

## 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

# タケプロン<sup>®</sup> 静注用30mg

*Takepron<sup>®</sup> INTRAVENOUS 30mg.*

剤形	注射用凍結乾燥製剤
製剤の規制区分	注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1バイアル中ランソプラゾール30mg含有
一般名	和名：ランソプラゾール (JAN) 洋名：Lansoprazole (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：2006年10月20日 薬価基準収載年月日：2006年12月1日 発売年月日：2006年12月7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 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 <a href="https://www.med.takeda-teva.com">https://www.med.takeda-teva.com</a>

本IFは2019年5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「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があり、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. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	2

## II：名称に関する項目

1. 販 売 名	
1-1 和 名	3
1-2 洋 名	3
1-3 名称の由来	3
2. 一 般 名	
2-1 和 名 (命名法)	3
2-2 洋 名 (命名法)	3
2-3 ス テ ム	3
3. 構造式又は示性式	3
4. 分子式及び分子量	3
5. 化学名 (命名法)	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3

## III：有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質	
1-1 外観・性状	4
1-2 溶 解 性	4
1-3 吸 湿 性	5
1-4 融点 (分解点)、沸点、凝固点	5
1-5 酸塩基解離定数	5
1-6 分配係数	5
1-7 その他の主な示性値	5
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6
3. 有効成分の確認試験法	6
4. 有効成分の定量法	6

## IV：製剤に関する項目

1. 剤形	
1-1 剤形の区別、規格及び性状	7
1-2 溶液及び溶解時のpH、浸透圧比、比重、安定なpH域	7
1-3 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類	7
2. 製剤の組成	
2-1 有効成分（活性成分）の含量	7
2-2 添加物	7
2-3 電解質の濃度	7
2-4 添付溶解液の組成及び容量	7
2-5 その他	7
3. 注射剤の調製法	7
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	8
5. 製剤の各種条件下における安定性	8
6. 溶解後の安定性	9
7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	17
8. 生物学的試験法	17
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	17
10. 製剤中の有効成分の定量法	17
11. 力価	17
12. 混入する可能性のある夾雑物	17
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	18
14. その他	18

## V：治療に関する項目

1. 効能又は効果	22
2. 用法及び用量	22
3. 臨床成績	
3-1 臨床データパッケージ	22
3-2 臨床効果	22
3-3 臨床薬理試験：忍容性試験	23
3-4 探索的試験：用量反応探索試験	23
3-5 検証的試験	24
3-6 治療的使用	24

## 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	25
2. 薬理作用	
2-1 作用部位・作用機序	25
2-2 薬効を裏付ける試験成績	26
2-3 作用発現時間・持続時間	28

## Ⅶ：薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法	
1-1 治療上有効な血中濃度	30
1-2 最高血中濃度到達時間	30
1-3 臨床試験で確認された血中濃度	30
1-4 中毒域	31
1-5 食事・併用薬の影響	31
1-6 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	31
2. 薬物速度論的パラメータ	
2-1 コンパートメントモデル	31
2-2 吸収速度定数	31
2-3 バイオアベイラビリティ	31
2-4 消失速度定数	31
2-5 クリアランス	31
2-6 分布容積	31
2-7 血漿蛋白結合率	32
3. 吸収	32
4. 分布	
4-1 血液-脳関門通過性	32
4-2 血液-胎盤関門通過性	32
4-3 乳汁への移行性	33
4-4 髄液への移行性	33
4-5 その他の組織への移行性	34
5. 代謝	
5-1 代謝部位及び代謝経路	36
5-2 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種	37
5-3 初回通過効果の有無及びその割合	37
5-4 代謝物の活性の有無及び比率	37
5-5 活性代謝物の速度論的パラメータ	37

6. 排 泄	
6-1 排泄部位 .....	38
6-2 排泄率 .....	39
6-3 排泄速度 .....	39
7. 透析等による除去率 .....	39

## 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 .....	40
2. 禁忌内容とその理由 .....	40
3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	40
4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	40
5. 慎重投与内容とその理由 .....	40
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	40
7. 相互作用	
7-1 併用禁忌とその理由 .....	41
7-2 併用注意とその理由 .....	41
8. 副作用	
8-1 副作用の概要 .....	41
8-2 重大な副作用と初期症状 .....	42
8-3 その他の副作用 .....	42
8-4 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧 .....	43
8-5 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 .....	44
8-6 薬物アレルギーに対する注意及び試験法 .....	44
9. 高齢者への投与 .....	44
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 .....	44
11. 小児等への投与 .....	44
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	44
13. 過量投与 .....	45
14. 適用上の注意 .....	45
15. その他の注意 .....	45
16. その他 .....	45

## Ⅸ：非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	
1-1 薬効薬理試験（「Ⅵ：薬効薬理に関する項目」参照） .....	46
1-2 副次的薬理試験 .....	46
1-3 安全性薬理試験 .....	46
1-4 その他の薬理試験 .....	46



2. 毒性試験	
2-1 単回投与毒性試験	46
2-2 反復投与毒性試験	47
2-3 生殖発生毒性試験	47
2-4 その他の特殊毒性	48

## X：管理的事項に関する項目

1. 規制区分	49
2. 有効期間又は使用期限	49
3. 貯法・保存条件	49
4. 薬剤取扱い上の注意点	
4-1 薬局での取り扱いについて	49
4-2 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	49
5. 承認条件等	49
6. 包装	49
7. 容器の材質	49
8. 同一成分・同効薬	50
9. 国際誕生年月日	50
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	50
11. 薬価基準収載年月日	50
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	50
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	50
14. 再審査期間	50
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	50
16. 各種コード	50
17. 保険給付上の注意	50

## XI：文献

1. 引用文献	51
2. その他の参考文献	51

## XII：参考資料

1. 主な外国での発売状況	52
2. 海外における臨床支援情報	52

## XIII：備考

その他の関連資料	53
----------	----



## I：概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

---

タケプロンは、武田薬品工業株式会社研究所において側鎖に含フッ素置換基を有する一連の(RS)-2-[(2-pyridyl) methyl]sulfinyl benzimidazole 誘導体に関する研究の結果、開発されたプロトンポンプインヒビター、ランソプラゾールの製剤である。

タケプロン経口剤は1992年10月にその有用性が認められ、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群に対して承認を受けた。その後、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍、胃MALTリンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助(15mg・30mg製剤共通)、非びらん性胃食道逆流症、低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制、非ステロイド性抗炎症薬投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制(15mg製剤のみ)の効能・効果、逆流性食道炎の維持療法における用法・用量が追加された。

一方、経口投与できない患者に対して、ランソプラゾール注射剤の開発を進め、各種臨床試験の結果、2006年10月にタケプロン静注用30mgが、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1日2回静脈内投与で承認された。2016年9月に再審査結果が公表され有用性が再確認された。

2019年5月に武田テバ薬品株式会社が武田薬品工業株式会社より製造販売承認を承継した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

---

(1) 武田薬品・研究所が合成したプロトンポンプインヒビター、ランソプラゾールの注射用製剤

(2) 出血を伴う消化性潰瘍等\*に1日2回投与で、速やかな止血効果

出血を伴う消化性潰瘍等\*を対象とした臨床試験で、3日間(72時間)以内に94.6%(192例/203例)に止血効果が確認された。

(3) CYP2C19の遺伝子型の違いにかかわらず高い胃内pHを保持

健康成人男子に5日間投与時の24時間 $\text{pH} \geq 4$ ホールディングタイムは、EM群\*\*で1日目69%、5日目は88%、PM群\*\*\*では1日目90%、5日目は98%であった。

(4) 副作用

承認時までの試験では、ランソプラゾールとして1回30mgを1日2回投与された221例中31例(14.0%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。主な副作用はALT(GPT)上昇(6.2%)、AST(GOT)上昇(5.7%)、LDH上昇(2.0%)、 $\gamma$ -GTP上昇(1.5%)等の臨床検査値異常変動であった(承認時)。

製造販売後調査では、1,142例中35例(3.1%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。主な副作用は、下痢、肝機能異常、肝障害、発熱及び白血球数減少(各0.3%)であった(再審査終了時点)。

重大な副作用としてアナフィラキシー、ショック、汎血球減少、無顆粒球症、溶血性貧血、顆粒球減少、血小板減少、貧血、重篤な肝機能障害、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)、間質性肺炎、間質性腎炎が認められている。

\*経口投与不可能な、出血を伴う下記疾患

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

\*\* EM (Extensive Metabolizer) 群：ランソプラゾールが速やかに代謝される群

\*\*\* PM (Poor Metabolizer) 群：ランソプラゾールが緩やかに代謝される群

## Ⅱ：名称に関する項目

1. 販売名 \_\_\_\_\_

1-1 和名 \_\_\_\_\_

タケプロン® 静注用 30mg

1-2 洋名 \_\_\_\_\_

Takepron® INTRAVENOUS 30mg

1-3 名称の由来 \_\_\_\_\_

タケプロン：タケダのプロトンポンプインヒビター

2. 一般名 \_\_\_\_\_

2-1 和名(命名法) \_\_\_\_\_

ランソプラゾール (JAN)

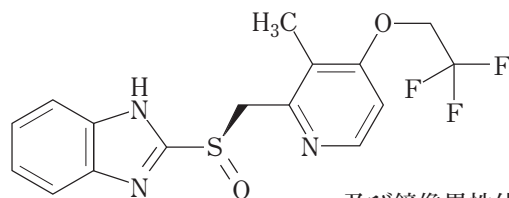
2-2 洋名(命名法) \_\_\_\_\_

Lansoprazole (JAN)

2-3 ステム \_\_\_\_\_

プロトンポンプ阻害薬：-prazole

3. 構造式又は示性式 \_\_\_\_\_



4. 分子式及び分子量 \_\_\_\_\_

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>14</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S

分子量：369.36

5. 化学名(命名法) \_\_\_\_\_

(*RS*)-2-({[3-Methyl-4-(2,2,2-trifluoroethoxy) pyridin-2-yl]methyl} sulfinyl) -1*H*-benzimidazole (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 \_\_\_\_\_

治験番号：AG-1749

7. CAS登録番号 \_\_\_\_\_

103577-45-3

### Ⅲ：有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### 1-1 外観・性状

本品は白色～帯褐白色の結晶性の粉末である。

(日本薬局方)

##### 1-2 溶解性

本品は *N,N*-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール (99.5) にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(日本薬局方)

#### ■各種溶媒に対する溶解性

溶媒名	本品1gを溶かすのに要する溶媒量 (mL)	溶解性の表現
<i>N,N</i> -ジメチルスルホキシド	3	溶けやすい
メタノール	22~23	やや溶けやすい
エタノール (99.5)	57~58	やや溶けにくい
ジエチルエーテル	2400	極めて溶けにくい
水	29000~31000	ほとんど溶けない

(武田薬品・品質保証部)

#### ■各種pHにおける溶解性 (約25℃)

水溶液のpH*	溶解度 (g/mL)	水溶液のpH*	溶解度 (g/mL)
1	$1.3 \times 10^{-2**}$	9.0 (9.0)	$8.0 \times 10^{-5***}$
3.0	$3.0 \times 10^{-3**}$	11.0 (10.4)	$1.3 \times 10^{-3***}$
5.0	$< 5.0 \times 10^{-5**}$	13 (11.6)	$3.2 \times 10^{-2***}$
7.0 (7.0)	$3.2 \times 10^{-5***}$		

\*：pH調整のために以下の緩衝液を使用した。また、( )内はランソプラゾールを飽和した溶液が示したpHを示す。

pH1：0.1mol/L塩酸、pH3.0~11.0：Britton-Robinson緩衝液、pH13：0.1mol/L水酸化ナトリウム

\*\*：酸性条件下ではランソプラゾールは分解するため、肉眼で観察したみかけの溶解度を示す。

\*\*\*：液体クロマトグラフィーにより測定

(武田薬品・研究所)

### 1-3 吸湿性

25℃、75% RHの条件下に7日間保存したが、吸湿性は認められなかった。

(武田薬品・研究所)

### 1-4 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：約166℃(分解)

(日本薬局方)

### 1-5 酸塩基解離定数

$pK_a = 8.87$  (吸光度測定法)、 $8.82$  (溶解度法) [ベンズイミダゾリル基]

$pK_a = \text{約} 1.3$  [ベンズイミダゾリル基] \*

$pK_a = \text{約} 4.5$  [ピリジル基] \*

\*：本品は酸性溶液中で不安定なため、酸に安定な類似化合物を用い推定した。

(武田薬品・研究所)

### 1-6 分配定数

25℃における有機溶媒と各種pHの水溶液との間の分配係数は下記のとおりであった。

#### ■ランソプラゾールの分配係数\*

水溶液のpH	オクタノール	酢酸エチル	ジクロロメタン	ジエチルエーテル
7.0	240	230	180	20
9.0	120	110	90	8
11.0	10	—	2	0.2
13	0.8	—	0.02	0.004

\*：分配係数=有機層中の濃度/水層中の濃度、—：測定せず

(武田薬品・研究所)

### 1-7 その他の示性値

旋光性：本品の*N,N*-ジメチルホルムアミド溶液(1→10)は旋光性を示さない。

結晶多形：結晶多形が認められる。

(日本薬局方)

吸光度  $E_{1\text{cm}}^{1\%}(284\text{nm})$ ：約414 [メタノール溶液(1→100000)]

(武田薬品・研究所)

## 2. 有効成分の各種条件下における安定性

### ■ 固体状態での安定性

(3ロット平均)

	保存条件	保存期間	保存形態	結 果	
				外 観	含量(残存率) (%)
規格	—	—	—	白色～帯褐色の結晶性の粉末	99.0～101.0
—	—	イニシャル	—	白色の結晶性の粉末	99.6 (100 )
長期保存試験	室温(4～33℃)、暗所、18～95%RH	39ヵ月	無色ガラス瓶(密栓、乾燥剤入り)	帯褐色の結晶性の粉末	99.7 (100.1)
苛 度	温 40℃、暗所	12ヵ月	無色ガラス瓶(密栓)	ごくうすい褐色の結晶性の粉末	99.6 (100.0)
	度 50℃、暗所	9ヵ月		うすい褐色～褐色の結晶性の粉末	96.7 ( 97.1)
酷 度	湿 25℃、75%RH	18ヵ月	無色ガラス瓶(開栓)	うすい褐色の結晶性の粉末	98.4 ( 98.8)
	度 40℃、75%RH	6ヵ月		黄褐色の結晶性の粉末	88.5 ( 88.9)
試 験	光 25℃、白色蛍光灯(1000lx)	8週間	シャーレ(ポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆う)	微黄白色の結晶性の粉末	99.6 (100.0)
	25℃、フェードメータ[キセノンランプ8×10 <sup>4</sup> lx]	18.75時間		微黄白色の結晶性の粉末	99.3 ( 99.7)

### ■ 水溶液中での安定性

弱酸性～アルカリ性溶液

(20μg/mL, 約25℃)

pH	時間 (h)	残存率 (%)
5.0	0.5	50.1
6.0	1	80.9
7.0	2	90.3
8.0	8	89.2
9.0	8	98.0

酸性溶液

(1mg/mL, 24℃)

1	0.5	約1.7
---	-----	------

(武田薬品・研究所)

## 3. 有効成分の確認試験法

日局「ランソプラゾール」確認試験による。

## 4. 有効成分の定量法

日局「ランソプラゾール」定量法による。

## IV：製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### 1-1 剤形の区別、規格及び性状

◇剤形の区別：注射用凍結乾燥製剤

◇規格：本品は定量するとき、表示量の95.0～105.0%に対応するランソプラゾール(C<sub>16</sub>H<sub>14</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S：369.36)を含む。

◇性状：本品は白色～帯黄白色の塊又は粉末である。

#### 1-2 溶液及び溶解時のpH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等

pH：10.6～11.3(日局生理食塩液5mLにて溶解時)

浸透圧比：約1(日局生理食塩液5mLにて溶解時)

製剤の溶解性：プラセボ1バイアル(添加物のみ含有)に5mLの水を加えて溶かした溶液に大量のランソプラゾールを添加して溶解度を測定した。

pH	ランソプラゾールの25℃における溶解度	
	(mg/mL)	(mg/20mL)
11.1	45.2	904
10.6	22.4	448

#### 1-3 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素

### 2. 製剤の組成

#### 2-1 有効成分(活性成分)の含量

1バイアル中にランソプラゾール30mgを含有する。

#### 2-2 添加物

1バイアル中にD-マンニトール60mg、メグルミン10mg、pH調整剤を含有する。

#### 2-3 電解質の濃度

該当しない

#### 2-4 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

#### 2-5 その他

該当しない

### 3. 注射剤の調製法

日局生理食塩液又は日局5%ブドウ糖注射液に混合して点滴静注して用いる。或いは日局生理食塩液又は日局5%ブドウ糖注射液20mLに溶解して緩徐に静脈注射する。

なお、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。



#### 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

##### (1) 長期保存試験

保存条件：25℃・60%RH、暗所

保存形態：UVカットフィルムで被覆した無色のガラス容器

(3ロット平均)

測定項目	イニシャル	12ヵ月	24ヵ月	36ヵ月
外 観	白色の塊又は粉末	変化なし	変化なし	変化なし
残存率(%)	100	100.2	99.5	99.4

##### (2) 苛酷試験

###### 1) 温度安定性

保存条件：50℃

保存形態：UVカットフィルムで被覆した無色のガラス容器

測定項目	イニシャル	4週	8週	12週
外 観	白色の塊又は粉末	変化なし	変化なし	変化なし
残存率(%)	100	99.4	98.2	98.7

###### 2) 光に対する影響

保存条件：25℃、D 65 ランプ (1000lx)

保存形態：無色のガラス容器 (UVカットフィルムなし)

測定項目	イニシャル	40万lx・h	80万lx・h	120万lx・h
外 観	白色の塊又は粉末	変化なし	変化なし	変化なし
残存率(%)	100	97.6	96.0	95.4

保存条件：25℃、D 65 ランプ (1000lx)

保存形態：無色のガラス容器 (UVカットフィルムあり)

測定項目	イニシャル	40万lx・h	80万lx・h	120万lx・h
外 観	白色の塊又は粉末	変化なし	変化なし	変化なし
残存率(%)	100	99.7	99.4	99.9

(武田薬品・開発分析研究所)

一般的な医薬品と同様にできるだけ「遮光保存」することが望ましいが、上記試験結果に基づき、「遮光保存」と規定しなかった。

## 6. 溶解後の安定性

### (1) 溶解後の安定性の概要

溶 液	保存温度	容器/容量	結果(概要)
生理食塩液	5℃	ガラスバイアル：5mL プラスチックシリンジ：20mL プラボトル：100、500mL	48時間までほとんど変化がなかった
	25℃	ガラスバイアル：5mL プラスチックシリンジ：20mL プラボトル：100、200、500mL	8時間までほとんど変化がなかった(以後、含量低下が見られた)
		瓶ボトル(ガラスボトル)：200mL	4時間までほとんど変化がなかった(以後、不溶性微粒子が日局不適となった)
5%ブドウ糖注射液	5℃	ガラスバイアル：5mL プラスチックシリンジ：20mL プラボトル：100、250mL	48時間までほとんど変化がなかった
	25℃	ガラスバイアル：5mL プラスチックシリンジ：20mL プラボトル：100、200、250mL	4時間までほとんど変化がなかった(以後、不溶性異物/不溶性微粒子が日局不適となった)
		瓶ボトル(ガラスボトル)：200mL	3時間までほとんど変化がなかった(以後、不溶性微粒子が日局不適となった)

(武田薬品・開発分析研究所)

(2) 日局生理食塩液

1) 5mL 生理食塩液

保存条件：5℃

保存形態：ガラスバイアル

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	10.8	10.8	10.8	10.8	10.8	10.8	10.8
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	98.3	98.0	98.3	98.7	98.7	98.3

2) 5mL 生理食塩液

保存条件：25℃

保存形態：ガラスバイアル

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	無色澄明	/	/
pH	11.0	11.0	11.0		10.9		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局不適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適		日局適		
含量(残存率%)	100	100.0	100.0		100.0		

3) 20mL 生理食塩液

保存条件：5℃

保存形態：プラスチックシリンジ (テルモシリンジ)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	10.5	10.5	10.6	10.5	10.6	10.5	10.5
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.0	100.0	99.7	99.3	100.3	99.7

4) 20mL 生理食塩液

保存条件：25℃

保存形態：プラスチックシリンジ (テルモシリンジ)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	10.5	10.5	10.5	10.5	10.5	10.5	10.5
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.0	99.0	100.0	98.3	98.0	97.7

5) 100mL 生理食塩液

保存条件：5℃

保存形態：プラボトル (大塚)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	10.0	10.0	10.0	10.0	10.1	10.0	10.1
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.0	98.3	99.7	99.7	98.3	98.7

6) 100mL 生理食塩液

保存条件：25℃

保存形態：プラボトル (大塚)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	無色澄明	/	/
pH	10.1	10.1	10.1		10.1		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適		日局適		
含量(残存率%)	100	99.2	97.6		96.1		

7) 200mL 生理食塩液

保存条件：25℃

保存形態：プラボトル (大塚)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	無色澄明	/	/
pH	9.7	9.8	9.9		9.8		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適		日局適		
含量(残存率%)	100	100.8	100.4		98.1		

8) 200mL 生理食塩液

保存条件：25℃

保存形態：ガラスボトル (光)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	無色澄明	/	/
pH	9.8	9.8	9.8		9.8		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局不適		日局不適		
含量(残存率%)	100	99.3	98.5		97.4		

9) 500mL 生理食塩液

保存条件：5℃

保存形態：プラボトル (大塚)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	9.2	9.5	9.4	9.5	9.5	9.5	9.5
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.0	97.3	99.3	98.3	97.7	98.0

10) 500mL 生理食塩液

保存条件：25℃

保存形態：プラボトル (大塚)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	無色澄明	/	/
pH	9.5	9.4	9.4		9.4		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適		日局適		
含量(残存率%)	100	99.6	97.8		94.2		

(3) 日局 5%ブドウ糖注射液

1) 5mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：5℃

保存形態：ガラスバイアル

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	10.2	10.2	10.2	10.2	10.2	10.2	10.2
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.7	99.3	99.3	99.0	100.7	101.0

2) 5mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：25℃

保存形態：ガラスバイアル

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	微淡黄色澄明	微淡黄色澄明	/	淡黄色澄明	/	/
pH	10.3	10.3	10.3		10.2		
不溶性異物	日局適	日局適	日局不適		日局不適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適		日局適		
含量(残存率%)	100	100.0	101.8		100.0		

### 3) 20mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：5℃

保存形態：プラスチックシリンジ（テルモシリンジ）

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	9.8	9.9	9.9	9.9	9.8	9.9	9.9
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	101.0	102.1	101.0	102.1	101.7	101.4

### 4) 20mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：25℃

保存形態：プラスチックシリンジ（テルモシリンジ）

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	微黄色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明
pH	9.8	9.9	9.8	9.8	9.8	9.8	9.7
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局不適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	100.3	101.0	100.3	99.0	97.3	94.2

### 5) 100mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：5℃

保存形態：プラボトル（大塚）

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	9.4	9.4	9.4	9.4	9.4	9.4	9.4
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	100.7	100.7	99.3	99.3	101.0	100.0



6) 100mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：25℃

保存形態：プラボトル (大塚)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	微黄色澄明	/	淡黄色澄明	/	/
pH	9.4	9.4	9.4		9.3		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局不適		日局不適		
含量(残存率%)	100	98.8	96.5		91.2		

7) 200mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：25℃

保存形態：プラボトル (大塚)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	微黄色澄明	/	/
pH	9.1	9.2	9.2		9.1		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適		日局不適		
含量(残存率%)	100	97.8	95.9		89.9		

8) 200mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：25℃

保存形態：ガラスボトル (光)

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	1	2	3
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	9.1	9.1	9.1	9.1
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.3	99.3	98.5

9) 200mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：25℃

保存形態：ガラスボトル（光）

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	微黄色澄明	/	/
pH	9.2	9.2	9.2		9.1		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局不適	日局不適		日局不適		
含量(残存率%)	100	98.9	97.0		91.1		

10) 250mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：5℃

保存形態：プラボトル（大塚）

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	9.1	9.1	9.1	9.1	9.1	9.1	9.1
不溶性異物	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.7	97.3	99.3	98.3	100.0	99.3

11) 250mL 5%ブドウ糖注射液

保存条件：25℃

保存形態：プラボトル（大塚）

測定項目 \ 保持時間 (時間)	0	4	8	12	24	36	48
溶状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	/	微黄色澄明	/	/
pH	9.1	9.0	8.9		8.9		
不溶性異物	日局適	日局適	日局適		日局適		
不溶性微粒子	日局適	日局適	日局適		日局適		
含量(残存率%)	100	99.7	97.6		88.7		

(武田薬品・開発分析研究所)

7. 他剤との配合変化 (物理化学的变化) \_\_\_\_\_

配合変化による変色、沈殿物を生じることがあるため、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、補液又は他剤との混合はしないこと。

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 \_\_\_\_\_

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 薄層クロマトグラフィー

(武田薬品・研究所)

10. 製剤中の有効成分の定量法 \_\_\_\_\_

液体クロマトグラフィー

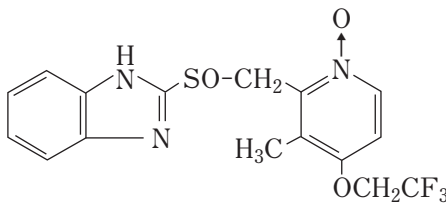
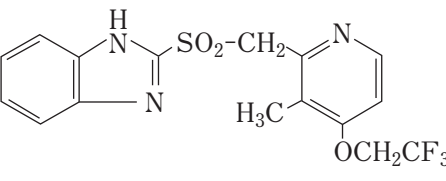
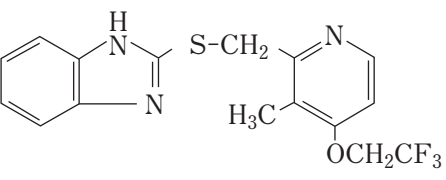
(武田薬品・研究所)

11. カ 価 \_\_\_\_\_

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物 \_\_\_\_\_

主たる夾雑物は下記のとおりである。

N-オキシド体	
スルホン体	
スルフィド体	

(武田薬品・研究所)

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. その他

輸液チューブ内での吸着性

点滴速度：100mL/時間

- テルフュージョン輸血セット：TS-U750P（15滴＝1mL、DEHPフリータイプ）  
〔テルモ社製〕、日局生理食塩液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	10.0	9.7
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	97.9

- テルフュージョン輸血セット：TS-J350PK027〔テルモ社製〕、  
日局生理食塩液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	10.0	9.8
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	96.9

- テルフュージョン輸血セット：TS-A350PK027〔テルモ社製〕、  
日局生理食塩液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	10.0	9.7
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	99.7

■テルフュージョン輸血セット：TS-U750P（15滴＝1mL、DEHPフリータイプ）  
〔テルモ社製〕、日局5%ブドウ糖注射液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	9.5	9.4
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	95.3

■テルフュージョン輸血セット：TS-J350PK027〔テルモ社製〕、  
日局5%ブドウ糖注射液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	9.5	9.4
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	94.6

■テルフュージョン輸血セット：TS-A350PK027〔テルモ社製〕、  
日局5%ブドウ糖注射液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	9.5	9.4
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	96.3

■塩化ビニル/可塑剤DEHP〔ニプロ社製〕、  
日局生理食塩液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	10.0	9.8
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	95.9

■塩化ビニル/可塑剤TOTM〔ニプロ社製〕、

日局生理食塩液〔大塚製薬/プラボトル〕 100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	10.0	9.8
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	98.6

■ポリブタジエン〔ニプロ社製〕、

日局生理食塩液〔大塚製薬/プラボトル〕 100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	10.0	9.8
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	98.6

■塩化ビニル/可塑剤DEHP〔ニプロ社製〕、

日局5%ブドウ糖注射液〔大塚製薬/プラボトル〕 100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	9.5	9.4
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	95.3

■塩化ビニル/可塑剤TOTM〔ニプロ社製〕、

日局5%ブドウ糖注射液〔大塚製薬/プラボトル〕 100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	9.5	9.4
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	96.6

■ポリブタジエン〔ニプロ社製〕、

日局5%ブドウ糖注射液〔大塚製薬/プラボトル〕100mL

測定項目 \ 測定時点	イニシャル	1時間後
溶状	無色澄明	無色澄明
pH	9.5	9.4
不溶性異物	日局適	日局適
不溶性微粒子	日局適	日局適
含量(残存率%)	100	98.0

(武田薬品・開発分析研究所)



## V：治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

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. 用法及び用量

通常、成人には、ランソプラゾールとして1回30mg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) 本剤は投与開始から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。(**【臨床成績】**の項参照)
- (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。

### 3. 臨床成績

#### 3-1 臨床データパッケージ

該当しない

#### 3-2 臨床効果

出血を伴う消化性潰瘍等を対象とした臨床試験において、1回30mg 1日2回静脈内投与され止血効果が評価された203例のうち、3日間(72時間)以内に止血が認められた症例は94.6%(192/203例)である。203例中内視鏡的な前処置が行われなかった症例は41例であり、3日間(72時間)以内に止血が認められた症例は97.6%(40/41例)である。

また、上記臨床試験において、1回30mg 1日2回静脈内投与された221例の有害事象(臨床検査値異常変動を除く)の発現率は14.9%(33/221例)である。

背景因子別の発現率では、男性12.7%(21/166例)、非高齢者8.5%(14/165例)、体重50.0kg以上60.0kg未満の層14.9%(11/74例)、体重60.0kg以上の層(体重が不明であった例を除く)10.0%(10/100例)と比べて、女性21.8%(12/55例)、高齢者33.9%(19/56例)、体重50.0kg未満の層29.7%(11/37例)でやや高かった。

### 3-3 臨床薬理試験：忍容性試験

健康成人男性 27 例を対象に、ランソプラゾール 7.5mg、30mg を単回点滴静注投与（30 分、1 時間）、15mg、30mg、60mg 単回静注（3 分間）、1 日 1 回 3 日間 30mg 反復静注（3 分間）、1 日 2 回 3 日間 30mg 反復静注（3 分間）して、忍容性を検討した。その結果、15mg 静注 1 例において投与中に投与局所の熱感が認められたが、投与中に消失したことから、安全性に問題はないと考えられた。また、臨床検査値の異常変動は軽度なものであり、臨床上問題はないと考えられた<sup>1)</sup>。

鎌田 武信，他：臨床医薬 1996，12：2739

注) 本剤の承認用法・用量は下記のとおりである。

通常、成人には、ランソプラゾールとして 1 回 30mg 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。

### 3-4 探索的試験：用量反応探索試験

(1) 上部消化管出血患者 47 例を対象に、ランソプラゾール 15mg あるいは 30mg を 1 日 2 回静脈内投与し、止血効果を検討した。

有効性評価採用例における「著効」\*例は 15mg 群で 63.6 % (14/22 例)、30mg 群では 72.2 % (13/18 例)、また、「有効」\*\*以上では 15mg 群で 81.8 % (18/22 例)、30mg 群では 88.9 % (16/18 例) であった。自他覚的副作用は 30mg 群で 1 例に腎障害が認められた。因果関係が否定できない臨床検査値異常変動は 15mg 群 24.0 %、30mg 群 19.0 % に認められた<sup>2)</sup>。

鎌田 武信，他：臨床医薬 1996，12：2885

(2) 上部消化管出血患者 196 例を対象に、H<sub>2</sub> 受容体拮抗剤を対照としてランソプラゾール 15mg あるいは 30mg を 1 日 2 回静脈内投与し、止血効果を検討した。

有効性評価採用例における「著効」\*例は 15mg 群で 90.6 % (48/53 例)、30mg 群では 81.1 % (43/53 例)、また、「有効」\*\*以上ではランソプラゾール 15mg 群で 94.3 % (50/53 例)、30mg 群では 92.5 % (49/53 例) であった。自他覚的副作用は 30mg 群で 1 例に下痢が認められた。因果関係が否定できない臨床検査値異常変動は 15mg 群 9.0 %、30mg 群 21.5 % に認められた<sup>3)</sup>。

\*「著効」：ランソプラゾール投与後 36 時間以内に止血が確認された症例

\*\*「有効」：ランソプラゾール投与後 36～72 時間以内に止血が確認された症例

鎌田 武信，他：臨床医薬 1996，12：2901

注) 本剤の承認用法・用量は下記のとおりである。

通常、成人には、ランソプラゾールとして 1 回 30mg 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。

### 3 - 5 検証的試験

---

経口投与困難な出血を伴う消化性潰瘍（胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃・十二指腸併存潰瘍）、急性ストレス潰瘍、急性胃粘膜病変患者270例を対象に、ランソプラゾール30mgを1日2回静脈内投与し、H<sub>2</sub>受容体拮抗剤を対照として、二重盲検群間比較で止血効果を検討した。本剤の有効性評価採用例における「著効」\*例は91.7%（121/132例）、また、「有効」\*\*以上では96.2%（127/132例）でありH<sub>2</sub>受容体拮抗剤と非劣性が認められた。自他覚的副作用は、本剤で3例（2.2%）に認められ、内容は発熱、振戦、多汗であった。因果関係が否定できない臨床検査値異常変動は、本剤で11例（8.1%）に認められた<sup>4)</sup>。

\*「著効」：ランソプラゾール投与後36時間以内に止血が確認された症例

\*\*「有効」：ランソプラゾール投与後36～72時間以内に止血が確認された症例

蘆田 潔, 他：薬理と治療 2007, 35 : 503

### 3 - 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）

再審査結果公表年月日：2016年9月30日

内容：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第14条第2項第3号イからハまでのいずれにも該当しない。

(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

プロトンポンプ阻害剤

### 2. 薬理作用

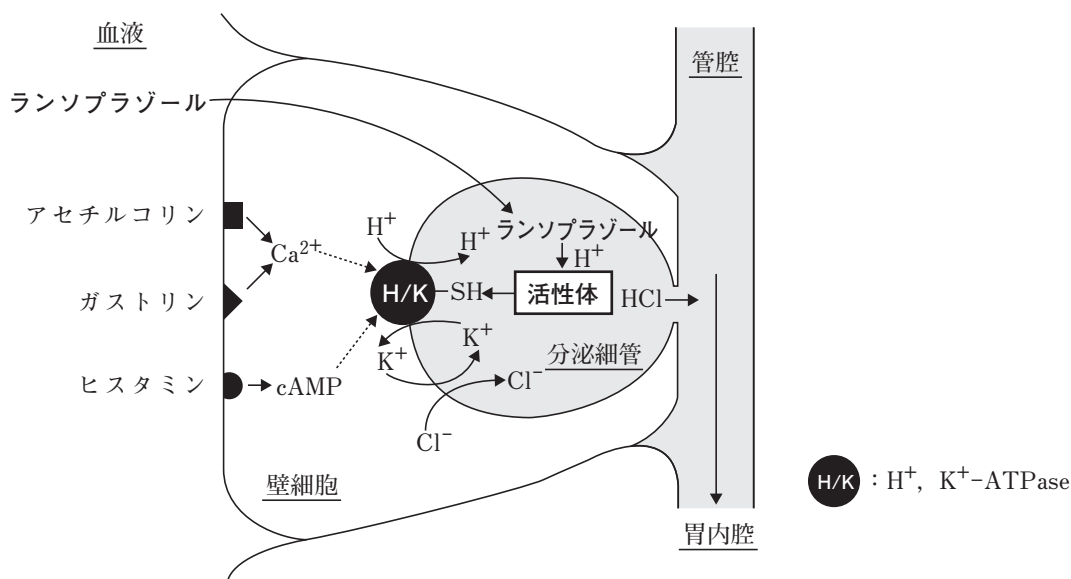
#### 2-1 作用部位・作用機序

本剤は胃粘膜壁細胞の酸生成部位へ移行した後、酸による転移反応を経て活性体へと構造変換され、この酸転移生成物が酸生成部位に局在してプロトンポンプとしての役割を担っている $H^+$ 、 $K^+$ -ATPaseのSH基と結合し、酵素活性を抑制することにより、酸分泌を抑制すると考えられる。

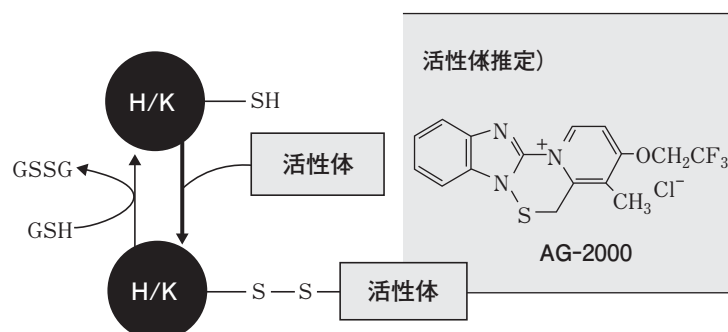
血液凝固能及び血小板凝集能は酸性条件下で強く障害され、さらに血液凝固の結果として形成されたフィブリンは酸性条件下でペプシンにより溶解されることが報告されているが、本剤は胃内pHを上昇させることにより血液凝固能及び血小板凝集能を改善し、ペプシン活性を抑制して出血抑制作用を示すと考えられる。

また、胃の損傷粘膜の修復は酸性条件下で抑制されるが、本剤は酸分泌を抑制することにより胃内pHを上昇させ、損傷粘膜の修復を促進すると考えられる<sup>5)~7)</sup>。

#### ■壁細胞における酸分泌機構とランソプラゾールの作用機序



なお、ランソプラゾールにより活性を抑制されたプロトンポンプ活性は、内因性のグルタチオン (GSH) あるいはde novoの蛋白合成により回復すると推定されている。

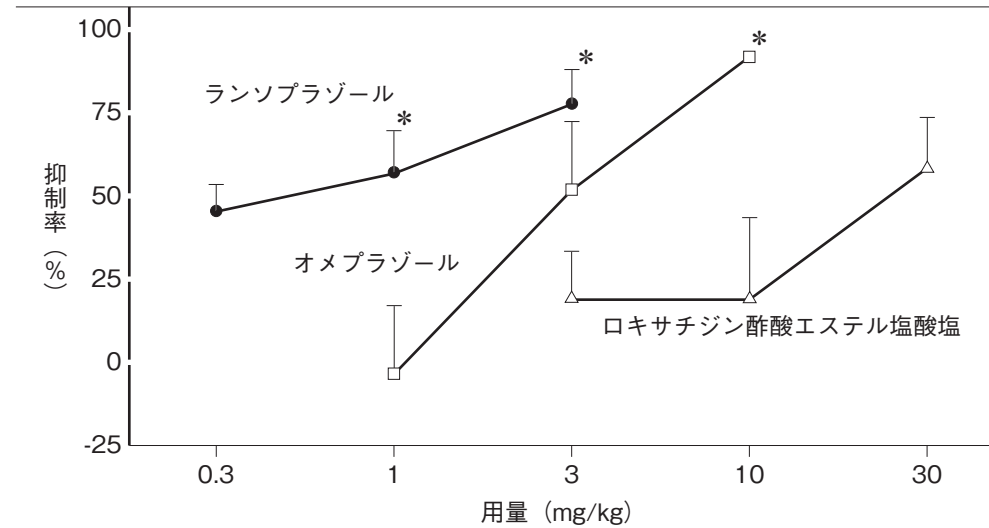


## 2-2 薬効を裏付ける試験成績

### (1) 胃出血抑制作用 (ラット)

ランソプラゾールは、胃酸分泌亢進下に脱血ショックにより生じる胃出血を有意に抑制した<sup>8)</sup>。

#### ■胃出血抑制作用 (ラット)



mean±SE, n=11~13, \* : p≤0.025 (対照群との比較)、片側Shirley-Willams検定

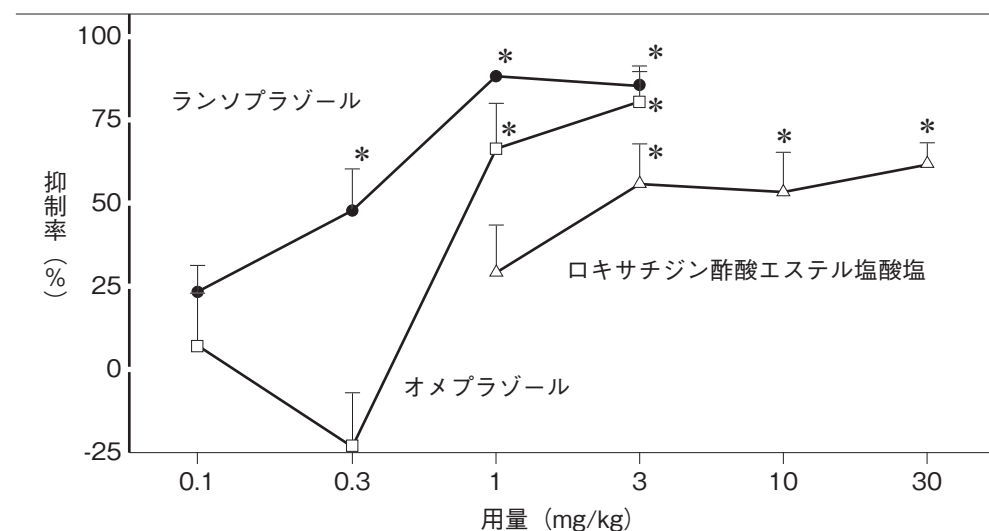
#### [試験方法]

ラットを麻酔下に腹部を切開し、幽門輪を結紮後、被験薬を静脈内投与し、3分後にヒスタミン二塩酸塩 30mg/kg 及び 2-デオキシ-D-グルコース 200mg/kg を皮下投与し、その90分後に体重の1.8%にあたる血液を脱血した。50分後に血液を還血し、その30分後に貯留胃液中のヘモグロビン量を測定した。

### (2) 胃粘膜損傷形成抑制作用 (ラット)

ランソプラゾールは、アスピリンによる胃粘膜損傷の形成を有意に抑制した<sup>8)</sup>。

#### ■胃粘膜損傷形成抑制作用 (ラット)



mean±SE, n=10~12, \* : p≤0.025 (対照群との比較)、片側Shirley-Willams検定

#### [試験方法]

ラットに被験薬を静脈内投与し、アスピリン 200mg/kg を経口投与し、4時間後に胃を摘出して粘膜損傷の長さを計測し総和を求めた。

(3) 胃酸分泌抑制作用 (ラット)

ランソプラゾールは、ラットの基礎胃酸分泌及び各種刺激に基づく胃酸分泌を抑制し、そのID<sub>50</sub>値 (50 %抑制量) は0.17～2.23mg/kgであった<sup>8)</sup>。

■胃酸分泌抑制作用 (ラット)

刺激の種類	ランソプラゾール	オメプラゾール	ロキサチジン酢酸エステル塩
基礎分泌	0.70	2.24	12.37
ヒスタミン	0.17	0.51	6.36
2-デオキシ-D-グルコース	2.23	3.95	14.37

mg/kg, n=10~12

[試験方法]

ラットを24時間絶食し、幽門部を結紮後に被験薬を静脈注射し、各種刺激薬を皮下投与し3時間後に胃を摘出して胃酸分泌量を求めた。

## 2 - 3 作用発現時間・持続時間

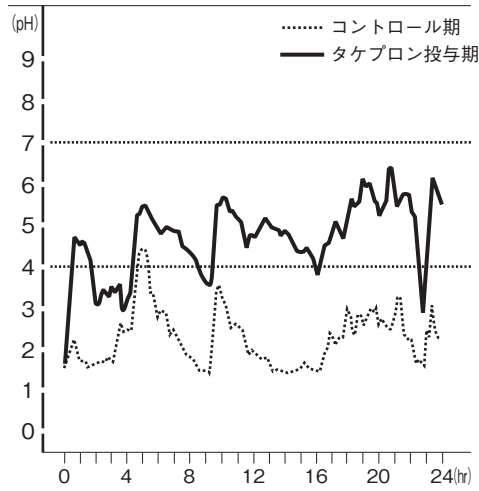
### 遺伝子型別の胃内pHに及ぼす影響（健康成人）

#### (1) 24時間胃内pHモニタリング

CYP2C19の遺伝子型で、本剤が速やかに代謝されるEM群と、緩やかに代謝されるPM群の健康成人男子にランソプラゾール1回30mg 1日2回を5日間静脈内点滴投与（30分）したときの、1日目と5日目の24時間胃内pHの推移は下記のとおりであった。

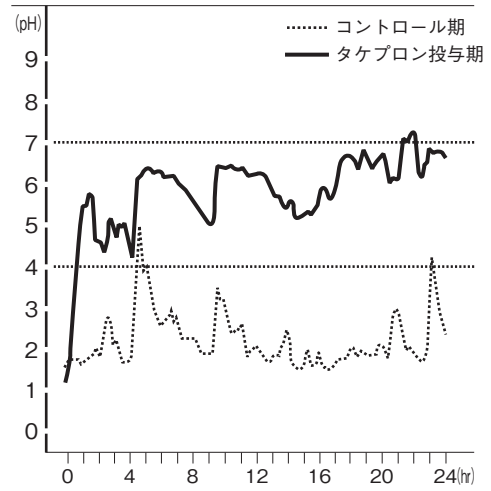
#### ■ 1日目の胃内pHの推移

##### EM群



n=8

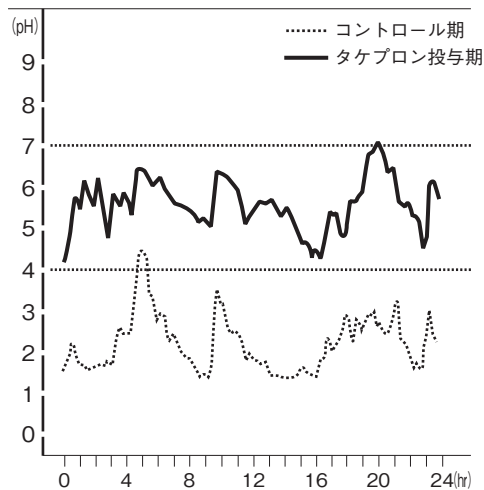
##### PM群



n=8

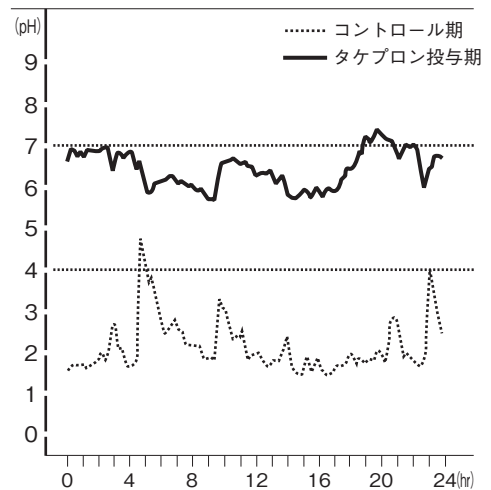
#### ■ 5日目の胃内pHの推移

##### EM群



n=8

##### PM群



n=8

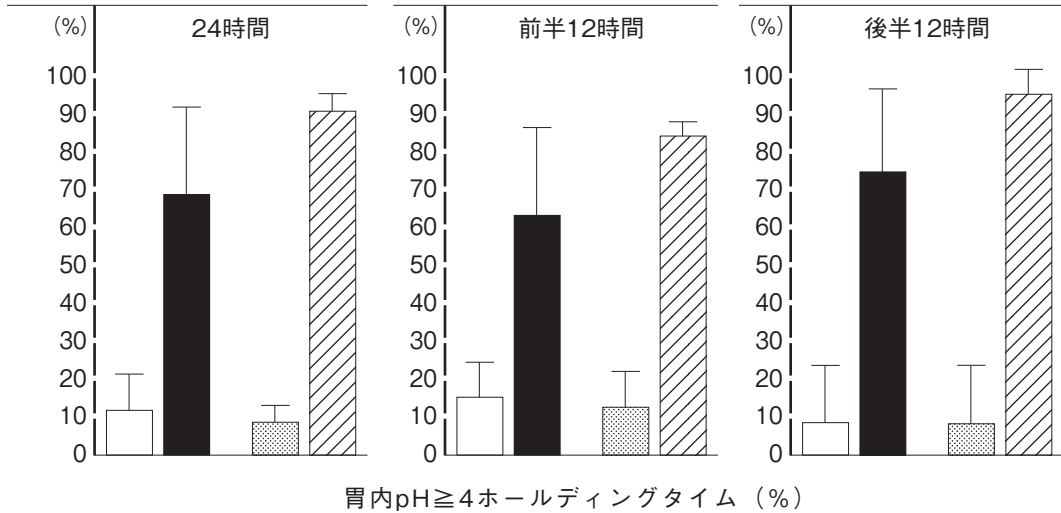
(承認時資料：2006年10月)



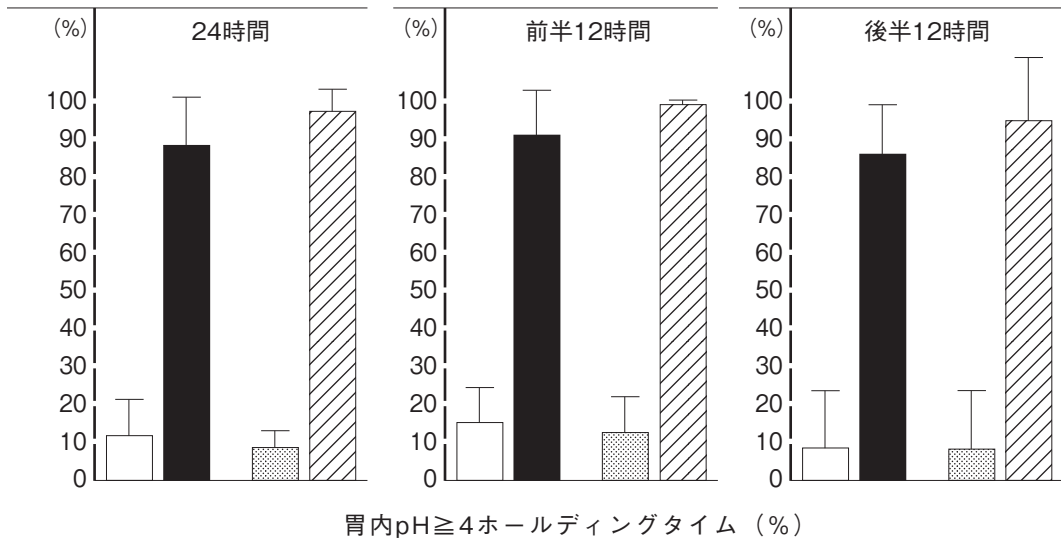
(2) 胃内pH $\geq$ 4ホールディングタイム (%) に及ぼす影響

ランソプラゾール投与によりEM群、PM群ともpH $\geq$ 4ホールディングタイムは増加した。

■ 1日目の胃内pH $\geq$ 4ホールディングタイム (%)



■ 5日目の胃内pH $\geq$ 4ホールディングタイム (%)



□ EMコントロール期    ■ EMタケブロン投与期    ▨ PMコントロール期    ▩ PMタケブロン投与期  
mean $\pm$ SD n=8

(承認時資料：2006年10月)

## VII：薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### 1-1 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### 1-2 最高血中濃度到達時間

「VII-1-3 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

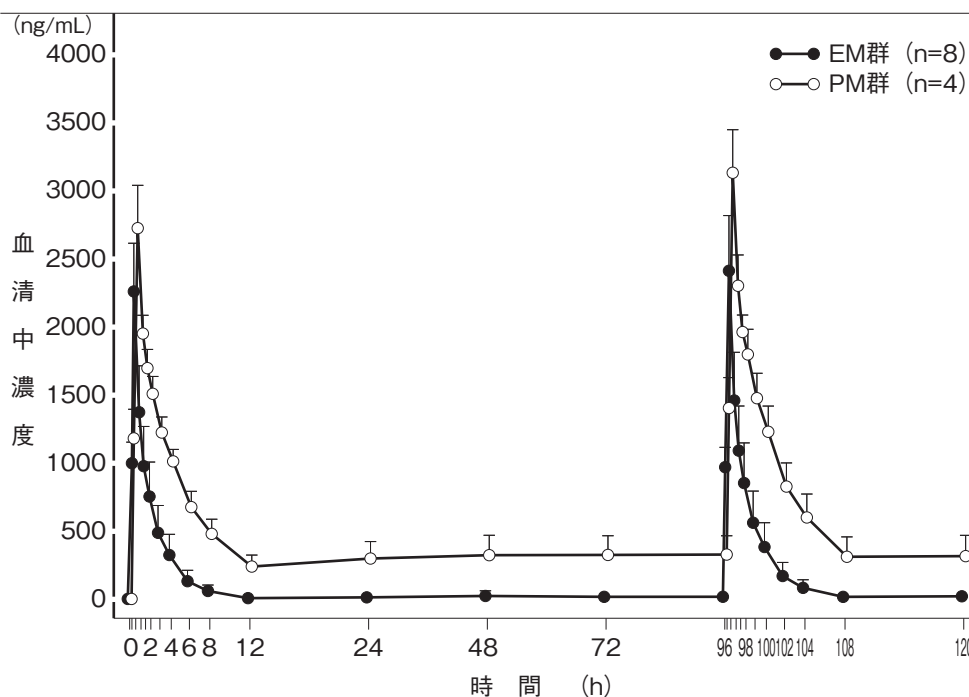
#### 1-3 臨床試験で確認された血中濃度

##### 健康成人での血清中濃度

本剤の静脈内投与における血清中濃度には個体間で差が認められる。

CYP2C19の遺伝子型で、本剤が速やかに代謝されるEM群と、緩やかに代謝されるPM群に分類した健康成人男子12例（EM：8例、PM：4例）を対象として、1回30mg 1日2回を5日間静脈内点滴投与（30分）した場合の血清中濃度は下記のとおりであった。

##### ■血清中濃度の推移



mean ± SD

##### ■薬物動態パラメータ

	代謝型	AUC <sub>0-12</sub> (ng·h/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>1/2</sub> (h)
1日目	EM群	4386±1335	2262±354	1.5±0.4
	PM群	10415±1159	2727±315	4.0±0.7
5日目	EM群	4939±1541	2414±406	1.6±0.5
	PM群	12579±1939	3134±316	4.2±1.1

mean ± SD、EM群：n=8、PM群：n=4

(承認時資料：2006年10月)

1-4 中毒域 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

1-5 食事・併用薬の影響 \_\_\_\_\_  
該当資料なし

1-6 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 \_\_\_\_\_

2-1 コンパートメントモデル \_\_\_\_\_  
CYP2C19の遺伝子型で、本剤が速やかに代謝されるEM群と、緩やかに代謝されるPM群に分類した健康成人男子12例（EM：8例、PM：4例）を対象として、1回30mg 1日2回を5日間静脈内点滴投与（30分）して、1コンパートメントモデルで解析した。

2-2 吸収速度定数 \_\_\_\_\_  
該当しない

2-3 バイオアベイラビリティ \_\_\_\_\_  
該当しない

2-4 消失速度定数 \_\_\_\_\_  
EM群で1日目  $0.51 \pm 0.21\text{h}^{-1}$ 、5日目  $0.48 \pm 0.22\text{h}^{-1}$ であり、PM群では1日目  $0.18 \pm 0.03\text{h}^{-1}$ 、5日目  $0.17 \pm 0.04\text{h}^{-1}$ であった（mean  $\pm$  SD）。  
(承認時資料：2006年10月)

2-5 クリアランス \_\_\_\_\_  
EM群で1日目  $7.91 \pm 4.39\text{L/h}$ 、5日目  $7.14 \pm 4.29\text{L/h}$ であり、PM群では1日目  $2.55 \pm 0.37\text{L/h}$ 、5日目  $2.13 \pm 0.42\text{L/h}$ であった（mean  $\pm$  SD）。  
(承認時資料：2006年10月)

2-6 分布容積 \_\_\_\_\_  
EM群で1日目  $13.20 \pm 1.42\text{L}$ 、5日目  $12.74 \pm 1.47\text{L}$ であり、PM群では1日目  $13.30 \pm 1.30\text{L}$ 、5日目  $11.38 \pm 1.03\text{L}$ であった（mean  $\pm$  SD）。  
(承認時資料：2006年10月)

## 2-7 血漿蛋白結合率

(参考) [in vitro]

ラット、イヌの血漿、ヒト血清及び4%ヒト血清アルブミンに *in vitro* で添加した [<sup>14</sup>C] ランソプラゾールの蛋白結合率はそれぞれ95~96%、94~96%、98%、98%であった。

(承認時資料：2006年10月)

## 3. 吸 収

該当しない

## 4. 分 布

### 4-1 血液-脳関門通過性

(参考) [ラット]

ラットに [<sup>14</sup>C] ランソプラゾールを静脈内投与したとき、脳への移行が示されている。

(承認時資料：2006年10月)

### 4-2 血液-胎盤関門通過性

(参考) [ラット]

妊娠20日目のラットに [<sup>14</sup>C] ランソプラゾール2mg/kgを静脈内投与したとき、投与15分においてすでに<sup>14</sup>Cは胎児血漿、組織中に検出され、胎児血漿中の<sup>14</sup>Cは母体血漿中よりも高くなった。胎児血漿中<sup>14</sup>Cに占める未変化体の割合は母体血漿中の割合より高く、未変化体は投与24時間後の胎児血漿中にも認められた。

#### ■胎児への移行性

試料	組成	濃度 (µg/mL or µg/g)			
		15分	2時間	6時間	24時間
母体血漿	総 <sup>14</sup> C	2.63±0.33	0.35±0.06	0.17±0.02	0.02±0.00
	未変化体	1.64±0.29	0.15±0.04	0.05±0.01	<0.01
	代謝物	0.99±0.05	0.20±0.02	0.12±0.03	0.02±0.00
胎盤	総 <sup>14</sup> C	1.43±0.23	0.90±0.04	0.51±0.04	0.25±0.03
羊水	総 <sup>14</sup> C	0.88±0.12	1.66±0.15	1.12±0.04	0.24±0.04
胎児血漿	総 <sup>14</sup> C	4.90±1.07	3.06±0.10	1.24±0.33	0.13±0.01
	未変化体	4.24±0.93	2.57±0.06	0.95±0.25	0.03±0.00
	代謝物	0.65±0.15	0.49±0.04	0.30±0.08	0.10±0.01
胎児組織	総 <sup>14</sup> C	1.36±0.19	1.29±0.06	0.57±0.15	0.13±0.00

mean±SD、n=3

(承認時資料：2006年10月)

#### 4 - 3 乳汁中への移行性

(参考) [ラット]

出産14日目のラットに [<sup>14</sup>C] ランソプラゾール 2mg/kg を静脈内投与したとき、<sup>14</sup>Cは乳汁中に検出された。未変化体は6時間後まで検出され、その濃度は血漿中とほぼ同じであった。

##### ■乳汁中への移行性

試料	組成	濃度 (µg/mL or µg/ g)			
		15分	2時間	6時間	24時間
血 漿	総 <sup>14</sup> C	1.57±0.10	0.18±0.03	0.09±0.01	0.02±0.00
	未変化体	0.80±0.07	0.01±0.01	<0.01	<0.01
	代謝物	0.78±0.04	0.17±0.03	0.09±0.01	0.02±0.00
乳 汁	総 <sup>14</sup> C	1.22±0.31	1.13±0.21	0.58±0.05	0.02±0.01
	未変化体	0.57±0.04	0.02±0.00	0.01±0.00	<0.01
	代謝物	0.66±0.29	1.11±0.21	0.58±0.05	0.02±0.01
乳 腺	総 <sup>14</sup> C	1.15±0.04	0.37±0.14	0.22±0.02	0.06±0.00
	未変化体	0.46±0.01	0.01±0.01	<0.01	<0.01
	代謝物	0.69±0.03	0.36±0.14	0.22±0.02	0.06±0.00

mean±SD、n=3

(承認時資料：2006年10月)

#### 4 - 4 髄液への移行性

該当資料なし

#### 4 - 5 その他の組織への移行性

##### (1) 胃粘膜への移行性

(参考) [ラット]

ラットに [ $^{14}\text{C}$ ] ランソプラゾール 2mg/kg を静脈内投与したとき、 $^{14}\text{C}$  は胃粘膜に血漿中よりも高い濃度で移行し、これらの組織中濃度は持続性を示した<sup>9)</sup>。

##### ■胃粘膜への移行性

組織	時間 (h)	濃度 ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ or $\mu\text{g}/\text{g}$ )				
		総 $^{14}\text{C}$	未変化体	代謝物M-I	代謝物M-VI	その他
血 漿	0.25	1.42±0.06	0.60	0.02	0.07	0.73
	2	0.15±0.03	0.01	<0.01	<0.01	0.14
	4	0.08±0.01	<0.01	<0.01	<0.01	0.08
	6	0.08±0.02	<0.01	<0.01	<0.01	0.08
胃 粘 膜	0.25	5.17±0.33	1.00	2.68	0.19	1.30
	2	3.71±0.12	0.04	2.01	0.43	1.23
	4	3.13±0.55	0.05	1.46	0.82	0.80
	6	2.32±0.26	0.03	0.84	0.86	0.59
胃筋肉層	0.25	1.45±0.42				
	2	0.27*	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
	4	0.28±0.03				
	6	0.28±0.02				

mean±SD、n=3、\* : 2例の平均、N. D. : 測定せず

##### (2) 胃粘膜壁細胞への移行性

(参考) [ラット]

ラットに [ $^3\text{H}$ ] ランソプラゾール 10mg/kg を経口投与したとき、 $^3\text{H}$  は胃粘膜壁細胞に選択的に取り込まれ、壁細胞内の現像銀粒子は投与8時間後で最も多く、24時間後も存在した<sup>10)</sup>。

##### ■胃壁細胞への取り込み (ラジオオートグラフの銀粒子の計測)

投与後の時間	壁細胞1個当たりの平均銀粒子数	Dunnrtt's test
1時間	29.1± 9.0	□ p<0.01
8時間	43.5± 7.7	
24時間	27.6±12.6	□ p<0.01

mean±SD、n=2、1匹当たり15個の壁細胞の現像銀粒子を顕微鏡下で計測

### (3) 各組織への移行性

(参考) [ラット]

ラットに [ $^{14}\text{C}$ ] ランソプラゾール 2mg/kg を静脈内投与したとき、 $^{14}\text{C}$  は投与5分で各組織に広く移行した。この時点における  $^{14}\text{C}$  濃度は肝臓で最も高く、次いで副腎、ハーダー腺、腎臓、膵臓、胃壁、顎下腺の順であり、脂肪で最も低かった。脂肪組織及び腸壁では投与30分後に、甲状腺では投与2時間後にピークになった。 $^{14}\text{C}$  濃度はピーク到達後経時的に低下し24時間からほぼ排泄が終了する72時間後にかけて各組織の放射能は低濃度に減少した。

#### ■各組織への移行性

組 織	$^{14}\text{C}$ 濃度 ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ or $\mu\text{g}/\text{g}$ )					
	5分	30分	2時間	6時間	24時間	72時間
血 漿	1.85±0.19	1.16±0.12	0.14±0.01	0.07±0.00	0.02±0.00	0.01±0.00
脳	0.62±0.22	0.12±0.01	0.05±0.00	0.02±0.00	0.01±0.00	0.01±0.00
脊 髄	0.58±0.04	0.17±0.02	0.05±0.01	0.03±0.00	0.01±0.00	0.01±0.00
下 垂 体	3.37±0.16	1.06±0.10	0.24±0.02	0.25±0.03	0.14±0.06	0.13±0.03
眼 球	0.48±0.02	0.16±0.02	0.05±0.00	0.03±0.01	0.01±0.00	0.01±0.00
ハーダー腺	5.36±0.57	1.97±0.33	0.22±0.01	0.16±0.01	0.09±0.00	0.05±0.00
顎 下 腺	3.80±0.18	1.04±0.11	0.14±0.00	0.08±0.01	0.05±0.00	0.03±0.00
甲 状 腺	3.12±0.34	2.90±0.33	5.77±0.60	5.30±0.63	1.14±0.20	0.43±0.04
胸 腺	1.59±0.40	0.53±0.05	0.11±0.00	0.07±0.00	0.04±0.00	0.01±0.00
心 臓	2.81±0.02	0.95±0.08	0.19±0.01	0.12±0.00	0.08±0.01	0.06±0.00
肺	2.49±0.02	1.06±0.04	0.37±0.05	0.21±0.01	0.15±0.00	0.10±0.01
肝 臓	9.71±0.52	5.93±0.85	0.93±0.03	0.62±0.03	0.30±0.02	0.13±0.01
脾 臓	1.77±0.08	0.80±0.06	0.29±0.02	0.21±0.01	0.17±0.01	0.13±0.01
膵 臓	4.31±0.28	1.37±0.27	0.15±0.01	0.09±0.00	0.05±0.00	0.03±0.00
副 腎	5.50±0.11	1.65±0.21	0.36±0.03	0.26±0.01	0.16±0.01	0.09±0.01
腎 臓	4.81±0.26	3.22±0.14	0.72±0.14	0.42±0.02	0.18±0.01	0.12±0.01
精 巢	0.30±0.05	0.24±0.02	0.08±0.00	0.04±0.00	0.02±0.00	0.01±0.00
骨 格 筋	1.38±0.28	0.50±0.06	0.08±0.01	0.05±0.01	0.03±0.00	0.02±0.00
脂 肪	0.17±0.03	0.43±0.02	0.05±0.01	0.03±0.00	0.02±0.00	0.01±0.00
胃 壁	3.82±0.26	3.77±1.47	2.69±0.36	1.77±0.34	0.60±0.08	0.05±0.01
腸 壁	1.95±0.23	2.58±0.18	2.17±0.65	1.03±0.40	0.14±0.03	0.02±0.00

mean±SD, n=3

(承認時資料：2006年10月)

## 5. 代 謝

### 5 - 1 代謝部位及び代謝経路

#### ◇代謝部位

(参考) [in vitro]

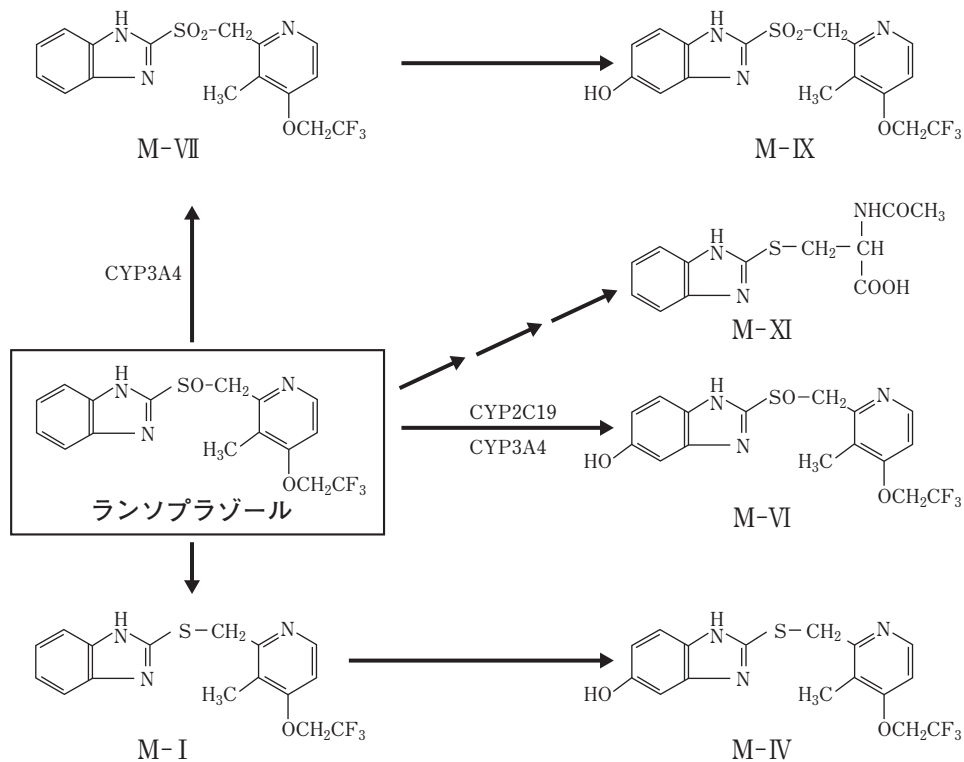
ラットの血漿と組織切片を用いて *in vitro* での代謝部位を検討した。[<sup>14</sup>C] ランソプラゾールは、主に肝臓と血液で代謝され、それらの代謝活性は肝臓で 2.27µg/h/g 組織、血液で 1.16µg/h/g 組織であった。

[<sup>14</sup>C] ランソプラゾールはラットの盲腸内容物によっても代謝される (代謝活性：4.44µg/h/g 内容物) ことから、胆汁から排泄されたランソプラゾール由来成分は腸内細菌によっても代謝されると考えられる<sup>11)</sup>。

#### ◇代謝経路

ヒトでは下記の代謝経路が推定されている。

#### ■ランソプラゾールのヒトにおける推定代謝経路



(承認時資料：2006年10月)



## 5 - 2 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

---

### ◇CYP の分子種

(参考) [in vitro]

主として CYP2C19、CYP3A4 により代謝される。

(承認時資料：2006 年 10 月)

### ◇肝薬物代謝酵素系に対する作用

(参考) [in vitro]

ヒト肝ミクロソームを用いて、各種 CYP 代謝活性に対するランソプラゾールの影響をみたところ、ランソプラゾールは CYP2C19 活性を阻害した。その阻害定数は  $0.383\mu\text{mol/L}$  であった。

他の CYP1A1/1A2、2A6、2B6、2C8/2C9、2D6、2E1、3A4 各分子種に対しては  $10\mu\text{mol/L}$  の濃度以下では影響は認められなかった。

(承認時資料：2006 年 10 月)

## 5 - 3 初回通過効果の有無及びその割合

---

該当しない

## 5 - 4 代謝物の活性の有無及び比率

---

(参考) [ラット、イヌ]

ヒトにおける主たる血中代謝物である M-VI 及び M-VII の酸分泌抑制作用及び抗潰瘍作用はほとんどないか極めて弱かった<sup>12)</sup>。

## 5 - 5 活性代謝物の速度論的パラメータ

---

該当しない

## 6. 排 泄

### 6-1 排泄部位

(参考) [ラット、イヌ]

ラットに [<sup>14</sup>C] ランソプラゾール 2mg/kg を静脈内投与したときの排泄は、72 時間でほぼ終了し、投与した <sup>14</sup>C の 33 % が尿中に、64 % が糞中に排泄された。<sup>14</sup>C の呼気への排泄はほとんど認められなかった。

イヌに [<sup>14</sup>C] ランソプラゾール 2mg/kg を静脈内投与したときの排泄は、96 時間でほぼ終了し、32 % が尿中に 66 % が糞中に排泄された。

#### ■累積排泄率

動 物	時間 (h)	累積排泄率 (投与量に対する %)			
		尿	糞	胆 汁	総排泄率
ラット	4	17.4±3.3	—	—	—
	8	21.7±3.1	—	—	—
	24	31.6±5.3	55.8± 5.5	—	87.4± 1.5
	48	33.0±5.2	63.3± 5.9	—	96.3± 1.1
	72	33.4±5.3	63.9± 6.1	—	97.2± 1.2
	96	33.7±5.5	64.0± 6.1	—	97.7± 1.2
ラット <sup>1)</sup>	2	—	—	76.6±4.6	—
	4	10.0±3.5	—	79.8±4.0	—
	8	11.5±3.8	—	80.7±3.9	—
	24	12.9±4.3	1.6± 0.1 <sup>2)</sup>	81.6±3.8	96.1± 1.0
イヌ	8	24.2±5.0	—	—	—
	24	29.3±4.0	32.9±22.6	—	62.2±23.3
	48	31.8±3.4	62.1± 3.2	—	93.9± 1.1
	72	32.2±3.4	66.0± 4.3	—	98.2± 1.2
	96	32.4±3.4	66.3± 4.2	—	98.7± 1.1
	120	32.6±3.4	66.5± 4.2	—	99.1± 1.1

mean±SD、n=4、—：測定せず、1) 胆管ろう形成ラット(n=3)、2) 消化管内容物を含む。

(承認時資料：2006年10月)

## 6-2 排泄率

健康成人男子にランソプラゾール1回30mgを単回静脈内投与したときの尿中には、ランソプラゾールの未変化体は検出されず、すべて代謝物であり、それらを合計した投与24時間後までの尿中排泄率は12.1～16.9%であった。

### ■単回投与時の24時間尿中累積排泄率(%)

対象	投与方法	例数	代謝物M-IV	代謝物M-VI	代謝物M-IX	合計
健康成人	静注(3分間)	6	4.20±2.23	11.95±6.70	0.75±0.35	16.90±5.32
健康成人	点滴(1時間)	3	4.57±1.98	6.57±3.78	1.00±0.79	12.13±2.55

mean ± SD

(承認時資料：2006年10月)

## 6-3 排泄速度

「VII-6-1 排泄部位」の項参照

## 7. 透析等による除去率

### ◇血液透析

週3回の維持血液透析療法施行中の慢性腎不全患者8例にランソプラゾール1回30mgを1日1回7日間朝食後に経口投与し、4時間透析による除去率を検討した。その結果、投与2日目の血液透析開始2.5時間後の血漿中濃度は、体外循環回路の動脈側212.6±142.0ng/mLに対して、静脈側214.2±146.0ng/mL、開始3.5時間後では動脈側233.6±53.9ng/mL、静脈側252.2±54.0ng/mLと透析による除去は認められなかった<sup>13)</sup>。

## 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

- (1) 本剤の成分に対する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（「Ⅷ－7 相互作用」の項参照）

### 3. 効能・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・用量に関連する使用上の注意とその理由

- (1) 本剤は投与開始から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。（「Ⅴ－3 臨床成績」の項参照）
- (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。

### 5. 慎重投与内容とその理由

- (1) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- (2) 肝障害のある患者 [本剤の代謝、排泄が遅延することがある。]
- (3) 高齢者（「Ⅷ－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こと。
- (2) 噴出性又は湧出性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内視鏡的止血術を行うこと。

## 7. 相互作用

本剤は主として肝薬物代謝酵素 CYP2C19 又は CYP3A4 で代謝される。  
また、本剤の胃酸分泌抑制作用により、併用薬剤の吸収を促進又は抑制することがある。

### 7-1 併用禁忌とその理由

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。

### 7-2 併用注意とその理由

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
テオフィリン	テオフィリンの血中濃度が低下することがある。	本剤が肝薬物代謝酵素を誘導し、テオフィリンの代謝を促進することが考えられている。
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。	本剤が肝薬物代謝酵素におけるタクロリムスの代謝を競合的に阻害するためと考えられている。
ジゴキシン、 メチルジゴキシン	左記薬剤の作用を増強する可能性がある。	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可能性がある。
イトラコナゾール、 ゲフィチニブ、 ボスチニブ水和物	左記薬剤の作用を減弱する可能性がある。 ボスチニブ水和物との併用は可能な限り避けること。	本剤の胃酸分泌抑制作用により左記薬剤の血中濃度が低下する可能性がある。
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。	機序は不明である。
フェニトイン、 ジアゼパム	左記薬剤の代謝、排泄が遅延することが類薬(オメプラゾール)で報告されている。	

## 8. 副作用

### 8-1 副作用の概要

承認時までの試験では、ランソプラゾールとして1回30mgを1日2回投与された221例中31例(14.0%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。主な副作用はALT(GPT)上昇(6.2%)、AST(GOT)上昇(5.7%)、LDH上昇(2.0%)、 $\gamma$ -GTP上昇(1.5%)等の臨床検査値異常変動であった(承認時)。

製造販売後調査では、1,142例中35例(3.1%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。主な副作用は下痢、肝機能異常、肝障害、発熱及び白血球数減少(各0.3%)であった(再審査終了時点)。

## 8 - 2 重大な副作用と初期症状

(いずれも頻度不明)

- (1) アナフィラキシー（全身発疹、顔面浮腫、呼吸困難等）があらわれることがあり、ショックを起こした例もあるので、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、無顆粒球症、溶血性貧血、顆粒球減少、血小板減少、貧血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) 黄疸、AST (GOT)、ALT (GPT) の上昇等を伴う重篤な肝機能障害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) 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) 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) 等があらわれた場合には、速やかに胸部 X 線等の検査を実施し、本剤の投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- (6) 間質性腎炎があらわれ、急性腎不全に至ることもあるので、腎機能検査値 (BUN、クレアチニン上昇等) 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。

(類薬)

類薬 (オメプラゾール) で以下の副作用が報告されている。

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。

## 8 - 3 その他の副作用

	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
1) 過敏症 <sup>注1)</sup>		発疹 <sup>注4)</sup>		掻痒、多形紅斑
2) 皮膚				亜急性皮膚エリテマトーデス
3) 肝臓 <sup>注2)</sup>	AST (GOT)、ALT (GPT) の上昇	AL-P、LDH、 $\gamma$ -GPT の上昇		
4) 血液		好酸球増多		
5) 消化器		下痢	便秘 <sup>注4)</sup> 、味覚異常 <sup>注4)</sup>	口渇、腹部膨満感、悪心、嘔吐、食欲不振、腹痛、カンジダ症、口内炎、舌炎、大腸炎 (collagenous colitis 等 <sup>注3)</sup> を含む)
6) 精神神経系		不眠 <sup>注4)</sup> 、振戦	うつ状態 <sup>注4)</sup>	頭痛、眠気、めまい
7) その他		発熱、尿酸の上昇	脱力感 <sup>注4)</sup>	女性化乳房 <sup>注1)</sup> 、浮腫、倦怠感、舌・口唇のしびれ感、四肢のしびれ感、筋肉痛、脱毛、かすみ目、関節痛、低ナトリウム血症、低マグネシウム血症、総コレステロールの上昇

自発報告あるいは経口製剤で認められた副作用の頻度は不明としている。

注1) このような場合には投与を中止すること。

注2) 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。

注3) 下痢が継続する場合、collagenous colitis 等が発現している可能性があるため、速やかに本剤の投与を中止すること。腸管粘膜に縦走潰瘍、びらん、易出血等の異常を認めることがあるので、下血、血便が認められる場合には、適切な処置を行うこと。

注4) 発現頻度は製造販売後調査の結果に基づく。

8 - 4 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

■副作用の種類別発現頻度

承認時までの調査		特定使用成績調査	
		止血効果・再出血率の検討(①) 急性ストレス潰瘍・急性胃粘膜病変の検討(②)	
調査症例数	221	調査症例数	1142
副作用等の発現症例数	31	副作用等の発現症例数	35
副作用等の発現症例率(%)	14.0%	副作用等の発現症例率(%)	3.06%

副作用等の種類	発現例数(%)	副作用等の種類	発現例数(%)
[神経系障害]	1(0.5)	[感染症および寄生虫症]	1(0.09)
振戦	1(0.5)	尿路感染	1(0.09)
[胃腸障害]	1(0.5)	[血液およびリンパ系障害]	1(0.09)
下痢	1(0.5)	貧血	1(0.09)
[皮膚および皮下組織障害]	1(0.5)	[精神障害]	3(0.26)
多汗症	1(0.5)	不眠症	2(0.18)
[腎および尿路障害]	1(0.5)	落ち着きのなさ	1(0.09)
腎障害	1(0.5)	抑うつ症状	1(0.09)
[全身障害および投与局所様態]	1(0.5)	[神経系障害]	2(0.18)
発熱	1(0.5)	意識レベルの低下	1(0.09)
[臨床検査]	29(13.1)	味覚減退	1(0.09)
血中LDH増加	4/200(2.0)	[胃腸障害]	14(1.23)
血中AL-P減少	1/195(0.5)	便秘	1(0.09)
血中AL-P増加	1/195(0.5)	下痢	3(0.26)
好酸球数増加	2/165(1.2)	出血性十二指腸潰瘍	1(0.09)
単球数増加	1/165(0.6)	胃出血	7(0.61)
白血球数減少	2/220(0.9)	出血性胃潰瘍	1(0.09)
白血球数増加	1/220(0.5)	小腸出血	1(0.09)
ALT(GPT)減少	1/211(0.5)	[肝胆道系障害]	7(0.61)
ALT(GPT)増加	13/211(6.2)	胆管炎	1(0.09)
AST(GOT)増加	12/212(5.7)	肝機能異常	3(0.26)
血中ビリルビン増加	1/204(0.5)	肝障害	3(0.26)
γ-GTP増加	3/195(1.5)	[皮膚および皮下組織障害]	3(0.26)
血中トリグリセリド増加	2/173(1.2)	薬疹	1(0.09)
血中尿酸減少	2/177(1.1)	発疹	2(0.18)
血中尿酸増加	1/177(0.6)	[筋骨格系および結合組織障害]	1(0.09)
血中クレアチニン増加	1/214(0.5)	筋力低下	1(0.09)
BUN増加	1/212(0.5)	[一般・全身障害および投与部位の状態]	3(0.26)
血中クロール増加	1/208(0.5)	発熱	3(0.26)
血中カリウム増加	1/212(0.5)	[臨床検査]	6(0.53)
血中アミラーゼ増加	1/1(100)	好酸球数増加	1(0.09)
		血小板数減少	1(0.09)
		白血球数減少	3(0.26)
		血中クレアチニン増加	1(0.09)

特定使用成績調査①及び②の併合集計

ICH 国際医薬用語集日本語版 (MedDRA/J) に記載されている用語 (Preferred Term : 基本語) で表示している。  
(承認時集計 : 2006 年 10 月)、(再審査資料集計 : 2016 年 9 月)

8 - 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

8 - 6 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

◇禁忌

本剤の成分に対する過敏症の既往歴のある患者

◇慎重投与

薬物過敏症の既往歴のある患者

◇重大な副作用

経口製剤で、アナフィラキシー（全身発疹、顔面浮腫、呼吸困難等）があらわれることがあり、ショックを起こした例もあるので、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。

◇その他の副作用

経口製剤で、発疹、瘙痒の副作用が報告されている。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下している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治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ投与すること。[動物試験（ラット、経口）において胎児血漿中濃度は母動物の血漿中濃度より高いことが認められている。また、ウサギ（経口 30mg/kg/日）で胎児死亡率の増加が認められている。]
- (2) 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。[動物試験（ラット、経口）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

該当資料なし

### 14. 適用上の注意

- (1) **投与経路**：本剤は静脈内注射にのみ使用すること。
- (2) **溶解後**：経時変化を生じることがあるため、溶解後は速やかに使用することとし保存しないこと。
- (3) **配合変化**：配合変化による変色、沈殿物を生じることがあるため、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はしないこと。
- (4) **投与方法**：本剤を投与する場合は、専用の経路を用いることとし他剤と共用しないこと。やむを得ず、他剤の輸液経路を用いて側管から投与する場合は、他剤の注入を休止し、本剤を投与する前後に日局生理食塩液又は日局5%ブドウ糖注射液でフラッシュすること。

### 15. その他の注意

- (1) ラットに52週間強制経口投与した試験で、50mg/kg/日群（臨床用量の約100倍）において1例に良性の精巣間細胞腫が認められている。さらに、24ヵ月間強制経口投与した試験で、15mg/kg/日以上群において良性の精巣間細胞腫の発生増加が、また、5mg/kg/日以上群において胃のカルチノイド腫瘍が認められており、加えて、雌ラットの15mg/kg/日以上及び雄ラットの50mg/kg/日以上群で網膜萎縮の発生頻度の増加が認められている。精巣間細胞腫及び網膜萎縮については、マウスのがん原性試験、イヌ、サル毒性試験では認められず、ラットに特有な変化と考えられる。
- (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のうえ投与すること。
- (3) 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。
- (4) 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

#### 1-1 薬効薬理試験（「Ⅵ：薬効薬理に関する項目」参照）

#### 1-2 副次的薬理試験

該当資料なし

#### 1-3 安全性薬理試験

ランソプラゾールの一般薬理作用を各種動物を用いて検討した。

##### 1) 一般症状、中枢及び体性神経系に対する作用

マウス (1,000mg/kg、経口投与) で軽度な全身の筋緊張の低下、マウス (30～300mg/kg、経口投与) で自発運動量の減少、ペントバルビタールの1時間前処置でマウス (30～300mg/kg、経口投与) 及びラット (100mg/kg、経口投与) で睡眠時間の延長、24時間前処置でマウス (300mg/kg、経口投与) で睡眠時間の短縮がみられた。

ペントバルビタール睡眠時間に対する作用のうち、睡眠時間の増強作用は肝臓の薬物代謝酵素阻害、睡眠時間の短縮作用は薬物代謝酵素誘導によるもので、中枢及び体性神経系に対しては特定の作用を有していないものと考えられた<sup>14)</sup>。

##### 2) 循環器系、自律神経系、腎機能及び消化器系に対する作用

モルモット摘出心房標本に対して、高用量 (10<sup>-4</sup>M) で左心房の収縮力の軽度な増加と右心房の自然拍動数の軽度な減少及び摘出平滑筋に対して、高用量 (10<sup>-4</sup>M) で軽度な抑制作用がみられたが、その他は明らかな作用を示さなかった<sup>14)</sup>。

##### 3) ホルモンに対する作用

ラット (150mg/kg/日、4週間経口投与) で、血清及び精巢中テストステロンの低値、血清及び下垂体中LHの高値が認められた。この血清テストステロンの低値は、50～500mg/kg/日を1又は2週間経口投与したラットにおけるhCG負荷試験でも認められた。また、*in vitro*において3.2µg/mL以上の濃度で精巢間細胞のテストステロン生合成抑制作用を示した。抗アンドロジェン及びエストロジェン作用は認められなかった。

(承認時資料：1992年10月)

#### 1-4 その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

#### 2-1 単回投与毒性試験

(概略の致死量、mg/kg)

投与経路	動物種		マウス		ラット	
	♂	♀	♂	♀	♂	♀
静脈内投与	167～218	>218	>167	128～167		

(承認時資料：2006年10月)

## 2-2 反復投与毒性試験

動物種	例数	投与期間	投与経路	投与量 (mg/kg/日)
ラット	20	4週間	静脈内	3、10、30
	20	13週間	静脈内	3、10、30、60
イヌ	6	4週間	静脈内	3、10、30
	6	13週間	静脈内	3、10、30

ラットにおいて胃主細胞の肥大・分泌顆粒の好酸性増加並びに肝酵素誘導がみられ、投薬期間の延長に伴い胃主細胞の過形成及び好銀性細胞の増加、肝細胞の肥大が認められた。ラット4及び13週試験における無毒性量は各10mg/kg/日であった。

イヌにおいては、胃壁細胞の空洞化・壊死、胃主細胞の分泌顆粒に好酸性増加及び壊死がみられ、胃の変化は本剤の薬理作用に起因したものと考えられたが、壁細胞あるいは主細胞の壊死は程度が強いものは毒性と判断した。また、肝臓の変化は薬物代謝酵素誘導に伴う変化と考えられた。イヌ4及び13週試験における無毒性量は各3及び10mg/kg/日であった。

(承認時資料：2006年10月)

## 2-3 生殖発生毒性試験

	動物種	投与量 (mg/kg/日)	投与期間	無毒性量 (mg/kg/日)	
				親動物	胎児・出生児
妊娠前及び妊娠初期投与試験	ラット	3、10、30	雄：交配前9週間その後4週間 雌：交配前2週間～妊娠7日まで	10	30
器官形成期投与試験	ラット	3、10、30	妊娠6～17日	10	10
器官形成期投与試験	ウサギ	3、10、30	妊娠6～18日	10	>30
周産期及び授乳期投与試験	ラット	3、10、30	妊娠15日～分娩後21日	10	10

(投与経路は静脈内)

ラット妊娠前及び妊娠初期投与試験、ウサギ器官形成期投与試験及びラット周産期及び授乳期投与試験において、親動物の生殖機能及び胎児の発生に異常はみられなかった。ラット器官形成期投与試験においては胎児体重の低値がみられたが、催奇形性はみられなかった。また、同試験における出生児観察では30mg/kg/日群で頸肋の発現頻度の高値がみられたが、これは母動物の体重増加抑制やストレスに起因した二次的变化と考えられた。

(承認時資料：2006年10月)

## 2 - 4 その他の特殊毒性

---

### (1) 抗原性試験

マウス及びモルモットを用いた試験では抗原性は認められていない<sup>15)</sup>。

### (2) 変異原性試験

*in vivo* / *in vitro* 不定期DNA合成試験、細菌による復帰変異試験、培養細胞による遺伝子突然変異試験、培養細胞による染色体異常試験及びマウス小核試験において変異原性は認められていない。

(承認時資料：1992年10月)

### (3) がん原性試験

マウスに15、75、150、300mg/kg/日、また、ラットに5、15、50mg/kg/日及び5、25、75、150mg/kg/日を各々24ヵ月間連日経口投与した試験では、ラットの15mg/kg/日以上  
の群で、本薬による長期にわたる持続的なLH刺激の結果と考えられる良性の精巣間  
細胞腫の発生増加が、また、ラットの各群に、本薬の薬理作用に基づく持続的高ガス  
トリン血症が原因と考えられる胃のカルチノイド腫瘍が認められた以外には、がん原  
性を示唆する所見は認められていない。

なお、雌ラットの15mg/kg/日以上及び雄ラットの50mg/kg/日以上の群で網膜萎縮の  
発生頻度の増加が認められたが、マウスのがん原性試験、イヌ、サルの毒性試験では  
認められず、ラットに特有な変化と考えられる。

(承認時資料：1992年10月)

### (4) 局所刺激性試験

生理食塩液、5%ブドウ糖溶液で溶解した場合に、いずれも静脈刺激性は弱く、回復  
性は良好であった。溶血性試験では本剤を静脈内投与した場合には溶血は起こらない  
と判断した。

(承認時資料：2006年10月)

## X：管理的事項に関する項目

1. 規制区分 \_\_\_\_\_  
製 剤：タケプロン静注用 30mg 注意－医師等の処方箋により使用すること  
有効成分：ランソプラゾール 該当しない
  
2. 有効期間又は使用期限 \_\_\_\_\_  
36 ヶ月（使用期限内であっても開封後はなるべく速やかに使用すること。）
  
3. 貯法・保存条件 \_\_\_\_\_  
室温保存
  
4. 薬剤取扱い上の注意点 \_\_\_\_\_
  - 4－1 薬局での取り扱いについて \_\_\_\_\_
    - (1) 投与経路：本剤は静脈内注射にのみ使用すること。
    - (2) 溶 解 後：経時変化を生じることがあるため、溶解後は速やかに使用することとし保存しないこと。
    - (3) 配合変化：配合変化による変色、沈殿物を生じることがあるため、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はしないこと。
    - (4) 投与方法：本剤を投与する場合は、専用の経路を用いることとし他剤と共用しないこと。やむを得ず、他剤の輸液経路を用いて側管から投与する場合は、他剤の注入を休止し、本剤を投与する前後に日局生理食塩液又は日局 5%ブドウ糖注射液でフラッシュすること。
  
  - 4－2 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等） \_\_\_\_\_  
該当しない
  
5. 承認条件等 \_\_\_\_\_  
該当しない
  
6. 包 装 \_\_\_\_\_  
10 バイアル
  
7. 容器の材質 \_\_\_\_\_  
注射用ガラス容器（紫外線吸収剤入り無色透明のUV カットフィルムで被覆）  
紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：タケプロンカプセル・OD錠、スタンゾームカプセル・OD錠、タイプロトンカプセル、タピゾールカプセル、ラソプランカプセル・OD錠、ランソプラゾールカプセル・OD錠、ランソラルカプセル

同効薬：オメプラゾール、ラベプラゾールナトリウム、ファモチジン等のH<sub>2</sub>受容体拮抗薬等

9. 国際誕生年月日

1990年12月31日(フランス)

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日：2006年10月20日

承認番号：21800AMZ10392

11. 薬価基準収載年月日

2006年12月1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

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

再審査結果公表年月日：2016年9月30日

内容：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第14条第2項第3号イからハまでのいずれにも該当しない。

14. 再審査期間

6年：2006年10月20日～2012年10月19日

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
タケプロン静注用30mg	117702201	2329404F1020	620004427

17. 保険給付上の注意

該当しない

## XI：文 献

### 1. 引用文献

---

- 1) 鎌田武信, 他：臨床医薬 1996, 12 : 2739
- 2) 鎌田武信, 他：臨床医薬 1996, 12 : 2885
- 3) 鎌田武信, 他：臨床医薬 1996, 12 : 2901
- 4) 蘆田潔, 他：薬理と治療 2007, 35 : 503
- 5) Nagaya H.,et al. : J.Pharmacol.Exp.Ther. 1989, 248 : 799
- 6) Nagaya H.,et al. : J.Pharmacol.Exo.Ther. 1990, 252 : 1289
- 7) 長屋秀明, 他：日本臨牀 1992, 50 : 26
- 8) 佐藤文彦, 他：薬理と治療 2005, 33 : 113
- 9) 三輪清, 他：薬理と治療 1990, 18 : 3413
- 10) Sekiguchi M.,et al. : Acta Histochem. Cytochem. 1992, 25 : 405
- 11) 小林卓郎, 他：薬理と治療 1990, 18 : 3437
- 12) 稲富信博, 他：薬理と治療 1991, 19 : 477
- 13) 中尾俊之, 他：新薬と臨牀 1995, 44 : 45
- 14) 鬼頭剛, 他：薬理と治療 1990, 18 : 3907
- 15) 土井孝良 他：薬理と治療 1990, 18(suppl.10) : 2785

### 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

---

インドネシア等で販売されている（2019年3月現在）。

### 2. 海外における臨床支援情報

---

該当しない



## XIII：備 考

その他の関連資料

---

該当しない

