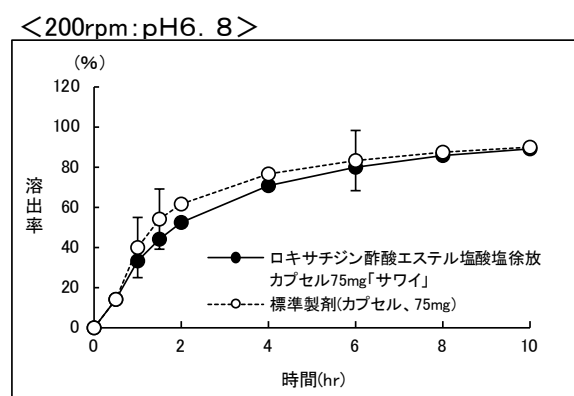
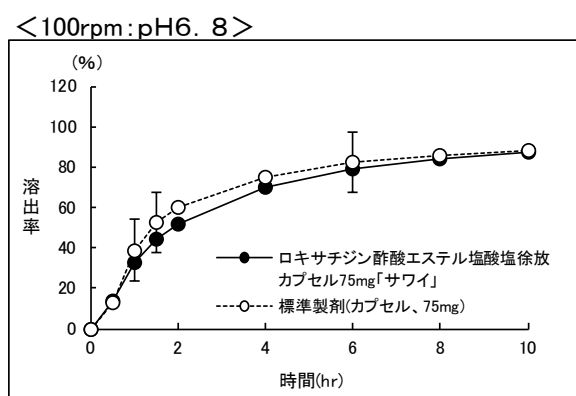
<100rpm : pH6.8>







回転バスケット法



( I : 判定基準の適合範囲)

8. 生物学的試験法 .....

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....

日局「ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル」の確認試験に準ずる。(紫外可視吸光度測定法)

10. 製剤中の有効成分の定量法 .....

日局「ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィ)

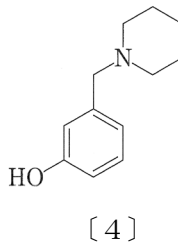
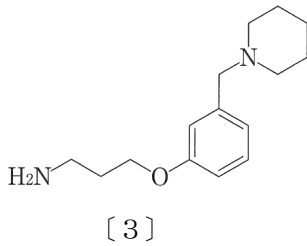
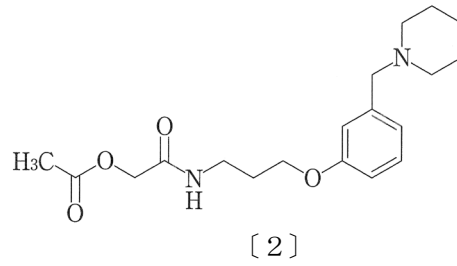
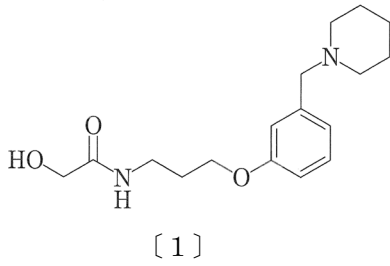
11. 力価 .....

該当しない

IV. 製剤に関する項目

12. 混入する可能性のある夾雑物 .....

混在が予想される主な類縁物質には〔1〕～〔4〕のようなものがある。<sup>1)</sup>



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 .....

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison症候群、逆流性食道炎、麻酔前投薬  
下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善  
急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

### 2. 用法及び用量

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎

通常、成人にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として1回75mgを1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。また、1回150mgを1日1回(就寝前)経口投与することもできる。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

Zollinger-Ellison症候群

通常、成人にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として1回75mgを1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

麻酔前投薬

通常、成人にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として1回75mgを手術前日就寝前及び手術当日麻酔導入2時間前の2回経口投与する。また、1回150mgを手術前日就寝前に1回経口投与することもできる。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを手術前日就寝前及び手術当日麻酔導入2時間前の2回経口投与する。

下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善

急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

通常、成人にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として1回75mgを1日1回(就寝前又は夕食後)経口投与する。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを1日1回(就寝前又は夕食後)経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

#### <用法及び用量に関連する使用上の注意>

腎機能障害患者では血中濃度が持続することがあるので、投与量を減ずるか投与間隔をあけるなど注意すること。

V. 治療に関する項目

3. 臨床成績 .....

1) 臨床データパッケージ

該当しない

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)

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. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群……………  
シメチジン、ファモチジン、ラフチジン等
  
2. 薬理作用……………
  - 1) 作用部位・作用機序
    1. 胃粘膜壁細胞のH<sub>2</sub>受容体を選択的に遮断して、持続的な胃酸分泌抑制作用及びペプシン分泌抑制作用等を示す。
    2. 速やかに吸収され、1日1～2回投与で胃・十二指腸潰瘍、胃炎等に治療効果を示す。
  
  - 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

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

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

VII. -1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」<sup>7)</sup>

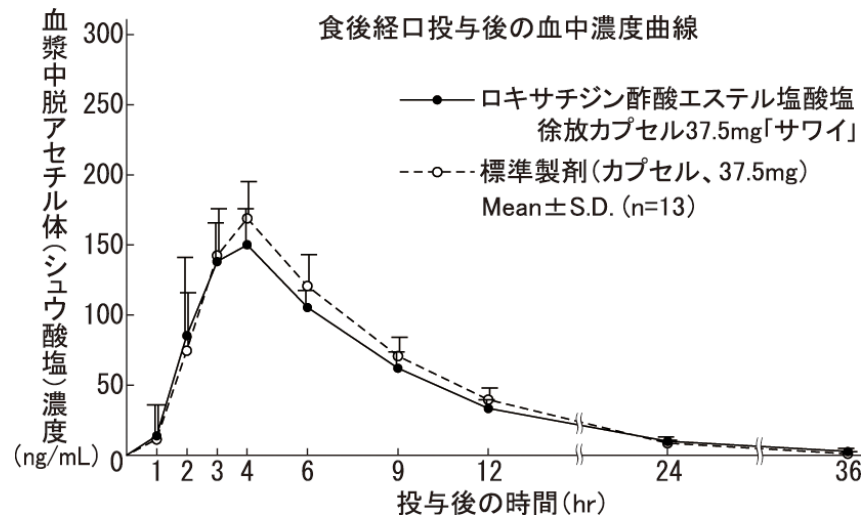
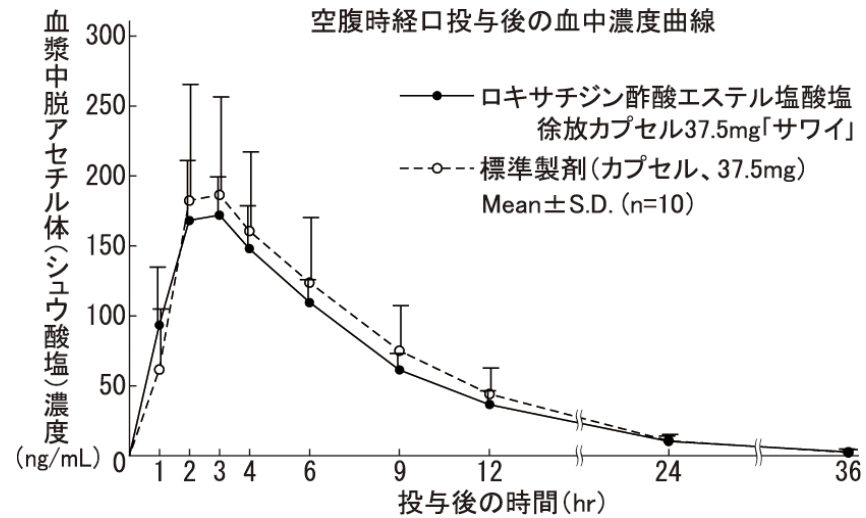
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、1、2、3、4、6、9、12、24、36hr
休薬期間	3日間
測定方法	LC/MS法

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1カプセル(ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として37.5mg)空腹時及び食後単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中脱アセチル体濃度(シュウ酸塩として)を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1カプセル投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-36hr</sub> (ng·hr/mL)
空腹時投与	ロキサチジン 酢酸エステル塩酸塩 徐放カプセル37.5mg 「サワイ」	179±35	2.6±0.5	6.8±1.6	1,534±273
	標準製剤 (カプセル、37.5mg)	193±80	2.4±0.5	6.2±1.5	1,687±593
食後投与	ロキサチジン 酢酸エステル塩酸塩 徐放カプセル37.5mg 「サワイ」	161±24	3.6±0.5	6.7±1.6	1,301±162
	標準製剤 (カプセル、37.5mg)	175±27	3.8±0.4	5.6±1.3	1,407±187

(Mean±S.D.)



●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」<sup>8)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、0.5、1、2、3、4、6、9、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	高速液体クロマトグラフィー

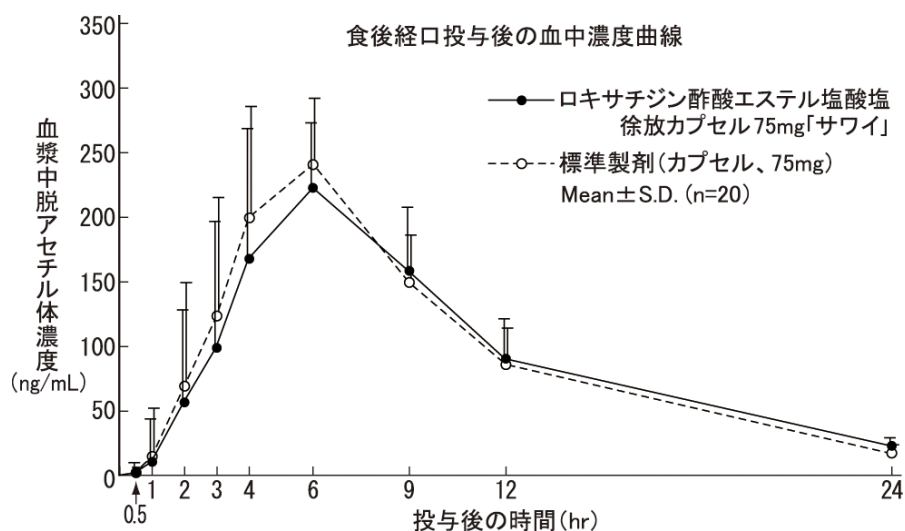
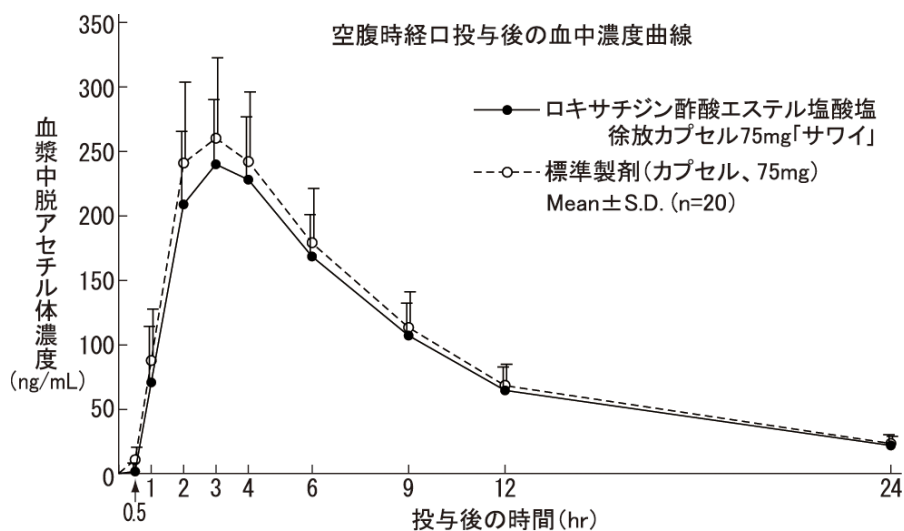
ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1カプセル(ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として75mg)空腹時及び食後単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中脱アセチル体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1カプセル投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> (ng·hr/mL)
空腹時投与	ロキサチジン 酢酸エステル塩酸塩 徐放カプセル75mg 「サワイ」	253±45	3.1±0.6	6.6±1.0	2,210±467
	標準製剤 (カプセル、75mg)	274±61	3.1±0.6	6.4±0.8	2,350±525
食後投与	ロキサチジン 酢酸エステル塩酸塩 徐放カプセル75mg 「サワイ」	258±56	6.0±1.9	5.6±0.7	2,264±372
	標準製剤 (カプセル、75mg)	270±46	5.3±1.5	4.9±0.8	2,305±371

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびに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

該当資料なし

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

3) バイオアベイラビリティ

VII. - 1. -3) 参照

4) 消失速度定数

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」を健康成人男子に1カプセル(ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として37.5mg)空腹時及び食後単回経口投与した場合の脱アセチル体(シュウ酸塩として)の消失速度定数<sup>7)</sup>

[空腹時]0.11±0.03hr<sup>-1</sup>、[食後]0.11±0.03hr<sup>-1</sup>

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」を健康成人男子に1カプセル(ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として75mg)空腹時及び食後単回経口投与した場合の脱アセチル体の消失速度定数<sup>8)</sup>

[空腹時]0.11±0.02hr<sup>-1</sup>、[食後]0.13±0.02hr<sup>-1</sup>

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

約9%<sup>1)</sup>

3. 吸収

大部分が消化管より吸収される。<sup>9)</sup>

## VII. 薬物動態に関する項目

### 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＞ラット及びウサギの器官形成期投与試験でラットの400mg/kg投与群に分娩異常、ウサギの400mg/kg投与群の少数例に流産が、ラットの周産期・授乳期投与試験で200mg/kg投与群の少数例に分娩異常がみられている。

#### 3) 乳汁への移行性

＜参考＞動物実験(ラット)で乳汁中への移行が認められている。

#### 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

肝、小腸及び血清中のエステラーゼにより脱アセチル化される。<sup>1)</sup>

#### 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

脱アセチル体は活性をもつ。<sup>9)</sup>

#### 5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

VII. -1. -3)及びVII. -2. -4)参照

### 6. 排泄

#### 1) 排泄部位及び経路

主として腎臓から排泄される。

#### 2) 排泄率

75mgを経口投与したときの脱アセチル体の尿中排泄率は投与量の約55%であり、カルボン酸誘導体は約10%である。<sup>1)</sup>

3) 排泄速度

VII. -6. -2) 参照

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……………  
該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)……………  
該当しない

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……………  
V. -2. 参照

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) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- 2) 肝障害のある患者
- 3) 腎障害のある患者〔血中濃度が持続することがあるので、使用に際しては投与量を減ずるか投与間隔をあけること。〕
- 4) 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……………

**重要な基本的注意**

治療にあたっては経過を十分に観察し、病状に応じ治療上必要最小限の使用にとどめ、本剤で効果がみられない場合には他の療法に切りかえること。なお、肝機能、腎機能、血液像等に注意すること。

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

該当しない

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

- 1) 重大な副作用(頻度不明)
- (1) **ショック**：ショック(初期症状：不快感、顔面蒼白、血圧低下等)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
  - (2) **再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少**：再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少(初期症状：全身倦怠、脱力、皮下・粘膜下出血、発熱等)があらわれることがあるので、定期的に血液検査を実施し、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。
  - (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)**：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、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。
  - (4) **肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP上昇等の肝機能障害、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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
  - (5) **横紋筋融解症**：横紋筋融解症があらわれることがあるので、CK(CPK)、LDH等の筋逸脱酵素の急激な上昇、ミオグロビン尿、筋肉痛等の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。
- 2) 重大な副作用(類薬)
- (1) **アナフィラキシー**：他のH<sub>2</sub>受容体拮抗剤で、アナフィラキシーがあらわれるとの報告があるので、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。
  - (2) **間質性腎炎**：他のH<sub>2</sub>受容体拮抗剤で、間質性腎炎[初期症状：発熱、腎機能検査値異常(BUN、クレアチニン上昇等)等]があらわれるとの報告があるので、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。
  - (3) **房室ブロック等の心ブロック**：他のH<sub>2</sub>受容体拮抗剤で、房室ブロック等の心ブロックがあらわれるとの報告があるので、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) **不全収縮**：他のH<sub>2</sub>受容体拮抗剤で、不全収縮があらわれるとの報告があるので、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

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
<b>過 敏 症</b>	発疹、そう痒感等
<b>血 液</b>	好酸球数増多、白血球数減少、貧血
<b>消 化 器</b>	便秘、下痢、悪心、腹部膨満感、口渇等
<b>肝 臓</b>	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、LDHの上昇、肝機能異常等
<b>精 神 神 経 系<sup>注)</sup></b>	可逆性の錯乱状態、幻覚、しびれ、眠気、不眠、めまい、頭痛等
<b>そ の 他</b>	女性型乳房、乳汁分泌、倦怠感、血圧上昇、BUN上昇

注)他のH<sub>2</sub>受容体拮抗剤で、痙攣があらわれるとの報告がある。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩製剤(同剤形)の副作用が以下のとおり報告されている。副作用発現率は1.75%(253/14,423)であり、主な副作用はALT(GPT)上昇0.33%、AST(GOT)上昇0.17%、便秘0.14%、好酸球増多0.11%等であった。<sup>10)</sup>

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

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

1) 薬物過敏症の既往歴のある患者

副作用

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、そう痒感等

9. 高齢者への投与

投与量を減ずるか投与間隔をあけるなど慎重に投与すること。[本剤は主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、血中濃度が持続するおそれがある。]

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、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。また、ラット及びウサギの器官形成期投与試験でラットの400mg/kg投与群に分娩異常、ウサギの400mg/kg投与群の少数例に流産が、ラットの周産期・授乳期投与試験で200mg/kg投与群の少数例に分娩異常がみられている。]
- 2) 投薬中は授乳させないように注意すること。[動物実験(ラット)で乳汁中への移行が認められている。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児に対する安全性は確立していない(低出生体重児、新生児、乳児又は幼児に対しては使用経験がない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与 .....  
    該当資料なし

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)

15. その他の注意 .....

本剤の投与が胃癌による症状を隠蔽することがあるので、悪性でないことを確認のうえ投与すること。

16. その他 .....

## IX. 非臨床試験に関する項目

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩の非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

## 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

LD<sub>50</sub> (mg/kg)<sup>11)</sup>

動物種	性	経口	皮下注	静注
マウス	♂	—	—	83
	♀	509	384	—
ラット	♂	755	—	110
	♀	—	595	110

2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

3) 生殖発生毒性試験

VIII. -10. 参照

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 .....

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	劇薬

## 2. 有効期間又は使用期限 .....

使用期限：3年

## 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

該当しない

## 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. -14. 参照

## 3) 調剤時の留意点について

該当しない

## 5. 承認条件等 .....

該当しない

## 6. 包装 .....

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」

PTP：100カプセル(10カプセル×10)

●ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」

PTP：100カプセル(10カプセル×10)、500カプセル(10カプセル×50)、

700カプセル(14カプセル×50)

X. 管理的事項に関する項目

7. 容器の材質
- ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」  
PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
  - ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」  
PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔  
[ピロー]ポリエチレンフィルム
8. 同一成分・同効薬
- 同一成分：アルタットカプセル37.5mg/カプセル75mg/細粒20%/静注用75mg  
同効薬：シメチジン、ファモチジン、ラフチジン等
9. 国際誕生年月日
- 該当しない
10. 製造販売承認年月日及び承認番号
- ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」  
製造販売承認年月日：2013年12月3日(販売名変更)、承認番号：22500AMX01899000  
ロキタットカプセル37.5mg(旧販売名)  
製造販売承認年月日：2008年7月15日、承認番号：22000AMX01737000
  - ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」  
製造販売承認年月日：2013年12月3日(販売名変更)、承認番号：22500AMX01900000  
ロキタットカプセル75mg(旧販売名)  
製造販売承認年月日：2005年3月8日、承認番号：21700AMZ00590000
11. 薬価基準収載年月日
- ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「サワイ」  
2014年6月20日(販売名変更)  
ロキタットカプセル37.5mg(旧販売名)  
2008年11月7日 経過措置期間終了：2015年3月31日
  - ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「サワイ」  
2014年6月20日(販売名変更)  
ロキタットカプセル75mg(旧販売名)  
2005年7月8日 経過措置期間終了：2015年3月31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
- 承認年月日：2015年5月20日  
用法・用量内容：小児に対する用法・用量を追加した。

13. 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

14. 再審査期間 .....  
 該当しない

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 .....

品名	HOT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
ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 徐放カプセル37.5mg「サワイ」	118912401	2325004M2075	621891201
ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 徐放カプセル75mg「サワイ」	116948501	2325004M1095	621694801

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) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十七改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016, C-5981 - C-5985.
  - 2) 日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集, No. 9, 薬事日報社, 2001, p. 131.
  - 3) ~ 4) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
  - 5) ~ 6) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
  - 7) ~ 8) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]
  - 9) Martindale : The Complete Drug Reference 35<sup>th</sup> edition, 2007, p. 1593.
  - 10) 厚生省薬務局, 平成6年度 新医薬品等の副作用のまとめ, 1996, p. 31-32.
  - 11) 薬事研究会編, 規制医薬品事典, 第5版, じほう, 1992, p. 580-581.
2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....

2. 海外における臨床支援情報 .....

該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

その他の関連資料 .....





