

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 2008 に準拠して作成

プロトンポンプ・インヒビター

オメプラゾール注用 20 mg「TYK」

Omeprazole for I.V. Injection 20mg「TYK」

剤形	用時溶解して用いる注射剤
製剤の規制区分	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 瓶中 オメプラゾール 20mg (オメプラゾールナトリウムとして 22.3mg)
一般名	和名:オメプラゾールナトリウム(JAN) 洋名:Omeprazole Sodium(JAN)
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: 2012年 2月 2日 薬価基準収載年月日: 2012年 6月 22日 発売年月日: 2010年 11月 19日
開発・製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	販売:武田薬品工業株式会社 発売元:武田テバファーマ株式会社 製造販売元:武田テバ薬品株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	武田テバ薬品株式会社 武田テバ DI センター TEL 0120-923-093 受付時間 9:00~17:30(土日祝日・弊社休業日を除く) 医療関係者向けホームページ https://www.med.takeda-teva.com

本IFは2016年10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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> 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 年が経過した現在、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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」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

「IF 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	10. 製剤中の有効成分の定量法	7
1. 開発の経緯	1	11. 力 価	7
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	12. 混入する可能性のある夾雑物	7
II 名称に関する項目	2	13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	7
1. 販売名	2	14. その他	7
(1)和名	2	V 治療に関する項目	8
(2)洋名	2	1. 効能又は効果	8
(3)名称の由来	2	2. 用法及び用量	8
2. 一般名	2	3. 臨床成績	8
(1)和名(命名法)	2	(1)臨床データパッケージ	8
(2)洋名(命名法)	2	(2)臨床効果	8
(3)ステム	2	(3)臨床薬理試験：忍容性試験	8
3. 構造式又は示性式	2	(4)探索的試験：用量反応探索試験	8
4. 分子式及び分子量	2	(5)検証的試験	8
5. 化学名(命名法)	2	1) 無作為化並行用量反応試験	8
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	2) 比較試験	8
7. CAS 登録番号	2	3) 安全性試験	8
III 有効成分に関する項目	3	4) 患者・病態別試験	8
1. 物理化学的性質	3	(6)治療の使用	8
(1)外観・性状	3	1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)	
(2)溶解性	3	・ 製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	8
(3)吸湿性	3	2) 承認条件として実施予定の内容又は	
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	3	実施した試験の概要	8
(5)酸塩基解離定数	3	VI 薬効薬理に関する項目	9
(6)分配係数	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	9
(7)その他の主な示性値	3	2. 薬理作用	9
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1)作用部位・作用機序	9
3. 有効成分の確認試験法	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	9
4. 有効成分の定量法	3	(3)作用発現時間・持続時間	9
IV 製剤に関する項目	4	VII 薬物動態に関する項目	10
1. 剤 形	4	1. 血中濃度の推移・測定法	10
(1)剤形の区別、規格及び性状	4	(1)治療上有効な血中濃度	10
(2)溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、 比重、安定な pH 域等	4	(2)最高血中濃度到達時間	10
(3)注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類	4	(3)臨床試験で確認された血中濃度	10
2. 製剤の組成	4	(4)中毒域	10
(1)有効成分(活性成分)の含量	4	(5)食事・併用薬の影響	10
(2)添加物	4	(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	10
(3)電解質の濃度	4	2. 薬物速度論的パラメータ	10
(4)添付溶解液の組成及び容量	4	(1)コンパートメントモデル	10
(5)その他	4	(2)吸収速度定数	10
3. 注射剤の調製法	4	(3)バイオアベイラビリティ	10
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	(4)消失速度定数	10
5. 製剤の各種条件下における安定性	5	(5)クリアランス	10
6. 溶解後の安定性	6	(6)分布容積	10
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	(7)血漿蛋白結合率	10
8. 生物学的試験法	7	3. 吸 収	10
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7		

4. 分 布	10
(1)血液－脳関門通過性	10
(2)血液－胎盤関門通過性	11
(3)乳汁への移行性	11
(4)髄液への移行性	11
(5)その他の組織への移行性	11
5. 代 謝	11
(1)代謝部位及び代謝経路	11
(2)代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種	11
(3)初回通過効果の有無及びその割合	11
(4)代謝物の活性の有無及びその比率	11
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	11
6. 排 泄	11
(1)排泄部位及び経路	11
(2)排泄率	11
(3)排泄速度	11
7. 透析等による除去率	11
VIII 安全性(使用上の注意等)に関する項目	12
1. 警告内容とその理由	12
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	12
3. 効能又は効果に関連する 使用上の注意とその理由	12
4. 用法及び用量に関連する 使用上の注意とその理由	12
5. 慎重投与内容とその理由	12
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	12
7. 相互作用	12
(1)併用禁忌とその理由	13
(2)併用注意とその理由	13
8. 副作用	14
(1)副作用の概要	14
(2)重大な副作用と初期症状	14
(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	15
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	16
16. その他	17

IX 非臨床試験に関する項目	18
1. 薬理試験	18
(1)薬効薬理試験	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	19
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)薬局での取り扱いについて	19
(2)薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)	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	19
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
11. 薬価基準収載年月日	20
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	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	21
1. 引用文献	21
2. その他の参考文献	21
XII 参考資料	21
1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21
XIII 備 考	21
その他の関連資料	21

I 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オメプラゾールは、胃酸分泌細胞(壁細胞)において、 H^+ , K^+ -ATPase を阻害することによって胃酸分泌を抑制するプロトンポンプ阻害剤の一つであり¹⁾、本邦では経口剤として1991年より発売されている。オメプラゾール注用 20mg「TYK」は、オメプラゾールのナトリウム塩を有効成分としている。

本剤は、後発医薬品として武田テバ薬品株式会社(旧大正薬品工業株式会社)が開発を企画し、2010年7月にオメプトロール注用20mgの販売名で承認され、同年11月発売に至った。2012年6月「医療事故防止等に係る代替新規」により、販売名をオメプラゾール注用 20mg「TYK」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1) 経口投与不可能な出血を伴う胃潰瘍、十二指腸潰瘍、急性ストレス潰瘍及び急性胃粘膜病変、Zollimnger-Ellison症候群に適応を有している。

(「V 1. 効能又は効果」の項参照)

3) 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のでいずれも頻度は不明であるが、重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー様症状、汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全、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)、視力障害、間質性腎炎、急性腎不全、低ナトリウム血症、間質性肺炎、横紋筋融解症、錯乱状態があらわれることがある。

(「VIII 8. 副作用」の項参照)

II 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

オメプラゾール注用 20mg「TYK」

(2) 洋名

Omeprazole for I.V. Injection 20mg「TYK」

(3) 名称の由来

一般名+剤形+含量+会社略号

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

オメプラゾールナトリウム(JAN)

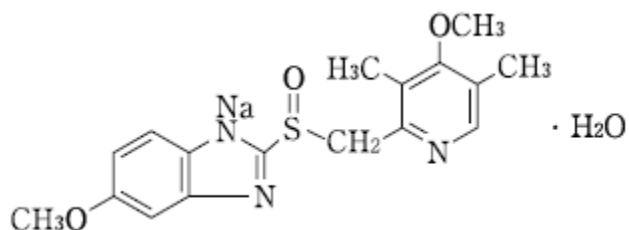
(2) 洋名(命名法)

Omeprazole Sodium(JAN)

(3) ステム

-prazole: ベンズイミダゾール系抗潰瘍薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: C₁₇H₁₈N₃NaO₃S · H₂O

分子量: 385.41

5. 化学名(命名法)

(RS)-Monosodium 5-methoxy-2- [(4-methoxy-3,5-dimethyl-2-pyridyl) methyl sulfinyl]
benzimidazolate monohydrate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

7. CAS 登録番号

73590-58-6(オメプラゾール)

Ⅲ 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けやすく、アセトニトリルに溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

(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

旋光性:本品の水溶液(1→10)は旋光性を示さない。

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

- 1) ナトリウム塩の定性反応
- 2) 水酸化カリウム・エタノール試液による呈色反応
- 3) 過マンガン酸カリウム試液による呈色反応
- 4) 紫外可視吸光度測定法(吸収スペクトル)
- 5) 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

電位差滴定法

IV 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	オメプラゾール注用 20mg「TYK」
区別	用時溶解して用いる注射剤
規格	1 瓶中オメプラゾール 20mg 含有 (オメプラゾールナトリウムとして 22.3mg)
性状	白色の粉末または塊

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH:9.5～11.0(水 20mL に溶かしたとき)

浸透圧比:約 1(生理食塩液に対する比)

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

1 瓶中オメプラゾール 20mg 含有(オメプラゾールナトリウムとして 22.3mg)

(2) 添加物

なし

(3) 電解質の濃度

該当資料なし

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

該当しない

3. 注射剤の調製法

通常、成人には、オメプラゾールとして 1 回 20mg を日局生理食塩液または日局 5%ブドウ糖注射液に混合する。或いは日局生理食塩液または日局 5%ブドウ糖注射液 20mL に溶解する。

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験²⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、オメプラゾール注用20mg「TYK」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

試験結果

【ガラスバイアル・ブチルゴム栓】

試験項目	試験規格	Lot	保存期間					
			開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後		
性状 (外観)	本品は白色の粉末又は塊である。	1	本品は白色の塊であった。	本品は白色の塊であった。	本品は白色の塊であった。	本品は白色の塊であった。		
		2	同上	同上	同上	同上		
		3	同上	同上	同上	同上		
確認試験	(1) 紫外可視吸光度測定	極大吸収 273~277nm 299~303nm	1	275.53 301.00	275.40 300.80	275.40 301.00	275.40 300.93	
			2	275.53 300.87	275.33 300.87	275.33 301.67	275.40 300.80	
		薄層クロマトグラフィー	試料溶液及び標準溶液から得たスポットのR _f 値は等しい。	1	試料溶液及び標準溶液から得たスポットのR _f 値は等しかった。	試料溶液及び標準溶液から得たスポットのR _f 値は等しかった。	試料溶液及び標準溶液から得たスポットのR _f 値は等しかった。	試料溶液及び標準溶液から得たスポットのR _f 値は等しかった。
				2	同上	同上	同上	同上
		pH	9.5~11.0	1	9.79 (9.78~9.81)	9.88 (9.81~10.02)	9.89 (9.83~9.95)	9.72 (9.70~9.74)
				2	9.91 (9.85~9.94)	9.94 (9.92~9.95)	9.87 (9.86~9.89)	9.79 (9.76~9.81)
3	9.80 (9.77~9.83)			9.85 (9.79~9.89)	9.86 (9.84~9.87)	9.76 (9.75~9.76)		
水分	8.0%以下	1	1.84 (1.59~2.05)	2.11 (1.83~2.40)	1.96 (1.88~2.08)	2.29 (2.13~2.52)		
		2	1.89 (1.73~2.06)	1.96 (1.87~2.12)	1.97 (1.92~2.03)	2.46 (2.12~2.92)		
		3	1.72 (1.67~1.77)	2.02 (1.90~2.21)	1.77 (1.71~1.89)	2.49 (2.38~2.67)		

試験項目	試験規格	Lot	保存期間			
			開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
エンドトキシン (比色法)	15EU/mg 未満	1	0.037 (0.033~0.044)			0.018 (0.013~0.027)
		2	0.038 (0.035~0.040)			0.018 (0.014~0.026)
		3	0.046 (0.037~0.052)			0.019 (0.012~0.030)
製剤均一性試験	質量偏差試験を行うとき日局に適合する。判定値：15.0%以下	1	2.02~2.59			1.85~3.00
		2	1.68~3.72			1.58~2.38
		3	1.92~3.55			1.46~2.09
不溶性異物試験	日局一般試験法注射剤の不溶性異物検査法第2法に適合する	1	適合	適合	適合	適合
		2	同上	同上	同上	同上
		3	同上	同上	同上	同上
不溶性微粒子試験	日局一般試験法注射剤の不溶性微粒子試験法第1法に適合する	1	適合	適合	適合	適合
		2	同上	同上	同上	同上
		3	同上	同上	同上	同上
無菌試験	日局一般試験法無菌試験法に適合する	1	適合			適合
		2	同上			同上
		3	同上			同上
定量	95.0~105.0%	1	100.46 (100.27~100.58)	100.18 (99.29~101.47)	100.63 (100.49~100.76)	100.02 (99.55~100.40)
		2	101.39 (100.78~101.90)	99.75 (99.61~99.92)	100.61 (99.95~101.06)	100.51 (100.00~101.03)
		3	101.47 (101.38~101.53)	100.37 (99.81~100.89)	100.68 (100.19~101.21)	100.55 (100.14~100.82)
類縁物質	オメガラズール： 0.5%以下 個々：0.5%以下 総類縁：1.5%以下	1	0.12	0.33	0.86	1.16
		2	0.10	0.30	0.88	1.16
		3	0.12	0.30	0.88	1.19

6. 溶解後の安定性

該当資料なし

7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)¹⁾

pH が高いほうで安定であるため非常に配合変化が多い。このため日局生理食塩液または日局5%ブドウ糖注射液以外の溶解液、輸液、補液及び他剤との混合は避ける。

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

- 1) 紫外可視吸光度測定法(吸収スペクトル)
- 2) 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(内標準法)

11. カ 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

1. 経口投与不可能な下記の疾患：
出血を伴う胃潰瘍、十二指腸潰瘍、急性ストレス潰瘍及び急性胃粘膜病変
2. 経口投与不可能な Zollinger-Ellison 症候群

2. 用法及び用量

通常、成人には、オメプラゾールとして 1 回 20mg を、日局生理食塩液又は日局 5%ブドウ糖注射液に混合して 1 日 2 回点滴静注する、或いは日局生理食塩液又は日局 5%ブドウ糖注射液 20mL に溶解して 1 日 2 回緩徐に静脈注射する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

1. 本剤を、「経口投与不可能な、出血を伴う胃潰瘍、十二指腸潰瘍、急性ストレス潰瘍及び急性胃粘膜病変」に対して投与した場合、3 日間までの成績で高い止血効果が認められているので、内服可能となった後は経口投与に切りかえ、漫然と投与しないこと。
2. 国内臨床試験*において、本剤の 7 日間を超える使用経験はない。

(*他社が実施した臨床試験)

3. 臨床成績

該当資料なし

(1) 臨床データパッケージ(2009 年 4 月以降承認品目)

(2) 臨床効果

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

(5) 検証的試験

- 1) 無作為化並行用量反応試験
- 2) 比較試験
- 3) 安全性試験
- 4) 患者・病態別試験

(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)
- 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

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

プロトンポンプ・インヒビター: ランソプラゾール、ラベプラゾール

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

胃酸分泌細胞(壁細胞)において、 H^+ 、 K^+ -ATPase を阻害することによって胃酸分泌を抑制する。弱塩基性薬物なので、壁細胞の外側の酸性領域に集積し、酸によって活性型となり H^+ K^+ -ATPase のサブユニットのSH基と結合してその活性を阻害する。酵素との結合は共有結合であり、非可逆的なので酵素阻害は薬物の血中濃度が低下した後も持続し、活性の回復は新たな酵素の生合成速度に依存する。これらの機序により、オメプラゾールは酸分泌が生じている部位に集積し、そこで特異的に活性化され、ポンプ活性を非可逆的に抑制するという特徴を示す。

(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

1. 血中濃度の推移・測定法

該当資料なし

- (1) 治療上有効な血中濃度
- (2) 最高血中濃度到達時間
- (3) 臨床試験で確認された血中濃度
- (4) 中毒域
- (5) 食事・併用薬の影響
- (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

2. 薬物速度論的パラメータ

該当資料なし

- (1) コンパートメントモデル
- (2) 吸収速度定数
- (3) バイオアベイラビリティ
- (4) 消失速度定数
- (5) クリアランス
- (6) 分布容積
- (7) 血漿蛋白結合率

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

「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

「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

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位:肝臓

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種

主として CYP2C19 及び一部 CYP3A4

(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その比率

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

該当資料なし

(1) 排泄部位及び経路

(2) 排泄率

(3) 排泄速度

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(原則禁忌を含む)

次の患者には投与しないこと

- (1)本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- (2)アタザナビル硫酸塩、リルピピリン塩酸塩を投与中の患者(「7.相互作用」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

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

<用法・用量に関連する使用上の注意>

- 1.本剤を、「経口投与不可能な、出血を伴う胃潰瘍、十二指腸潰瘍、急性ストレス潰瘍及び急性胃粘膜病変」に対して投与した場合、3日間までの成績で高い止血効果が認められているので、内服可能となった後は経口投与に切りかえ、漫然と投与しないこと。
- 2.国内臨床試験*において、本剤の7日間を超える使用経験はない。

(*他社が実施した臨床試験)

5. 慎重投与内容とその理由

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〔肝代謝性であり、血中濃度が高くなるおそれがある。〕
- (3)高齢者(「9.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)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。なお、血液像、肝機能、腎機能等に注意すること。
- (2)動脈性の急激な出血や露出血管を認めるなど急激な出血の危険性のある場合は、ヒータープローブやクリッピング等の適切な処置を行うこと。
- (3)緊急の場合以外には、静脈注射を避け点滴静注によることが望ましい。

7. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素 CYP2C19 及び一部 CYP3A4 で代謝される。
また、本剤の胃酸分泌抑制作用により、併用薬剤の吸収を上昇又は低下させることがある。

(1) 併用禁忌とその理由

併用しないこと		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アタザナビル硫酸塩 (レイアタツ)	アタザナビル硫酸塩の作用を減弱するおそれがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりアタザナビル硫酸塩の溶解性が低下し、アタザナビルの血中濃度が低下することがある。
リルピピリン塩酸塩(エジュラント)	リルピピリン塩酸塩の作用を減弱するおそれがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりリルピピリン塩酸塩の吸収が低下し、リルピピリンの血中濃度が低下することがある。

(2) 併用注意とその理由

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
ジアゼパム フェニトイン シロスタゾール	これらの薬剤の作用を増強することがある。	本剤は主に肝臓のチトクロームP450系薬物代謝酵素CYP2C19で代謝されるため、本剤と同じ代謝酵素で代謝される薬物の代謝、排泄を遅延させるおそれがある。
ワルファリン	抗凝血作用を増強し、出血に至るおそれがある。プロトロンビン時間国際標準比(INR)値等の血液凝固能の変動に十分注意しながら投与すること。	
タクロリムス水和物	タクロリムスの血中濃度が上昇することがある。	相互作用の機序は不明である。
ジゴキシン メチルジゴキシン	これらの薬剤の作用を増強することがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりジゴキシンの加水分解が抑制され、ジゴキシンの血中濃度が上昇することがある。
イトラコナゾール	イトラコナゾールの作用を減弱することがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりイトラコナゾールの溶解性が低下し、イトラコナゾールの血中濃度が低下することがある。
チロシンキナーゼ阻害剤 ゲフィチニブ エルロチニブ	これらの薬剤の血中濃度が低下することがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりこれらの薬剤の溶解性が低下し、吸収が低下することがある。
ボリコナゾール	本剤のC _{max} 及びAUCが増加したとの報告がある。	ボリコナゾールは本剤の代謝酵素(CYP2C19及びCYP3A4)を阻害することが考えられる。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ネルフィナビルメシル酸塩	ネルフィナビルの血中濃度が低下するおそれがある。	相互作用の機序は不明である。
サキナビルメシル酸塩	サキナビルの血中濃度が上昇するおそれがある。	相互作用の機序は不明である。
クロピドグレル硫酸塩	クロピドグレル硫酸塩の作用を減弱するおそれがある。	CYP2C19 を阻害することにより、クロピドグレル硫酸塩の活性代謝物の血中濃度が低下する。
セイヨウオトギリソウ (St.John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート) 含有食品	本剤の代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがある。	セイヨウオトギリソウが本剤の代謝酵素 (CYP2C19 及び CYP3A4) を誘導することが考えられる。
メトトレキサート	メトトレキサートの血中濃度が上昇することがある。高用量のメトトレキサートを投与する場合は、一時的に本剤の投与を中止することを考慮すること。	相互作用の機序は不明である。

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

頻度不明

- 1) **ショック、アナフィラキシー様症状**: ショック、アナフィラキシー様症状(血管浮腫、気管支痙攣等)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し、適切な処置を行うこと。
- 2) **汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少**: 汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、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し、適切な処置を行うこと。
- 3) **劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全**: 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全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) **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、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。
- 5) **視力障害**: 視力障害があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 6) **間質性腎炎、急性腎不全**:間質性腎炎、急性腎不全があらわれることがあるので、腎機能検査値(BUN、クレアチニン等)に注意し、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。
- 7) **低ナトリウム血症**:低ナトリウム血症があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 8) **間質性肺炎**:間質性肺炎があらわれることがあるので、発熱、咳嗽、呼吸困難、肺音の異常(捻髪音)等が認められた場合には投与を中止し、速やかに胸部X線等の検査を実施し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- 9) **横紋筋融解症**:筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 10) **錯乱状態**:せん妄、異常行動、失見当識、幻覚、不安、焦燥、攻撃性等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

	頻度不明
過敏症^{注)}	発疹、蕁麻疹、そう痒感、多形紅斑、光線過敏症
消化器	下痢・軟便、悪心、腹部膨満感、便秘、嘔吐、鼓腸放屁、カンジダ症、口渇、腹痛、口内炎、舌炎、顕微鏡的大腸炎(collagenous colitis, lymphocytic colitis)
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、 γ -GTPの上昇、LDH上昇
血液	白血球数減少、血小板数減少、貧血
精神神経系	頭痛、めまい、不眠(症)、眠気、しびれ感、振戦、傾眠、異常感覚、うつ状態
その他	血管痛、発熱、味覚異常、霧視、浮腫、女性化乳房、脱毛、倦怠感、関節痛、頻尿、動悸、月経異常、筋肉痛、発汗、筋力低下、及び BUN、クレアチニン、尿酸、トリグリセライド、血清カリウム、総コレステロールの上昇、低マグネシウム血症

注)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。

(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

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 薬物過敏症の既往歴のある患者には慎重に投与すること。
- 3) ショック、アナフィラキシー様症状(血管浮腫、気管支痙攣等)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し、適切な処置を行うこと。

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)妊婦等: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。〔動物実験(ウサギ経口 138mg/kg)で胎児毒性(死亡吸収胚率の増加)が報告されている。〕
- (2)授乳婦:授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット経口 5mg/kg)で、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(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

徴候、症状:オメプラゾールの過量投与により、悪心、嘔吐、めまい、腹痛、下痢、頭痛等が報告されている。

処置:症状に応じて適切な処置を行うこと。

14. 適用上の注意

投与時:

日局生理食塩液又は日局 5%ブドウ糖注射液以外の溶解液、輸液、補液及び他剤との混合注射は避けること。

15. その他の注意

- (1)ラットに 1.7mg/kg 以上を 2 年間経口投与した毒性試験で、胃にカルチノイドの発生がみられたとの報告がある。このカルチノイドの発生にはラットに種特異性が認められている。
- (2)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して投与すること。
- (3)因果関係は明らかではないが、他社が実施した国内臨床試験において難聴がみられたとの報告がある。
- (4)海外における複数の観察研究で、プロトンポンプインヒビターによる治療において骨粗鬆症に伴う股関節骨折、手関節骨折、脊椎骨折のリスク増加が報告されている。特に、高用量及び長期間(1年以上)の治療を受けた患者で、骨折のリスクが増加した。
- (5)海外における主に入院患者を対象とした複数の観察研究で、プロトンポンプインヒビターを投与した患者においてクロストリジウム・ディフィシルによる胃腸感染のリスク増加が報告されている。

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

該当資料なし

- (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
- (3) 安全性薬理試験
- (4) その他の薬理試験

2. 毒性試験

該当資料なし

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

X 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤:処方箋医薬品(注意—医師等の処方箋により使用すること)

有効成分:該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限:3年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

遮光、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

20mg×10瓶

7. 容器の材質

バイアル	瓶
栓	ブチルゴム
キャップ	アルミニウム+ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬:オメプラール注用 20(アストラゼネカ)

同 効 薬:ランソプラゾール、ファモチジン、シメチジン、ラニチジン塩酸塩

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

製造販売承認年月日:2012年2月2日

承認番号 :22400AMX00131

(旧版売名)オメプトロール注用 20mg
製造販売承認年月日:2010年7月15日
承認番号 :22200AMX00601

11. 薬価基準収載年月日

2012年6月22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

該当しない

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

HOT 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード (YJ コード)	レセプト電算コード
120198703	2329403D1084	622019802

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。

XI 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十五改正 日本薬局方第一追補解説書 (2008)
- 2) 武田テバ薬品(株) 社内資料：加速試験

2. その他の参考文献

該当しない

XII 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

該当資料なし

XIII 備 考

その他の関連資料

該当資料なし