

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領 2013 に準拠して作成

不眠症治療薬

習慣性医薬品、処方箋医薬品

エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」**エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」****エスゾピクロン錠 3mg「DSEP」****ESZOPICLONE TABLETS「DSEP」**

エスゾピクロン錠

剤形	錠 1mg「DSEP」、錠 3mg「DSEP」：錠剤（フィルムコーティング錠） 錠 2mg「DSEP」：錠剤（割線入りフィルムコーティング錠）
製剤の規制区分	習慣性医薬品（注意－習慣性あり）、 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	エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」：1錠中 エスゾピクロン 1mg エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」：1錠中 エスゾピクロン 2mg エスゾピクロン錠 3mg「DSEP」：1錠中 エスゾピクロン 3mg
一般名	和名：エスゾピクロン（JAN） 洋名：Eszopiclone（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：2021年2月15日 薬価基準収載年月日：2021年6月18日 発売年月日：2021年6月18日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：第一三共エスファ株式会社 販売提携：第一三共株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	第一三共エスファ株式会社 お客様相談室 TEL：0120-100-601 医療関係者向けホームページ： https://med.daiichisankyo-ep.co.jp/index.php

本IFは2022年7月改訂（第3版）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、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

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

最新版の e-IF は、(独) 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ

(<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

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

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

- ① 規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。
ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ② IF 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]

- ① IF 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。
- ② 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。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ① 「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	10. 製剤中の有効成分の定量法	15
1. 開発の経緯	1	11. 力 価	15
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	12. 混入する可能性のある夾雑物	15
II. 名称に関する項目	2	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	15
1. 販売名	2	14. その他	15
(1) 和 名	2	V. 治療に関する項目	16
(2) 洋 名	2	1. 効能又は効果	16
(3) 名称の由来	2	2. 用法及び用量	16
2. 一般名	2	3. 臨床成績	16
(1) 和 名 (命名法)	2	(1) 臨床データパッケージ	16
(2) 洋 名 (命名法)	2	(2) 臨床効果	16
(3) システム	2	(3) 臨床薬理試験	16
3. 構造式又は示性式	2	(4) 探索的試験	16
4. 分子式及び分子量	2	(5) 検証的試験	16
5. 化学名 (命名法)	2	1) 無作為化並行用量反応試験	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	2) 比較試験	16
7. CAS登録番号	3	3) 安全性試験	16
III. 有効成分に関する項目	4	4) 患者・病態別試験	16
1. 物理化学的性質	4	(6) 治療の使用	16
(1) 外観・性状	4	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)	16
(2) 溶解性	4	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	17
(3) 吸湿性	4	VI. 薬効薬理に関する項目	18
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	4	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18
(5) 酸塩基解離定数	4	2. 薬理作用	18
(6) 分配係数	4	(1) 作用部位・作用機序	18
(7) その他の主な示性値	4	(2) 薬効を裏付ける試験成績	18
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(3) 作用発現時間・持続時間	18
3. 有効成分の確認試験法	4	VII. 薬物動態に関する項目	19
4. 有効成分の定量法	4	1. 血中濃度の推移・測定法	19
IV. 製剤に関する項目	5	(1) 治療上有効な血中濃度	19
1. 剤 形	5	(2) 最高血中濃度到達時間	19
(1) 剤形の区別、外観及び性状	5	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	19
(2) 製剤の物性	5	(4) 中毒域	20
(3) 識別コード	5	(5) 食事・併用薬の影響	20
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	5	(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	20
2. 製剤の組成	5	2. 薬物速度論的パラメータ	20
(1) 有効成分(活性成分)の含量	5	(1) 解析方法	20
(2) 添加物	5	(2) 吸収速度定数	20
(3) その他	6	(3) バイオアベイラビリティ	20
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	(4) 消失速度定数	20
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	(5) クリアランス	20
5. 調製法及び溶解後の安定性	8	(6) 分布容積	20
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	(7) 血漿蛋白結合率	21
7. 溶出性	8		
8. 生物学的試験法	15		
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	15		

3. 吸 収	21	IX. 非臨床試験に関する項目	28
4. 分 布	21	1. 薬理試験	28
(1) 血液－脳関門通過性	21	(1) 薬効薬理試験	28
(2) 血液－胎盤関門通過性	21	(2) 副次的薬理試験	28
(3) 乳汁への移行性	21	(3) 安全性薬理試験	28
(4) 髄液への移行性	21	(4) その他の薬理試験	28
(5) その他の組織への移行性	21	2. 毒性試験	28
5. 代 謝	21	(1) 単回投与毒性試験	28
(1) 代謝部位及び代謝経路	21	(2) 反復投与毒性試験	28
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種	21	(3) 生殖発生毒性試験	28
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	21	(4) その他の特殊毒性	28
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	21	X. 管理的事項に関する項目	29
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	21	1. 規制区分	29
6. 排 泄	21	2. 有効期間又は使用期限	29
(1) 排泄部位及び経路	21	3. 貯法・保存条件	29
(2) 排泄率	21	4. 薬剤取扱い上の注意点	29
(3) 排泄速度	21	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	29
7. トランスポーターに関する情報	22	(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）	29
8. 透析等による除去率	22	(3) 調剤時の留意点について	29
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	23	5. 承認条件等	29
1. 警告内容とその理由	23	6. 包 装	29
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	23	7. 容器の材質	30
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	23	8. 同一成分・同効薬	30
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	23	9. 国際誕生年月日	30
5. 慎重投与内容とその理由	23	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	30
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	24	11. 薬価基準収載年月日	30
7. 相互作用	24	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	30
(1) 併用禁忌とその理由	24	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	30
(2) 併用注意とその理由	24	14. 再審査期間	30
8. 副作用	24	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	30
(1) 副作用の概要	24	16. 各種コード	31
(2) 重大な副作用と初期症状	25	17. 保険給付上の注意	31
(3) その他の副作用	25	XI. 文 献	32
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	25	1. 引用文献	32
(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	25	2. その他の参考文献	32
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	26	XII. 参考資料	33
9. 高齢者への投与	26	1. 主な外国での発売状況	33
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	26	2. 海外における臨床支援情報	33
11. 小児等への投与	26	XIII. 備 考	34
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	26	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	34
13. 過量投与	27	2. その他の関連資料	36
14. 適用上の注意	27		
15. その他の注意	27		
16. その他	27		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

エスゾピクロンは、ラセミ体であるゾピクロンを光学分割して得られた S 体のエスゾピクロンの製剤であり、イオンチャネル型γ-アミノ酪酸（Gamma Amino Butyric Acid : GABA）受容体作動薬である。

エスゾピクロンは、GABA_A受容体への結合を介した催眠作用、鎮静作用及び抗不安作用を有すること、加えてゾピクロンの薬理活性の大部分を有することが証明され、様々な不眠症の入眠障害及び中途覚醒に有効で、長期に投与した場合でも注意すべき副作用のリスクが少ない睡眠薬と考えられている。

これらの特徴を有する非ベンゾジアゼピン系睡眠薬として期待され、本邦においても、2012年より、臨床使用されている。エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」、エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」及びエスゾピクロン錠 3mg「DSEP」は、株式会社陽進堂、東和薬品株式会社、日新製薬株式会社、日医工株式会社、Meiji Seika ファルマ株式会社及び第一三共エスファ株式会社の共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、平成 26 年 11 月 21 日付薬食発 1121 第 2 号に基づき承認申請を行い、2021 年 2 月に承認を取得し、2021 年 6 月に販売を開始した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 中枢神経系の GABA_A受容体複合体に結合し、GABA の効果を増強して催眠作用及び鎮静作用を発揮する不眠症治療薬である。
- (2) ゾピクロンを光学分割して得られた、ゾピクロンの薬理活性の大部分を有する S 体である。
- (3) 不眠症の主症状である入眠障害と中途覚醒のいずれにも有効である。
- (4) 原発性と併発性のいずれの不眠症にも有効である。
- (5) 錠剤に製品名と有効成分の含量を両面印刷し、判別しやすくしている。
- (6) PTP シートはピッチコントロールを行い、製品名と有効成分の含量の表示を識別しやすくしている。
また、薬剤の特徴や疾患の特性をイメージしたオリジナルシンボルを表示している。
- (7) 薬剤取り違い防止における負担軽減のため、PTP シート裏面に、1 スリットごとに GS1 データバーを表示している。
- (8) バラ包装では、バイオマスプラスチック含有包剤を採用し、また、クラッシュ機能を搭載した個装箱を採用している。
- (9) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、依存性、呼吸抑制、肝機能障害、精神症状、意識障害、一過性前向き健忘、もうろう状態、睡眠随伴症状（夢遊症状等）が報告されている。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1)和 名

エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」

エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」

エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」

(2)洋 名

ESZOPICLONE TABLETS 1mg 「DSEP」

ESZOPICLONE TABLETS 2mg 「DSEP」

ESZOPICLONE TABLETS 3mg 「DSEP」

(3)名称の由来

通知「平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

2. 一般名

(1)和 名 (命名法)

エスゾピクロン (JAN)

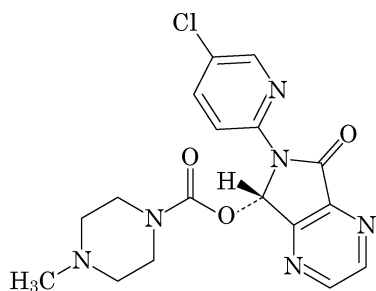
(2)洋 名 (命名法)

Eszopiclone (JAN)

(3)ステム

催眠鎮静剤 : -clone

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{17}H_{17}ClN_6O_3$

分子量 : 388.81

5. 化学名 (命名法)

(5*S*)-6-(5-Chloropyridin-2-yl)-7-oxo-6,7-dihydro-5*H*-pyrrolo[3,4-*b*]pyrazin-5-yl 4-methylpiperazine-1-carboxylate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

開発番号 : NS028 (エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」)

: NS029 (エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」)

: NS030 (エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」)

7. CAS 登録番号

138729-47-2

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～淡黄色の粉末である。

(2) 溶解性

該当資料なし

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	有効成分	剤形	色	外形		
				直径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (mg)
エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」	1錠中 エスゾピクロン 1mg	フィルム コーティング錠	白色			
				6.1	2.8	104.5
エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」	1錠中 エスゾピクロン 2mg	フィルム コーティング錠 (割線入)	淡黄色			
				6.1	2.8	104.5
エスゾピクロン錠 3mg「DSEP」	1錠中 エスゾピクロン 3mg	フィルム コーティング錠	淡赤色			
				6.1	2.8	104.5

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」 : エスゾピクロン 1 DSEP

エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」 : エスゾピクロン 2 DSEP

エスゾピクロン錠 3mg「DSEP」 : エスゾピクロン 3 DSEP

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」 : 1錠中に エスゾピクロン 1mg を含有

エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」 : 1錠中に エスゾピクロン 2mg を含有

エスゾピクロン錠 3mg「DSEP」 : 1錠中に エスゾピクロン 3mg を含有

(2) 添加物

エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」 : 乳糖水和物、結晶セルロース、無水リン酸水素カルシウム、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン

エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」 : 乳糖水和物、結晶セルロース、無水リン酸水素カルシウム、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、黄色三二酸化鉄

IV. 製剤に関する項目

エスゾピクロン錠 3mg「DSEP」：乳糖水和物、結晶セルロース、無水リン酸水素カルシウム、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、三酸化鉄

(3)その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

(1)加速条件下での安定性試験

PTP 包装

試験項目〔規格値〕		開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状〔※1〕		適	適	適	適
確認試験（液体クロマトグラフィー）〔※2〕		適	適	適	適
純度試験（液体クロマトグラフィー）〔※3〕		適	適	適	適
製剤均一性試験〔判定値 15.0%以内〕		適	適	適	適
溶出試験〔pH2.0、50rpm、45分間、※4〕		適	適	適	適
定量〔95.0～105.0%〕 ^{※5} （平均含有率(%)±C.V.）	錠 1mg「DSEP」	100.0±1.1	99.8±0.8	100.0±0.9	99.3±1.0
	錠 2mg「DSEP」	100.7±0.8	100.7±1.2	100.6±0.6	99.6±1.1
	錠 3mg「DSEP」	101.0±0.6	101.1±0.7	100.9±0.5	100.4±1.0

バラ包装

試験項目〔規格値〕		開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状〔※1〕		適	適	適	適
確認試験（液体クロマトグラフィー）〔※2〕		適	適	適	適
純度試験（液体クロマトグラフィー）〔※3〕		適	適	適	適
製剤均一性試験〔判定値 15.0%以内〕		適	適	適	適
溶出試験〔pH2.0、50rpm、45分間、※4〕		適	適	適	適
定量〔95.0～105.0%〕 ^{※5} （平均含有率(%)±C.V.）	錠 1mg「DSEP」	100.0±1.1	99.7±0.7	99.9±1.5	99.6±0.6
	錠 2mg「DSEP」	100.7±0.8	100.2±0.6	99.2±1.3	100.6±0.9
	錠 3mg「DSEP」	101.0±0.6	100.6±1.1	99.9±0.7	100.6±0.5

※1：錠 1mg：白色のフィルムコーティング錠、錠 2mg：割線入りの淡黄色のフィルムコーティング錠
錠 3mg：淡赤色のフィルムコーティング錠

※2：試料溶液から得た主ピークの保持時間は、標準溶液から得た主ピークの保持時間と等しい。

※3：相対保持時間約 0.31 及び約 0.55 の類縁物質 0.5%未満、それ以外の類縁物質 0.1%未満

※4：錠 1mg「DSEP」：75%、錠 2mg「DSEP」、錠 3mg「DSEP」：80%

※5：3Lot の平均値

(2)長期保存試験

PTP 包装

試験項目〔規格値〕		開始時	6 ヶ月後	1 年後	1.5 年後	2 年後
性状〔※1〕		適	適	適	適	適
確認試験（液体クロマトグラフィー）〔※2〕		適	適	適	適	適
純度試験（液体クロマトグラフィー）〔※3〕		適	適	適	適	適
製剤均一性試験〔判定値 15.0%以内〕		適	適	適	適	適
溶出試験〔pH2.0、50rpm、45 分間、※4〕		適	適	適	適	適
定量(%) 〔95.0~105.0%〕 ※5	錠 1mg「DSEP」	100.0	99.4	99.7	99.2	99.2
	錠 2mg「DSEP」	100.7	99.8	99.9	99.6	99.3
	錠 3mg「DSEP」	101.0	100.4	100.6	99.8	99.3

バラ包装

試験項目〔規格値〕		開始時	6 ヶ月後	1 年後	1.5 年後	2 年後
性状〔※1〕		適	適	適	適	適
確認試験（液体クロマトグラフィー）〔※2〕		適	適	適	適	適
純度試験（液体クロマトグラフィー）〔※3〕		適	適	適	適	適
製剤均一性試験〔判定値 15.0%以内〕		適	適	適	適	適
溶出試験〔pH2.0、50rpm、45 分間、※4〕		適	適	適	適	適
定量(%) 〔95.0~105.0%〕 ※5	錠 1mg「DSEP」	100.0	99.5	100.0	99.9	99.6
	錠 2mg「DSEP」	100.7	99.8	99.6	100.3	101.0
	錠 3mg「DSEP」	101.0	100.1	100.3	100.7	100.5

※1：錠 1mg：白色のフィルムコーティング錠、錠 2mg：割線入りの淡黄色のフィルムコーティング錠
錠 3mg：淡赤色のフィルムコーティング錠

※2：試料溶液から得た主ピークの保持時間は、標準溶液から得た主ピークの保持時間と等しい。

※3：相対保持時間約 0.31 及び約 0.55 の類縁物質 0.5%未満、それ以外の類縁物質 0.1%未満

※4：錠 1mg「DSEP」：75%、錠 2mg「DSEP」、錠 3mg「DSEP」：80%

※5：3Lot の平均値

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）及び長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、24 ヶ月）の結果、エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」、エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」及びエスゾピクロン錠 3mg「DSEP」の PTP 包装品は、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。また、最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」、エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」及びエスゾピクロン錠 3mg「DSEP」のバラ包装品は、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

(3)無包装状態での安定性

エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」、エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」及びエスゾピクロン錠 3mg「DSEP」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性〔性状、硬度、純度試験、溶出試験、定量〕を確認した。

IV. 製剤に関する項目

試験条件		結果		
		錠 1mg	錠 2mg	錠 3mg
温度	40℃、3 ヶ月 (褐色ガラス瓶、密栓)	変化なし	変化なし	変化なし
湿度	30℃、75%RH、3 ヶ月 (褐色ガラス瓶・開栓)	硬度低下傾向	硬度低下傾向	硬度低下傾向
光	総照射量 120 万 Lux・hr (25℃、60%RH、開放)	硬度低下傾向 錠剤の印字の退色	硬度低下傾向 光照射面の錠剤の退色 錠剤の印字の退色	硬度低下傾向 光照射面の錠剤の退色 錠剤の印字の退色

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性²⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験

1) エズピクロン錠 1mg「DSEP」

「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」及び「溶出試験法回転バスケット法」による。

標準製剤：エズピクロン錠 3mg「DSEP」

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 日本薬局方精製水

回転数：100rpm

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って同等性を判定した。

【pH1.2、100rpm】（回転バスケット法）、【pH5.0、100rpm】（回転バスケット法）：

平均溶出率：標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

【pH6.8、100rpm】（回転バスケット法）：

平均溶出率：標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間内において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 50 以上である。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が 50%以上に達し、85%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±20%の範囲を超えるものがない。

ない。

【水、100rpm】（回転バスケット法）：

平均溶出率：標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間内において標準製剤の平均溶出率が 50%以上 85%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 55 以上である。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が 50%以上に達し、85%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 20\%$ の範囲を超えるものがない。

【pH6.8、100rpm】（パドル法）：

平均溶出率：標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出する場合

標準製剤の平均溶出率が平均 60%及び 85%となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 50 以上である。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがない。

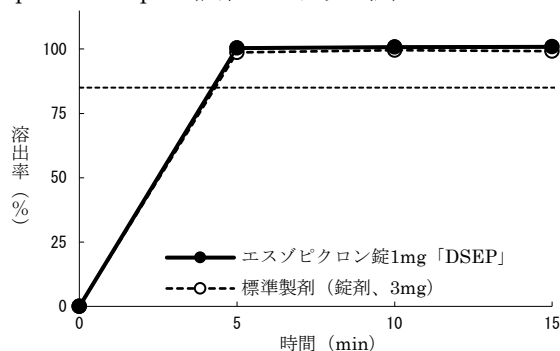
試験結果：規定された溶出試験条件において「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

溶出挙動における同等性（エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」 及び標準製剤の平均溶出率の比較）

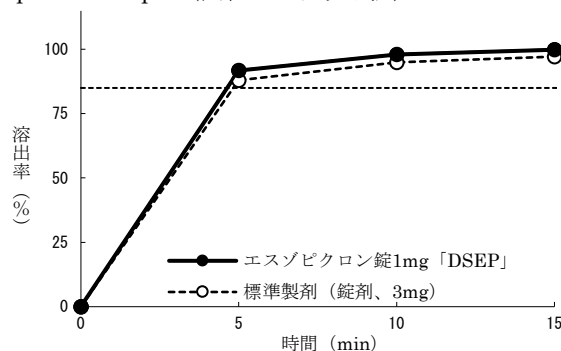
試験条件	溶出時間 (分)	平均溶出率 (%)			判定	判定基準 (エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」 の溶出条件)
		エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」	標準製剤 (錠剤、3mg)	差 (絶対値)		
100rpm 回転バスケット法	pH1.2	15	100.9	99.2	1.7	適 $\geq 85\%$ 又は $\pm 10\%$
	pH5.0	15	99.9	97.2	2.7	
	pH6.8	5	42.6	37.9	4.7	適 $\pm 10\%$ 又は f_2 関数 ≥ 50
		60	90.2	83.0	7.2	
	水	10	50.5	43.2	7.3	適 $\pm 8\%$ 又は f_2 関数 ≥ 55
360		83.7	75.9	7.8		
100rpm パドル法	pH6.8	10	71.2	69.5	1.7	適 $\pm 10\%$ 又は f_2 関数 ≥ 50
		30	85.6	86.2	0.6	

(溶出曲線)

pH1.2/100rpm (回転バスケット法)

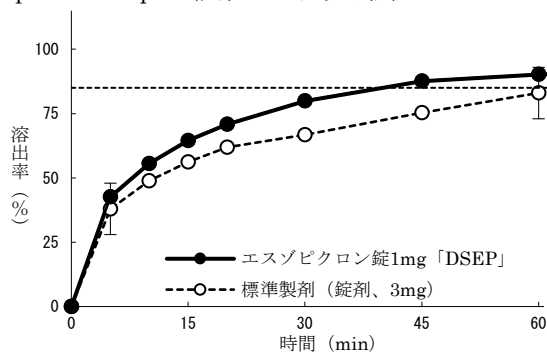


pH5.0/100rpm (回転バスケット法)

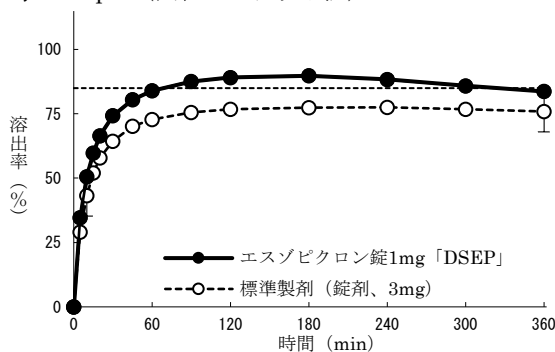


IV. 製剤に関する項目

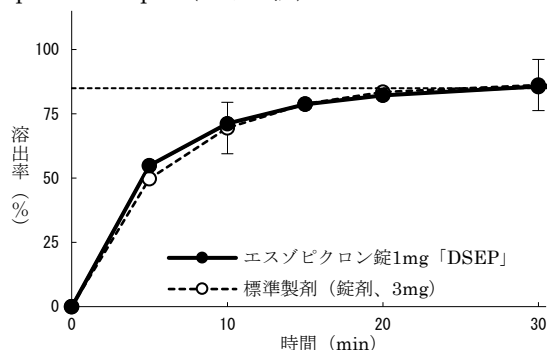
pH6.8/100rpm (回転バスケット法)



水/100rpm (回転バスケット法)



pH6.8/100rpm (パドル法)



最終比較時点でのエソゾピクロン錠 1mg 「DSEP」 の個々の溶出率 (%)

pH1.2/ 50rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：15分						平均溶出率：100.9%			上限：115.9%			下限：85.9%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12				
	100.9	96.5	103.3	98.3	103.3	101.3	101.7	101.3	101.3	101.6	97.5	103.2				
pH5.0/ 50rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：15分						平均溶出率：99.9%			上限：114.9%			下限：84.9%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12				
	102.3	99.7	103.3	97.4	101.7	101.3	102.3	92.4	100.8	100.0	98.7	98.9				
pH6.8/ 50rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：60分						平均溶出率：90.2%			上限：102.2%			下限：78.2%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12				
	90.7	80.3	90.1	88.4	85.2	92.5	95.3	94.7	91.9	86.7	92.1	94.5				
水/ 50rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：360分						平均溶出率：83.7%			上限：95.7%			下限：71.7%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12				
	88.1	89.2	84.8	79.0	86.8	84.7	79.2	84.3	80.4	80.9	79.5	87.7				
pH6.8/ 100rpm パドル法	最終比較時点：30分						平均溶出率：85.6%			上限：100.6%			下限：70.6%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12				
	81.2	85.9	84.9	89.4	90.1	84.7	87.5	81.8	85.7	92.3	81.2	82.7				

2) エソゾピクロン錠 2mg 「DSEP」

「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査 発 0229 第 10 号）」に基づき、試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」及び「溶出試験法回転バスケット法」による。

標準製剤：エソゾピクロン錠 3mg 「DSEP」

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 日本薬局方精製水

回転数：100rpm

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って同等性を判定した。

【pH1.2、100rpm】（回転バスケット法）、【pH5.0、100rpm】（回転バスケット法）：

平均溶出率：標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

【pH6.8、100rpm】（回転バスケット法）：

平均溶出率：標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間内において標準製剤の平均溶出率が85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が50以上である。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が50%以上に達し、85%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがない。

【水、100rpm】（回転バスケット法）：

平均溶出率：標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間内において標準製剤の平均溶出率が50%以上85%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が55以上である。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が50%以上に達し、85%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがない。

【pH6.8、100rpm】（パドル法）：

平均溶出率：標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出する場合

標準製剤の平均溶出率が平均60%及び85%となる適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が50以上である。

個々の溶出率：標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

試験結果：規定された溶出試験条件において「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

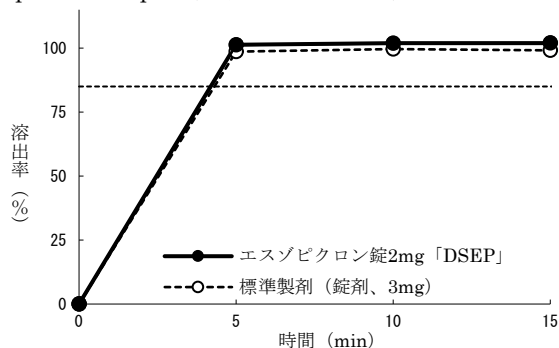
IV. 製剤に関する項目

溶出挙動における同等性（エスゾピクロン錠2mg「DSEP」及び標準製剤の平均溶出率の比較）

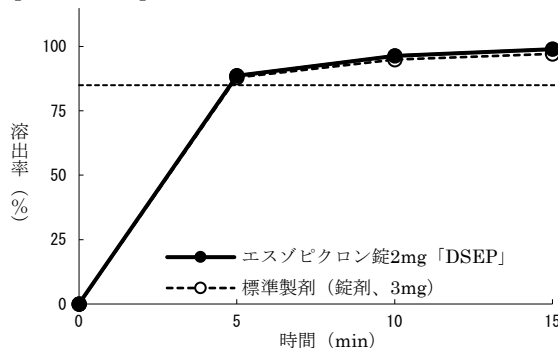
試験条件		溶出時間 (分)	平均溶出率 (%)				判定	判定基準 (エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」の溶出条件)
			エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」	標準製剤 (錠剤、3mg)	差 (絶対値)	f2 関数		
100rpm 回転バスケット法	pH1.2	15	102.0	99.2	2.8	/	適	≥85%又は±10%
	pH5.0	15	99.0	97.2	1.8			
	pH6.8	5	41.3	37.9	3.4	/	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50
		60	90.6	83.0	7.6			
	水	10	46.3	43.2	3.1	78.5	適	±8%又は f2 関数 ≥ 55
		360	84.9	75.9	9.0			
100rpm パドル法	pH6.8	10	67.6	69.5	1.9	/	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50
		30	85.6	86.2	0.6			

(溶出曲線)

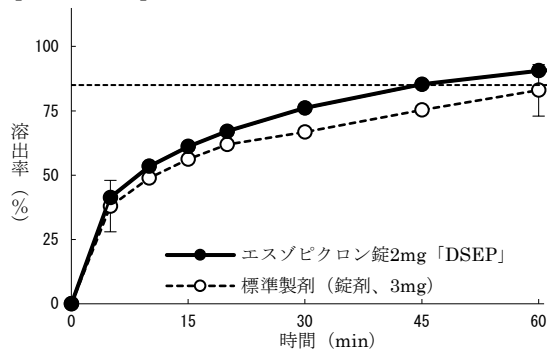
pH1.2/100rpm (回転バスケット法)



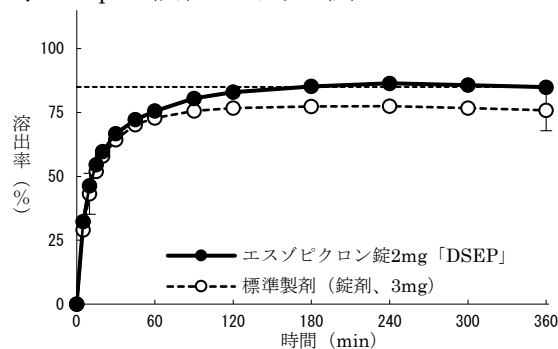
pH5.0/100rpm (回転バスケット法)



pH6.8/100rpm (回転バスケット法)

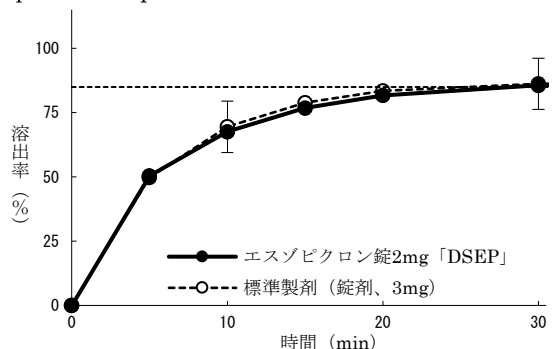


水/100rpm (回転バスケット法)



f2 関数 ≥ 50

pH6.8/100rpm (パドル法)



最終比較時点でのエソゾピクロン錠 2mg 「DSEP」の個々の溶出率 (%)

pH1.2/ 100rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：15分			平均溶出率：102.0%			上限：117.0%			下限：87.0%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	
	103.3	104.5	103.3	105.0	103.8	102.1	100.4	101.6	102.1	100.6	98.4	99.1	
pH5.0/ 100rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：15分			平均溶出率：99.0%			上限：114.0%			下限：84.0%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	
	105.2	98.6	100.1	98.7	94.4	102.7	96.7	98.9	98.9	96.9	98.4	98.2	
pH6.8/ 100rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：60分			平均溶出率：90.6%			上限：102.6%			下限：78.6%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	
	89.0	85.9	92.1	89.8	96.2	80.3	90.4	89.0	93.8	97.1	90.2	93.4	
水/ 100rpm 回転バス ケット法	最終比較時点：360分			平均溶出率：84.9%			上限：96.9%			下限：72.9%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	
	86.6	85.3	86.8	83.9	86.9	89.2	79.5	85.2	85.5	86.2	82.1	81.6	
pH6.8/ 100rpm パドル法	最終比較時点：30分			平均溶出率：85.6%			上限：100.6%			下限：70.6%			判定 適
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	
	81.9	81.1	85.4	91.9	96.7	92.5	86.2	85.3	83.8	84.5	80.8	84.2	

3) エソゾピクロン錠 3mg 「DSEP」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)」に基づき、試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」及び「溶出試験法回転バスケット法」による。

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液： pH1.2 日本薬局方溶出試験第1液
pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液
pH6.8 日本薬局方溶出試験第2液
水 日本薬局方精製水

回転数：100rpm

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

【pH1.2、100rpm】(回転バスケット法)、【pH5.0、50rpm】(回転バスケット法)：

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲内である。

【pH6.8、100rpm】(回転バスケット法)：

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間内において標準製剤の平均溶出率が85%以上となると、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。

【水、50rpm】(回転バスケット法)：

平均溶出率：標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合

規定された試験時間内において標準製剤の平均溶出率が50%以上85%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間内において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあるか、又はf2関数の値は55以上である。

【pH6.8、100rpm】（パドル法）：

標準製剤が 15～30 分に平均 85%以上溶出する場合

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

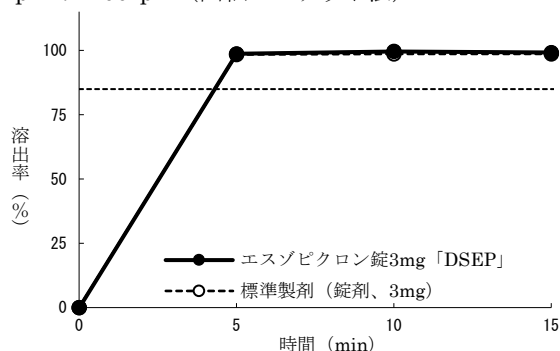
試験結果：すべての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

溶出挙動における類似性（エソズピクロン錠 3mg 「DSEP」 及び標準製剤の平均溶出率の比較）

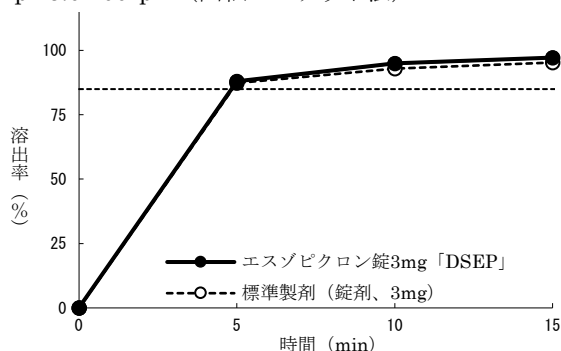
試験条件	溶出時間 (分)	平均溶出率 (%)			判定	判定基準 (エソズピクロン錠 3mg 「DSEP」 の溶出条件)
		エソズピクロン錠 3mg 「DSEP」	標準製剤 (錠剤、3mg)	差 (絶対値)		
100rpm 回転バスケット法	pH1.2	15	99.2	98.7	0.5	適 ≥85%以上又は±15%
		pH5.0	15	97.2	95.2	
	pH6.8	5	37.9	41.8	3.9	適 ±15%又は f2 関数 ≥42
		90	88.6	84.3	4.3	
	水	5	29.1	36.1	7.0	適 ±12%又は f2 関数 ≥46
		360	75.9	79.0	3.1	
100rpm パドル法	pH6.8	5	49.7	60.4	10.7	適 ±15%又は f2 関数 ≥42
		20	83.4	85.7	2.3	

(溶出曲線)

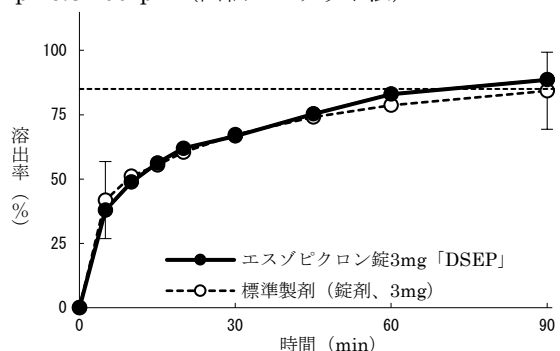
pH1.2/100rpm (回転バスケット法)



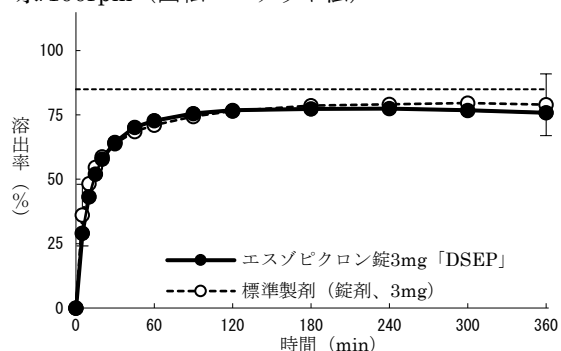
pH5.0/100rpm (回転バスケット法)

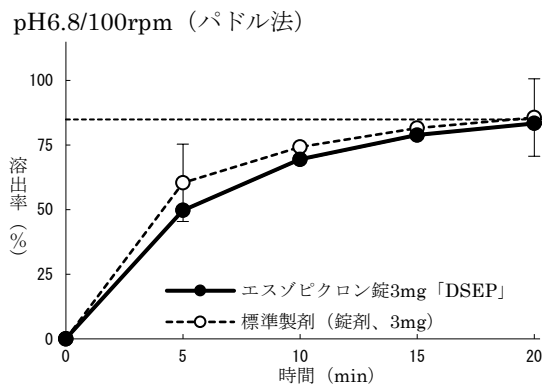


pH6.8/100rpm (回転バスケット法)



水/100rpm (回転バスケット法)





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

液体クロマトグラフィー

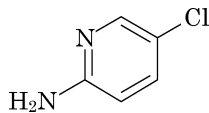
10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. カ 価

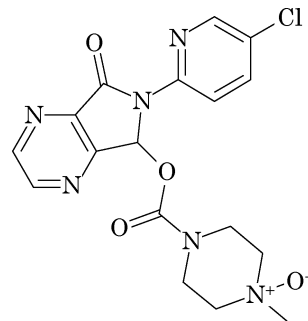
該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物



2-Amino-5-chloropyridine

副生成物

6-(5-Chloropyridin-2-yl)-7-oxo-6,7-dihydro-5H-pyrrolo[3,4-b]pyrazin-5-yl
4-methylpiperazine-1-carboxylate 4-oxide)

副生成物

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

不眠症

2. 用法及び用量

通常、成人にはエスゾピクロンとして1回 2mg を、高齢者には1回 1mg を就寝前に経口投与する。なお、症状により適宜増減するが、成人では1回 3mg、高齢者では1回 2mg を超えないこととする。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

1. 通常用量を超えて増量する場合には、患者の状態を十分に観察しながら慎重に行うこととし、症状の改善に伴って減量に努めること。
2. 本剤は就寝直前に服用させること。また、服用して就寝した後、睡眠途中で一時的に起床して仕事等で活動する可能性があるときは服用させないこと。
3. 高度の肝機能障害又は高度の腎機能障害のある患者では、1回 1mg を投与することとし、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。なお増量する場合には、1回 2mg を超えないこと（「慎重投与」の項参照）。
4. 本剤は食事と同時又は食直後の服用は避けること。〔食後投与では、空腹時投与に比べ本剤の血中濃度が低下することがある。〕

3. 臨床成績

(1)臨床データパッケージ

該当資料なし

(2)臨床効果

該当資料なし

(3)臨床薬理試験

該当資料なし

(4)探索的試験

該当資料なし

(5)検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6)治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要
該当資料なし

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

ゾピクロン、非ベンゾジアゼピン系化合物（ゾルピデム酒石酸塩）、ベンゾジアゼピン系化合物（ジアゼパム、ニトラゼパム等）、チエノジアゼピン系化合物（クロチアゼパム、エチゾラム、プロチゾラム等）

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序³⁾

エスゾピクロンの睡眠促進作用はベンゾジアゼピン結合部位において GABA_A 受容体機能の亢進を介して発現されと考えられている。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1)治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2)最高血中濃度到達時間⁴⁾

健康成人男子 1錠投与時	最高血中濃度到達時間
エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」	該当資料なし
エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」	該当資料なし
エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」	1.17 時間 (n=35)

(3)臨床試験で確認された血中濃度

1) 生物学的同等性試験

i) エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」²⁾

エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

「IV. 7. (1)溶出挙動における類似性 1)」の項を参照

ii) エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」²⁾

エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

「IV. 7. (1)溶出挙動における類似性 2)」の項を参照

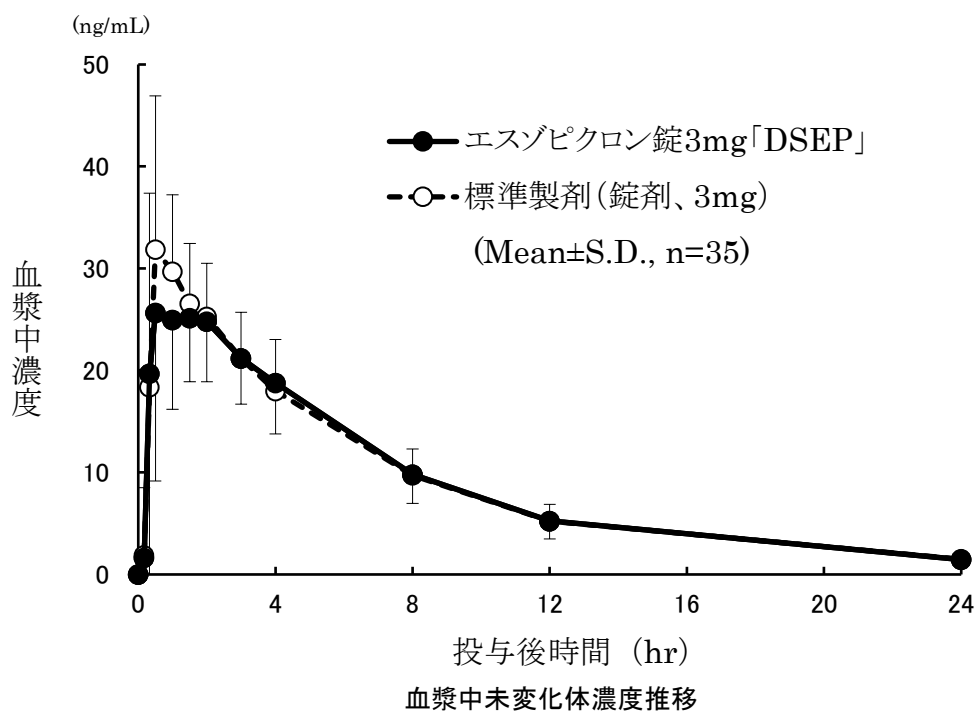
iii) エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」⁴⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1錠（エスゾピクロンとして 3mg）を健康成人男子に絶食時単回経口投与（水 150mL で服用）して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

薬物動態パラメータ

	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」	213.504±45.854	35.540±10.860	1.17±1.01	5.75±0.67
標準製剤（錠剤、3mg）	216.565±54.811	37.066±12.205	0.84±0.51	5.82±0.75

(Mean±S.D., n=35)



血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2)中毒域

該当資料なし

(3)食事・併用薬の影響

該当資料なし

(4)母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1)解析方法

該当資料なし

(2)吸収速度定数

該当資料なし

(3)バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4)消失速度定数⁴⁾

健康成人男子単回投与（1錠）

	エスゾピクロン錠 1mg「DSEP」	エスゾピクロン錠 2mg「DSEP」	エスゾピクロン錠 3mg「DSEP」
Kel (hr ⁻¹)	該当資料なし	該当資料なし	0.1222±0.0145 (n=35)

(Mean±S.D.)

(5)クリアランス

該当資料なし

(6)分布容積

該当資料なし

(7)血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸 収

該当資料なし

4. 分 布

(1)血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2)血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

<参考>

「VIII.10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与(1)」の項を参照

(3)乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>

「VIII.10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)」の項を参照

(4)髄液への移行性

該当資料なし

(5)その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代 謝

(1)代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2)代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

本剤は主として肝薬物代謝酵素 CYP3A4 で代謝される。

(3)初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4)代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5)活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排 泄

(1)排泄部位及び経路

該当資料なし

(2)排泄率

該当資料なし

(3)排泄速度

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

血液透析による除去は有効ではない

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

【警告】

本剤の服用後に、もうろう状態、睡眠随伴症状（夢遊症状等）があらわれることがある。また、入眠までの、あるいは中途覚醒時の出来事を記憶していないことがあるので注意すること。

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

1. 本剤の成分又はゾピクロンに対し過敏症の既往歴のある患者
2. 重症筋無力症の患者 [筋弛緩作用により症状を悪化させるおそれがある。]
3. 急性閉塞隅角緑内障の患者 [抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。]

【原則禁忌】（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）

肺性心、肺気腫、気管支喘息及び脳血管障害の急性期等で呼吸機能が高度に低下している場合 [炭酸ガスナルコーシスを起こしやすい。]

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 2. 用法及び用量」の項を参照

5. 慎重投与内容とその理由

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 衰弱者 [薬物の作用が強くあらわれ、副作用が発現しやすい。]
- (2) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）
- (3) 心障害のある患者 [血圧低下があらわれるおそれがあり、症状の悪化につながるおそれがある。]
- (4) 脳に器質的障害のある患者 [作用が強くあらわれるおそれがある。]
- (5) 肝機能障害又は腎機能障害のある患者 [本剤のクリアランスが低下し、血中濃度が上昇するおそれがある（「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照）。]
- (6) 本剤により睡眠随伴症状（夢遊症状等）として異常行動を発現したことがある患者 [重篤な自傷・他傷行為、事故等に至る睡眠随伴症状を発現するおそれがあるため、投与の中止を検討すること。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

<p>2. 重要な基本的注意</p> <p>(1)連用により薬物依存を生じることがあるので、漫然とした継続投与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続する場合には、治療上の必要性を十分に検討すること（「重大な副作用」の項参照）。</p> <p>(2)本剤の影響が翌朝以降に及び、眠気、注意力、集中力、反射運動能力等の低下が起こることがあるので、自動車の運転など危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意すること。</p>

7. 相互作用

<p>3. 相互作用</p> <p>本剤は主として肝薬物代謝酵素 CYP3A4 で代謝される。</p>
--

(1)併用禁忌とその理由

該当しない

(2)併用注意とその理由

<p>3. 相互作用</p> <p>併用注意（併用に注意すること）</p>		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
<p>筋弛緩薬 スキサメトニウム塩化物水和物 ツボクラリン塩化物塩酸塩水和物 パンクロニウム臭化物</p> <p>中枢神経抑制剤 フェノチアジン誘導体 バルビツール酸誘導体 等</p>	<p>これらの作用が増強されることがあるので、併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与すること。</p>	<p>相加的に抗痙攣作用、中枢神経抑制作用が増強される可能性がある。</p>
<p>アルコール（飲酒）</p>	<p>相互に作用を増強することがある。</p>	<p>飲酒により中枢神経抑制作用が増強されることがある。</p>
<p>麻酔時 チアミラルナトリウム チオペンタールナトリウム 等</p>	<p>呼吸抑制があらわれることがあるので、慎重に投与すること。</p>	<p>本剤により呼吸抑制があらわれることがあり、麻酔により相加的に呼吸が抑制される可能性がある。</p>
<p>CYP3A4 誘導作用を有する薬剤 リファンピシン 等</p>	<p>本剤の代謝を促進し、作用を減弱させるおそれがある。</p>	<p>これらの薬剤の肝代謝酵素誘導作用により、本剤の代謝が促進され、効果の減弱を来すことがある。</p>
<p>CYP3A4 阻害作用を有する薬剤 イトラコナゾール 等</p>	<p>本剤の代謝を阻害し、作用を増強させるおそれがある。</p>	<p>これらの薬剤の肝代謝酵素阻害作用により、本剤の代謝が阻害され、本剤の血漿中濃度が増加するおそれがある。</p>

8. 副作用

(1)副作用の概要

<p>4. 副作用</p> <p>本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。</p>

(2)重大な副作用と初期症状

4. 副作用

(1)重大な副作用（頻度不明）

- 1) **ショック、アナフィラキシー**：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、蕁麻疹、血管浮腫等の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) **依存性**：連用により薬物依存を生じることがあるので、観察を十分に行い、用量及び使用期間に注意し慎重に投与すること。また、連用中における投与量の急激な減少ないし投与の中止により、不安、異常な夢、悪心、胃不調、反跳性不眠等の離脱症状があらわれることがあるので、投与を中止する場合には、徐々に減量するなど慎重に行うこと。
- 3) **呼吸抑制**：呼吸抑制があらわれることがある。また呼吸機能が高度に低下している患者に投与した場合、炭酸ガスナルコーシスを起こすおそれがあるので、このような場合には気道を確保し、換気を図るなど適切な処置を行うこと。
- 4) **肝機能障害**：AST (GOT)、ALT (GPT)、ALP、 γ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 5) **精神症状、意識障害**：悪夢（異常な夢）、意識レベルの低下、興奮（激越）、錯乱（錯乱状態）、幻覚、攻撃性、せん妄、異常行動等の精神症状及び意識障害があらわれることがあるので、患者の状態を十分に観察し、異常が認められた場合には投与を中止すること。
- 6) **一過性前向性健忘、もうろう状態、睡眠随伴症状（夢遊症状等）**：一過性前向性健忘（中途覚醒時の出来事をおぼえていない等）、もうろう状態、睡眠随伴症状（夢遊症状等）があらわれることがあるので、本剤を投与する場合には少量から開始するなど、慎重に投与すること。なお、ゾピクロン製剤において、十分に覚醒しないまま、車の運転、食事等を行い、その出来事を記憶していないとの報告がある。異常が認められた場合には投与を中止すること。

(3)その他の副作用

4. 副作用

(2) その他の副作用

	頻 度 不 明
精 神 神 経 系	傾眠、頭痛、浮動性めまい、不安、注意力障害、異常な夢、うつ病、神経過敏、記憶障害、錯感覚、思考異常、感情不安定、錯乱状態
過 敏 症 ^{注)}	発疹、そう痒症
消 化 器	味覚異常、口渇、口腔内不快感、口内乾燥、下痢、便秘、悪心、消化不良、嘔吐
肝 臓	AST (GOT)、ALT (GPT)、ALP、 γ -GTP、ビリルビンの上昇
そ の 他	倦怠感、湿疹、尿中ブドウ糖陽性、尿中血陽性、リビドー減退、筋肉痛、片頭痛、背部痛、高血圧、末梢性浮腫

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5)基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

1. 本剤の成分又はゾピクロンに対し過敏症の既往歴のある患者

4. 副作用

(1) 重大な副作用（頻度不明）

- 1) ショック、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、蕁麻疹、血管浮腫等の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. 副作用

(2) その他の副作用

	頻 度 不 明
過 敏 症 ^{注)}	発疹、そう痒症

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

9. 高齢者への投与

5. 高齢者への投与

高齢者での薬物動態試験で、血中濃度が高い傾向が認められており、運動失調等の副作用が起りやすいので1回1mgを投与することとし、増量する場合には2mgを超えないこと（「用法・用量」の項参照）。

10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦等

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。〔妊娠中及び授乳中の投与に関する安全性は確立されていない。妊娠後期に本剤を投与された患者より出生した児に呼吸抑制、痙攣、振戦、易刺激性、哺乳困難等の離脱症状があらわれるおそれがある。なお、これらの症状は、新生児仮死として報告される場合もある。〕

(2) 授乳婦

授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。〔ヒト母乳中に移行し、新生児に嗜眠を起こすおそれがある。〕

11.小児等への投与

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない（国内での使用経験がない）。

12.臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

8. 過量投与

- (1) 徴候・症状：本剤の過量投与により傾眠、錯乱、嗜眠を生じ、更には失調、筋緊張低下、血圧低下、メトヘモグロビン血症、呼吸機能低下、昏睡等に至るおそれがある。他の中枢神経抑制剤やアルコールと併用時の過量投与は致死的となることがある。また、合併症や衰弱状態などの危険因子がある場合は、症状は重篤化するおそれがあり、ごくまれに致死的な経過をたどることがある。
- (2) 処置：呼吸、脈拍、血圧の監視を行うとともに、催吐、胃洗浄、吸着剤・下剤の投与、輸液、気道の確保等の適切な処置を行うこと。また、本剤の過量投与が明白又は疑われた場合の処置としてフルマゼニル（ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤）を投与する場合には、使用前にフルマゼニルの使用上の注意（禁忌、慎重投与、相互作用等）を必ず読むこと。なお、血液透析による除去は有効ではない。

14. 適用上の注意

9. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

15. その他の注意

10. その他の注意

- (1) 投与した薬剤が特定されないままにフルマゼニル（ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤）を投与された患者で、新たに本剤を投与する場合、本剤の鎮静、抗痙攣作用が変化、遅延するおそれがある。
- (2) 本剤は、ラセミ体であるゾピクロン的一方のエナンチオマー（(S)-エナンチオマー）である。ゾピクロンでは臨床用量の約800倍（100mg/kg/日）をマウス、ラットに2年間投与した試験において、マウス雄の皮下、雌の肺、ラット雄の甲状腺、雌の乳腺での腫瘍発生頻度が対照群に比べ高いとの報告がある。

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1)薬効薬理試験（「VI.薬効薬理に関する項目」参照）

(2)副次的薬理試験

該当資料なし

(3)安全性薬理試験

該当資料なし

(4)その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1)単回投与毒性試験

該当資料なし

(2)反復投与毒性試験

該当資料なし

(3)生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4)その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：習慣性医薬品（注意—習慣性あり）、処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：毒薬、習慣性医薬品（注意—習慣性あり）

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

保管方法

PTP包装はアルミ袋開封後、バラ包装は開栓後湿気を避けて保存すること。

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

「X.3.貯法・保存条件」の項を参照

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

「Ⅷ.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」、「Ⅷ.14.適用上の注意」及び「X.3.貯法・保存条件」の項を参照

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」	:	(PTP)	100錠
		(バラ)	100錠
エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」	:	(PTP)	100錠
		(バラ)	100錠
エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」	:	(PTP)	100錠
		(バラ)	100錠

7. 容器の材質

PTP 包装:

P T P :ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン・ポリエチレン多層フィルム、アルミニウム箔
ピロー :ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルム

個装箱 :紙

バラ包装:

ボトル :ポリエチレン

キャップ :ポリプロピレン

個装箱 :紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬 :ルネスタ錠 1mg、ルネスタ錠 2mg、ルネスタ錠 3mg (エーザイ株式会社)

同効薬 :ゾルピデム酒石酸塩、ゾピクロン、トリアゾラム、ラメルテオン

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」	2016年2月15日	30300AMX00210000
エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」	2016年2月15日	30300AMX00211000
エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」	2016年2月15日	30300AMX00212000

11. 薬価基準収載年月日

2021年6月18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

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は厚生労働大臣の定める「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

16.各種コード

販売名	HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」	128541301	1129010F1036	622854101
エスゾピクロン錠 2mg 「DSEP」	128542001	1129010F2032	622854201
エスゾピクロン錠 3mg 「DSEP」	128543701	1129010F3039	622854301

17.保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 社内資料（安定性）
- 2) 社内資料（溶出性）
- 3) グッドマン・ギルマン薬理書（上）薬物治療の基礎と臨床 第12版 廣川書店 2013;584
- 4) 社内資料（生物学的同等性）

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備 考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。

試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎後の安定性試験

1. 試験目的

エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」、錠 2mg 「DSEP」及び錠 3mg 「DSEP」の粉碎した錠剤について、通常条件下、加湿条件下及び曝光条件下に保存し、その安定性を検討した。

2. 試験項目

性状、純度試験、溶出試験、定量

3. 試験結果

通常条件（温湿度なりゆき、室内散光）下

試験項目〔規格値〕		開始時	1ヵ月後	2ヵ月後	3ヵ月後
性状		白色の粉末 ^{※3}	変化なし	黄変	黄変
純度試験〔※1〕		適	適	適	適
溶出試験〔※2〕		適	適	適	適
定量（%）〔95.0～105.0%〕	錠 1mg 「DSEP」	98.52	97.77	97.55	95.75
	錠 2mg 「DSEP」	98.38	97.16	97.40	96.54
	錠 3mg 「DSEP」	98.88	97.11	97.34	96.62

加湿条件（30±2℃、75±5%RH）下

試験項目〔規格値〕		開始時	1ヵ月後	2ヵ月後	3ヵ月後
性状		白色の粉末 ^{※3}	変化なし	変化なし	僅かな黄変
純度試験〔※1〕		適	適	適	適
溶出試験〔※2〕		適	適	適	適
定量（%）〔95.0～105.0%〕	錠 1mg 「DSEP」	98.52	96.30	97.10	95.36
	錠 2mg 「DSEP」	98.38	96.26	96.24	95.40
	錠 3mg 「DSEP」	98.88	96.07	96.84	95.43

曝光条件（温湿度なりゆき、1000Lux 照射）下

試験項目〔規格値〕		開始時	30万 Lux・hr	60万 Lux・hr	120万 Lux・hr
性状		白色の粉末 ^{※3}	黄変	黄変	黄変
純度試験〔※1〕		適	適	不適	不適
溶出試験〔※2〕		適	適	適	適
定量（%）〔95.0～105.0%〕	錠 1mg 「DSEP」	98.52	95.29	94.42	93.91
	錠 2mg 「DSEP」	98.38	95.51	95.43	95.53
	錠 3mg 「DSEP」	98.88	95.92	95.69	95.65

※1：相対保持時間約 0.31 及び約 0.55 の類縁物質 0.5%未満、それ以外の類縁物質 0.1%未満

※2：pH2.0、50rpm、45 分間、75%以上（錠 1mg 「DSEP」）、80%以上（錠 2mg 「DSEP」、錠 3mg 「DSEP」）

※3：フィルムが混在

注)

- ・本データは、上記条件下における結果であり、他の条件下における安定性を保証するものではありません。
- ・製品を加工することによって生じる有効性の変化・副作用の発現等は検討しておりません。
- ・製品を加工する行為は PL 法の対象となり、その製造物責任は加工した医療関係者に帰することとなります。

(2) 経管通過性試験

1. 試験目的

エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」、錠 2mg 「DSEP」及び錠 3mg 「DSEP」について、崩壊懸濁試験における崩壊・懸濁の状態と、経管通過性試験における経管栄養チューブの通過性を検討した。

2. 試験方法

(1) 崩壊懸濁試験… ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に製剤 1 個を入れてピストンを押し込む。ディスペンサーに 55℃の温湯 20mL を吸い取り、キャップで閉じ、ディスペンサーを横にした状態で 5 分間放置する。5 分後にディスペンサーを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後、同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止する。この中止した薬品のうち、粉碎可能な錠剤は粉碎又はコーティングを破壊してから、ディスペンサーに入れて同様に実験を行う。錠剤の粉碎又はコーティングの破壊はシートの上から錠剤を乳棒で数回叩いて行う。

(2) 通過性試験… 崩壊懸濁性試験で得られた懸濁液をサイズ 8Fr. (フレンチ) の経管栄養チューブに約 2~3mL/秒の速度で注入し、通過性を確認する。懸濁液を注入した後に 20 mL の水を同じディスペンサーで吸い取り、注入してチューブを洗う時、ディスペンサー及びチューブ内に薬が残存していなければ通過性に問題なしとする。また、18Fr. ガストロフィーディングチューブについても同様の操作を行い、通過性を確認する。

3. 試験材料

製 剤 名 : エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」、錠 2mg 「DSEP」及び錠 3mg 「DSEP」
 使用器具 : ディスペンサー (20mL)、経管栄養チューブ (8Fr.)、ガストロフィーディングチューブ (18Fr.)

4. 試験結果

エスゾピクロン錠 1mg 「DSEP」、錠 2mg 「DSEP」及び錠 3mg 「DSEP」は、崩壊懸濁試験においては、5 分以内に崩壊・懸濁した。

また、通過性試験において、8Fr. チューブ及び 18Fr. ガストロフィーディングチューブを通過した。

(1) 崩壊懸濁試験				(2) 通過性試験	
水 (約 55℃)		粉碎・破壊→水		通過サイズ	
5 分	10 分	5 分	10 分		
○	△	△	△	経管栄養チューブ (8Fr.)	
				ガストロボタンフィーディングチューブ (18Fr.)	

○ : 完全崩壊

× : 投与困難な崩壊状態

△ : 時間をかければ完全崩壊しそうな状況、またはコーティング残留等によりチューブを閉塞する危険性がある崩壊状態

注)

懸濁溶液を経管チューブにて投与することは、適用外使用になります。また、その場合の体内動態データはありません。

本データは、懸濁溶液の経管チューブを用いての使用における「効果・安全性・品質」を保証するものではありません。

製品を加工する行為は PL 法の対象となり、その製造物責任は加工した医療関係者に帰することとなります。

2. その他の関連資料

該当資料なし

〔文献請求先・製品情報お問い合わせ先〕
第一三共エスファ株式会社 お客様相談室
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1
TEL:0120-100-601