2025年4月改訂（第9版）

| 日本標準商品分類番号 |
| --- |
| 872329 |

# 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(2019年更新版)に準拠して作成

胃炎・胃潰瘍治療剤

日本薬局方　トロキシピド錠

# トロキシピド錠100mg「オーハラ」

TROXIPIDE TABLETS 100mg「OHARA」

| | |
| --- | --- |
| 剤形 | 錠剤(フィルムコーティング錠) |
| 製剤の規制区分 | 該当しない |
| 規格・含量 | 1錠中日局トロキシピド100mgを含有する。 |
| 一般名 | 和名：トロキシピド [JAN]<br>洋名：Troxipide [JAN, INN] |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・<br>販売開始年月日 | 製造販売承認年月日:2018年 1月25日(販売名変更による)<br>薬価基準収載年月日:2018年 6月15日(販売名変更による)<br>販売開始年月日:1994年 7月 8日 |
| 製造販売(輸入)・<br>提携・販売会社名 | 製造販売元：大原薬品工業株式会社 |
| 医薬情報担当者<br>の連絡先 | |
| 問い合わせ窓口 | 大原薬品工業株式会社　お客様相談室<br>フリーダイヤル 0120-419-363<br>URL　https://www.ohara-ch.co.jp |

本IFは2024年3月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。
最新の情報は、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」
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－

(2020 年 4 月改訂)

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)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)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている．この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目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)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 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)の医療用医薬品情報検索のページ(https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/)にて公開されている．日病薬では，2009 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か審査・検討している．

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ，IF 記載要領 2018 が公表され，今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため，その更新版を策定した．

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し，医師・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造販売又は販売に携わる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 に記載する項目配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠し，一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される．ただし，製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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，利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに，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 の提供は電子データを基本とし，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利用者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，製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等，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「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」，「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり，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

IF を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. IF は日病薬の要請を受けて，当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する，医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが，記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン，製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは，未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について，製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており，MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより，利用者自らが IF の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない. 製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し，その客観性を見抜き，医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり，IF を活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい.

# 目　　次


Ⅰ　概要に関する項目
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的特性 …… 1
3. 製品の製剤学的特性 …… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
6. RMP の概要 …… 2

Ⅱ　名称に関する項目
1. 販売名 …… 3
2. 一般名 …… 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）又は本質 …… 3
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 …… 3

Ⅲ　有効成分に関する項目
1. 物理化学的性質 …… 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …… 4
3. 有効成分の確認試験法、定量法 …… 5

Ⅳ　製剤に関する項目
1. 剤形 …… 6
2. 製剤の組成 …… 6
3. 添付溶解液の組成及び容量 …… 6
4. 力価 …… 7
5. 混入する可能性のある夾雑物 …… 7
6. 製剤の各種条件下における安定性 …… 7
7. 調製法及び溶解後の安定性 …… 8
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 8
9. 溶出性 …… 8
10. 容器・包装 …… 9
11. 別途提供される資材類 …… 10
12. その他 …… 10

Ⅴ　治療に関する項目
1. 効能又は効果 …… 11
2. 効能又は効果に関連する注意 …… 11
3. 用法及び用量 …… 11
4. 用法及び用量に関連する注意 …… 11
5. 臨床成績 …… 11

Ⅵ　薬効薬理に関する項目
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 14
2. 薬理作用 …… 14

Ⅶ　薬物動態に関する項目
1. 血中濃度の推移 …… 15
2. 薬物速度論的パラメータ …… 17
3. 母集団（ポピュレーション）解析 …… 17
4. 吸収 …… 17
5. 分布 …… 17
6. 代謝 …… 18
7. 排泄 …… 18
8. トランスポーターに関する情報 …… 18
9. 透析等による除去率 …… 18
10. 特定の背景を有する患者 …… 18
11. その他 …… 18

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 …… 19
2. 禁忌内容とその理由 …… 19
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 19
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 19
5. 重要な基本的注意とその理由 …… 19
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 …… 19
7. 相互作用 …… 20
8. 副作用 …… 20
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 …… 20
10. 過量投与 …… 20
11. 適用上の注意 …… 21
12. その他の注意 …… 21

Ⅸ　非臨床試験に関する項目
1. 薬理試験 …… 22
2. 毒性試験 …… 22

Ⅹ　管理的事項に関する項目
1. 規制区分 …… 23
2. 有効期間 …… 23
3. 包装状態での貯法 …… 23
4. 取扱い上の注意 …… 23
5. 患者向け資材 …… 23
6. 同一成分・同効薬 …… 23
7. 国際誕生年月日 …… 23
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 …… 23
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 …… 24
10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 …… 24
11. 再審査期間 …… 24
12. 投薬期間制限に関する情報 …… 24
13. 各種コード …… 24
14. 保険給付上の注意 …… 24

ＸＩ　文献
1. 引用文献 ····· 25
2. その他の参考文献 ····· 25

ＸⅡ　参考資料
1. 主な外国での発売状況 ····· 26
2. 海外における臨床支援情報 ····· 26

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 ····· 27
2. その他の関連資料 ····· 27

付表 ····· 28

略語表

| 略語 | 略語内容(英語) | 略語内容(日本語) |
|---|---|---|
| Al-P | alkaline phosphatase | アルカリフォスファターゼ |
| ALT | alanine aminotransferase | アラニンアミノトランスフェラーゼ |
| AST | aspartate aminotransferase | アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ |
| ATP | adenosin triphosphate | アデノシン三リン酸 |
| AUC | area under the plasma concentration-time curve | 血漿中濃度－時間曲線下面積 |
| $C_{max}$ | maximum plasma concentration | 最高血漿中濃度 |
| CYP | cytochrome P450 | チトクローム P450 |
| γ-GTP | gamma-glutamyl transpeptidase | γ-グルタミントランスペプチダーゼ |
| LDH | lactate dehydrogenase | 乳酸脱水素酵素 |
| RMP | risk management plan | 医薬品リスク管理計画 |
| $t_{1/2}$ | elimination half-life | 半減期 |
| $t_{max}$ | time of maximum plasma concentration | 最高血漿中濃度到達時間 |

# Ⅰ．概要に関する項目

## １．開発の経緯

トロキシピド(一般名)は、胃炎・胃潰瘍治療剤であり、本邦では1986年に上市されている。

トロキシピド錠100mg「オーハラ」は、大原薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬発第698号表1及び別表2-(1)（昭和55年5月30日)(付表参照)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1994年3月に製造販売承認を取得し、1994年7月に上市した。

その後、2008年12月及び2018年6月に医療事故防止のための販売名変更を行った。

## ２．製品の治療学的特性

(1) 本剤は胃炎・胃潰瘍の治療薬である。(「Ⅴ．治療に関する項目」参照)

(2) トロキシピドは胃粘膜の血流増加作用、胃粘膜構成成分の正常化作用、胃粘膜内のプロスタグランジン量増加作用、 及び胃粘膜の代謝賦活作用により、胃粘膜の組織修復を促進させる。(「Ⅵ．薬効薬理に関する項目」参照)

(3) 重大な副作用として、**ショック、アナフィラキシー、肝機能障害、黄疸**が報告されている。 (「Ⅷ．安全性(使用上の注意等)に関する項目」参照)

## ３．製品の製剤学的特性

(1) 成分名の一部及び含量が刻印された錠剤である。

(2) 成分名、含量、屋号、GS1コードが表示されたPTPシートである。

(3) 個装箱には、製品名カード、剤形イメージ、GS1 コードの 3 つの製品情報が盛り込まれている。また、解体用ミシン目を設けることによって廃棄時の負担軽減に配慮している。

## 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、<br>最適使用推進ガイドライン等 | 有無 |
|---|---|
| RMP | 無 |
| 追加の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

該当しない

### (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

トロキシピド錠 100mg「オーハラ」

(2) 洋名

TROXIPIDE TABLETS 100mg「OHARA」

(3) 名称の由来

通知「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）

トロキシピド（JAN）

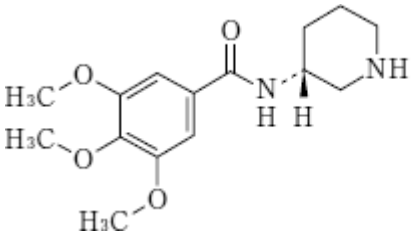
(2) 洋名（命名法）

Troxipide（JAN, INN）

(3) ステム

特になし

## ３．構造式又は示性式




及び鏡像異性体

## ４．分子式及び分子量

(1) 分子式：$C_{15}H_{22}N_2O_4$

(2) 分子量：294.35

## ５．化学名（命名法）又は本質

3,4,5-Trimethoxy-*N*-[(3*RS*)-piperidin-3-yl]benzamide

## ６．慣用名，別名，略号，記号番号

開発番号：OHK0506

# Ⅲ．有効成分に関する項目

## １．物理化学的性質

### (1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末である。

### (2) 溶解性

溶解性

| 溶媒 | 日本薬局方の溶解度表記 |
|---|---|
| 酢酸(100) | 溶けやすい |
| メタノール | やや溶けやすい |
| エタノール(99.5) | やや溶けにくい |
| 水 | 溶けにくい |

本品は 0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

溶解度(37℃)[1)]

| | |
|---|---|
| pH1.2 | 25.1mg/mL |
| pH4.0 | 13.5mg/mL |
| pH6.8 | 4.8mg/mL |
| 水 | 0.8mg/mL |

### (3) 吸湿性

該当資料なし

### (4) 融点(分解点)，沸点，凝固点

**融点**：177～181℃

### (5) 酸塩基解離定数[1)]

p*K*a：9.49(25℃)、9.47(35℃)

### (6) 分配係数

該当資料なし

### (7) その他の主な示性値

旋光度：本品の 1mol/L 塩酸試液溶液(1→5)は旋光性を示さない。

吸光度：258nm 付近に吸収の極大を示し、極大吸収波長における比吸光度($E^{1\%}_{1cm}$)は約 330(本品の 0.1mol/L 塩酸試液溶液(1→62500))

pH　　：9.0～10.5(本品 0.09g に水を加えて溶かし、100mL とした液)

## 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、定量法

確認試験法

日局「トロキシピド」による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

定量法

日局「トロキシピド」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

錠剤(フィルムコーティング錠)

### (2) 製剤の外観及び性状

| 剤形 | 性状 | 外形・サイズ | | |
|---|---|---|---|---|
| | | 表面 | 裏面 | 側面 |
| フィルムコーティング錠 | 白色 | | | |
| | | 直径：7.1mm　厚さ：3.5mm　質量：140mg | | |

### (3) 識別コード

表示部位：錠剤

表示内容：トロキシ 100

### (4) 製剤の物性 [2,3]

| 崩壊試験 [2] (min, n=3) | 硬度 [3] (kp, n=5) |
|---|---|
| 4.2※1(1.8～6.2)※2 | 9.1※1 |

※1:平均値　※2:最小値～最大値

### (5) その他

該当しない

## ２．製剤の組成

### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

| | |
|---|---|
| 有効成分 | 1 錠中日局トロキシピド 100mg を含有 |
| 添加剤 | 乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、タルク、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 1500、酸化チタン |

### (2) 電解質等の濃度

該当しない

### (3) 熱量

該当しない

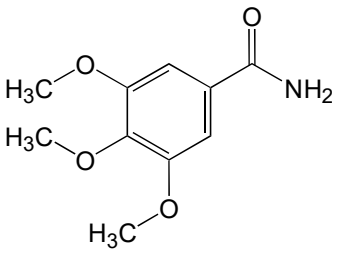
## ３．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

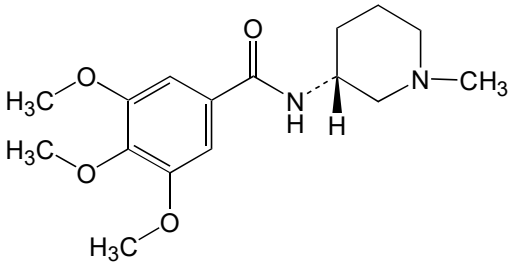
## ４．力価

該当しない

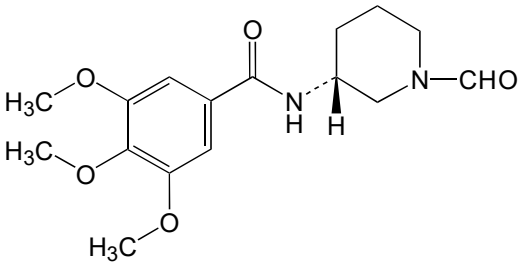
## ５．混入する可能性のある夾雑物




〔１〕




〔２〕




〔３〕

## ６．製剤の各種条件下における安定性

### (1) 長期保存条件下での安定性試験 [4)]

・ 保存形態：

PTP 包装：PTP(ポリ塩化ビニル及びアルミ箔)包装したものを紙箱に入れ封をした。

バラ包装：ポリエチレン製容器に入れ封をした。

・ 保存条件：なりゆき温度・湿度

・ 保存期間：36 ヵ月

・ 試験項目：性状、確認試験、溶出試験、定量

・ 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

| 保存条件 | 期間 | 保存形態 | 結果 |
|---|---|---|---|
| なりゆき温度・湿度 | 36 ヵ月 | PTP 包装 | 全て変化なし。 |
| | | バラ包装 | 全て変化なし。 |

### (2) 加速条件下での安定性試験 [2)]

・ 保存形態：

PTP 包装：PTP(ポリ塩化ビニル及びアルミ箔)包装したものを紙箱に入れ封をした。

バラ包装：ポリエチレン製容器に入れ封をした。

・ 保存条件：40℃(±1℃)、75%RH(±5%RH)

・ 保存期間：6 ヵ月

・ 試験項目：性状、確認試験、崩壊試験、定量

・ 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

| 保存条件 | 期間 | 保存形態 | 結果 |
|---|---|---|---|
| 40℃(±1℃)、75%RH(±5%RH) | 6ヵ月 | PTP包装 | 全て変化なし。 |
| | | バラ包装 | 全て変化なし。 |

(3) 無包装状態での安定性試験[3)]

無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験(性状、崩壊試験、定量、硬度)を行った。

| | 試験条件 | 結果 |
|---|---|---|
| 温度 | 40℃、3ヵ月(遮光・気密容器) | わずかに着色。その他は変化なし。 |
| 湿度 | 25℃、75%RH、3ヵ月(遮光・開放) | わずかに着色。その他は変化なし。 |
| 光 | 総照射量120万lx・hr(開放) | 全て変化なし。 |

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当しない

## 9. 溶出性

(1) 日局溶出試験

試験方法:日局一般試験法「溶出試験法パドル法」により、試験を行う。

条件:回転数　50rpm

試験液　水

試験結果:日本薬局方医薬品各条に定められた「トロキシピド錠」の溶出規格(30分間の溶出率が70%以上)に適合した。

| 時間 | 溶出率※(最小値～最大値) |
|---|---|
| 30分 | 94.2%(86.2～98.9%) |

※:3Lot平均値

(2) 品質再評価における溶出挙動の同等性[5)]

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成13年5月31日 医薬審786号)」に従って試験を行った。

試験方法:日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

試験液量:900mL

温度　　:37℃±0.5℃

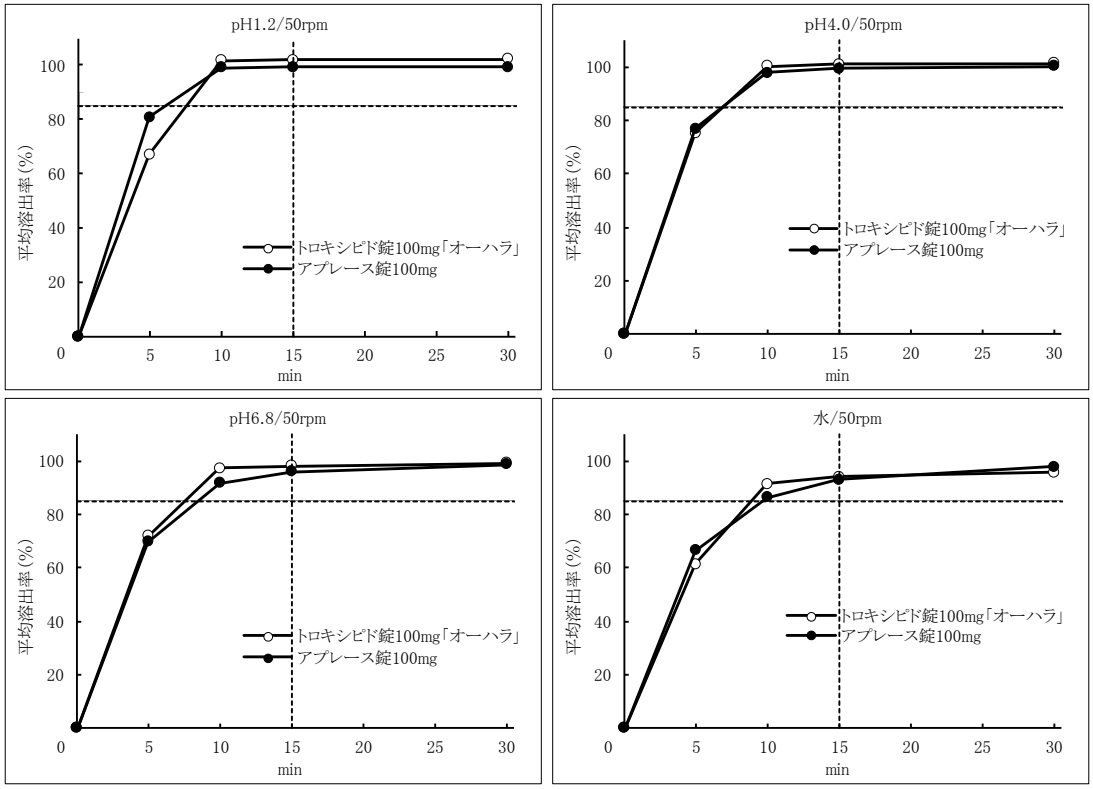
試験結果:「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。これによりトロキシピド錠 100mg「オーハラ」の溶出挙動は、全ての試験条件において標準製剤(アプレース錠 100mg)と同等であると判定された。

表 溶出挙動における同等性

| 試験条件 | | 判定時点(分) | 平均溶出率(%) | | 同等性の判定基準 | 判定 |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | | 試験製剤 | アプレース錠 100mg | | |
| 50rpm | pH1.2 | 15 | 102.1 | 99.3 | 試験製剤が 15 分間に平均 85%以上溶出 | 同等 |
| | pH4.0 | 15 | 100.9 | 99.4 | 試験製剤が 15 分間に平均 85%以上溶出 | 同等 |
| | pH6.8 | 15 | 98.1 | 95.9 | 試験製剤が 15 分間に平均 85%以上溶出 | 同等 |
| | 水 | 15 | 93.9 | 93.0 | 試験製剤が 15 分間に平均 85%以上溶出 | 同等 |

(n=6)

(溶出曲線)




試験液: pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液　pH4.0=酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L)
pH6.8=日本薬局方リン酸塩緩衝液(1→2)　水=日本薬局方精製水

## 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

(PTP) 100 錠(10 錠×10)
1000 錠(10 錠×100)
(バラ) 1000 錠

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTP 包装

PTP：ポリ塩化ビニル及びアルミ箔

バラ包装

ボトル：ポリエチレン、キャップ：ポリプロピレン

## 11. 別途提供される資材類

該当しない

## 12. その他

特になし

# Ⅴ．治療に関する項目

## １．効能又は効果

〇胃潰瘍

〇下記疾患の胃粘膜病変（びらん、出血、発赤、浮腫）の改善

急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

## ２．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

通常、成人にはトロキシピドとして１回 100mg（錠剤１錠）を１日３回食後に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

## 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

該当資料なし

### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

### (4) 検証的試験

#### 1) 有効性検証試験

〈胃炎〉

① 国内プラセボ対照二重盲検比較試験

出血又はびらんを呈する胃炎患者 72 例を対象に、トロキシピド 100mg1 日 3 回（300mg/日）2 週間経口投与における胃炎に対する有効性及び安全性を評価する目的で、プラセボを対照とした無作為化二重盲検並行群間比較試験を行った。

全般改善度解析対象集団 69 例（トロキシピド群 36 例、プラセボ群 33 例）における胃炎の改善率はトロキシピド群が 80.6%（29/36 例）、プラセボ群が 60.6%（20/33 例）であり、トロキシピド群ではプラセボ群と比較して有意に高

かった(p＜0.05)。

トロキシピド群では、副作用及び臨床検査値異常例ともに認められなかった[6)]。

**② 国内実薬対照二重盲検比較試験**

胃炎(急性胃炎又は慢性胃炎の急性胃粘膜変化)患者 259 例を対象に、トロキシピド 100mg1 日 3 回(300mg/日)2 週間(未治癒の場合は 4 週まで可)経口投与における胃炎に対する有用性を評価する目的で、セトラキサート塩酸塩を対照とした無作為化二重盲検並行群間比較試験を行った。

全般改善度解析対象集団 233 例(トロキシピド群 117 例、セトラキサート塩酸塩群 116 例)における胃炎の改善率はトロキシピド群が 82.1%(96/117 例)、セトラキサート塩酸塩群が 75.9%(88/116 例)であり、両群間に有意差は認められなかった。

副作用発現頻度はトロキシピド群が 0.8%(1/120 例)、セトラキサート塩酸塩群が 1.6%(2/127 例)であった。トロキシピド群で認められた副作用は、下痢 0.8%(1/120 例)であった。また、臨床検査値異常例は総ビリルビン上昇が 1 例、尿蛋白陽性が 1 例、アルカリホスファターゼ上昇が 1 例であった[7)]。

**〈胃潰瘍〉**

**国内実薬対照二重盲検比較試験**

胃潰瘍患者 321 例を対象に、トロキシピド 100mg1 日 3 回(300mg/日)12 週間経口投与における消化性胃潰瘍に対する有効性及び安全性を評価する目的で、セトラキサート塩酸塩を対照とした無作為化二重盲検並行群間比較試験を行った。

解析対象集団 312 例(トロキシピド群 154 例、セトラキサート塩酸塩群 158 例)における胃潰瘍の改善率はトロキシピド群が 68.8%(106/154 例)、セトラキサート塩酸塩群が 71.5%(113/158 例)であり、両群間に有意差は認められなかった。

副作用発現頻度はトロキシピド群が 4.5%(7/154 例)、セトラキサート塩酸塩群が 1.9%(3/158 例)であった。トロキシピド群で認められた主な副作用は、便秘 1.9%(3/154 例)であった。また、個々の臨床検査値異常例の発現頻度について、両群間で有意差は認められなかった[8)]。

**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**

該当資料なし

### (7) その他

該当資料なし

# Ⅵ．薬効薬理に関する項目

## １．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

胃粘膜保護薬

(スクラルファート水和物、レバミピド、ソファルコン、セトラキサート塩酸塩、テプレノン等)

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

## ２．薬理作用

### (1) 作用部位・作用機序

本剤は作用機序として、胃粘膜の血流増加作用、胃粘膜構成成分の正常化作用、胃粘膜内のプロスタグランジン量増加作用、及び胃粘膜の代謝賦活作用により、胃粘膜の組織修復を促進させる[9~20]。

### (2) 薬効を裏付ける試験成績

#### 1) 胃粘膜血流量増加作用

交叉熱電対法[9](ウサギ、イヌ)及び水素ガスクリアランス法(ラット[10]、イヌ[11])において、胃粘膜血流量の増加が認められた。また、臓器反射スペクトル解析法(ラット)で、脱血時の胃粘膜及び酢酸潰瘍辺縁部粘膜の血流量を増加させた[12]。

#### 2) 胃粘膜構成成分正常化作用

ラットの胃粘膜に含まれるムコ多糖体を増加し、また抗炎症薬等又はストレス負荷によるムコ多糖体の減少を抑制して胃粘膜バリヤーを増強した[13,14]。

#### 3) 胃粘膜内プロスタグランジン量増加作用

ラットの胃粘膜内で細胞保護作用のあるプロスタグランジン量を増加させた[15]。

#### 4) 胃粘膜代謝賦活作用

ラットの胃粘膜酸素消費量を増加させ、ATP 含量を増加させることにより、胃粘膜エネルギー代謝を賦活した。特に、血流量が減少している潰瘍辺縁部粘膜で、その作用が強く認められた[16,17]。

#### 5) 組織修復促進作用

ラットのクランピング・コルチゾン潰瘍、酢酸潰瘍及びクランピング潰瘍の組織学的検討において、胃粘膜再生と潰瘍底膠原線維発育に調和のとれた修復促進作用を示し、慢性潰瘍の治癒を促進させた[18,19]。

また、ラットの酢酸潰瘍において、シメチジンとの併用効果が認められた[20]。

#### 6) 実験胃炎に対する治療効果

タウロコール酸ナトリウムによって惹起されるラットの実験的慢性(萎縮性)胃炎に対し治療及び予防効果を示した[21]。

7) 急性胃粘膜病変に対する作用

ラットのアスピリン、0.6mol/L 塩酸及びエタノール(99.5)、水浸拘束ストレスによる胃粘膜病変に対し予防効果を示した[22~24]。

8) 各種実験潰瘍抑制作用

ラットの水浸拘束ストレス、ストレス・レセルピン、インドメタシン、脱血アスピリン、ヒドロコルチゾン、幽門結紮ストレス潰瘍の発生を各々抑制し、粘液保護作用を示した[24,25]。

(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

該当資料なし

### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

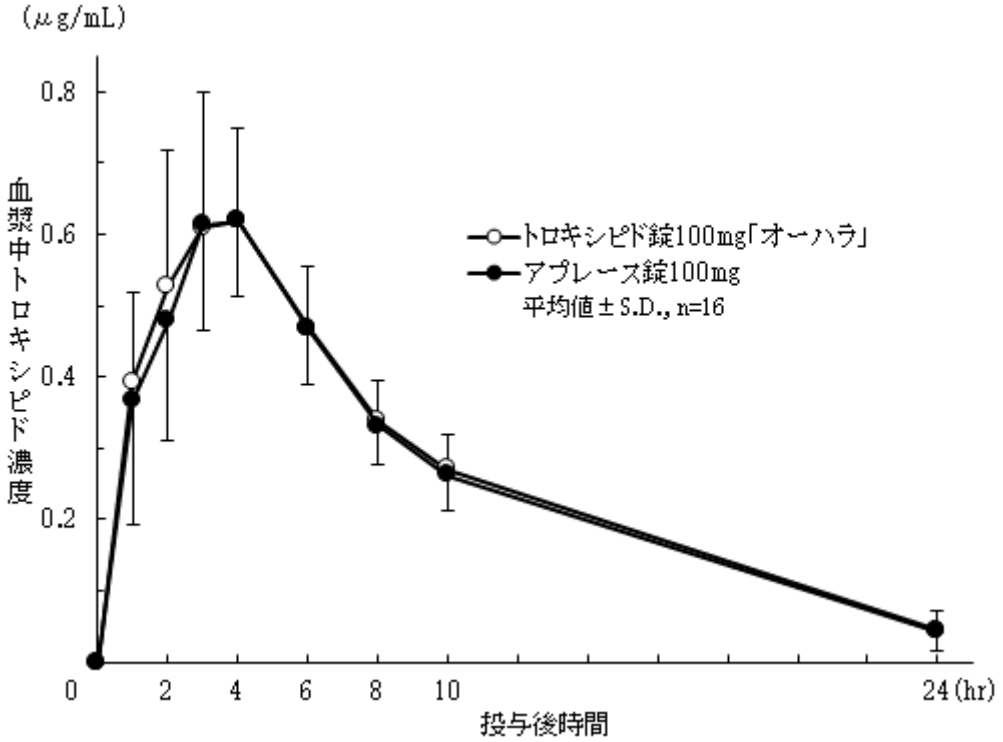
**生物学的同等性試験[26)]**

トロキシピド錠100mg「オーハラ」とアプレース錠100mgを、クロスオーバー法により1錠(トロキシピドとして100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、$C_{max}$)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

薬物動態パラメータ

| | n | $AUC_{0\to24}$ (μg･hr/mL) | $C_{max}$ (μg/mL) | $t_{max}$ (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
|---|---|---|---|---|---|
| トロキシピド錠100mg「オーハラ」 | 16 | 6.54±0.99 | 0.71±0.13 | 3.1±1.2 | 5.9±0.8 |
| アプレース錠 100mg | 16 | 6.39±1.05 | 0.69±0.14 | 3.3±1.3 | 5.6±1.0 |

(平均値±S.D.)




**血漿中トロキシピド濃度の推移**

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

該当資料なし

2) 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

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(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

該当資料なし

## ５．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

### (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

＜参考＞

動物実験(ラット)において乳汁への移行が認められている。（「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 6.特定の背景を有する患者に関する注意 (6)授乳婦」の項参照)

### (4) 髄液への移行性

該当資料なし

### (5) その他の組織への移行性

該当資料なし

### (6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## ６．代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

健康成人にトロキシピド 100mg を単回経口投与した結果、尿中排泄物の 96%以上は未変化体であり、その他に一種の代謝物(6-オキソ体)が認められた[27,28]。

### (2) 代謝に関与する酵素（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

該当資料なし

## ７．排泄

健康成人にトロキシピド 100mg を単回経口投与した結果、24 時間で投与量の約 61%、48 時間で投与量の約 67%が尿中に排泄された[29]。

## 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

該当資料なし

## 10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

## 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

設定されていない

## 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

設定されていない

### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

### (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。

### (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、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験(ラット)において乳汁への移行が認められている。

### (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

一般に、生理機能が低下していることが多い。

## 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

## 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、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

蕁麻疹、呼吸困難、血圧低下等の異常が認められる場合がある。

11.1.2 肝機能障害、黄疸(いずれも頻度不明)

AST、ALT、Al-P、γ-GTP、LDH 等の上昇等を伴う肝機能障害や黄疸があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

| | 0.1～5%未満 | 頻度不明 |
|---|---|---|
| 消化器 | 便秘、腹部膨満感、胸やけ、嘔気　等 | |
| 過敏症 | | そう痒、発疹　等 |
| その他 | 頭重感、動悸、全身倦怠感　等 | 浮腫 |

## 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 薬剤交付時の注意

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

該当資料なし

### (2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 ラット亜急性毒性試験 1,000mg/kg/日以上を経口投与したとき、膀胱での炎症及び出血によると考えられる尿潜血が対照群に比較して多いという報告がある。

15.2.2 動物実験(ラット)でプロラクチン分泌異常に由来すると推定される性周期の乱れが報告されているので、月経異常、乳汁分泌などの観察を十分に行い、異常が認められた場合には、休薬又は中止等の適切な処置を行うこと。

# 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) 安全性薬理試験

該当資料なし

### (3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

### (4) がん原性試験

該当資料なし

### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

### (7) 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：トロキシピド錠 100mg「オーハラ」　該当しない

有効成分：トロキシピド　劇薬※

※：1 個中 100mg 以下を含有する内用剤は除かれる。

## 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

設定されていない

## ５．患者向け資材

・ 患者向医薬品ガイド：無し
・ くすりのしおり：有り
・ 患者用指導箋：無し

## ６．同一成分・同効薬

同一成分薬：無し

同　効　薬：イルソグラジンマレイン酸塩、エカベトナトリウム水和物、セトラキサート塩酸塩、ソファルコン、テプレノン、ベネキサート塩酸塩ベータデクス、レバミピド　等

## ７．国際誕生年月日

1986 年 4 月 30 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

| 履歴 | 製造販売承認年月日 | 承認番号 | 薬価基準収載年月日 | 販売開始年月日 |
|---|---|---|---|---|
| 旧販売名<br>トロキシン錠 | 1994 年 3 月 14 日 | (06AM)0495 | 1994 年 7 月 8 日 | 1994 年 7 月 8 日 |
| 旧販売名<br>トロキシン錠 100mg | 2008 年 9 月 4 日 | 22000AMX01928000 | 2008 年 12 月 19 日 | 2008 年 12 月 19 日 |
| 販売名変更<br>トロキシピド錠<br>100mg「オーハラ」 | 2018 年 1 月 25 日 | 23000AMX00080000 | 2018 年 6 月 15 日 | 2018 年 6 月 15 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

該当しない

## 11. 再審査期間

該当しない

## 12. 投薬期間制限に関する情報

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。

## 13. 各種コード

| 販売名 | HOT9 | 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード | レセプト電算処理システムコード |
|---|---|---|---|
| トロキシピド錠 100mg「オーハラ」 | 113712511 | 2329015F2146 | 621371211 |

## 14. 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) (財)日本公定書協会編,医療用医薬品 品質情報集 No.6(薬事日報社) p97 (2000)
2) 大原薬品工業株式会社　社内資料：加速試験(1992 年)
3) 大原薬品工業株式会社　社内資料：苛酷試験(2006 年)
4) 大原薬品工業株式会社　社内資料：長期保存試験
5) 大原薬品工業株式会社　社内資料：溶出試験(2000 年)
6) 渋江正他：医学と薬学 1989；22(4)：1029-1040
7) 三好秋馬他：臨床医薬 1990；6(1)：85-108
8) 後藤由夫他：医学と薬学 1984；12(2)：487-539
9) 阿部泰夫他：日本薬理学雑誌 1980；76：355-361
10) 松尾裕他：薬理と治療 1982；10(6)：3129-3139
11) 中村欣一他：薬理と治療 1982；10(10)：5939-5945
12) 中川彰史他：診療と新薬 1982；19(7)：1803-1808
13) 阿部泰夫他：応用薬理 1984；27(3)：521-531
14) 阿部泰夫他：日本薬理学雑誌 1984；84：11-18
15) 望月利郎他：応用薬理 1986；32(2)：387-395
16) 阿部泰夫他：日本薬理学雑誌 1984；83：317-324
17) 阿部泰夫他：基礎と臨床 1983；17(12)：4073-4076
18) 入倉勉他：応用薬理 1978；15(4)：641-651
19) 百々研次郎：実験潰瘍－病態モデルとその病因－．東京：日本メディカルセンター；1976．実験的慢性胃潰瘍に対する各種薬物の治療効果，p197-207
20) 関口治男他：薬理と治療 1987；15(6)：2425-2436
21) 岸本眞也他：薬理と治療 1989；17(11)：5443-5460
22) 関口治男他：日本薬理学雑誌 1987；89：111-119
23) 関敦子他：薬理と治療 1990；18(3)：1071-1078
24) 桑山肇他：応用薬理 1990；40(1)：63-66
25) 入倉勉他：応用薬理 1979；17(3)：371-382
26) 大原薬品工業株式会社　社内資料：生物学的同等性試験(1991 年)
27) 入倉勉他：応用薬理 1979；18(4)：619-634
28) 第十八改正日本薬局方解説書　2021：C3758-3760
29) 川原富美男他：基礎と臨床 1984；18(7)：2859-2870
30) 大原薬品工業株式会社　社内資料：粉砕後の安定性試験(2006 年)
31) 大原薬品工業株式会社　社内資料：経管通過性試験(2006 年)


## 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

本剤は海外では発売されていない。

## ２．海外における臨床支援情報

該当しない

# 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。

（掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関するQ&Aについて(その3)」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課）

### (1) 粉砕[30)]

粉砕品について保存し、安定性試験(性状、定量)を行った。

| 試験条件 | 結果 |
|---|---|
| 25℃、60%RH、2週間(遮光・開放) | 全て変化なし。 |

### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性[31)]

試験方法

〔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試料（錠剤1錠または細粒 0.5g）を入れてピストンを戻し、ディスペンサーに約 55℃の温湯 20mLを吸い取り、筒先の蓋をして5分間自然放置する。5分後にディスペンサーを手で90 度 15 往復横転し、崩壊･懸濁の状態を観察する。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、錠剤をコーティング破壊してから、ディスペンサー内に入れて同様の操作を行い、崩壊･懸濁の状態を観察する。

〔通過性試験〕

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を、ディスペンサーに吸い取り、経管チューブの注入端より2～3mL/秒の速度で注入する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端（注入端）を30cmの高さにセットし、チューブ（サイズ；8フレンチ）の通過性を観察する。

なお、8 フレンチのチューブを通過しない場合は、18 フレンチのチューブを用いて同様に通過性を観察する。

| 試験方法 | 崩壊懸濁試験 | 通過性試験 | 判定 |
|---|---|---|---|
| 試験結果 | 5分以内に崩壊・懸濁した。 | チューブ（8フレンチ）を通過した。 | 適1 |

## ２．その他の関連資料

特になし

①

# 付表

薬発第698号(昭和55年5月30日)に基づく承認申請時に添付する資料※

別表1及び別表2-(1)医療用医薬品より改変

※昭和55年6月30日から平成12年3月31日の間に申請した医薬品に適用された。

| 添付資料の内容 | | 新有効成分含有製剤（先発医薬品） | その他の医薬品（後発医薬品） | 剤形追加に係る医薬品（後発医薬品） |
|---|---|---|---|---|
| イ　起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料 | 1 起原又は発見の経緯 | ○ | × | ○ |
| | 2 外国における使用状況 | ○ | × | ○ |
| | 3 特性及び他の医薬品との比較検討等 | ○ | × | ○ |
| ロ　物理的化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料 | 1 構造決定 | ○ | × | × |
| | 2 物理的化学的性質等 | ○ | × | × |
| | 3 規格及び試験方法 | ○ | ○ | ○ |
| ハ　安定性に関する資料 | 1 長期保存試験 | ○ | × | × |
| | 2 苛酷試験 | ○ | × | × |
| | 3 加速試験 | × | ○ | ○ |
| ニ　急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料 | 1 急性毒性 | ○ | × | × |
| | 2 亜急性毒性 | ○ | × | × |
| | 3 慢性毒性 | ○ | × | × |
| | 4 生殖に及ぼす影響 | ○ | × | × |
| | 5 依存性 | △ | × | × |
| | 6 抗原性 | △ | × | × |
| | 7 変異原性 | △ | × | × |
| | 8 がん原性 | △ | × | × |
| | 9 局所刺激 | △ | × | × |
| ホ　薬理作用に関する資料 | 1 効力を裏付ける試験 | ○ | × | × |
| | 2 一般薬理 | ○ | × | × |
| ヘ　吸収、分布、代謝、排泄に関する資料 | 1 吸収 | ○ | × | × |
| | 2 分布 | ○ | × | × |
| | 3 代謝 | ○ | × | × |
| | 4 排泄 | ○ | × | × |
| | 5 生物学的同等性 | × | ○ | ○ |
| ト　臨床試験の試験成績に関する資料 | 臨床試験の試験成績 | ○ | × | ○ |

○添付　×添付不要　△個々の医薬品により判断される。

＊本通知は平成11年4月8日医薬発第481号により改正された。