

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



剤形	素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中オキセサゼイン 5mg 含有
一般名	和名：オキセサゼイン 洋名：Oxethazaine
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：2007年8月31日 薬価基準収載年月日：2007年12月21日 発売年月日：1962年3月1日
開発・製造販売(輸入) ・提携・販売会社名	製造販売元：アルフレッサ ファーマ株式会社 販売元：エーザイ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	エーザイ株式会社 hhcホットライン フリーダイヤル 0120-419-497 FAX 03-3811-5033 https://www.eisai.co.jp

本IFは2023年4月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

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（<http://www.info.pmda.go.jp/>）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. 開発の経緯…………… 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性…………… 1

II. 名称に関する項目

1. 販売名…………… 2
 - (1) 和名…………… 2
 - (2) 洋名…………… 2
 - (3) 名称の由来…………… 2
2. 一般名…………… 2
 - (1) 和名 (命名法)…………… 2
 - (2) 洋名 (命名法)…………… 2
 - (3) ステム…………… 2
3. 構造式又は示性式…………… 2
4. 分子式及び分子量…………… 2
5. 化学名 (命名法)…………… 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号…………… 2
7. CAS登録番号…………… 2

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質…………… 3
 - (1) 外観・性状…………… 3
 - (2) 溶解性…………… 3
 - (3) 吸湿性…………… 3
 - (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点…………… 3
 - (5) 酸塩基解離定数…………… 3
 - (6) 分配係数…………… 3
 - (7) その他の主な示性値…………… 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性…………… 3
3. 有効成分の確認試験法…………… 3
4. 有効成分の定量法…………… 3

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形…………… 4
 - (1) 剤形の区別、外観及び性状…………… 4
 - (2) 製剤の物性…………… 4
 - (3) 識別コード…………… 4
 - (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等…………… 4
2. 製剤の組成…………… 4
 - (1) 有効成分 (活性成分) の含量…………… 4
 - (2) 添加物…………… 4
 - (3) その他…………… 4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意…………… 4
4. 製剤の各種条件下における安定性…………… 5
5. 調製法及び溶解後の安定性…………… 5
6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)…………… 5

7. 溶出性…………… 5
8. 生物学的試験法…………… 5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法…………… 5
10. 製剤中の有効成分の定量法…………… 5
11. 力価…………… 6
12. 混入する可能性のある夾雑物…………… 6
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報…………… 6
14. その他…………… 6

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果…………… 7
2. 用法及び用量…………… 7
3. 臨床成績…………… 7
 - (1) 臨床データパッケージ…………… 7
 - (2) 臨床効果…………… 7
 - (3) 臨床薬理試験…………… 7
 - (4) 探索的試験…………… 7
 - (5) 検証的試験…………… 7
 - 1) 無作為化並行用量反応試験…………… 7
 - 2) 比較試験…………… 7
 - 3) 安全性試験…………… 7
 - 4) 患者・病態別試験…………… 7
 - (6) 治療的使用…………… 7
 - 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)…………… 7
 - 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…………… 7

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…………… 8
2. 薬理作用…………… 8
 - (1) 作用部位・作用機序…………… 8
 - (2) 薬効を裏付ける試験成績…………… 8
 - (3) 作用発現時間・持続時間…………… 8

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法…………… 9
 - (1) 治療上有効な血中濃度…………… 9
 - (2) 最高血中濃度到達時間…………… 9
 - (3) 臨床試験で確認された血中濃度…………… 9
 - (4) 中毒域…………… 9
 - (5) 食事・併用薬の影響…………… 9
 - (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…………… 9
2. 薬物速度論的パラメータ…………… 9

(1) 解析方法	9
(2) 吸収速度定数	9
(3) バイオアベイラビリティ	9
(4) 消失速度定数	9
(5) クリアランス	9
(6) 分布容積	9
(7) 血漿蛋白結合率	9
3. 吸収	10
4. 分布	10
(1) 血液-脳関門通過性	10
(2) 血液-胎盤関門通過性	10
(3) 乳汁への移行性	10
(4) 髄液への移行性	10
(5) その他の組織への移行性	10
5. 代謝	11
(1) 代謝部位及び代謝経路	11
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	11
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	11
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	11
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	11
6. 排泄	11
(1) 排泄部位及び経路	11
(2) 排泄率	11
(3) 排泄速度	11
7. トランスポーターに関する情報	11
8. 透析等による除去率	11

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	12
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	12
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	12
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	12
5. 慎重投与内容とその理由	12
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	12
7. 相互作用	12
(1) 併用禁忌とその理由	12
(2) 併用注意とその理由	12
8. 副作用	12
(1) 副作用の概要	12
(2) 重大な副作用と初期症状	12
(3) その他の副作用	13

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	13
(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	13
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	13
9. 高齢者への投与	13
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	14
11. 小児等への投与	14
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	14
13. 過量投与	14
14. 適用上の注意	14
15. その他の注意	14
16. その他	14

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	15
(1) 薬効薬理試験 (「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)	15
(2) 副次的薬理試験	15
(3) 安全性薬理試験	15
(4) その他の薬理試験	15
2. 毒性試験	15
(1) 単回投与毒性試験	15
(2) 反復投与毒性試験	16
(3) 生殖発生毒性試験	16
(4) その他の特殊毒性	16

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	17
2. 有効期間又は使用期限	17
3. 貯法・保存条件	17
4. 薬剤取扱い上の注意点	17
(1) 薬局での取扱い上の留意点について	17
(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)	17
(3) 調剤時の留意点について	17
5. 承認条件等	17
6. 包装	17
7. 容器の材質	17
8. 同一成分・同効薬	18
9. 国際誕生年月日	18
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	18
11. 薬価基準収載年月日	18
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	18

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	18
14. 再審査期間	18
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	18
16. 各種コード	19
17. 保険給付上の注意	19
XI. 文献	
1. 引用文献	20
2. その他の参考文献	20
XII. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21
XIII. 備考	
その他の関連資料	22

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1911年、Zeliony & Savichらは胃幽門洞粘膜にコカイン溶液をあらかじめ塗布しておくこと、肉エキス投与による胃酸分泌が著明に抑制される現象を報告した。

1934年、Bayerは胃疾患に伴う疼痛あるいは不定愁訴へプロカインを投与した。

しかし、先のコカインは効力は強いが毒性も強く、耐性も生じやすいため、またコカイン、プロカインとも強い酸性下（pH3.0以下）では効力を発揮しないなどの理由により、なかなか実用的には至らなかった。

1957年、Wyeth Laboratoriesで合成されたオキセサゼインは、局所麻酔作用がプロカインの4,000倍もありながら毒性は極めて低く、しかもpHによる影響は受けないという画期的なもので、1962年3月、国内においては当社が消化管粘膜局麻剤としてストロカイン錠、顆粒^{注)}の販売名で発売した。

なお、医療事故防止対策に伴い販売名が変更され、「ストロカイン錠」は「ストロカイン錠5mg」として2007年8月に製造販売承認され現在に至っている。

注) 現在は製造販売を中止している。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

ストロカインは、酸性下でも効果を発揮する消化管粘膜局麻剤である。本剤はガストリンの遊離を抑制し、二次的に胃酸分泌を抑制する。臨床的には胃炎、消化性潰瘍等の消化管粘膜疾患に随伴する心窩部痛をはじめ、悪心・嘔吐、胸やけ、噯気、胃部不快感、便意逼迫等の自覚症状を改善する。

製剤上の特徴：溶出パターンにすぐれる。

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～微黄白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

本品は酢酸（100）に極めて溶けやすく、メタノール又はエタノール（95）に溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：101～104℃

(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

紫外可視吸収スペクトル

本品のエタノール溶液（1→2500）につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 252nm、259nm 及び 265nm に吸収の極大を示す。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

温度及び光に対しては安定であるが湿気により分解する。

3. 有効成分の確認試験法

日局オキセサゼインの確認試験法による。




4. 有効成分の定量法

日局オキセサゼインの定量法による。

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	剤形 識別コード	外 形			性 状
		表	裏	側 面	
ストロカイン 錠 5mg	素 錠				わずかに褐色を 帯びた白色
	EISAI SR005	直径(mm)・質量(mg)・厚さ(mm) 10.6 440 4.0			

(2) 製剤の物性

硬度 68.6N 以上

崩壊性

日局一般試験法崩壊試験(1) 即放性製剤の項により試験を行うときこれに適合する。

(3) 識別コード

EISAI SR005

(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

1錠中にオキセサゼイン 5mg を含有する。

(2) 添加物

添加物として含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、水酸化アルミニウム、ステアリン酸カルシウム、タルク、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム、トウモロコシデンプン含有する。

(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

IV. 製剤に関する項目

4. 製剤の各種条件下における安定性

試験方法	保存条件	包装形態	保存期間	試験項目	結果	
長期保存	25℃/75%RH	PTP+乾燥剤+アルミ袋+紙箱	36 カ月	性状 溶出性 乾燥減量 含量	いずれの試験項目においても変化なし。	
開封後	湿度	25℃/75%RH	PTP	6 カ月	性状 崩壊性 乾燥減量 含量	いずれの試験項目においても変化なし。
無包装	温度	40℃	ガラス瓶 (密栓)	3 カ月	性状 硬度 溶出性 含量	いずれの試験項目においても変化なし。
	湿度	25℃/75%RH	シャーレ (開放)	3 カ月		硬度低下 (1 カ月後規格値外)、その他の試験項目においては変化なし。
	光	2 万 lx	シャーレ (蓋)	60 時間*		いずれの試験項目においても変化なし。

*キセノンランプを 60 時間(総照度 120 万 lx・hr、総近紫外放射エネルギー200W・h/m²)照射

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)

本剤は錠剤であり配合変化試験を行っていない。

7. 溶出性

方法：日局一般試験法 (パドル法)

条件：回転数 50rpm

試験液 pH4.0 の 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 900mL

測定法 液体クロマトグラフィー (波長 259nm)

結果：本品の 45 分間の溶出率が 70%以上のとき適合する。

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

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー (波長 259nm)

IV. 製剤に関する項目

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

下記疾患に伴う疼痛・酸症状・嘔気・悪心・嘔吐・胃部不快感・便意逼迫
食道炎、胃炎、胃・十二指腸潰瘍、過敏性大腸症（イリタブルコロン）

2. 用法及び用量

通常成人1日3～8錠（オキセサゼインとして1日15～40mg）を3～4回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

(2) 臨床効果

胃炎、消化性潰瘍についての二重盲検試験によって本剤の有用性が確認された。症状別には、胸やけ、
吞酸、腹部膨満感、胃のもたれ、食欲不振等に対する有効性が認められた。 (①)

(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

腹痛、胸やけ、悪心、腹部膨満感などを主訴とする胃炎、消化性潰瘍を対象に、本剤（1回2錠、1日3回、1週間食前経口投与）とプラセボによる二重盲検比較試験を実施した。その結果、本剤はプラセボに比べて腹痛、胸やけ、吞酸、胃のもたれ、食欲不振について有意な改善を示し、全般改善度においても本剤はプラセボより有意に優れていた。なお、1週間の観察期間中、副作用や臨床検査値異常は認められなかった。 (①)

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

該当しない

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

アミノ安息香酸エチル、コカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩、テトラカイン塩酸塩、プロカイン塩酸塩、リドカイン塩酸塩等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：消化管粘膜

作用機序：本薬は、ガストリン分泌細胞の刺激感受部位といわれている胃内腔に突起している微絨毛を麻酔することにより、その刺激感受性を低下させ、血中へのガストリン分泌を抑制すると考えられている。また、粘膜面の神経レセプターを介する迷走神経や交感神経線維中を上行する刺激をブロックすることにより、種々の愁訴を除去すると考えられる。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1. 局所麻酔作用

本薬の局所麻酔作用は、ウサギの角膜においてプロカインの4,000倍、コカインの500倍を示す。また、本薬の局所麻酔作用はpH1.0~2.0の強酸性下でも影響を受けず、強力な局所麻酔作用を示す。(②③)

2. ガストリン遊離抑制作用

Heidenhain pouch イヌを用いた実験では、本薬の経口投与により、アセチルコリン刺激による胃幽門部からのガストリンの遊離を抑制する。(④)

3. 胃酸分泌抑制作用

イヌを用いた実験では、本薬の経口投与により、ペントガストリン又は食餌刺激による胃酸分泌を抑制する。(⑤)

消化性潰瘍患者に本薬を経口投与し、胃内pHの変動をpH電極を胃内に挿入して測定すると、投与1時間後には全例の胃内pHは3以上に上昇する。(⑥)

4. 胃腸管運動抑制作用

麻酔イヌに本薬を経口投与すると胃の自律運動は抑制され、更に塩化バリウムによって実験的に引き起こされた胃、十二指腸の運動亢進を本薬は緩解させる。(⑦)

(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

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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

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

該当資料なし

(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

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

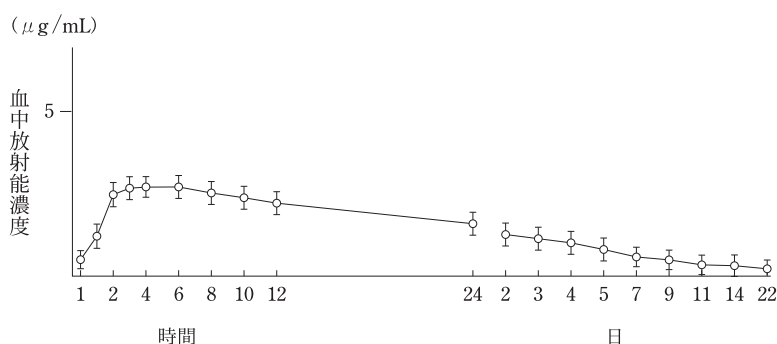
3. 吸収

〈参考〉

ラットに、 ^{14}C -オキセサゼイン $5\text{mg}/\text{kg}$ を単回経口投与したところ、投与 4 時間後に最高血中放射能濃度（オキセサゼイン当量として $2.7\ \mu\text{g}/\text{mL}$ ）に達し、以後緩徐に低下し、投与後 22 日においても $0.34\ \mu\text{g}/\text{mL}$ の血中放射能濃度（オキセサゼイン当量）を示した。

この長時間にわたって残存する血中の放射能は、以下の理由によりオキセサゼイン及びその代謝物の残留性を示すものではない。「Ⅶ.-6.-（2）排泄率」の項で後述するように、呼気中に ^{14}C -炭酸ガスとして放射能が排泄されるが、これは ^{14}C -オキセサゼインの ^{14}C 標識部位- $^*\text{CH}_2^*\text{CH}_2\text{OH}$ 基が酸化的に N-脱離し、これが C_1 単位として蛋白や脂質等の生体成分の合成に利用されたことを意味している。なお、血中の未変化体濃度は 1 時間後に $0.1\ \mu\text{g}/\text{mL}$ 、2 時間後にはほとんど消失した。

ラットにおける ^{14}C -オキセサゼイン単回経口投与時の血中放射能濃度（オキセサゼイン当量）の推移



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

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

〈参考〉

ラットに ^{14}C -オキセサゼイン $5\text{mg}/\text{kg}$ を単回経口投与した。その結果、投与 4 時間後における組織内分布では脳、神経、精巣、筋肉及び脂肪への放射能の取り込みは少なかった。血液より高い放射能濃度を示す臓器として、肝、脾、胃、腎、副腎及び脾臓があり、特に肝臓は著しく高い放射能濃度を示していた。

投与 12 日後ではほとんどの組織に放射能がほぼ一様に分布しており、体内残留は投与量の 11.7% であった。この見かけ上の放射能残留も、「Ⅶ.-3. 吸収」の項で述べた理由による。

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

〈参考〉

オキセサゼインは主に肝で代謝され、ヒドロキシルアミン又はジメチルヒドロキシエチルアミンが遊離し、さらに代謝される。また一部は、アミダーゼ及びペプチダーゼにより局部的に加水分解される。メフェンテルミン (N-methyl- ω -phenyl-tert-butylamine) 部分は、さらにN-脱メチル化され、ノルメフェンテルミンに、*p*位の水酸化によって*p*-ヒドロキシメフェンテルミンに代謝される。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450等) の分子種

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

尿中、糞中、呼気中

(2) 排泄率

〈参考〉

ラットに¹⁴C-オキセサゼイン 5mg/kgを単回経口投与した。その結果、投与後12日間の累積尿中排泄率は投与量の21.3%であり、その83%が24時間以内に排泄された。また、12日間の累積糞中排泄率は投与量の25.5%であり、その86%が24時間以内に排泄された。さらに、投与後7日間の呼気への累積排泄率は投与量の26.9%であった。

(3) 排泄速度

該当資料なし

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

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

本剤の成分に対し過敏症を有する患者は、重篤なアレルギー反応を示す可能性が高い。

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

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

7. 相互作用

(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

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

総症例 951 例中、38 例（4.00%）の副作用が報告されている。（再評価結果時）

(2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(3) その他の副作用

	0.1～5%未満	頻度不明
過敏症 ^{注1)}		発疹
消化器 ^{注2)}	便秘、食欲不振、 口渇、悪心、下痢	
精神神経系	頭痛、眩暈	眠気、脱力感

注1) 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。

注2) このような症状の継続又は増強がみられた場合は、減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

副作用は総症例 951 例中 38 例（4.00%）に認められ、症状別には便秘 23 件（2.42%）、食欲不振 3 件（0.32%）、口渇 3 件（0.32%）、頭痛 2 件（0.21%）等であった。

また、本剤に起因すると考えられる臨床検査値の変動は報告されていない。

副作用発現頻度一覧表

	症例数 (%)
総 症 例 数	951
副作用発現症例数	38 (4.00)
[消化器]	33 (3.47)
便 秘	23 (2.42)
口内異味感	1 (0.11)
口 渇	3 (0.32)
悪心（嘔気）	2 (0.21)
食 欲 不 振	3 (0.32)
胸 や け	1 (0.11)
下 痢	1 (0.11)
[全身・その他]	4 (0.42)
頭 痛	2 (0.21)
め ま い	1 (0.11)
悪 寒	1 (0.11)

(1974年7月集計)

(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)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

その他の副作用

過敏症^{注)}：発疹（頻度不明）

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

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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にのみ投与すること。

(解説)

妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。

11. 小児等への投与

小児に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

該当しない

14. 適用上の注意

(1) 投与時

長期連続投与は避けること。

(解説)

本剤は局麻作用により消化器疾患に伴う自覚症状を緩解するものであり、漫然と長期投与すべきでない。

(2) 服用時

口内にしびれ等を残さないため噛み砕いたりせず、速やかに飲みくださいよう注意させること。

(3) 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に刺入し、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報告されている)

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

Ⅷ. 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

1. 中枢神経系に対する影響

マウスにおいて、本薬 80mg/kg 以上の腹腔内投与で自発運動の抑制や歩行障害がみられている。また、ウサギの体温は、本薬 80~160mg/kg の経口投与で約 0.5℃ 低下し、2~3 時間で回復した。ウサギの大脳皮質および海馬の自発脳波は本薬 40~80mg/kg の腹腔内投与で高電位の徐波成分が増加した。

2. 循環系に対する影響

麻酔イヌに本薬 1mg/kg を静注した結果、著明な血圧降下と心電図 PR 間隔の延長が認められた。無麻酔イヌに本薬 10~20mg/kg を経口投与した結果、血圧や心電図 PR 間隔は変化しなかったが、心拍数が若干増加した。

3. 消化器系に対する影響

クロラロス麻酔下のネコに本薬の 0.01~0.1% 溶液を十二指腸注入及び静注した場合にも、唾液分泌促進作用が認められた。この作用は迷走神経や内臓神経の切断後、あるいはアトロピンやヘキサメトニウム処置後でも有効であることから、神経系を介さないものであると考えられる。

(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

LD ₅₀ (mg/kg)		マウス		ラット	
投与経路	動物種	雄	雌	雄	雌
経口		1231	1000~2000	1000~2000	1071

○マウス・ラット・ウサギ

〈中毒症状〉

協調性運動失調、振戦、強直性痙攣、間代性痙攣、呼吸促迫、呼吸困難

〈死因〉

心臓の収縮力の抑制、伝導障害

〈最大無作用量等〉

該当資料なし

Ⅹ. 非臨床試験に関する項目

(2) 反復投与毒性試験

1) 亜急性毒性

Wistar系ラット雌雄に本薬 25、100、400mg/kg/日を1カ月間経口投与した。その結果、高用量の400mg/kg投与群で軽度の腎障害及び胃腸障害が認められた。100mg/kg以下では、血液検査、尿検査、生化学検査、組織学的検査において異常所見は認められなかった。

2) 慢性毒性

ラット雌雄を本薬 0.1%、0.2%及び0.4%含有餌で28週間飼育した、あるいはイヌに400mg、800mg/頭/日を28週間経口投与した結果、いずれも臓器重量、血液検査、組織学的検索において異常所見は認められなかった。 (8)

(3) 生殖発生毒性試験

ラットの妊娠前・初期、器官形成期及び周産・授乳期に本薬 20、40mg/kg/日を、また、ウサギの器官形成期に本薬 10、20mg/kg/日を経口投与した。その結果、生殖能への影響、発育抑制、催奇形性は認められなかった。

(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：該当しない（処方箋医薬品以外の医薬品である）

有効成分：オキセサゼイン 劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年間

3. 貯法・保存条件

室温保存

アルミ袋開封後、湿気を避けて保存すること（湿気により含量が低下する）。

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

該当しない

(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）

「Ⅷ.-14. 適用上の注意」の項参照

くすりのしおり：有り

(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

ストロカイン錠 5mg……………100錠（PTP）・1,000錠（PTP）

7. 容器の材質

PTP包装品

PTP：ポリプロピレン、アルミ箔

袋：アルミラミネート

X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：該当しない

同 効 薬

一 般 名	商 品 名	会 社 名
ピペリジノアセチルアミノ安息香酸エチル	スルカイン錠 100mg	日本新薬
Ⓜアミノ安息香酸エチル	アネステジン「ホエイ」	マイラン製薬-ファイザー 等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2007年8月31日

承認番号：21900AMX01227000

注) (旧販売名) ストロカイン錠 製造販売承認年月日：1962年2月27日

11. 薬価基準収載年月日

2007年12月21日

注) (旧販売名) ストロカイン錠：1963年1月1日 (経過措置期間終了：2008年8月31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

再評価結果公表年月日：1979年2月2日

効能・効果：「急性・慢性胃炎に伴う次の諸症状に局所麻酔として使用する。ただし、低酸性胃炎及び無酸性胃炎を除く。胃痛、嘔気、呑酸、嘈雜、胃部不快感」を「下記疾患に伴う疼痛・酸症状・嘔気・悪心・嘔吐・胃部不快感・便秘逼迫 食道炎、胃炎、胃・十二指腸潰瘍、過敏性大腸症（イリタブルコロン）」に変更。

用法・用量：「1回1～2錠、1日3回症状に応じて適宜増減する。」を「通常成人1日3～8錠（オキセサゼインとして1日15～40mg）を3～4回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」に変更。

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、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

X. 管理的事項に関する項目

16. 各種コード

包 装	HOT(13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
PTP 100T	1016871 01 0204	1219 002F 1065	620005991
PTP 1000T	1016871 01 0205		

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

		文献請求番号
① 白壁彦夫ら：臨牀と研究,	52, 3065 (1975)	SR-0001
② Farrar, G. E. Jr. et al. : Pa. Med. J.,	65, 1369 (1962)	SR-0003
③ Seifter, J. et al. : Proc. Soc. Exp. Bio. Med.,	109, 664 (1962)	SR-0004
④ Posey, E. L. Jr. et al. : Am. J. Gastroenterol.,	55, 54 (1971)	SR-0006
⑤ Posey, E. L. Jr. et al. : Am. J. Dig. Dis.,	14, 797 (1969)	SR-0005
⑥ 山形徹一ら：診療,	21, 1035 (1969)	SR-0008
⑦ 難波良司ら：日本消化器病学会雑誌,	63, 271 (1966)	SR-0007
⑧ Glassman, J. M. et al. : Toxicol Appl. Pharmacol.,	5, 184 (1963)	SR-0043

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

2016年2月現在、香港、シンガポール等で販売されている。

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし

