

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示

アレルギー性疾患治療剤

オキサトミド錠 30mg 'ZE'

OXATOMIDE TABLETS 30mg 'ZE'

オキサトミド錠

承認番号	22000AMX00381000
薬価収載	2008年 6月
販売開始	2008年 6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(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

【組成・性状】

成分・分量 (1錠中)	剤形	色調	外形・サイズ(識別コード)
オキサトミド 30mg	素錠 (割線入り)	白色	 直径：6.5mm 厚み：2.5mm 重量：100mg (ZE32)

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

【効能・効果】

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚癢症、湿疹・皮膚炎、痒疹

【用法・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(「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に十分注意すること。
 - (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、既にお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

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) 肝炎、肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、ビリルビン、Al-P、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：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)：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：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。

種類	頻度	頻度不明
錐体外路症状 ^{注1)}		硬直(口周囲、四肢)、眼球偏位、後屈頸、攣縮、振戦
過敏症 ^{注2)}		発疹、浮腫(顔面、手足等)
内分泌		月経障害、乳房痛、女性化乳房 ^{注2)}
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、食欲亢進、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

注1) 発現した場合には投与を中止し、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。

注2) 発現した場合には投与を中止すること。

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、縮腫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、さら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。]

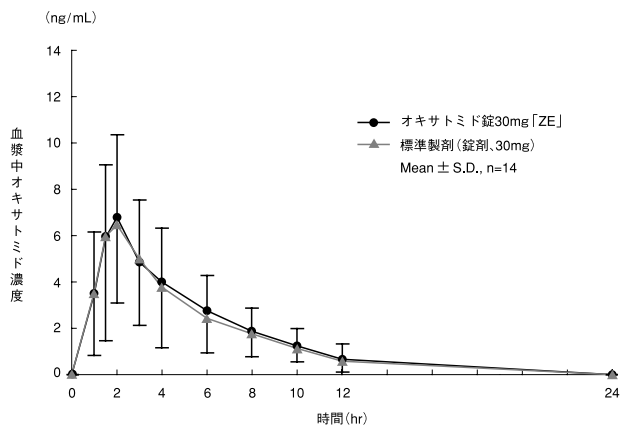
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験¹⁾

オキサトミド錠30mg「ZE」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(オキサトミドとして30mg)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、Cmax)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。

	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「ZE」	37.89 ± 19.92	7.63 ± 3.13	1.9 ± 0.5	3.5 ± 1.3
標準製剤 (錠剤、30mg)	35.80 ± 18.74	7.88 ± 4.28	1.8 ± 0.5	3.8 ± 1.4

(Mean ± S.D., n=14)



血漿中濃度並びに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「ZE」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。

【薬効薬理】

1. 細胞内カルシウム(Ca)制御作用³⁾

細胞膜外Ca²⁺存在下でラット腹腔内肥満細胞からのヒスタミン遊離を抑制した。

2. メディエーター遊離抑制作用⁴⁾

感作ラットの抗原誘発ヒスタミン遊離を強く抑制した(in vitro)。アレルギー喘息患者の好塩基球からの抗原によるヒスタミン遊離を抑制した(in vitro)。

3. ロイコトリエン産生阻害作用⁵⁾

カルシウムイオノフォアで活性化したヒト好中球からのロイコトリエンB₄産生及びアラキドン酸放出を抑制した(in vitro)。

4. メディエーター拮抗作用^{6,7)}

ラット摘出動脈標本のセロトニン収縮を抑制し、強力な抗セロトニン作用を示した(in vitro)。

モルモットのヒスタミン又はセロトニン誘発気管支収縮を用量依存的に抑制した(in vitro)。

また、抗血小板活性化因子作用もみられた(in vitro)。

【有効成分に関する理化学的知見】

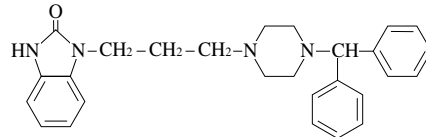
一般名：オキサトミド(Oxatamide)(JAN)

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。酢酸(100)又はクロロホルムに溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、ジエチル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⁸⁾

PTP包装(PTPシートをKOPピロー包装)したものを用いた長期保存試験(室温、5年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、オキサトミド錠30mg「ZE」は通常の市場流通下において5年間安定であることが確認された。

【包装】

PTP：100錠、1,000錠

【主要文献】

- 1) 全星薬品工業(株)：生物学的同等性試験に関する資料(社内資料)
- 2) 全星薬品工業(株)：溶出試験に関する資料(社内資料)
- 3) Clerck, F. D. et al. : Agents and Actions, **11**, 184(1981)
- 4) Bierman, C. W. et al. : Int. J. Immunopharmac., **1**, 227(1979)
- 5) Taniguchi, K. et al. : Jpn. J. Pharmacol., **52**, 101(1990)
- 6) Van Nueten, J. M. et al. : Arch. Int. Pharmacodyn., **232**, 217(1978)
- 7) 得雄一郎ら：アレルギーの臨床, **9**, 831(1989)
- 8) 全星薬品工業(株)：安定性試験に関する資料(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下さい。

全星薬品工業株式会社 医薬情報部


〒545-0051 大阪市阿倍野区旭町1-2-7

☎ 0120-189-228

TEL 06-6630-8820

FAX 06-6630-8990

発売元
 全星薬品株式会社
堺市堺区向陵中町2-4-12

※※ 製造販売元
 全星薬品工業株式会社
大阪市阿倍野区旭町1-2-7