

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018に準拠して作成

H₂受容体拮抗剤

日本薬局方

注射用ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩

アルタット[®] 静注用75mg

ALTAT[®] FOR I.V. INJECTION

剤形	注射剤（凍結乾燥製剤）
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1バイアル中 日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 75mg
一般名	和名：ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩（JAN） 洋名：Roxatidine Acetate Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2012年2月13日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2020年6月19日（剤形変更による） 販売開始年月日：1995年3月23日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：あすか製薬株式会社 販売元：武田薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	あすか製薬株式会社 くすり相談室 TEL 0120-848-339 FAX 03-5484-8358 医療関係者向けホームページ https://www.aska-pharma.co.jp/medical/index.html

本IFは2020年2月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）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医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFは紙媒体の冊子としての提供方式からPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDAと略す）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されて入手可能となっている。日病薬では、2008年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切に審査・検討している。

この度、2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、新たに日病薬医薬情報委員会が記載要領を改め、「IF記載要領2018」として公表された。

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。

IF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。ただし、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（以下、薬機法と略す）に基づく承認事項を逸脱するもの、製薬企業の機密等に関わ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の提供は、電子媒体を基本とし、必要に応じて薬剤師が印刷して使用する。製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより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、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「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、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I F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いただきたい。しかし、薬機法の広告規制や医療用医薬品プロモーションコード等により、製薬企業が提供できる情報の範囲には自ずと限界がある。I F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。

(2018年10月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目	14
1. 開発の経緯	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	14
2. 製品の治療学的特性	1	2. 薬理作用	14
3. 製品の製剤学的特性	1	VII. 薬物動態に関する項目	16
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	1. 血中濃度の推移	16
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	2. 薬物速度論的パラメータ	19
6. RMPの概要	2	3. 母集団（ポピュレーション）解析	19
II. 名称に関する項目	3	4. 吸収	19
1. 販売名	3	5. 分布	20
2. 一般名	3	6. 代謝	21
3. 構造式又は示性式	4	7. 排泄	22
4. 分子式及び分子量	4	8. トランスポーターに関する情報	22
5. 化学名（命名法）又は本質	4	9. 透析等による除去率	22
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	10. 特定の背景を有する患者	23
III. 有効成分に関する項目	5	11. その他	23
1. 物理化学的性質	5	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	24
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6	1. 警告内容とその理由	24
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6	2. 禁忌内容とその理由	24
IV. 製剤に関する項目	7	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	24
1. 剤形	7	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	24
2. 製剤の組成	7	5. 重要な基本的注意とその理由	24
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	24
4. 力価	8	7. 相互作用	26
5. 混入する可能性のある夾雑物	8	8. 副作用	27
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	30
7. 調製法及び溶解後の安定性	9	10. 過量投与	30
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	9	11. 適用上の注意	30
9. 溶出性	10	12. その他の注意	30
10. 容器・包装	10	IX. 非臨床試験に関する項目	31
11. 別途提供される資材類	10	1. 薬理試験	31
12. その他	10	2. 毒性試験	31
V. 治療に関する項目	11	X. 管理的事項に関する項目	33
1. 効能又は効果	11	1. 規制区分	33
2. 効能又は効果に関連する注意	11	2. 有効期間	33
3. 用法及び用量	11	3. 包装状態での貯法	33
4. 用法及び用量に関連する注意	11	4. 取扱い上の注意	33
5. 臨床成績	12		

5. 患者向け資料	33
6. 同一成分・同効薬.....	33
7. 国際誕生年月日	33
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価 基準収載年月日、販売開始年月日	33
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更 追加等の年月日及びその内容	34
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び その内容	34
11. 再審査期間	34
12. 投薬期間制限に関する情報.....	34
13. 各種コード	34
14. 保険給付上の注意	34
X I. 文献.....	35
1. 引用文献	35
2. その他の参考文献.....	36
X II. 参考資料	37
1. 主な外国での発売状況	37
2. 海外における臨床支援情報	37
X III. 備考.....	38
その他の関連資料.....	38
配合変化表	1
pH 変動試験.....	10

略語集

略語	略語の内容
DHEA-S	デヒドロエピアンドロステロンサルフェート
FSH	卵胞刺激ホルモン
HPLC	高速液体クロマトグラフィー
LH	黄体化ホルモン
PCA	受動皮膚アナフィラキシー
TEN	中毒性表皮壊死融解症
TLC	薄層クロマトグラフィー

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アルタット（ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩）は、ヒスタミンの基本構造にとらわれることなく、帝国臓器製薬（現あすか製薬）独自の研究により開発された H₂ 受容体拮抗剤（H₂ ブロッカー）である。化学構造は従来の H₂ ブロッカーと異なり、基本骨格は 6 員環（ベンゼン環）で、側鎖は単純なアミド結合を有している。

従来、H₂ 受容体拮抗作用の発現には、シメチジンのグアニジノ基 $[-NHC(NCN)NHCH_3]$ 及びラニチジンのエテンジアミノ基 $[>C=C< \begin{matrix} NH- \\ NH-CH_3 \end{matrix}]$ に示される 2 個以上の N-H 基が必須であると考えられていた。当社では上記部分構造のかわりに生体内に多く存在し、かつ安定性のあるアミド結合 $[-NHCO-]$ を導入しても H₂ 受容体に対して高い親和性が得られることを見出した。種々の検討の中から本化合物アルタット（ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩）を合成した。

アルタット注 75 は、上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）、麻酔前投薬の効能・効果を有する静脈内投与する注射剤として開発し、1995 年 1 月に承認された。

その後、医療事故防止対策として注射部位及び成分含量単位を表示した「アルタット静注用 75mg」に販売名を変更し、2012 年 2 月に承認された。

2. 製品の治療学的特性

- ①胃酸分泌抑制作用を示す。（「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照）
- ②1 日 2 回投与により、上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）に対してすみやかな止血効果を示す。（「V. 5. (4) 検証的試験」の項参照）
- ③嚥下性肺炎の発生防止を目的とした麻酔前投薬において、胃液量の減少、胃液 pH の上昇に効果を示す。（「V. 5. (4) 検証的試験」の項参照）
- ④副作用（臨床検査値異常を含む）の発現率は 3.44%（4,533 例中 156 例）で、主なものは AST（GOT）・ALT（GPT）上昇、白血球減少、好酸球増多等であった（再審査終了時）。（「VIII. 8. (3) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧」の項参照）

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（いずれも 0.1%未満）。また、他の H₂ ブロッカー（類薬）でアナフィラキシー様症状、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（頻度不明）。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加リスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

設定されていない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

アルタット® 静注用 75mg

(2) 洋名

ALTAT® FOR I.V. INJECTION

(3) 名称の由来

「アルタット」、「ALTAT」の名称は、ULCEROSTATIC [潰瘍の発育（進行）を阻止する] という語に由来している。

AL TAT
↓ ↓
-STAT...

「一定に保たせるもの」「発育（進行）を阻止するもの」の意

ULCERO... ULCER は潰瘍を意味し、アルサーと発音するが、ウルサーとも読めるので、UをAとした。

従って、「ALTAT」「アルタット」とは、「潰瘍の進行を阻止し、治癒状態にするもの」という意味である。

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）

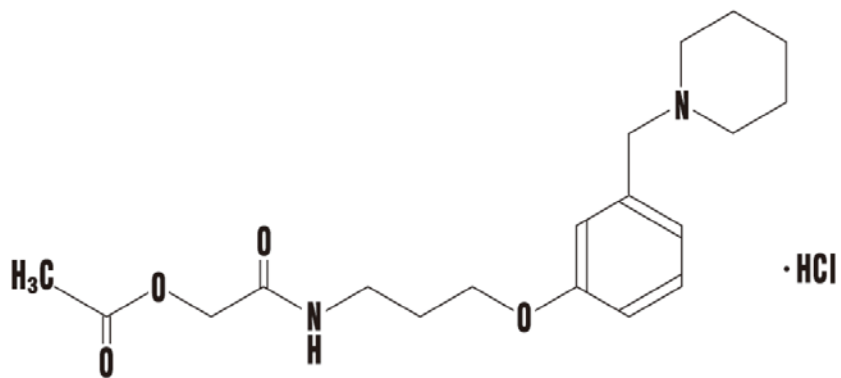
(2) 洋名（命名法）

Roxatidine Acetate Hydrochloride（JAN）

(3) ステム

シメチジン系ヒスタミン H₂ 受容体拮抗剤：-tidine(x)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₉H₂₈N₂O₄ · HCl

分子量：384.90

5. 化学名（命名法）又は本質

(3-{3-[(Piperidin-1-yl)methyl]phenoxy}propylcarbamoyl)methyl acetate monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

治験番号：TZU-0460

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ある。

(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。

測定温度：20±5℃

溶 液	溶解性 (mL/g)	溶解性用語
水	0.6	極めて溶けやすい
酢酸（100）	1.4	溶けやすい
クロロホルム	4.0	溶けやすい
エタノール（99.5）	50	やや溶けにくい
無水酢酸	550	溶けにくい
エーテル	>10000	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性¹⁾

40℃、相対湿度 75%の条件下で 6 カ月間放置するとき、吸湿性を認めない。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：147～151℃（乾燥後）

(5) 酸塩基解離定数¹⁾

pKa=9.3

(6) 分配係数¹⁾

pH	3	4	5	6	7	8	9
分配係数（クロロホルム/緩衝液 [※] ）	0.01	0.06	0.44	2.73	29.6	105	336

測定温度：25℃ ※Britton-Robinson 緩衝液

(7) その他の主な示性値

分子吸光係数¹⁾ (ϵ) [エタノール（95.5）]：2.29×10³（277nm）、2.07×10³（283.5nm）

水溶液（1→20）の pH：4.0～6.0

2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験	条件	保存期間	保存形態	結果	
長期保存試験	室温	36 カ月	ポリエチレン製袋 (無色透明)	変化なし	
苛酷試験	温度 ・ 湿度	40℃、75%RH	6 カ月	シャーレ	変化なし
		100℃	30 時間	ガラス瓶：開栓状態 (無色透明)	変化なし
	光	蛍光灯照射 (15W 下 30cm)	6 カ月	シャーレ	変化なし
		キセノン光照射 (500W 下 40cm)	72 時間	シャーレ	48 時間で表面が淡黄色に変化したが他の試験項目に異状は認められなかった
水溶液中の 安定性試験	pH 1.2、40℃	30 時間	無色アンプル	30 時間後の M-1 生成率は約 61%、M-4 生成率は約 0.56% であった*	
	pH 6.8、40℃	30 時間	無色アンプル	30 時間後の M-1 生成率は 14%であった*	

試験項目：外観、確認試験、pH、融点、溶状、TLC、HPLC、乾燥減量、定量

※M-1、M-4については「IV. 製剤に関する項目」を参照。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

①確認試験法

日本薬局方「ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法

赤外吸収スペクトル測定法

塩化物の定性反応

②定量法

日本薬局方「ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩」の定量法による。

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

注射剤

(2) 製剤の外観及び性状

バイアル（白色の塊又は粉末の凍結乾燥製剤）

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

本品 1 管を生理食塩液 20mL に溶かした場合（無色澄明）

pH	3.5~4.5
浸透圧比	約 1（生理食塩液に対する比）

(5) その他

容器中の気体：窒素

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

①有効成分（活性成分）の含量

1 バイアル中 日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩を 75mg 含有

②添加剤

1 バイアル中 グリシン 75mg、pH 調節剤

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

合成工程で微量混入する可能性のある副生成物及び予想される分解物は以下のとおりである。

化学名	構造式*	由来
2-Hydroxy-N-(3-{3-[(piperidin-1-yl)methyl]phenoxy}propyl)acetamide monohydrochloride (M-1 塩酸塩)		副生成物 分解物
N-(3-{3-[(Piperidin-1-yl)methyl]phenoxy}propyl)acetamide monohydrochloride (N-アセチル-M-4 塩酸塩)		副生成物
3-{3-[(Piperidin-1-yl)methyl]phenoxy}propylamine (M-4)		分解物
3-[(Piperidin-1-yl)methyl]phenol (M-3)		分解物

(* : 社内資料の標記に従った)

6. 製剤の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40℃	6 ヶ月	バイアル	変化なし

試験項目：性状、確認試験、pH、純度試験（溶状）、エンドトキシン、製剤均一性（質量偏差試験）、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌、定量

7. 調製法及び溶解後の安定性

①調製法

1 バイアルに日局生理食塩液又は日局ブドウ糖注射液 20mL を加えて溶解する。

なお、点滴静注する場合は、溶解した液を輸液に混合する。

②溶解後の安定性

<参考>

- 1) アルタット静注用 75mg 2 管を日局注射用水、日局生理食塩液、日局 5%ブドウ糖注射液の各 20mL で溶解後、室温に 1 週間保存しロキサチジン酢酸エステル塩酸塩の残存率を検討したところ、変化は認められなかった。

溶解液	容量	時間	残存率
日局注射用水	20mL	1 週間後	100%
日局生理食塩液	20mL	1 週間後	99%
日局 5%ブドウ糖注射液	20mL	1 週間後	100%

- 2) アルタット静注用 75mg 1 管を日局注射用水、日局生理食塩液、日局 5%ブドウ糖注射液、輸液用電解質液（ソリタ T3 号：清水製薬）の各 20mL 又は 500mL で溶解後、室温で 48 時間保存し、性状、pH、ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩の残存率を検討したところ、変化は認められなかった。

溶解液	容量	時間	性状	pH	残存率
日局注射用水	20mL	溶解直後	無色澄明な液体	4.0	100%
		48 時間後	同上	4.0	100%
日局生理食塩液	20mL	溶解直後	無色澄明な液体	4.0	100%
		48 時間後	同上	4.0	100%
	500mL	溶解直後	無色澄明な液体	4.6	100%
		24 時間後	同上	4.6	101%
48 時間後	同上	4.6	100%		
日局 5%ブドウ糖注射液	20mL	溶解直後	無色澄明な液体	4.0	100%
		48 時間後	同上	4.0	100%
	500mL	溶解直後	無色澄明な液体	4.2	100%
		24 時間後	同上	4.3	97%
48 時間後	同上	4.3	98%		
輸液用電解質液	500mL	溶解直後	無色澄明な液体	5.0	100%
		24 時間後	同上	5.0	99%
		48 時間後	同上	5.0	99%

(3 ロット平均)

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

巻末を参照

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

10 バイアル

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

バイアル：無色ガラス

ゴム栓：ブチルゴム

フィリップキャップ：アルミ

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

<参考>

フィルター通過性

アルタット静注液 75mg 1管を日局 生理食塩液 20mL、又は5%ブドウ糖注射液 20mLで溶解後、ポール輸液フィルターELD（材質：ナイロン 66、孔径：0.2 μ m、日本ポール(株)）により、ろ過したところ、残存率はいずれの場合も 99%であった。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）、麻酔前投薬

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

〈上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）〉

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を日局生理食塩液又は日局ブドウ糖注射液20mLにて溶解し、1日2回（12時間毎）緩徐に静脈内投与する。又は輸液に混合して点滴静注する。なお、年齢、症状により適宜増減する。一般的に1週間以内に効果の発現をみるが、内服可能となった後は経口投与に切りかえる。

〈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を日局生理食塩液又は日局ブドウ糖注射液20mLにて溶解し、麻酔導入1時間前に緩徐に静脈内投与する。

〈参考〉

腎機能障害患者へのアルタット静注液75mg投与の目安として、下記のような投与方法が考えられる。

正常者	腎機能低下患者 (Ccr60mL/分未満)	透析患者
1日2バイアル (150mg/日)	1日1バイアル (75mg/日)	1日1/2バイアル (37.5mg/日)

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

「V.5(3) 用量反応探索試験」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験²⁾

健康成人 2 名、3 名、5 名、3 名に本剤 25mg、50mg、75mg、150mg をそれぞれ単回静脈内投与、また、健康成人 5 名に本剤 75mg を 1 日 2 回 3 日間連続投与した結果、臨床症状及び各種臨床検査に特記すべき異常を認めなかった。

注) 本剤の承認されている用法・用量は上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）に対して 1 回 75mg を 1 日 2 回（12 時間ごと）に静脈内投与又は点滴静注、麻酔前投薬に対して麻酔導入 1 時間前に 1 回 75mg を静脈内投与である。

(3) 用量反応探索試験³⁾

上部消化管出血患者 117 名を対象に、本剤 1 回 37.5mg、75mg 又は 150mg を 1 日 2 回（12 時間ごと）静脈内投与したときの上部消化管出血に対する止血効果を二重盲検法により比較検討した。その結果、本剤は上部消化管出血の治療に対して臨床上有用であり、1 回 75mg 1 日 2 回の静脈内投与方法が至適であると結論された。

注) 本剤の承認されている用法・用量は上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）に対して 1 回 75mg を 1 日 2 回（12 時間ごと）に静脈内投与又は点滴静注である。

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

① 上部消化管出血⁴⁾

上部消化管出血の患者 94 名を対象に本剤 75mg 1 日 2 回静脈内投与の上部消化管出血に対する臨床的有用性についてシメチジンを対照薬とする二重盲検比較試験において確認した。その結果、本剤は上部消化管出血に対し 1 回 75mg 1 日 2 回静脈内投与でシメチジン 200mg 1 日 4 回静脈内投与と同等の臨床的有用性を示した。

② 麻酔前投薬⁵⁾

全身麻酔を必要とする患者 54 名を対象に本剤 75mg の麻酔導入 1 時間前静脈内投与の麻酔前投薬としての臨床的有用性及び安全性についてプラセボを対照とした二重盲検比較試験において検討した。その結果、胃液に対する効果判定及び胃液に対する総合効果判定においてロキサチジン酢酸エステル塩酸塩群がプラセボ群より有意に優れていた。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

H₂受容体拮抗剤

一般名：シメチジン、塩酸ラニチジン、ファモチジン、ニザチジン、ラフチジン

注 意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

胃粘膜壁細胞のヒスタミン H₂受容体を選択的に遮断することにより胃酸分泌抑制作用を示す。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

<ヒトでの作用>

① 胃酸分泌抑制作用

i. 基礎分泌⁶⁾

健康成人に本剤 75mg を静脈内投与した結果、投与後 3 時間の総酸分泌量は 92.6%抑制された。

ii. ペンタガストリン刺激分泌⁷⁾

健康成人に本剤 75mg を静脈内投与した結果、ペンタガストリン (6µg/kg) 筋注による刺激後 90 分間の総酸分泌量は 90.0%抑制された。

iii. 24 時間分泌⁸⁾

消化性潰瘍患者に本剤 1 回 75mg を 1 日 2 回 (12 時間ごと) 静脈内投与した結果、胃内の pH は著明に上昇した。24 時間の平均 pH は 4.39 とプラセボ投与時 (2.66) より有意に上昇した。

② ペプシン分泌抑制作用

健康成人に本剤 75mg を静脈内投与した結果、投与後 3 時間の総ペプシン分泌量は 85.5%抑制された⁶⁾。また、健康成人に本剤 75mg を静脈内投与した結果、ペンタガストリン (6µg/kg) 筋注による刺激後 90 分間の総ペプシン分泌量は 65.4%抑制された⁷⁾。

③ 血清ガストリンに及ぼす影響

上部消化管出血患者に本剤 1 日 150mg を 7 日間静脈内投与した結果、血清ガストリン値は投与前後において有意な変動は認められなかった⁹⁾。

注射剤の第 I 相試験において健康成人に本剤 1 日 150mg を 3 日間静脈内投与した結果、1 例において血清ガストリン値が投与 15 及び 30 分後に約 400pg/mL に上昇した²⁾。

④血清プロラクチン等に及ぼす影響⁹⁾

上部消化管出血患者に本剤 1 日 150mg を 7 日間静脈内投与した結果、血清プロラクチン、血清 LH、FSH、テストステロン、エストラジオール、DHEA-S 及びコルチゾールは投与前後において臨床上問題となる変動を示さなかった。

⑤胃液内ヘキソサミン量に対する作用⁶⁾

健康成人に本剤 75mg を静脈内投与した結果、胃液中のヘキソサミン濃度は有意に増加したが、ヘキソサミン分泌量には有意な変動は認められなかった。

<動物での作用>

①実験的急性胃出血に対する作用¹⁰⁾

ラットの実験的急性胃出血に対し、用量依存的に胃出血量を抑制した。

②胃粘膜電位差に対する作用¹¹⁾

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 25mg/kg を静脈内投与した結果、基礎状態の胃粘膜電位差には影響がみられなかったが、アスピリン胃内注入による胃粘膜電位差の低下は有意に抑制された。

③胃粘膜血液量及び粘膜内ヘモグロビン酸素飽和度に対する作用¹²⁾

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 10mg/kg を静脈内投与した結果、基礎状態の粘膜血液量及び粘膜内ヘモグロビン酸素飽和度には影響がみられなかったが、脱血ショックによるこれら指標の低下は有意に抑制された。

④胃粘膜プロスタグランジン産生能に対する作用¹³⁾

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 200mg/kg を経口投与した結果、胃粘膜のプロスタグランジン E₂ 及びプロスタグランジン I₂ の産生能を低下させなかった。

⑤胃粘膜障害抑制作用¹⁴⁾

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 30mg/kg を腹腔内投与した結果、無水エタノール、0.6N 塩酸及び 0.2N 水酸化ナトリウム投与による胃粘膜障害の発生を有意に抑制した。

⑥胃粘液生合成・分泌増加作用

ラットに胃組織培養系において粘液生合成増加作用が認められた (in vitro)¹⁵⁾。また、ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 50、100 及び 200mg/kg を経口投与した結果、100mg/kg 以上で胃粘液分泌を増加させた¹⁶⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

胃酸分泌 50%抑制濃度 (IC₅₀ 値) : 64.1 ± 5.8 ng/mL

(健康成人及び消化性潰瘍患者 8 例、経管的胃内注入)

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

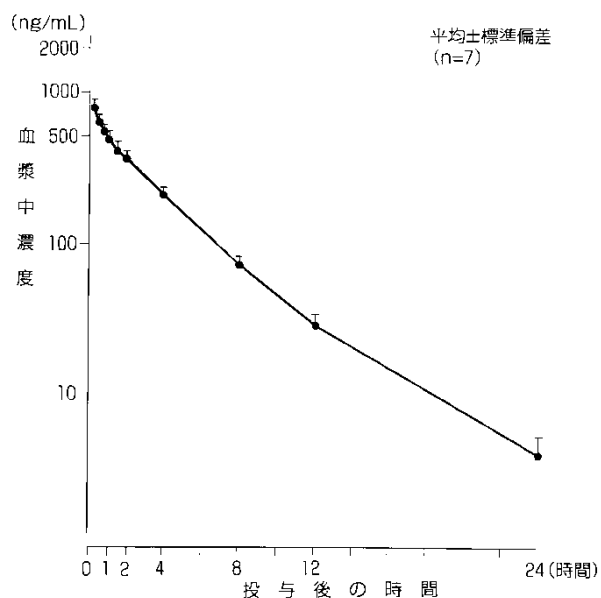
①健康成人

健康成人に 1 回 75mg を静脈内投与した結果、最大血漿中濃度は 773ng/mL、血漿中半減期は 3.36 時間であった。

また、健康成人に 75mg を 1 日 2 回 3 日間連続静脈内投与したときの血漿中薬物動態の解析結果から蓄積性は認められなかった。

i. 75mg 単回静脈内投与 (健康成人 7 例) ²⁾

血漿中濃度の推移

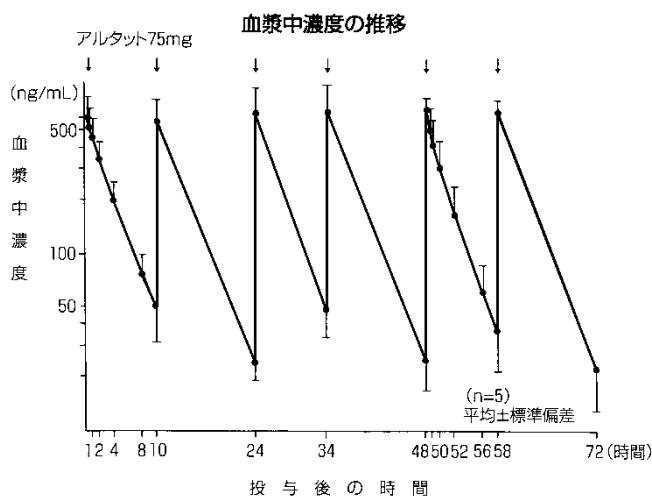


T _{max} (hr)	0.29 ± 0.09
C _{max} (ng/mL)	773.0 ± 109.0
T _{1/2} (hr)	3.36 ± 0.31
AUC (ng·hr/mL)	2553.9 ± 206.7

(Mean ± S.D, n=7.)

ii. 75mg 1日2回静脈内連続投与（健康成人5例）²⁾

投与間隔は、10時間、14時間である



	第1回投与时	第5回投与时
C _{max} (ng/mL)	590.5 ± 197.8	669.1 ± 121.3
T _{1/2} (hr)	2.80 ± 0.31	2.49 ± 0.29
AUC ₀₋₁₀ (ng·hr/mL)	2071.2 ± 566.2	1888.1 ± 707.2

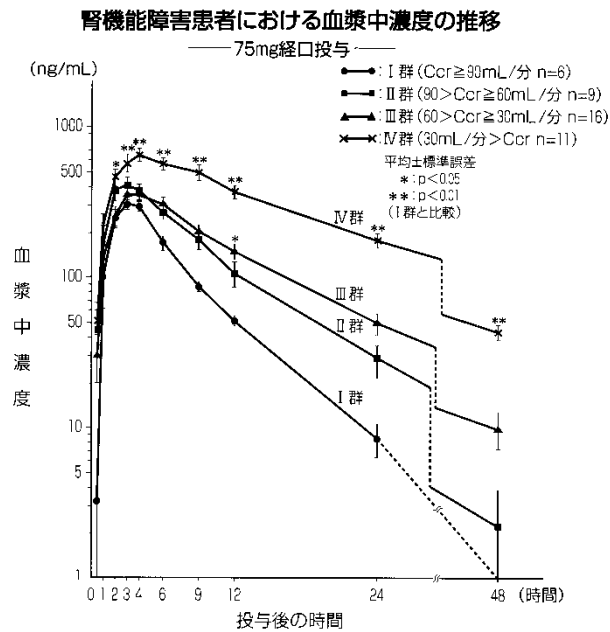
(Mean ± S.D, n=5.)

②腎機能障害患者

<参考>経口剤でのデータ

i. 腎機能障害患者（非透析患者）

腎機能障害患者 36 例に 75mg を経口投与した結果、健康成人と比較して吸収過程に変化はみられなかったが、最大血漿中濃度に到達した後の血漿からの消失は腎機能の低下とともに遅延した¹⁷⁾。したがって腎機能障害患者に本剤を投与する場合には、投与量、投与間隔の適切な調節（投与量を減ずるか投与間隔をあけること）が必要である（「V. 治療に関する項目」の項参照）。



クレアチンクリアランス (mL/min)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (ng·hr/mL)
Ccr ≥ 90	3.17 ± 0.17	336.3 ± 22.5	3.94 ± 0.34	2362 ± 160
90 > Ccr ≥ 60	2.78 ± 0.22	430.8 ± 54.0	5.68 ± 0.51	4101 ± 618
60 > Ccr ≥ 30	3.38 ± 0.31	425.8 ± 26.9	7.70 ± 0.49	4981 ± 477
30 > Ccr	3.73 ± 0.38	714.5 ± 67.8	12.13 ± 1.13	12993 ± 1,245

(Mean ± S.E)

ii. 透析患者

血液透析症例 6 例にアルタット 75mg を透析終了時に経口投与した結果、血漿中半減期は Ccr30mL/min 未満の高度腎機能障害患者よりもさらに延長がみられた¹⁸⁾。

Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)
3.75 ± 1.50	599.5 ± 116.0	14.2 ± 3.9

また、週 3 回の血液透析症例 10 例に対し 37.5mg を連日経口投与した場合の平均血漿中濃度は 1 週後から 8 週後（毎週測定）までほぼ 200ng/mL 前後に維持され、蓄積性は認められなかった¹⁹⁾。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数²⁾

$0.52 \pm 0.34 \text{hr}^{-1}$ (健康成人 7 例、75mg 単回静脈内投与)

(4) クリアランス²⁾

$29.5 \pm 2.4 \text{L/hr}$ (健康成人 7 例、75mg 単回静脈内投与)

$35.2 \pm 9.8 \text{L/hr}$ (健康成人 5 例、75mg 1 日 2 回静脈内連続投与、第 1 回投与時)

$44.1 \pm 24.2 \text{L/hr}$ (健康成人 5 例、75mg 1 日 2 回静脈内連続投与、第 5 回投与時)

(5) 分布容積²⁾

$143.2 \pm 18.8 \text{L}$ (健康成人 7 例、75mg 単回静脈内投与)

$142.1 \pm 41.6 \text{L}$ (健康成人 5 例、75mg 1 日 2 回静脈内連続投与、第 1 回投与時)

$154.4 \pm 73.4 \text{L}$ (健康成人 5 例、75mg 1 日 2 回静脈内連続投与、第 5 回投与時)

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

静脈内投与によりすべて血中に移行する。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

「(5) その他の組織への移行性」の項参照

(2) 血液－胎盤関門通過性²⁰⁾

帝王切開患者 7 例にロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 75mg を手術前 2 回経口投与した結果、臍帯血漿中濃度は母体静脈血漿中濃度の約 60% であり、羊水への移行量は投与量の 0.3% 以下であった。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>動物でのデータ²¹⁾

授乳期ラットに [¹⁴C] ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩を経口投与した結果、乳汁中濃度は血漿中の約 2 倍であったが、半減期は血漿中と同程度であった。

(4) 髄液への移行性

<参考>外国人でのデータ²²⁾

重篤な心、腎、肝疾患のない腰椎麻酔患者 9 例にロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 150mg を経口投与したときの髄液－血漿濃度比 (C_{CSF}/C_P) は 0~0.089 であった。

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

<参考>動物でのデータ

ラットに [¹⁴C] ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩を経口又は静脈内投与した時の放射活性は肝臓、腎臓、小腸及び胃において高く、脳への移行は少なかった。投与経路及び性による分布パターンの差異は認められなかった²¹⁾。また、連続経口投与しても蓄積性は認められなかった²³⁾。

(6) 血漿蛋白結合率

約 9% (平衡透析法)²⁴⁾

腎機能障害患者においても同程度であった¹⁷⁾。

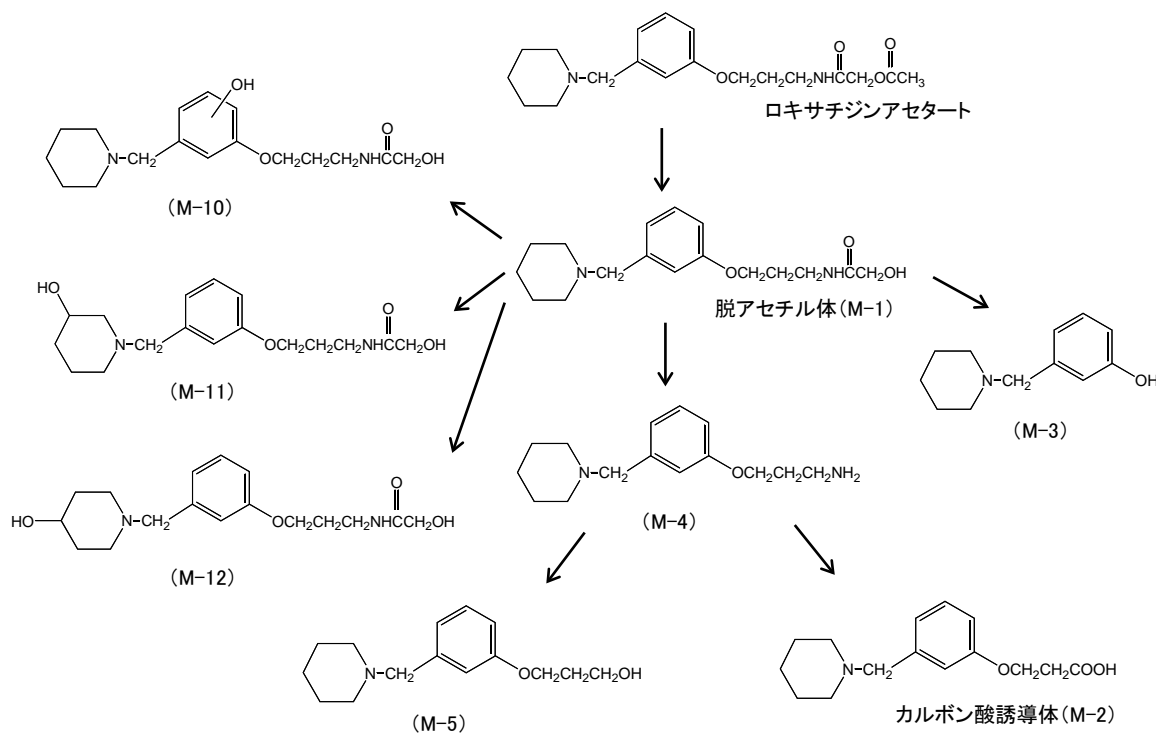
6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

＜参考＞経口剤でのデータ

代謝部位：肝臓、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。

代謝経路：健康成人 5 例にアルタット 75mg を経口投与した結果、主代謝物は脱アセチル体 (M-1) であり、尿中排泄率は投与量の約 55% を占めていた。次に多い代謝物はカルボン酸誘導体 (M-2) で投与量の約 10% を占め、他の代謝物はすべて 3% 以下であった (投与後 24 時間以内の累積値)²⁵⁾。



図：推定代謝経路 (ヒト)

(2) 代謝に關与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

脱アセチル体 (M-1) はロキサチジン酢酸エステル塩酸塩とほぼ同程度の薬理活性を示す。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

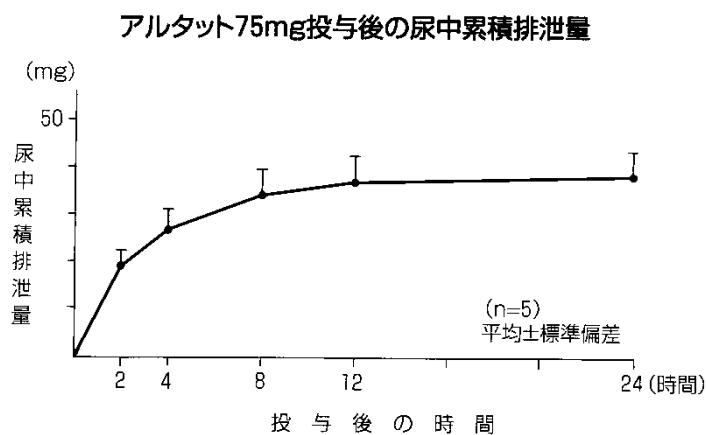
7. 排泄

①排泄部位及び経路

腎

②排泄率²⁾

健康成人 7 例に本剤 75mg を静脈内投与した結果、24 時間以内に投与量の 67.5%が脱アセチル体として尿中に排泄された。また、健康成人 5 例に本剤 75mg を 1 日 2 回連続静脈内投与したときの尿中排泄率は 53.4~56.1%と一定であり、蓄積性は認められなかった。



③排泄速度

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

<参考>経口剤でのデータ

1) 血液透析症例 6 例に対し透析終了時に 75mg を経口投与した場合の平均血漿中濃度は次回透析開始時 (45 時間後) $67 \pm 43 \text{ng/mL}$ 、透析終了時 $38 \pm 26 \text{ng/mL}$ であった¹⁸⁾。

(この結果より算出した除去率は 43.3%である。)

2) 血液透析症例 3 例に対し 37.5mg、9 例に対し 75mg を経口投与した場合の平均透析除去率は $33.3 \pm 8.6\%$ 及び $35.7 \pm 8.4\%$ であり、透析前の血中濃度の高低には影響されなかった^{26)、27)}。

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

腎機能障害患者に 75mg を経口投与すると、表 1 に示すとおり健康成人と比較して吸収過程に変化はみられなかったが、最大血漿中濃度に到達した後の血漿からの消失は腎機能の低下とともに遅延した¹⁷⁾。したがって腎機能障害患者に本剤を投与する場合には、投与量、投与間隔の適切な調節が必要である。[9.2、9.8 参照]

表 1 腎機能と $T_{1/2}$ 及び AUC

クレアチニンクリアランス (mL/min)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC (ng · hr/mL)
$Ccr \geq 90$	3.94 ± 0.34	2362 ± 160
$90 > Ccr \geq 60$	5.68 ± 0.51	4101 ± 618
$60 > Ccr \geq 30$	7.70 ± 0.49	4981 ± 477
$30 > Ccr$	12.13 ± 1.13	12993 ± 1245

11. その他

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

設定されていない

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

肝機能、腎機能、血液像等に注意すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 薬物過敏症の既往歴のある患者

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

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。[9.8、16.6.1 参照]

(解説)

「Ⅶ. 1. (2) 臨床試験で確認された血中濃度」「Ⅷ. 6. (8) 高齢者」の項参照

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。ラット及びウサギの器官形成期投与試験におけるラットの63mg/kg 投与群⁴⁵⁾及びウサギの32mg/kg 投与群⁴⁶⁾、ラットの周産期・授乳期投与試験における60mg/kg 投与群⁴⁷⁾の少数例に死亡がみられている。

(解説)

「IX. 2. (5) 生殖発生毒性試験」の項参照

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続または中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が認められている。[16.3.3 参照]

(解説)

「VII. 5. (3) 乳汁への移行性」の項参照

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。[9.2、16.6.1 参照]

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

＜参考＞経口剤でのデータ

①アルタットの他剤への影響

アルタットの他剤への影響を検討した結果、テオフィリン、アンチピリン、トリメタジオン、ジゴキシン、バルプロ酸ナトリウムの体内動態パラメーター等に対する影響は認められなかった^{28)~31)}。

アルタットの他剤への影響を検討した結果、テオフィリン、アンチピリン、プロプラノロール、ジアゼパム、ワルファリンの体内動態パラメーター等に対する影響は認められなかった（外国人でのデータ^{32)、33)}。また、アルタットと経口避妊薬を併用した結果、排卵抑制効果に影響は認められなかった（外国人でのデータ³⁴⁾。

②他剤によるアルタットへの影響

制酸剤によるアルタットへの影響を検討した結果、アルタットの体内動態パラメーターには影響が認められなかった。また、スクラルファートでは、体内動態パラメーターに影響が認められたという報告³⁵⁾と、認められないという報告（外国人でのデータ³⁶⁾がある。

④ 食物、嗜好品による影響

食物によるアルタットへの影響を検討した結果、アルタットの体内動態パラメーターには影響が認められなかった（外国人でのデータ³²⁾。

また、アルタットの飲酒への影響を検討した結果、エタノール負荷後の血中アルコール濃度に対する影響は認められなかった³⁷⁾。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック（0.1%未満）、アナフィラキシー（頻度不明）

ショック（初期症状：不快感、顔面蒼白、血圧低下等）があらわれた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.2 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少（0.1%未満）

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。

11.1.3 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）（0.1%未満）

11.1.4 肝機能障害、黄疸（0.1%未満）

AST、ALT、 γ -GTP 上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

11.1.5 横紋筋融解症（0.1%未満）

CK、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。

11.1.6 房室ブロック等の心ブロック（頻度不明）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症		発疹、そう痒感等	
血液	好酸球増多、白血球減少	貧血	
消化器		悪心等	便秘、下痢、腹部膨満感、口渇等
肝臓	肝機能異常、AST、ALT、LDH 上昇等	ALP 上昇等	
精神神経系		めまい、幻覚、可逆性の錯乱状態	頭痛、眠気、しびれ、不眠、痙攣等
投与部位		一過性の疼痛	
その他		血圧上昇、BUN 上昇	女性型乳房、乳汁分泌、倦怠感

注) 発現頻度は使用成績調査を含む。

◆項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

副作用発現頻度

承認時及び市販後の使用成績調査における調査症例 4,533 例中 156 例 (3.44%) に副作用 (臨床検査値の異常を含む) が報告された。

調査症例数	4,533 例
副作用等の発現例数	156 例
副作用等の発現症例率	3.44%
副作用等の発現件数	182 件

副作用等の種類	件数 (%)	副作用等の種類	件数 (%)	
皮膚・皮膚付属器障害 痒痒感 発疹 皮疹	4(0.09)	心・血管障害(一般) 血圧上昇	1(0.02)	
	2(0.04)		1(0.02)	
	3(0.07)	心拍数・心リズム障害 頻脈 不整脈	1(0.02)	
	1(0.02)		1(0.02)	
中枢・末梢神経系障害 めまい	1(0.02)			
	1(0.02)			
精神障害 幻覚 可逆性錯乱状態	2(0.04)	呼吸器系障害 肺炎	1(0.02)	
	2(0.04)		1(0.02)	
	1(0.02)	赤血球障害 貧血 ヘマトクリット値減少 ヘモグロビン減少	3(0.07)	
	1(0.02)			
	1(0.02)			
消化管障害 嘔気 悪心 嘔吐 心窩部不快感 腹部不快感	3(0.07)	白血球・網内系障害 好中球減少 単球減少 好酸球増多(症) 白血球分画異常 白血球減少(症) 白血球増多(症)	38(0.84)	
	1(0.02)		3(0.07)	
	1(0.02)		2(0.04)	
	1(0.02)		13(0.29)	
	1(0.02)		2(0.04)	
	1(0.02)		18(0.40)	
肝臓・胆管系障害 肝機能異常 肝機能検査異常 肝機能障害 肝機能障害の増悪 肝酵素上昇 肝障害 AST (GOT) 上昇 ALT (GPT) 上昇 トランスアミナーゼ(値)上昇 チモール混濁反応異常 高ビリルビン血症 ビリルビン値上昇	89(1.96)	血小板・出血凝血障害 血小板増加 血小板増多(症) 血小板減少(症)	9(0.20)	
	45(0.99)		1(0.02)	
	2(0.04)		1(0.02)	
	11(0.24)		1(0.02)	
	1(0.02)	泌尿器系障害 BUN 上昇	1(0.02)	
	1(0.02)		1(0.02)	
	6(0.13)		一般的全身障害 発熱	1(0.02)
	7(0.15)			1(0.02)
	10(0.22)			1(0.02)
	1(0.02)		適用部位障害 注射部疼痛	2(0.04)
	1(0.02)			2(0.04)
1(0.02)				
1(0.02)				
3(0.07)				
代謝・栄養障害 ALP 上昇 LDH 上昇 血清クロール上昇 ナトリウム上昇 低クロール血症 低蛋白血症 血清総蛋白減少 低ナトリウム血症 電解質異常	13(0.29)			
	1(0.02)			
	8(0.18)			
	1(0.02)			
	1(0.02)			
	1(0.02)			
	1(0.02)			
	2(0.04)			
	1(0.02)			
	1(0.02)			
	1(0.02)			

ゴシック文字：副作用発現症例数を示す。

(注) 承認時迄の副作用は「臨床検査値異常」は含まれません。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

10. 過量投与

該当資料なし

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 投与経路

本剤は静脈内注射にのみ使用すること。

14.1.2 投与速度

本剤を投与する場合には、1 バイアルを 20mL に希釈して少なくとも 2 分以上かけて緩徐に注入すること。

14.1.3 投与時の注意

静脈内投与により注射部位の一過性の疼痛を起こすことがあるので、注射部位、注射方法等に十分注意すること。また、注射に際しては血管外に漏出しないように注意すること。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

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。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

マウス、ラット、モルモット、ウサギ、イヌ、ネコを用いてロキサチジン酢酸エステル塩酸塩の中樞神経系、呼吸・循環器系、自律神経系、体性神経系、消化器系、泌尿・生殖器系及びその他に対する作用を検討した。その結果、静脈内投与時に一過性の血圧低下(麻酔イヌ 3mg/kg以上、ラット 10・30mg/kg)、一過性の心拍数の減少(ラット 30mg/kg)、呼吸数の増加(イヌ・ラット 30mg/kg)がみられたが、これらの作用発現には比較的大量を要し、静脈内持続注入時及び経口投与時にはみられなかった。また、大量投与時に消化管運動の抑制(イヌ 10mg/kg・静脈内、ラット 100mg/kg・腹腔内、マウス 200mg/kg・経口)、尿量の増加(ラット 50・100mg/kg・経口)、子宮運動の亢進(ラット 30mg/kg・静脈内)等がみられたが、その他中樞神経系等では特記すべき作用は認められなかった³⁸⁾。

また、ラットにおいてアンチアンドロゲン作用を示さず³⁹⁾、肝薬物代謝酵素に影響を与えなかった⁴⁰⁾。

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験³⁹⁾

LD₅₀ (mg/kg)

動物		投与経路			動物		投与経路		
		経口	皮下	静脈内			経口	皮下	静脈内
ddY系 マウス	♂	625	440	83	SD系 ラット	♂	755	652	110
	♀	509	384	94		♀	787	595	110

(2) 反復投与毒性試験

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 6.7、20、50mg/kg を 3 カ月間静脈内投与した結果、20mg/kg 以上の投与群で投与直後に特異な鳴声、腹臥、振戦、流涎等がみられた⁴¹⁾。ビーグル犬にロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 10、20、40mg/kg を 3 カ月間静脈内投与した結果、40mg/kg 群で軽度の振戦、20mg/kg 以上の投与群の一部に嘔吐及び流涎がみられた⁴²⁾。無影響量はラットでは 6.7mg/kg、イヌでは 10mg/kg であった。

(3) 遺伝毒性試験

変異原性試験⁴³⁾

DNA 修復試験、復帰変異試験、ラットの骨髄細胞を用いた染色体異常試験及びマウスを用いた小核試験の結果、変異原性は認められなかった。

(4) がん原性試験⁴⁴⁾

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 125 及び 500mg/kg を 105 週間経口投与した結果、がん原性は認められなかった。

(5) 生殖発生毒性試験

①受胎能試験及び一般的生殖能試験⁴⁵⁾

ラット（雌雄）にロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 2.5、10、40mg/kg を静脈内投与した結果、40mg/kg 投与群で性周期がわずかに延長したが、妊娠能に異常はみられず胎児の成長も正常であった。

②器官形成期投与試験

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 6.3、20、63mg/kg を静脈内投与した結果、63mg/kg 投与群に死亡がみられた。しかし、胎児に致死毒性、発育抑制、あるいは催奇形性作用は認められず、出生児の成長や分化にも異常がみられなかった⁴⁶⁾。

また、ウサギにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 8、16、32mg/kg を静脈内投与した結果、32mg/kg 投与群の母動物に死亡がみられたが、胎児死亡や催奇形性はみられず胎児毒性は弱かった⁴⁷⁾。

③周産期・授乳期投与試験⁴⁸⁾

ラットにロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として 3.8、15、60mg/kg を静脈内投与した結果、60mg/kg 投与群の少数例に死亡がみられたが、分娩や哺育には異常がみられず、出生児の成長、分化、行動及び生殖能にも影響が認められなかった。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

抗原性試験⁴⁹⁾

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩の単独投与時及びアジュバントとの併用時において、モルモットにおける全身性アナフィラキシー反応、PCA 反応及び Shultz-Dale 反応で陽性を示さなかった。また、マウスの IgE 抗体産生も認められなかった。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：アルタット® 静注用 75mg

劇薬、処方箋医薬品^(注) 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩

劇薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当資料なし

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分：アルタットカプセル 37.5mg・75mg、アルタット細粒 20%

同 効 薬：シメチジン、ラニチジン塩酸塩、ファモチジン、ニザチジン、ラフチジン

7. 国際誕生年月日

1986年7月1日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
アルタット静注用 75mg	2012年2月13日	22400AMX00161000	2020年6月19日	1995年3月23日
アルタット静注用 75mg 【旧製品 (アンプル)】	2012年2月13日	22400AMX00161000	2012年6月22日	1995年3月23日
アルタット注 75 【旧販売名】	1995年1月20日	20700AMZ00003000	1995年3月17日	1995年3月23日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査（アルタット注 75 として）

通知年月日：2004 年 3 月 23 日

再審査結果：薬事法第 14 条第 2 項の各号に該当しない。（承認拒否事由に該当しない）

11. 再審査期間

6 年：1995 年 1 月 20 日～2001 年 1 月 19 日（終了 [アルタット注 75 として]）

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投与期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別医薬品 コード (YJ コード)	HOT (9 桁) コード	レセプト電算 処理システム 用コード
アルタット静注用 75mg	2325403D2022	2325403D2022	128164401	622816401
アルタット静注用 75mg 【旧製品 (アンプル)】	2325403D1069	2325403D1069	104326602	620432602

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 柴田 健雄 他: 医薬品研究. 1985; 16(3): 485-492
- 2) 青井 禮子 他: 臨床医薬. 1989; 5(12): 2485-2512
- 3) 三好 秋馬 他: 消化器科. 1990; 13(1): 123-136
- 4) 三好 秋馬 他: 臨床医薬. 1991; 7(12): 2737-2752
- 5) 野口 純一 他: 診療と新薬. 1990; 27(11): 2113-2120
- 6) 杉山 貢 他: 消化器科. 1990; 12(1): 120-134
- 7) 杉山 貢 他: 消化器科. 1990; 13(4): 505-514
- 8) 長尾 房大 他: 消化器科. 1991; 14(2): 194-204
- 9) 三澤 正 他: 医学と薬学. 1991; 25(6): 1591-1596
- 10) 布施 宏昭 他: 薬理と治療. 1990; 18(8): 2965-2972
- 11) 白土 賢治 他: 薬理と治療. 1985; 13(3): 1413-1420
- 12) 川野 淳 他: 薬理と治療. 1985; 13(3): 1429-1433
- 13) Mikami T.: 薬理と治療. 1988; 16(9): 3743-3748
- 14) Shiratsuchi K. et al.: Arch Int Pharmacodyn Ther. 1988; 294: 295-304
(PMID: 2906796)
- 15) Ichikawa T. et al.: Br J Pharmacol. 1997; 122(6): 1230-1236 (PMID: 9401791)
- 16) 高橋 伸行 他: 薬理と治療. 1998; 26(10): 1701-1704
- 17) 高島 利一 他: 薬理と治療. 1985; 13(6): 3377-3388
- 18) 相澤 純雄 他: 薬理と治療. 1988; 16(12): 4821-4825
- 19) 蜂巢 忠 他: 腎と透析. 1997; 42(2): 245-249
- 20) 河西 稔 他: 麻酔. 1986; 35(1): 130-138
- 21) 岩村 敏 他: 応用薬理. 1985; 30(2): 299-320
- 22) Tryba M. et al.: Scand J Gastroenterol. 1988; 23(suppl 146): 153-158 (PMID: 2906459)
- 23) 岩村 敏 他: 応用薬理. 1985; 30(2): 321-328
- 24) 坏 玲子 他: 薬理と治療. 1985; 13(3): 1435-1443
- 25) 本間 誠次郎 他: 応用薬理. 1985; 30(3): 555-563
- 26) 蜂巢 忠 他: 腎と透析. 1991; 30(2): 283-289
- 27) Hachisu T. et al.: Drug Investigation. 1992; 4(1): 7-14
- 28) Tanaka E. et al.: British Journal of Clinical Pharmacology. 1989; 28: 171-174
(PMID: 2570603)
- 29) 相沢 敏也 他: 薬理と治療. 1989; 17(3): 823-828
- 30) Yoshimura N. et al.: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol. 1989; 27(6): 308-312
(PMID: 2737801)
- 31) 石岡 忠夫: 薬理と治療. 1988; 16(1): 115-118
- 32) Labs R. A.: Drugs. 1988; 35(suppl.3): 82-89 (PMID: 2905254)

- 33) Collins J. D.: Scand J Gastroenterol. 1988; 23(suppl.146): 89-99 (PMID: 2906472)
- 34) Meyer B. H. et al.: Med Sci Res. 1987; 15: 1497
- 35) 黒山 政一 他: TDM研究. 1994; 11(1): 61-67
- 36) Grafe M. S. et al.: Eur J Clin Pharamacol. 1991; 40: 637-638 (PMID: 1679394)
- 37) 川嶋 治 他: アルコールと医学生物学. 1994; 14: 38-42
- 38) 宮坂 克彦 他: 薬理と治療. 1985; 13(2): 627-661
- 39) 今井 強一 他: 薬理と治療. 1985; 13(2): 663-667
- 40) 本間 誠次郎 他: 応用薬理. 1985; 30(2): 357-366
- 41) 舟橋 紀男 他: 応用薬理. 1991; 42(5): 403-418
- 42) 久田 茂 他: 応用薬理. 1991; 42(5): 419-437
- 43) 中山 隆治 他: 薬理と治療. 1985; 13(3): 1167-1176
- 44) 久田 茂 他: 薬理と治療. 1985; 13(3): 1367-1372
- 45) 臼井 哲夫 他: 応用薬理. 1991; 42(5): 439-447
- 46) Baeder C. 他: ヘキスト株式会社社内資料「HOE760のウィスターラットにおける静脈内投与胎児毒性試験」
- 47) Baeder C. 他: ヘキスト株式会社社内資料「HOE760のヒマラヤンウサギにおける静脈内投与胎児毒性試験」
- 48) 臼井 哲夫 他: 応用薬理. 1991; 42(5): 449-455
- 49) 堀内 敏 他: 薬理と治療. 1985; 13(3): 1373-1379

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XⅢ. 備考

その他の関連資料

該当資料なし

配合変化表

<参考>

配合方法：アルタット静注用 75mg 1 管を生理食塩液 20mL に溶解し、配合薬剤 1 管（または 1 瓶）と配合した。ただし、用時溶解する薬剤については、その薬剤の定める方法により溶解した後に配合した。また、輸液類のうちで容量が 200mL を越えるものについては、その輸液 100mL と配合した。

観察項目：外観（色調、濁り、分離、析出等）、pH、アルタット残存率

観察時間：配合直後、配合 3、6 および 24 時間後

※配合薬剤の残存率は測定していない。配合に際しては、配合薬剤の配合変化資料や添付文書等を参照のこと。

（－：測定未実施）

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3 時間後	6 時間後	24 時間後	備考
電 解 質 剤	アクチット注	200mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.34	5.29	5.33	5.35	
			残存率(%)	—	—	104	104	
	EL-3 号	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.48	5.50	5.46	5.50	
			残存率(%)	—	—	100	98	
	ヴィーン D 注	300mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.43	5.42	5.43	5.44	
			残存率(%)			98	100	
	ヴィーン F 注	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.48	6.45	6.48	6.49	
			残存率(%)	—	—	99	98	
	KN 補液 1A	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.28	4.27	4.29	4.27	
			残存率(%)	—	—	101	100	
	KN 補液 2A	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.76	4.76	4.76	4.76	
			残存率(%)	—	—	103	103	
	KN 補液 3A	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.24	5.27	5.25	5.31	
			残存率(%)	—	—	99	97	
KN 補液 MG3 号	500mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.86	4.88	4.89	4.86		
		残存率(%)	—	—	97	99		
KN 補液 4A	500mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.10	5.10	5.10	5.15		
		残存率(%)	—	—	98	99		
生理食塩液	500mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.29	4.30	4.30	4.34		
		残存率(%)	—	—	101	98		
ソリタ-T1 号	200mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.06	5.06	5.06	5.06		
		残存率(%)	—	—	—	—		
ソリタ-T2 号	200mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.80	4.79	4.83	4.84		
		残存率(%)	—	—	100	103		
ソリタ-T3 号	500mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.07	5.07	5.06	5.06		
		残存率(%)	—	—	—	—		
ソリタ-T4 号	200mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.03	5.03	5.03	5.03		
		残存率(%)	—	—	—	—		
ソリタックス-H	500mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.92	5.89	5.90	5.92		
		残存率(%)	—	—	99	102		
トリフリード	200mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.95	4.90	4.87	4.92		
		残存率(%)	—	—	100	103		

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
電 解 質 剤	フィジオゾール・3号	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.73	4.74	4.74	4.72	
			残存率(%)	—	—	103	101	
	ポタコールR	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.88	4.88	4.86	4.89	
			残存率(%)	—	—	100	98	
	ラクテック注	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.77	5.78	5.74	5.79	
			残存率(%)	—	—	101	100	
	ラクテックD注	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.89	4.92	4.87	4.92	
			残存率(%)	—	—	98	97	
	ラクテックG注	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.73	5.74	5.71	5.75	
			残存率(%)	—	—	101	99	
	ラクトリンゲル液 "フソー"	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.67	5.72	5.71	5.69	
			残存率(%)	—	—	102	102	
	リナセート	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.30	5.28	5.33	5.34	
			残存率(%)	—	—	100	103	
	リプラス・3号	200mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.00	4.99	5.00	5.02	
			残存率(%)	—	—	99	100	
リンゲル液	500mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.33	4.33	4.35	4.36		
		残存率(%)	—	—	98	99		
デキ スト ラン 剤	低分子デキストラン糖 注	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.01	4.00	4.00	4.00	
			残存率(%)	—	—	—	—	
低分子デキストランL 注	500mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.21	5.19	5.23	5.23		
		残存率(%)	—	—	98	98		
ビ タ ミ ン 剤	アデラビン9号	1mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.26	4.24	4.26	4.28	
			残存率(%)	—	—	96	101	
	アリナミン注射液	10mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.93	3.99	3.92	3.94	
			残存率(%)	—	—	100	102	
	アリナミンF50注	50mg/20mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.88	3.86	3.86	3.92	
			残存率(%)	—	—	—	—	
	M.VI-3注	5mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.75	4.75	4.76	4.74	
			残存率(%)	—	—	96	94	
	M.VI注「エスエス」	5mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.69	4.71	4.71	4.74	
			残存率(%)	—	—	104	102	
	ネオM.VI-9注	5mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.71	4.72	4.76	4.82	
			残存率(%)	—	—	97	101	
	オーツカMV注	4mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.62	5.81	5.90	5.90	
			残存率(%)	—	—	98	95	

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
ビ タ ミ ン 剤	シータック注20%	1g/5mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.49	6.70	6.72	6.51	
			残存率(%)	—	—	102	99	
	シーパラ注	2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.71	4.76	4.80	4.80	
			残存率(%)	—	—	—	—	
	デルモリチン注10%	200mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.63	4.62	4.62	4.57	
			残存率(%)	—	—	99	100	
	ネオラミン・スリービー液 (静注用)	10mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.81	3.79	3.78	3.85	
			残存率(%)	—	—	100	101	
	ネオラミン・マルチV	5mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.00	5.05	5.11	5.17	
			残存率(%)	—	—	100	100	
	パントール注射液 500mg	500mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.30	4.32	4.32	4.34	
			残存率(%)	—	—	97	94	
	ビスコリン注25%	500mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.19	6.25	6.43	6.29	
			残存率(%)	—	—	100	99	
ピタシミン注射液 100mg	100mg/1mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.46	5.58	5.66	5.62		
		残存率(%)	—	—	—	—		
静注用ピタノイリン	20mL	外観変化	変化なし					
		pH	3.97	3.92	3.92	3.97		
		残存率(%)	—	—	104	99		
ピタメジン静注用	20mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.64	4.60	4.70	4.64		
		残存率(%)	—	—	102	103		
ピドキサル注30mg	30mg/1mL	外観変化	変色				変色：微黄色澄明→黄色澄明	
		pH	6.23	6.12	6.08	5.98		
		残存率(%)	—	—	—	—		
フラビタン注5mg	5mg/1mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.08	4.08	4.08	4.09		
		残存率(%)	—	—	—	—		
マルタミン注射用	5mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.74	4.79	4.83	4.88		
		残存率(%)	—	—	91	93		
糖 質 剤	クリニット注10%	20mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.09	4.18	4.13	4.07	
			残存率(%)	—	—	100	97	
	第一糖液注20%	20mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.05	4.15	4.07	4.03	
			残存率(%)	—	—	96	101	
	トリパレン1号	400mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.07	4.71	4.71	4.72	
			残存率(%)	—	—	103	96	
	ハイカリック液1号	700mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.47	4.43	4.47	4.48	
			残存率(%)	—	—	99	102	
	5%フルクトン注	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.00	3.98	3.98	4.00	
			残存率(%)	—	—	—	—	

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
糖 質	マルトス-10	250mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.13	4.13	4.13	4.15	
			残存率(%)	—	—	95	98	
剤	リハビックス-K1号	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.14	5.03	5.06	5.06	
			残存率(%)	—	—	100	99	
ア ミ ノ 酸 製 剤	アミカリック	200mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.07	4.98	5.00	5.07	
			残存率(%)	—	—	100	100	
	アミノトリパ1号	850mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.63	5.61	5.60	5.56	
			残存率(%)	—	—	103	100	
	アミノフリード	500mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.64	6.62	6.50	6.46	
			残存率(%)	—	—	100	95	
	アミノレバン	200mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.87	5.72	5.69	5.80	
			残存率(%)	—	—	95	96	
	アミパレン	200mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.85	6.87	6.91	6.91	
			残存率(%)	—	—	102	100	
	キドミン	200mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.82	6.86	6.89	6.88	
			残存率(%)	100	—	100	97	
	ピーエヌツイン-1号	1000mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.95	4.95	5.02	5.03	
			残存率(%)	—	—	99	101	
	ピーエヌツイン-2号	1100mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.20	5.14	5.14	5.16	
			残存率(%)	—	—	100	102	
ピーエヌツイン-3号	1200mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.15	5.08	5.09	5.16		
		残存率(%)	—	—	100	100		
プラスアミノ	200mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.45	4.47	4.50	4.43		
		残存率(%)	—	—	102	98		
プロテアミン12X 注射液	20mL	外観変化	変化なし					
		pH	6.05	6.06	6.04	6.02		
		残存率(%)	—	—	—	—		
マックアミン	200mL	外観変化	変化なし					
		pH	6.71	6.65	6.68	6.71		
		残存率(%)	—	—	100	102		
強力モリアミンS	20mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.87	5.82	5.84	5.82		
		残存率(%)	—	—	—	—		
モリへパミン	200mL	外観変化	変化なし					
		pH	7.20	7.11	7.10	7.16		
		残存率(%)	—	—	99	96		
抗 生 物 質	アザクタム注射用1g	1g/20mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.15	5.13	5.12	5.17	
			残存率(%)	—	—	定量不可		
	硫酸アミカシン注射液 「萬有」	200mg/2mL	外観変化	変化なし				
pH			6.24	6.34	6.30	6.23		
			残存率(%)	—	—	107	103	

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
抗 生 物 質	イセパシン注射液 400	400mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.54	6.53	6.55	6.64	
			残存率(%)	—	—	100	96	
	エクサシン注射液	200mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.37	6.36	6.34	6.37	
			残存率(%)	—	—	98	98	
	カルベニン点滴用 0.25g	0.25g/100mL	外観変化	変色				変色：微黄色澄明→黄色澄明
			pH	6.13	6.04	5.92	5.44	
			残存率(%)	—	—	97	97	
	クラフォラン注射用 0.5g	0.5g/2mL	外観変化	変化なし				pH 低下 (ただし配合薬剤を 生食で溶かした場合も同 様)
			pH	4.97	4.89	4.87	4.73	
			残存率(%)			—	—	
	ケイペラゾン静注用	1g/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.28	4.17	4.04	4.05	
			残存率(%)	—	—	定量不可		
	ケニセフ静注用 1g	1g/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.92	5.92	5.92	5.92	
			残存率(%)	100	102	—	101	
	ゲンタシン注 60	60mg/1.5mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.19	4.17	4.15	4.20	
			残存率(%)	—	—	99.7	90.3	
	スルペラゾン静注用 1g	1g/10mL	外観変化	変化なし	白濁			
			pH	4.63	4.46	4.41	4.44	
			残存率(%)	—	—	定量不可		
	セフトアックス注射用	1g/20mL	外観変化	変化なし	臭い発生			配合薬剤単独でも臭い発生
			pH	5.09	5.00	4.96	4.90	
			残存率(%)	—	—	定量不可		
セフトピッド注射用 1g	1g/20mL	外観変化	変化なし	イオウ臭発生			配合薬剤単独でも臭い発生	
		pH	4.50	4.46	4.38	4.51		
		残存率(%)	—	—	定量不可			
セフトペラジン注射用 1g	1g/4mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.35	4.17	4.24	4.26		
		残存率(%)	—	—	定量不可			
セフメタゾン静注用 1g	1g/10mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.51	4.42	4.36	4.27		
		残存率(%)	—	—	定量不可			
タケスリン静注用 1g	1g/20mL	外観変化	変化なし					
		pH	3.95	3.98	3.98	3.96		
		残存率(%)	—	—	101	100		
ダラシン S 注射液	300mg/2mL	外観変化	変化なし					
		pH	6.47	6.47	6.68	6.50		
		残存率(%)	—	—	101	105		
チエナム点滴用	500mg/100mL	外観変化	変化なし					
		pH	7.36	7.28	7.19	6.85		
		残存率(%)	—	—	104	96.8		
注射用トブラシン V90mg	90mg/1.5mL	外観変化	変化なし					
		pH	7.07	7.02	7.02	7.06		
		残存率(%)	—	—	104	96.4		
パニマイシン注射液	100mg/2mL	外観変化	変化なし					
		pH	6.62	6.55	6.52	6.60		
		残存率(%)	—	—	96.7	104		
塩酸バンコマイシン点 滴静注用 0.5g	0.5g/10mL	外観変化	変化なし					
		pH	3.89	3.88	3.87	3.93		
		残存率(%)	—	—	97	99		

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
抗 生 物 質	ハンスボリン静注用0.25g	250mg/3mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.51	6.63	6.84	6.90	
			残存率(%)	—	—	110	92	
	注射用ピクシリン	250mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	8.17	8.12	8.11	7.91	
			残存率(%)	—	—	91	85	
	ファーストシ静注用1g	1g/20mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.69	7.87	7.80	7.82	
			残存率(%)	—	—	103	98	
	フルマリン静注用1g	1g/100mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.60	4.84	4.85	4.90	
			残存率(%)	—	—	108	109	
	プロアクト静注用	1g/10mL	外観変化	変化なし				変色:微黄色澄明な液→黄褐色澄明(ただし配合薬剤を生食で溶かした場合も同様)
			pH	7.50	7.56	7.59	7.42	
			残存率(%)	—	—	—	—	
	ベストコール静注用0.5g	500mg/3mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.45	7.51	7.83	7.74	
			残存率(%)	—	—	101	89	
	ペントシリン注射用2g	2g/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.07	5.06	5.00	4.88	
残存率(%)			—	—	定量不可			
静注用ホスミシンS	500mg/20mL	外観変化	変化なし					
		pH	7.53	7.52	7.49	7.48		
		残存率(%)	—	—	93	87		
注射用マキシピーム1g	1g/20mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.53	4.49	4.45	4.69		
		残存率(%)	—	—	100	101		
メロペン点滴用0.5g	0.5g/100mL	外観変化	変化なし					
		pH	7.90	7.90	7.92	7.99		
		残存率(%)	—	—	98	94		
モダシン静注用	1g/20mL	外観変化	変化なし					
		pH	6.21	6.31	6.39	6.60		
		残存率(%)	—	—	定量不可			
ロセフィン静注用1g	1g/10mL	外観変化	変化なし					
		pH	5.97	5.97	5.98	6.13		
		残存率(%)	—	—	定量不可			
化学療法剤	ジフルカン静注液0.2% [100mg]	100mg/50mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.30	4.34	4.33	4.38	
			残存率(%)	—	—	98	101	
点滴静注用ゾピラックス	250mg/10mL	外観変化	白濁					
		pH	9.80	9.78	9.75	9.80		
		残存率(%)	—	—	—	—		
神経系用剤	注射用アイオナール・ナトリウム(0.2)	200mg/4mL	外観変化	結晶析出				
			pH	8.59	8.49	8.49		8.48
			残存率(%)	—	—	93		58
	アタラックス-P注射液(50mg/mL)	50mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.08	4.12	4.12	4.09	
			残存率(%)	—	—	104	105	
	0.5g イソゾール	500mg/20mL	外観変化	白濁				
			pH	9.28	9.07	9.07		9.24
			残存率(%)	—	—	19		7
	1%カルボカイン注	100mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.13	5.98	5.92	6.18	
			残存率(%)	—	—	定量不可		

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
神経系用剤	キシロカイン注射液1%	100mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.50	6.28	6.22	6.18	
			残存率(%)	—	—	103	103	
	セスデン注射液	7.5mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.06	4.02	4.00	4.06	
			残存率(%)	—	—	101	98	
	セルシン注射液	10mg/2mL	外観変化	黄濁				
			pH	5.17	5.11	5.11	5.13	
			残存率(%)	—	—	104	106	
	ソセゴン注射液 30mg	30mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.03	4.07	4.09	4.03	
			残存率(%)	—	—	105	105	
	ドルミカム注	10mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.09	4.06	4.06	4.09	
			残存率(%)	—	—	94	101	
	ドロレブタン	25mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.70	3.71	3.71	3.70	
			残存率(%)	—	—	98	100	
	ノバミン注	5mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.35	4.35	4.34	4.30	
			残存率(%)	—	—	100	101	
	ハイスコ	0.5mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.99	3.99	3.94	4.01	
			残存率(%)	—	—	102	95	
ホリゾン注射液 10mg	10mg/2mL	外観変化	黄濁					
		pH	5.18	5.15	5.15	5.18		
		残存率(%)	—	—	103	101		
鎮痙剤	硫酸アトロピン注射液 タナベ	0.5mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.01	4.00	3.97	4.03	
			残存率(%)	—	—	102	104	
ブスコパン注射液	20mg/1mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.19	4.21	4.19	4.16		
		残存率(%)	—	—	98	99		
循環器系用剤	注射用アプレゾリン	20mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.07	4.09	4.08	4.04	
			残存率(%)	—	—	106	103	
	イノバン注	100mg/5mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.06	4.03	4.01	4.03	
			残存率(%)	—	—	99	91	
	インデラル注射液 2mg	2mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.03	4.01	4.01	4.00	
			残存率(%)	—	—	98	95	
	グリセオール注	300mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.07	4.12	4.10	4.09	
			残存率(%)	—	—	98	98	
	ニコリン注射液	100mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.45	5.42	5.40	5.43	
			残存率(%)	—	—	97	99	
	ニコリンH注射液	1g/4mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.16	6.24	6.21	6.17	
			残存率(%)	—	—	100	100	
	ネオフィリン注	250mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	8.77	8.69	8.65	8.67	
			残存率(%)	—	—	84	50	

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
循環器系用剤	ペルサンチン注射液	10mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.79	3.69	3.67	3.81	
			残存率(%)	—	—	100	101	
	注射用ルシドリール	250mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.15	3.93	3.75	3.65	
			残存率(%)	—	—	98	101	
	レコグナン注500mg	500mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.97	5.95	5.98	5.95	
			残存率(%)	—	—	108	94	
利尿剤	ソルダクトン200mg	200mg/10mL	外観変化	白濁				
			pH	8.03	8.15	8.18	8.22	
			残存率(%)	—	—	99	81	
	ラシックス注	20mg/2mL	外観変化	白濁				
			pH	4.43	4.43	4.38	4.52	
			残存率(%)	—	—	99	106	
ルネトロン注射液	0.5mg/1mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.15	4.13	4.13	4.20		
		残存率(%)	—	—	102	100		
ホルモン剤	オルガドロン注射液	5mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.62	5.62	5.62	5.49	
			残存率(%)	—	—	98	103	
	ソル・コーテフ500	500mg/4mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.13	7.13	7.12	7.06	
			残存率(%)	—	—	103	97	
	ソル・メドロール500	500mg/8mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.26	7.28	7.26	7.20	
			残存率(%)	—	—	101	93	
	ノルアドリナリン	1mg/1mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.93	3.91	3.90	3.94	
			残存率(%)	—	—	95	95	
	水溶性ハイドロコートン注射液	500mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.50	7.59	7.60	7.51	
			残存率(%)	—	—	102	101	
	水溶性プレドニン50mg	50mg/5mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.32	6.35	6.42	6.40	
			残存率(%)	—	—	97	95	
	リンデロン注100mg	100mg/5mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.05	6.93	6.93	6.89	
			残存率(%)	—	—	100	94	
消化器系用剤	ソルコセルル「注」	4mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.13	6.16	6.16	6.18	
			残存率(%)	—	—	108	96	
	テルペラン注射液	10mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.03	4.00	3.99	4.04	
			残存率(%)	—	—	定量不可		
	ドグマチール注射液	50mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.00	4.04	4.04	4.08	
			残存率(%)	—	—	99	97	
プリンペラン注射液	10mg/2mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.03	4.01	4.00	4.06		
		残存率(%)	—	—	定量不可			
酵素製剤	ウロキナーゼ24万ヨシトミ	240,000単位/20mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.07	6.00	5.99	5.99	
			残存率(%)	—	—	107	105	

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
去痰剤	ピソルボン注射液	4mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	3.82	3.83	3.77	3.83	
			残存率(%)	—	—	96	95	
血液系 用剤	アドナ(AC-17)注射液	10mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.16	4.12	4.13	4.23	
			残存率(%)	—	—	103	103	
	トランサミンS注	250mg/2.5mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.18	6.18	6.18	6.20	
			残存率(%)	—	—	101	99	
	ノボ・ヘパリンカルシウム注射液	10,000単位/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.39	4.43	4.40	4.42	
			残存率(%)	—	—	102	101	
	ヘムロン注S	1000mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.95	6.93	6.94	6.85	
			残存率(%)	—	—	99	100	
レプチラーゼ=S注	2単位/2mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.08	4.04	4.03	4.07		
		残存率(%)	—	—	101	96		
肝臓疾患用剤	500mg グロンサン注	500mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.17	5.19	5.23	5.16	
			残存率(%)	—	—	100	101	
強力ネオミノファーゲンシー	20mL	外観変化	変化なし					
		pH	6.01	6.01	6.01	5.95		
		残存率(%)	—	—	106	97		
解毒剤	メイロン	3.5g/50mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.98	8.25	8.29	8.44	
			残存率(%)	—	—	104	82	
代謝系用剤	アデホス-L コーワ注3号	20mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.85	7.69	7.59	7.49	
			残存率(%)	—	—	93	88	
	アルギメート	20g/200mL	外観変化	変化なし				
			pH	6.76	6.71	6.70	6.70	
			残存率(%)	—	—	100	101	
	注射用エフオーワイ500	500mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.26	4.11	4.15	4.05	
			残存率(%)	—	—	94	95	
	注射用カタクロット	20mg/5mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.04	7.01	7.02	7.03	
			残存率(%)	—	—	97	97	
	カルチコール注射液	850mg/10mL	外観変化	変化なし				
			pH	5.53	5.55	5.66	5.61	
			残存率(%)	—	—	102	97	
	キサンボン注	20mg/5mL	外観変化	変化なし				
			pH	7.06	7.06	7.06	7.07	
			残存率(%)	—	—	98	104	
	コンドロン注2%	40mg/2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.21	4.20	4.18	4.23	
			残存率(%)	—	—	104	105	
注射用フサン50	50mg/10mL	外観変化	変化なし					
		pH	3.75	3.79	3.79	3.85		
		残存率(%)	—	—	97	101		
ミラクリッド	50,000単位/10mL	外観変化	変化なし					
		pH	4.38	4.37	4.37	4.43		
		残存率(%)	—	—	101	101		

(一：測定未実施)

分類	配合薬剤 (商品名は試験実施当時)	含量/容量	観察項目	配合直後	3時間後	6時間後	24時間後	備考
無 機 質 製	エレメンミック注	2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.15	4.17	4.17	4.18	
			残存率(%)	—	—	99	98	
	K.C.L.注射液(1号)	3g/20mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.51	4.50	4.50	4.50	
			残存率(%)	—	—	98	98	
	ミネラル注	2mL	外観変化	変化なし				
			pH	4.19	4.23	4.20	4.23	
			残存率(%)	—	—	98	101	
抗 悪 性 腫 瘍 剤	5-FU 協和	250mg/5mL	外観変化	変化なし				
			pH	8.33	8.31	8.29	8.35	
			残存率(%)	—	—	84	42	
血 液 製 剤	フィブロガミンP	4mL	外観変化	変化なし	白濁			
			pH	4.78	4.80	4.77	4.74	
			残存率(%)	—	—	—	—	

pH 変動試験

	アルタット静注用 75mg + 生理食塩液 20mL	
規格 pH 域	3.5~5.6	
試料 pH	4.16	
最終 pH 又は 変化点 pH	0.1N HCl 10.0mL 滴下 2.25	0.1N NaOH 10.0mL 滴下 10.37
移動指数	1.91	6.21
変化所見	なし	なし
浸透圧比	約 1	