

※※2013年12月改訂 (第11版、販売名変更に伴う改訂)

※2010年5月改訂

アレルギー性疾患治療剤

日本標準商品分類番号

87449

※※ オキサトミド錠30mg「ケミファ」

貯法：室温保存

使用期限：外装に表示 (3年)

Oxatomide

オキサトミド製剤

| | |
|--------|------------------|
| ※※承認番号 | 22500AMX00475000 |
| ※※薬価収載 | 2013年12月 |
| ※※販売開始 | 1998年7月 |

●禁忌 (次の患者には投与しないこと)

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人 (「6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

●組成・性状

1. 組成

オキサトミド錠 30mg「ケミファ」は、1錠中にオキサトミド 30.0mg を含有する。

添加物として、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

2. 製剤の性状

オキサトミド錠 30mg「ケミファ」は、白色～微黄白色の割線入りの素錠である。

| サイズ | 表 | 裏 | 側面 | 識別コード |
|----------|--|--|--|-------------|
| 直径 7.1mm |  |  |  | NPI 449A |
| 厚さ 2.6mm | | | | |
| 重量 120mg | | | | |

●効能又は効果

成人：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚掻痒症、湿疹・皮膚炎、痒疹

●用法及び用量

通常、成人には1回オキサトミドとして30mg (1錠) を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

●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) 肝障害又はその既往歴のある患者
[肝障害が悪化又は再燃するおそれがある。]
- (2) 幼児 (「7. 小児等への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。
- (2) 本剤は気管支拡張剤並びに全身性ステロイド剤と異なり、既に起こっている喘息発作を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことは患者に十分注意しておく必要がある。
- (3) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (4) 本剤により、末梢血中好酸球が増加することがあるので、このような場合には経過観察を十分に行うこと。
- (5) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

3. 相互作用

併用注意 (併用に注意すること)

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|--|------------------------|-----------|
| アルコール性飲料 中枢神経抑制剤 麻薬性鎮痛剤、 鎮静剤、催眠剤等 | 眠気、倦怠感等が強くあらわれるおそれがある。 | 相加的に作用する。 |

4. 副作用

(1) 重大な副作用

- 1) 肝炎、肝機能障害 (0.5%)、黄疸：AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTP、ビリルビン、ALP、LDH の著しい上昇等を伴う肝炎、肝機能障害、黄疸 (初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気・嘔吐等) 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。
- 2) ショック、アナフィラキシー様症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、全身紅潮、咽頭・喉頭浮腫等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 3) 皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson 症候群)、中毒性表皮壊死症 (Lyell 症候群) があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) 血小板減少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。

(2) その他の副作用

下記のような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減量・休薬等の適切な処置を行うこと。

なお、太字で記載の副作用については投与を中止すること。また、錐体外路症状が発現した場合には、必要に応じて抗パーキンソン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

| | 副作用発現頻度 | | |
|--------|----------------|--------------------------------------|------------------------------|
| | 0.1%～5%未満 | 0.1%未満 | 頻度不明 |
| 錐体外路症状 | | 硬直 (口周囲、四肢)、眼球偏位、後屈頸、攣縮、振戦 | |
| 過敏症 | 発疹 | 浮腫 (顔面、手足等) | |
| 内分泌 | | 月経障害、乳房痛 | 女性化乳房 |
| 精神神経系 | 眠気、倦怠感、口渇 | 頭痛・頭重、めまい・ふらつき・立ちくらみ、しびれ感 | |
| 泌尿器 | | | 膀胱炎様症状 (頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等)、排尿困難 |
| 消化器 | 嘔気・嘔吐、胃部不快感、下痢 | 便秘、胃痛、腹痛、食欲不振、食欠進、にがみ、腹部不快感、口内炎、舌のあれ | |
| 循環器 | | 動悸 | |
| その他 | 好酸球増多 | ほてり、鼻出血 | 発熱 |

5. 高齢者への投与

本剤は、主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能が低下していることが多いので、慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。

[動物実験(ラット)で口蓋裂、合指症、指骨の形成不全等の催奇形作用が報告されている。]

(2) 授乳婦に投与する場合には、授乳を中止させること。

[動物実験(イヌ)で乳汁移行が認められている。]

7. 小児等への投与

幼児(特に2歳以下)において錐体外路症状が発現するおそれがあるため、過量投与を避けること。

8. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与は、アレルゲン皮内反応を抑制し、アレルゲンの確認に支障をきたすので、アレルゲン皮内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。

9. 過量投与

頸部硬直等の錐体外路症状、痙攣、意識障害、傾眠、血圧低下、洞性徐脈、縮瞳等が発現した例があるので、過量に服用した場合には、支持・対症療法等適切な処置を行うこと。

10. 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。]

●薬物動態

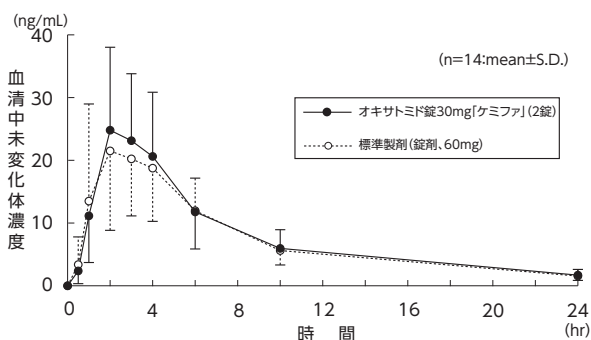
1. 生物学的同等性試験¹⁾

オキサトミド錠30mg「ケミファ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠(オキサトミドとして60mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清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、Cmax)について分散分析を中心とした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。

(注)オキサトミド60mg単回投与は、承認外用量である。

| 製剤名 | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|---------------------------|-----------------------------------|-----------------|---------------|--------------------------|
| | AUC _{0→24} (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | t _{1/2} (hr) |
| オキサトミド錠30mg「ケミファ」 (2錠) | 189.28 ±85.78 | 27.31 ±11.39 | 2.50 ±0.76 | 6.618 ±0.925 |
| 標準製剤 (錠剤、60mg) | 179.01 ±77.39 | 25.05 ±12.71 | 2.57 ±0.85 | 6.617 ±1.125 |

(n=14, mean±S.D.)



血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・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²⁾

オキサトミド錠30mg「ケミファ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたオキサトミド錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

●有効成分に関する理化学的知見

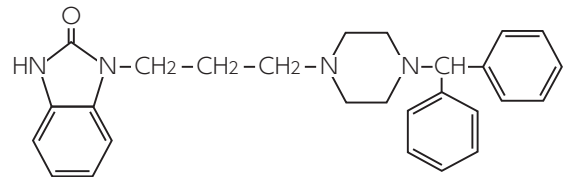
一般名: オキサトミド (Oxatamide)

化学名: 1-[3-[4-(Diphenylmethyl)-1-piperazinyl]propyl]-2-benzimidazol-2(3H)-one

分子式: C₂₇H₃₀N₄O

分子量: 426.55

構造式:



性状: オキサトミドは白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

本品は氷酢酸又はクロロホルムに溶けやすく、エタノールにやや溶けにくく、エーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点: 155～161℃

●取扱い上の注意

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、オキサトミド錠30mg「ケミファ」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。

※●包装

オキサトミド錠30mg「ケミファ」: 100錠(10錠×10)

●主要文献

1) 日本薬品工業株式会社: 生物学的同等性に関する資料(社内資料)

2) 日本薬品工業株式会社: 溶出に関する資料(社内資料)

3) 日本薬品工業株式会社: 安定性に関する資料(社内資料)

●文献請求先

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

日本ケミファ株式会社 安全管理部

〒101-0032 東京都千代田区岩本町2丁目2番3号

TEL 03-3863-1225

FAX 03-3861-9567

販売元
日本ケミファ株式会社
東京都千代田区岩本町2丁目2-3

製造販売元
日本薬品工業株式会社
東京都千代田区岩本町2丁目2-3