

**2018年6月改訂(第2版)
*2018年2月改訂(第1版、販売名変更に伴う改訂)

貯法：室温保存、気密容器
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。

日本標準商品分類番号		
872325		
	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 37.5mg「オーハラ」	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 75mg「オーハラ」
承認番号	23000AMX00083000	23000AMX00084000
薬価収載	2018年6月	2018年6月
販売開始	2005年7月	2005年7月
用法追加	2015年5月	2015年5月

注：旧販売名 ロキサチ[®]カプセル37.5
ロキサチ[®]カプセル75

H₂受容体拮抗剤

日本薬局方 ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル

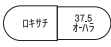

* **ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」**

* **ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」**

* **ROXATIDINE ACETATE HYDROCHLORIDE SR CAPSULES 37.5mg「OHARA」**

* **ROXATIDINE ACETATE HYDROCHLORIDE SR CAPSULES 75mg「OHARA」**

*【組成・性状】

販売名	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 37.5mg「オーハラ」	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル 75mg「オーハラ」
成分・含量	1カプセル中日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 37.5mgを含有	1カプセル中日局ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 75mgを含有
添加物	精製白糖、トウモロコシデンプン、タルク、エチルセルロース、セタノール、ラウリル硫酸ナトリウム、トリアセチン、酸化チタン、ゼラチン	
色調・剤形	キャップ：白色 ボディ：白色 硬カプセル剤(4号)	キャップ：白色 ボディ：白色 硬カプセル剤(3号)
外形	 長径:14.2mm 短径:5.3mm	 長径:15.8mm 短径:5.8mm
重量(約)	122mg	214mg
識別コード	ロキサチ 37.5 オーハラ	ロキサチ 75 オーハラ
内容物	白色の徐放性顆粒	白色の徐放性顆粒

【効能・効果】

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison症候群、逆流性食道炎、麻酔前投薬

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

【用法・用量】

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎

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1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。また、1回150mgを1日1回(就寝前)経口投与することもできる。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

Zollinger-Ellison症候群

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1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを1日2回(朝食後、就寝前又は夕食後)経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

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を手術前日就寝前及び手術当日麻酔導入2時間前の2回経口投与する。また、1回150mgを手術前日就寝前に1回経口投与することもできる。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを手術前日就寝前及び手術当日麻酔導入2時間前の2回経口投与する。

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

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1日1回(就寝前又は夕食後)経口投与する。

通常、小児にはロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として、体重30kg未満では1回37.5mgを、体重30kg以上では1回75mgを1日1回(就寝前又は夕食後)経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

腎機能障害患者では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。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- (2) 肝障害のある患者
- (3) 腎障害のある患者

[血中濃度が持続することがあるので、使用に際しては投与量を減ずるか投与間隔をあけること。]

- (4) 高齢者(「4. 高齢者への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

治療にあたっては経過を十分に観察し、病状に応じ治療上必要最小限の使用にとどめ、本剤で効果がみられない場合には他の療法に切りかえること。なお、肝機能、腎機能、血液像等に注意すること。

3. 副作用

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。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

- 1) ショック：ショック(初期症状：不快感、顔面蒼白、血圧低下等)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少：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。

- 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) : 中毒性表皮壊死融解症 (Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群) があらわれることがあるので、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。
- 4) 肝機能障害、黄疸 : AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP 上昇等の肝機能障害、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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 5) 横紋筋融解症 : 横紋筋融解症があらわれることがあるので、CK (CPK)、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。

(2) 重大な副作用(類薬) (頻度不明)

- 1) アナフィラキシー : 他のH₂受容体拮抗剤で、アナフィラキシーがあらわれるとの報告があるので、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。
- 2) 間質性腎炎 : 他のH₂受容体拮抗剤で、間質性腎炎(初期症状 : 発熱、腎機能検査値異常 (BUN、クレアチニン上昇等)等)があらわれるとの報告があるので、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。
- 3) 房室ブロック等の心ブロック : 他のH₂受容体拮抗剤で、房室ブロック等の心ブロックがあらわれるとの報告があるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) 不全収縮 : 他のH₂受容体拮抗剤で、不全収縮があらわれるとの報告があるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	副作用の頻度	
	頻度不明	
過敏症	発疹、痒痒感等	
血液	好酸球数増多、白血球数減少、貧血	
消化器	便秘、下痢、悪心、腹部膨満感、口渴等	
肝臓	AST (GOT)、ALT (GPT)の上昇、Al-P、LDHの上昇、肝機能異常等	
精神神経系 ^{注)}	可逆性の錯乱状態、幻覚、しびれ、眠気、不眠、めまい、頭痛等	
その他	女性型乳房、乳汁分泌、倦怠感、血圧上昇、BUN上昇	

注) 他のH₂受容体拮抗剤で、痙攣(頻度不明)があらわれるとの報告がある。

4. 高齢者への投与

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。〕

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、ラット及びウサギの器官形成期投与試験でラットの400mg/kg投与群に分娩異常、ウサギの400mg/kg投与群の少数例に流産が、ラットの周産期・授乳期投与試験で200mg/kg投与群の少数例に分娩異常がみられている。〕
- (2) 投薬中は授乳させないよう注意すること。〔動物実験(ラット)で乳汁中への移行が認められている。〕

6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児に対する安全性は確立していない。(低出生体重児、新生児、乳児又は幼児に対しては使用経験がない。)

7. 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。〕

8. その他の注意

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。

*【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」及びロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」と各標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル(ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩として37.5mg及び75mg)健康成人男子に絶食及び食後単回経口投与して血漿中脱アセチル体(M-1^{*} シュウ酸塩)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¹⁾。

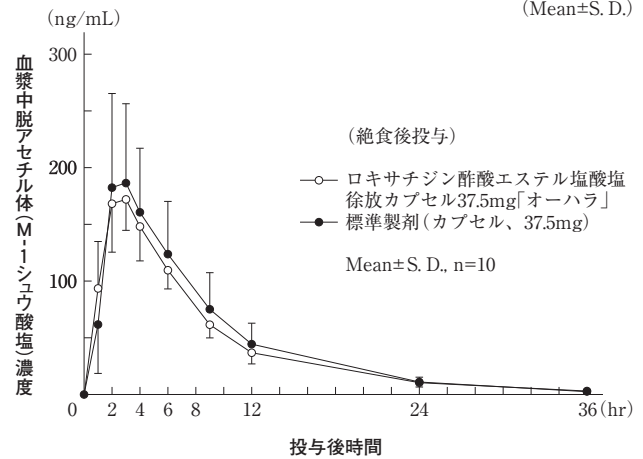
※M-1 : 2-Hydroxy-N-(3-(3-piperidin-1-ylmethyl) phenoxy) propyl acetamide

(1) ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₃₆ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
絶食後投与	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」	1533.63±272.88	178.83±34.93	2.6±0.5	6.8±1.6
	標準製剤(カプセル, 37.5mg)	1687.33±592.87	192.62±79.56	2.4±0.5	6.2±1.5
食後投与	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」	1301.40±162.07	160.52±23.72	3.6±0.5	6.7±1.6
	標準製剤(カプセル, 37.5mg)	1406.87±187.34	174.85±26.72	3.8±0.4	5.6±1.3

(Mean±S.D.)



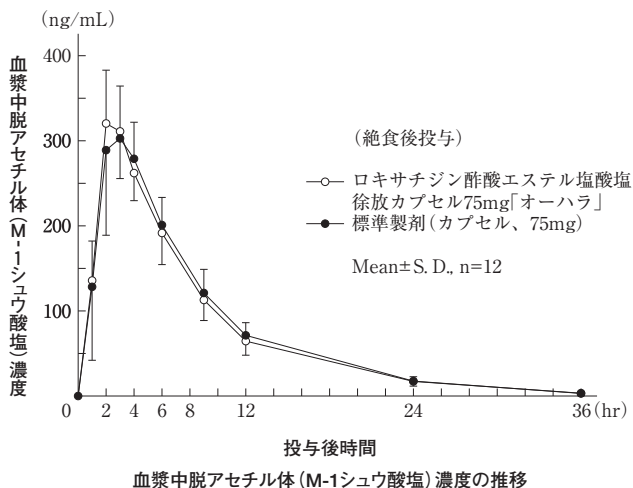
血漿中脱アセチル体 (M-1シュウ酸塩) 濃度の推移

(2) ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₃₆ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
絶食後投与	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」	2687.46±459.75	327.87±57.53	2.3±0.5	5.9±1.2
	標準製剤(カプセル, 75mg)	2767.72±457.40	323.13±69.06	2.8±0.9	5.5±1.0
食後投与	ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」	2610.51±292.62	324.56±38.00	3.4±0.7	6.6±1.1
	標準製剤(カプセル, 75mg)	2741.56±378.21	338.96±40.59	3.7±1.1	5.6±1.1

(Mean±S.D.)



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. 溶出挙動

ロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」及びロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセルの溶出規格に適合していることが確認されている³⁾。

【薬効薬理】

胃粘膜壁細胞のヒスタミン H_2 受容体を選択的に遮断し、胃酸分泌を抑制することにより、胃・十二指腸潰瘍及び胃炎等に効果を示す。

【有効成分に関する理化学的知見】

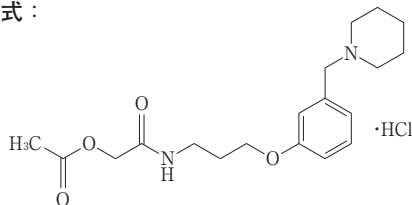
一般名：ロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩

Roxatidine Acetate Hydrochloride

化学名：(3-{3-[(Piperidin-1-yl) methyl] phenoxy}

propylcarbamoyl) methyl acetate monohydrochloride

化学構造式：



分子式： $C_{19}H_{28}N_2O_4 \cdot HCl$

分子量：384.90

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。においはなく、味は苦い。

本品は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。

融点：147～151℃(乾燥後)

*【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(なりゆき温度及び湿度、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」及びロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された³⁾。

*【包装】

ロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル37.5mg「オーハラ」:

(PTP) 100カプセル(10カプセル×10)

(バラ) 500カプセル

ロキシサチジン酢酸エステル塩酸塩徐放カプセル75mg「オーハラ」:

(PTP) 100カプセル(10カプセル×10)

(バラ) 500カプセル

【主要文献】

- 1) 大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(2003年)
- 2) 大原薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験(2003年)
- 3) 大原薬品工業株式会社 社内資料：長期安定性試験

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。

大原薬品工業株式会社 安全管理部 お客様相談室

〒104-6591 東京都中央区明石町8-1 聖路加タワー36階

☎ 0120-419-363 FAX 03-6740-7702

URL <http://www.ohara-ch.co.jp>



製造販売元 大原薬品工業株式会社

滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121-15

ROX(C)②