

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 2008 に準拠して作成

プロトンポンプ・インヒビター

日本薬局方 オメプラゾール腸溶錠

オメプラゾール錠10「SW」

オメプラゾール錠20「SW」

Omeprazole Tablets「SW」

剤形	腸溶性フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	錠10「SW」：1錠中に日局オメプラゾール10mgを含有 錠20「SW」：1錠中に日局オメプラゾール20mgを含有
一般名	和名：オメプラゾール 洋名：Omeprazole
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	錠10「SW」 製造販売承認年月日：2006年2月27日 薬価基準収載年月日：2006年7月7日 発売年月日：2006年7月7日 錠20「SW」 製造販売承認年月日：2004年2月25日 薬価基準収載年月日：2004年7月9日 発売年月日：2004年7月9日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：メディサ新薬株式会社 発売元：旭化成ファーマ株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	旭化成ファーマ株式会社【医薬情報部 くすり相談窓口】 TEL:0120-114-936 FAX:03-6699-3697 受付時間 9:00～17:45（土日祝、休業日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.asahikasei-pharma.co.jp

本 IF は 2018 年 8 月改訂(第 21 版)の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://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－

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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

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 判、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。
- ②IF 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]

- ①IF 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。
- ②IF 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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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、今後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。

(2008 年 9 月)

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 3
7. CAS 登録番号 3

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 4
 - (1)外観・性状 4
 - (2)溶解性 4
 - (3)吸湿性 4
 - (4)融点(分解点)、沸点、凝固点 4
 - (5)酸塩基解離定数 4
 - (6)分配係数 4
 - (7)その他の主な示性値 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 4
4. 有効成分の定量法 4

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 5
 - (1)剤形の区別、規格及び性状 5
 - (2)製剤の物性 5
 - (3)識別コード 5
 - (4)pH、浸透圧比、粘度、比重、
無菌の旨及び安定なpH域等 5
2. 製剤の組成 5
 - (1)有効成分(活性成分)の含量 5
 - (2)添加物 5
 - (3)その他 6

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 6
5. 調製法及び溶解後の安定性 8
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化) 8
7. 溶出性 8
8. 生物学的試験法 10
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 10
10. 製剤中の有効成分の定量法 10
11. 力価 11
12. 混入する可能性のある夾雑物 11
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 11
14. その他 11

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 12
2. 用法及び用量 12
3. 臨床成績 13
 - (1)臨床データパッケージ 13
 - (2)臨床効果 13
 - (3)臨床薬理試験: 忍容性試験 13
 - (4)探索的試験: 用量反応探索試験 13
 - (5)検証的試験 14
 - 1)無作為化並行用量反応試験 14
 - 2)比較試験 14
 - 3)安全性試験 14
 - 4)患者・病態別試験 14
 - (6)治療的使用 14
 - 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) 14
 - 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 14

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 15
2. 薬理作用 15
 - (1)作用部位・作用機序 15
 - (2)薬効を裏付ける試験成績 15
 - (3)作用発現時間・持続時間 15

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法 16
 - (1)治療上有効な血中濃度 16
 - (2)最高血中濃度到達時間 16

(3)臨床試験で確認された血中濃度	16
(4)中毒域	17
(5)食事・併用薬の影響	17
(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	17
2. 薬物速度論的パラメータ	18
(1)コンパートメントモデル	18
(2)吸収速度定数	18
(3)バイオアベイラビリティ	18
(4)消失速度定数	18
(5)クリアランス	18
(6)分布容積	18
(7)血漿蛋白結合率	18
3. 吸収	18
4. 分布	18
(1)血液－脳関門通過性	18
(2)血液－胎盤関門通過性	19
(3)乳汁への移行性	19
(4)髄液への移行性	19
(5)その他の組織への移行性	19
5. 代謝	19
(1)代謝部位及び代謝経路	19
(2)代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種	19
(3)初回通過効果の有無及びその割合	19
(4)代謝物の活性の有無及び比率	19
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	19
6. 排泄	20
(1)排泄部位及び経路	20
(2)排泄率	20
(3)排泄速度	20
7. 透析等による除去率	20

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	21
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	21
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由	21
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由	21
5. 慎重投与内容とその理由	21
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21
7. 相互作用	22
(1)併用禁忌とその理由	22
(2)併用注意とその理由	23
8. 副作用	24
(1)副作用の概要	24

(2)重大な副作用と初期症状	24
(3)その他の副作用	25
(4)項目別副作用発現頻度 及び臨床検査値異常一覧	25
(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	25
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法	25
9. 高齢者への投与	26
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	26
11. 小児等への投与	26
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	26
13. 過量投与	26
14. 適用上の注意	26
15. その他の注意	27
16. その他	27

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	28
(1)薬効薬理試験	28
(2)副次的薬理試験	28
(3)安全性薬理試験	28
(4)その他の薬理試験	28
2. 毒性試験	28
(1)単回投与毒性試験	28
(2)反復投与毒性試験	28
(3)生殖発生毒性試験	28
(4)その他の特殊毒性	28

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	29
2. 有効期間又は使用期限	29
3. 貯法・保存条件	29
4. 薬剤取扱い上の注意点	29
(1)薬局での取扱いについて	29
(2)薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)	29
5. 承認条件等	29
6. 包装	29
7. 容器の材質	29
8. 同一成分・同効薬	30
9. 国際誕生年月日	30
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	30
11. 薬価基準収載年月日	30
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	30

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	31
14. 再審査期間	32
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	32
16. 各種コード	32
17. 保険給付上の注意	32
X I. 文献	
1. 引用文献	33
2. その他の参考文献	33
X II. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	34
2. 海外における臨床支援情報	34
X III. 備考	
その他の関連資料	35

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オメプラゾール錠 10/錠 20「SW」は日局オメプラゾールを含有するプロトンポンプ・インヒビターである。

オメプラゾールは強力に胃酸分泌を抑制するプロトンポンプ阻害作用があり、胃潰瘍の治療に用いられる。¹⁾

オメプラゾール錠 10/錠 20「SW」は、後発医薬品として開発を企画し、医薬発第 481 号（平成 11 年 4 月 8 日）に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施した。オメプラゾール錠 20「SW」は平成 16 年 2 月に承認を取得、同年 7 月に上市した。また、オメプラゾール錠 10「SW」は平成 18 年 2 月に承認を取得、同年 7 月に上市した。平成 17 年 8 月にはオメプラゾール錠 20「SW」に「再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法」の効能が追加された（オメプラゾール錠 10「SW」は既承認）。また、平成 19 年 11 月にはオメプラゾール錠 10/錠 20「SW」に「胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」（アモキシシリン及びクラリスロマイシンとの併用）の効能が追加された。次いで、平成 21 年 6 月にはオメプラゾール錠 10「SW」に「非びらん性胃食道逆流症」の効能が追加された。

さらに、オメプラゾール錠 10/錠 20「SW」に、平成 22 年 9 月、「胃 MALT リンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能が、平成 25 年 6 月、「ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能がそれぞれ追加された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 腸溶性のフィルムコーティング錠である。
- 2) 本剤は酸分泌が生じている部位に集積し、そこで特異的に活性化され、プロトンポンプ活性を非可逆的に抑制する。¹⁾
- 3) 1 日 1 回投与で胃潰瘍、十二指腸潰瘍、逆流性食道炎に対し、早期より治療効果を示す。
- 4) 24 時間胃内 pH モニタリング法によって比較した胃酸分泌抑制効果は、標準製剤と同等であった。²⁾
- 5) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー様症状、汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全、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)、視力障害、間質性腎炎、急性腎不全、低ナトリウム血症、間質性肺炎、横紋筋融解症、錯乱状態があらわれることがある (頻度不明)。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

オメプラゾール錠 10「SW」

オメプラゾール錠 20「SW」

(2) 洋名

Omeprazole Tablets 10「SW」

Omeprazole Tablets 20「SW」

(3) 名称の由来

一般名より命名

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

オメプラゾール (JAN)

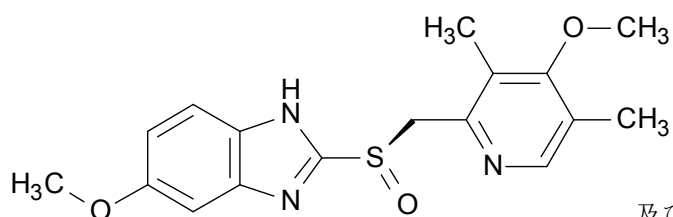
(2) 洋名(命名法)

Omeprazole (JAN, INN)

(3) ステム

抗潰瘍性ベンズイミダゾール誘導体 : -prazole

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

分子式 : C₁₇H₁₉N₃O₃S

分子量 : 345.42

5. 化学名(命名法)

(*RS*)-5-Methoxy-2-[[4-methoxy-3,5-dimethylpyridin-2-yl)methyl]sulfinyl]-1*H*-benzimidazole (IUPAC)

Ⅱ. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

73590-58-6

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～帯黄白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。

(2) 溶解性

N,N-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

本品 1g は *N,N*-ジメチルホルムアミド約 9mL、エタノール(99.5)約 75mL に溶ける。¹⁾

溶解度(37°C) ³⁾	pH1.2 : 33.0 mg/mL	pH6.0 : 0.079mg/mL
	pH6.8 : 0.078mg/mL	水 : 0.091mg/mL

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点 : 約 150°C(分解)

(5) 酸塩基解離定数³⁾

pKa₁:4.5、pKa₂:8.9 (室温、吸光度法)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

N,N-ジメチルホルムアミド溶液(1→25)は旋光性を示さない。

比吸光度 $E_{1cm}^{1\%}$ (271nm) : 約 1030¹⁾

2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に黄白色となる。

水 : 37°C、2 時間及び 6 時間でそれぞれ 14%及び 43%分解する。³⁾

液性(pH) : pH1.2、pH4.0 及び pH6.8 において、37°C、2 時間でそれぞれ 83%、97%及び 8% 分解する。³⁾

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「オメプラゾール」の確認試験に準ずる。

4. 有効成分の定量法


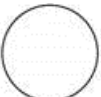
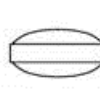

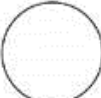
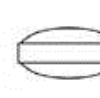
日本薬局方「オメプラゾール」の定量法に準ずる。

(電位差滴定法)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

品名	剤形	外形			性状
		直径(mm)	重量(mg)	厚さ(mm)	
オメプラゾール錠 10「SW」	腸溶性 フィルム コーティング錠	 6.2	 約 97	 3.5	白色
オメプラゾール錠 20「SW」	腸溶性 フィルム コーティング錠	 7.2	 約 139	 3.6	白色

(2) 製剤の物性

製剤均一性：日本薬局方「オメプラゾール腸溶錠」の製剤均一性の項に定められた含量均一性試験を行うとき、これに適合する。

溶出性：日本薬局方「オメプラゾール腸溶錠」の溶出性の項に定められた溶出試験を行うとき、これに適合する。

(3) 識別コード

オメプラゾール錠 10「SW」：SW 181（錠剤本体及びPTPシート上に記載）

オメプラゾール錠 20「SW」：SW 180（錠剤本体及びPTPシート上に記載）

(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

オメプラゾール錠 10「SW」：1 錠中に日局オメプラゾール 10mg を含有する。

オメプラゾール錠 20「SW」：1 錠中に日局オメプラゾール 20mg を含有する。

(2) 添加物

オメプラゾール錠10「SW」：カルナウバロウ、クエン酸トリエチル、酸化チタン、水酸化Al、ステアリン酸Mg、セタノール、タルク、炭酸水素Na、デンプングリコール酸Na、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒプロメロース、ヒプロメロースフタル酸エステル、ポリソルベート80、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、マクロゴール6000、メタクリル酸コポリマーLD、ラウリル硫酸Naを含有する。

オメプラゾール錠 20「SW」：カルナウバロウ、クエン酸トリエチル、酸化チタン、水酸化 Mg、ステアリン酸 Mg、セタノール、デンプングリコール酸 Na、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ヒプロメロースフタル酸エステル、マクロゴール 6000、ラウリル硫酸 Na を含有する。

IV. 製剤に関する項目

(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

4. 製剤の各種条件下における安定性

〈 オメプラゾール錠 10「SW」 〉

1) PTP 包装品の安定性 (加速試験)

オメプラゾール錠 10「SW」を PTP 包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロ一包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等全ての規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。⁴⁾

試験項目	イニシャル	40℃75%RH・遮光 6 ヶ月
性 状	白色の腸溶性フィルムコーティング錠	変化なし
確認試験	規格に適合	規格に適合
質量偏差試験	規格に適合	規格に適合
溶出試験	規格に適合	規格に適合
定量試験※	102.1	101.3

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

オメプラゾール錠 10「SW」の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、硬度、溶出試験、定量試験)を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。⁴⁾

試験項目	イニシャル	温度 (40℃、3 ヶ月)	湿度 (25℃・75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60 万 lx・hr)	室温散光下 (なりゆき 3 ヶ月)
性 状	白色の腸溶性 フィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬 度(kg)	8.5	8.4	10.2	8.3	9.2
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.5	99.2	100.1	99.7

※：イニシャルを 100 としたときの含有率 (%)

IV. 製剤に関する項目

〈 オメプラゾール錠 20「SW」 〉

1) PTP 包装品の安定性 (加速試験)

オメプラゾール錠20「SW」を PTP 包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等全ての規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。⁵⁾

試験項目	イニシャル	40℃75%RH・遮光 6 ヶ月
性状	白色の腸溶性フィルムコーティング錠	変化なし
確認試験	規格に適合	規格に適合
含量均一性試験	規格に適合	規格に適合
溶出試験	規格に適合	規格に適合
定量試験※	100.1	99.0

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性 (加速試験)

オメプラゾール錠 20「SW」をバラ包装(ポリエチレン袋+アルミ袋(乾燥剤入り))したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等全ての規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。⁵⁾

試験項目	イニシャル	40℃75%RH・遮光 6 ヶ月
性状	白色の腸溶性フィルムコーティング錠	変化なし
確認試験	規格に適合	規格に適合
含量均一性試験	規格に適合	規格に適合
溶出試験	規格に適合	規格に適合
定量試験※	100.1	99.8

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性

オメプラゾール錠20「SW」の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、硬度、溶出試験、定量試験)を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。⁵⁾

試験項目	イニシャル	温度 (40℃、3 ヶ月)	湿度 (25℃・75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60 万 lx・hr)	室温 (25℃・60%RH 3 ヶ月)
性状	白色の腸溶性 フィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	16.8	16.2	15.1	15.8	16.6
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.6	99.6	100.5	99.9

※：イニシャルを 100 としたときの含有率 (%)

IV. 製剤に関する項目

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)

該当資料なし

7. 溶出性

溶出挙動

本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

〈オメプラゾール錠 10「SW」〉⁶⁾

溶出挙動における同等性

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日付 医薬審第487号」
(平成13年5月31日付 医薬審発第786号により一部改正)

試験製剤：オメプラゾール錠 10「SW」

標準製剤：錠剤、10mg

試験方法：日本薬局方一般試験法溶出試験法第2法（パドル法）

試験条件 試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

回転数：50rpm (pH1.2、pH6.0、pH6.8)、100rpm (pH6.0)

〈50rpm：pH1.2〉

両製剤とも規定された試験時間(120分)における溶出率は50%未満であり、測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。

〈50rpm：pH6.0〉及び〈100rpm：pH6.0〉

標準製剤の溶出にラグ時間があり、試験製剤との平均溶出ラグ時間の差は10分以内であったため、溶出曲線を溶出ラグ時間で補正した。

補正後の溶出曲線において、両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

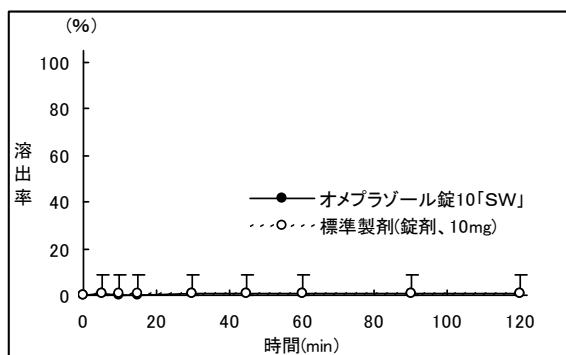
〈50rpm：pH6.8〉

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

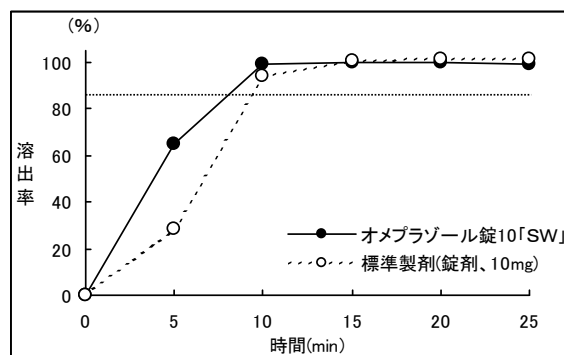
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断された。

IV. 製剤に関する項目

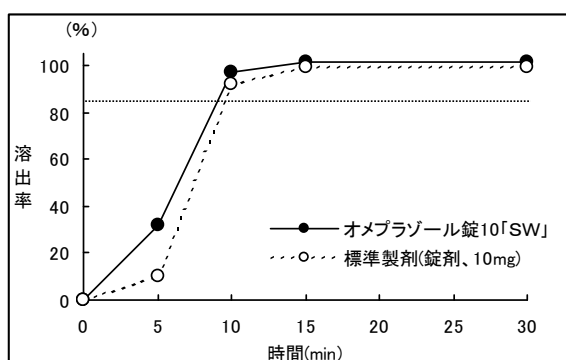
<50rpm : pH1.2>



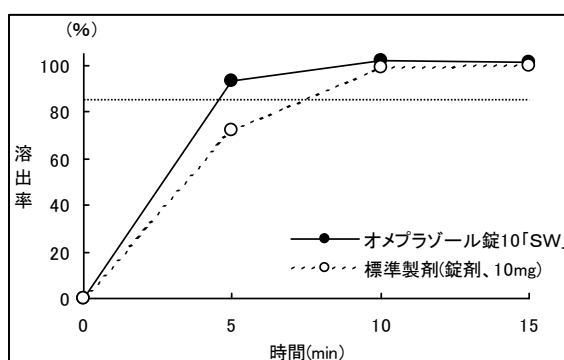
<50rpm : pH6.0>



<50rpm : pH6.8>



<100rpm : pH6.0>



〈オメプラゾール錠 20「SW」〉⁷⁾

溶出挙動における類似性

「医療用医薬品の品質再評価に係る公的溶出試験(案)等について」:平成17年3月15日 薬食審査発第0315001号

試験製剤:オメプラゾール錠 20「SW」

標準製剤:錠剤、20mg

試験方法:日本薬局方一般試験法溶出試験法第2法(パドル法)

試験条件 試験液量:900mL

温度:37±0.5℃

回転数:50rpm (pH1.2、pH6.0、pH6.8、水)

<50rpm : pH1.2>

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

<50rpm : pH6.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

IV. 製剤に関する項目

<50rpm : pH6.8>

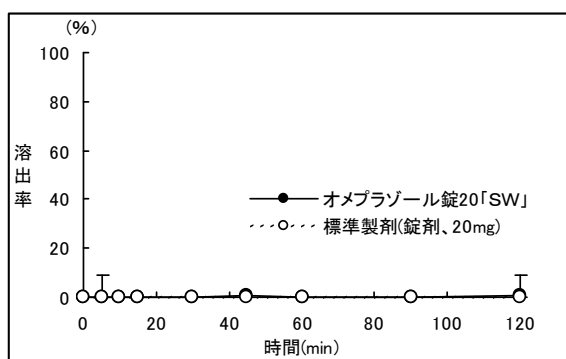
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

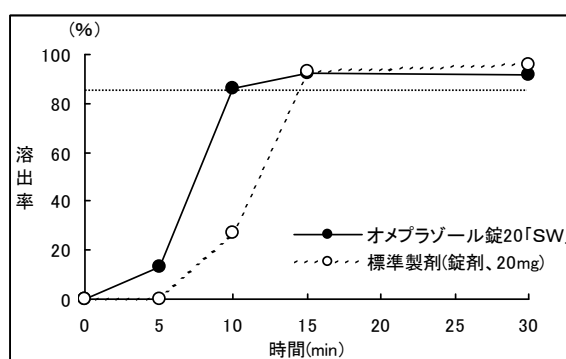
標準製剤の平均溶出率が40%付近(120分)及び85%付近(140分)の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断された。

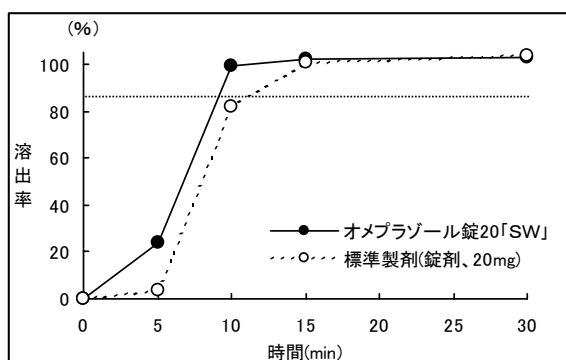
<50rpm : pH1.2>



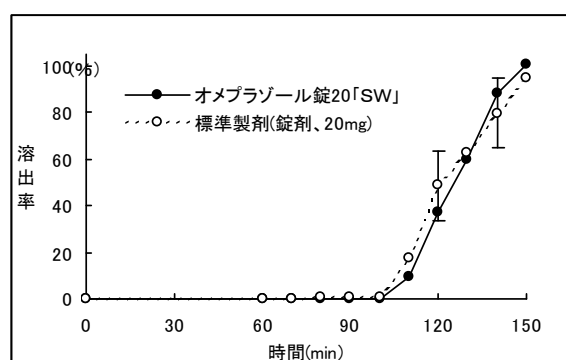
<50rpm : pH6.0>



<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水 >



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

日本薬局方「オメプラゾール腸溶錠」の確認試験に準ずる。

10. 製剤中の有効成分の定量法

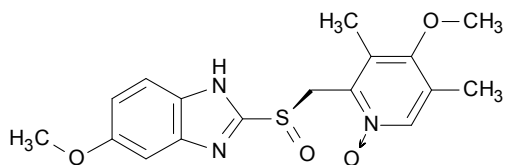
日本薬局方「オメプラゾール腸溶錠」の定量法に準ずる。
(液体クロマトグラフ法)

IV. 製剤に関する項目

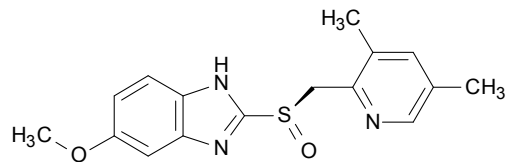
11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物 ¹⁾



N-オキシド体



4'-デスメトキシ体

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

〈 オメプラゾール錠 10「SW」 〉

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、非びらん性胃食道逆流症、Zollinger-Ellison症候群
- 下記におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助
胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃 MALT リンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

〈 オメプラゾール錠 20「SW」 〉

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群
- 下記におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助
胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃 MALT リンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

〈効能又は効果に関連する使用上の注意〉

ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助の場合

- 1) 進行期胃 MALT リンパ腫に対するヘリコバクター・ピロリ除菌治療の有効性は確立していない。
- 2) 特発性血小板減少性紫斑病に対しては、ガイドライン等を参照し、ヘリコバクター・ピロリ除菌治療が適切と判断される症例にのみ除菌治療を行うこと。
- 3) 早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃以外には、ヘリコバクター・ピロリ除菌治療による胃癌の発症抑制に対する有効性は確立していない。
- 4) ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎に用いる際には、ヘリコバクター・ピロリが陽性であること及び内視鏡検査によりヘリコバクター・ピロリ感染胃炎であることを確認すること。

2. 用法及び用量

〈 オメプラゾール錠10「SW」 〉

- 胃潰瘍、吻合部潰瘍、十二指腸潰瘍、Zollinger-Ellison 症候群
通常、成人にはオメプラゾールとして1日1回20mgを経口投与する。なお、通常、胃潰瘍、吻合部潰瘍では8週間まで、十二指腸潰瘍では6週間までの投与とする。
- 逆流性食道炎
通常、成人にはオメプラゾールとして1日1回20mgを経口投与する。なお、通常、8週間までの投与とする。さらに再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法においては、1日1回10～20mgを経口投与する。
- 非びらん性胃食道逆流症
通常、成人にはオメプラゾールとして1日1回10mgを経口投与する。なお、通常、4週間までの投与とする。

V. 治療に関する項目

○ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助

通常、成人にはオメプラゾールとして1回20mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びクラリスロマイシンとして1回200mg(力価)の3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。

プロトンポンプインヒビター、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合は、これに代わる治療として、通常、成人にはオメプラゾールとして1回20mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びメトロニダゾールとして1回250mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

〈 オメプラゾール錠20「SW」 〉

○胃潰瘍、吻合部潰瘍、十二指腸潰瘍、Zollinger-Ellison 症候群

通常、成人にはオメプラゾールとして1日1回20mgを経口投与する。なお、通常、胃潰瘍、吻合部潰瘍では8週間まで、十二指腸潰瘍では6週間までの投与とする。

○逆流性食道炎

通常、成人にはオメプラゾールとして1日1回20mgを経口投与する。なお、通常、8週間までの投与とする。さらに再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法においては、1日1回10~20mgを経口投与する。

○ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助

通常、成人にはオメプラゾールとして1回20mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びクラリスロマイシンとして1回200mg(力価)の3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。

プロトンポンプインヒビター、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合は、これに代わる治療として、通常、成人にはオメプラゾールとして1回20mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びメトロニダゾールとして1回250mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(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

該当資料なし

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

プロトンポンプ・インヒビター：ランソプラゾール、ラベプラゾールナトリウム、エソメプラゾールマグネシウム水和物

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

プロトンポンプ・インヒビターである。胃酸分泌細胞(壁細胞)において、 H^+, K^+ -ATPase を阻害することによって胃酸分泌を抑制する。弱塩基性薬物なので、壁細胞の外側の酸性領域に集積し、酸によって活性型となり H^+, K^+ -ATPase の α サブユニットの SH 基と結合してその活性を阻害する。酵素との結合は共有結合であり、非可逆的なので酵素阻害は薬物の血中濃度が低下した後も持続し、活性の回復は新たな酵素の生合成速度に依存する。これらの機序により、本薬は酸分泌が生じている部位に集積し、そこで特異的に活性化され、ポンプ活性を非可逆的に抑制するという特徴を示す。¹⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

(3) 作用発現時間・持続時間

24 時間胃内 pH モニタリング²⁾

オメプラゾール錠20「SW」と標準製剤(錠剤、20mg)の胃酸分泌抑制効果について、健康成人男性6名を対象として24時間胃内 pH モニタリング法により比較検討した。

その結果、

- 1) 両製剤とも24時間を通じて胃内 pH の上昇が認められ、薬剤非投与時と比較して顕著な胃酸分泌抑制効果が認められた。
- 2) 薬剤投与後の pH3 Holding Time については、両製剤とも薬剤非投与時と比較して有意な延長が認められた。
- 3) 薬剤投与24時間の平均胃内 pH は、両製剤とも薬剤非投与時と比較して有意な pH 上昇が認められた。
- 4) pH3 Holding Time 及び平均胃内 pH について、それぞれ両製剤間の対数値の平均値の差の90%信頼区間及び平均値の差の90%信頼区間を算出したところ、いずれも±20%の範囲内であった。

以上よりオメプラゾール錠 20「SW」と標準製剤は、臨床での使用において同等の胃酸分泌抑制効果を有していることが示唆された。

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

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日付 医薬審第487号」
(平成13年5月31日付 医薬審発第786号により一部改正)

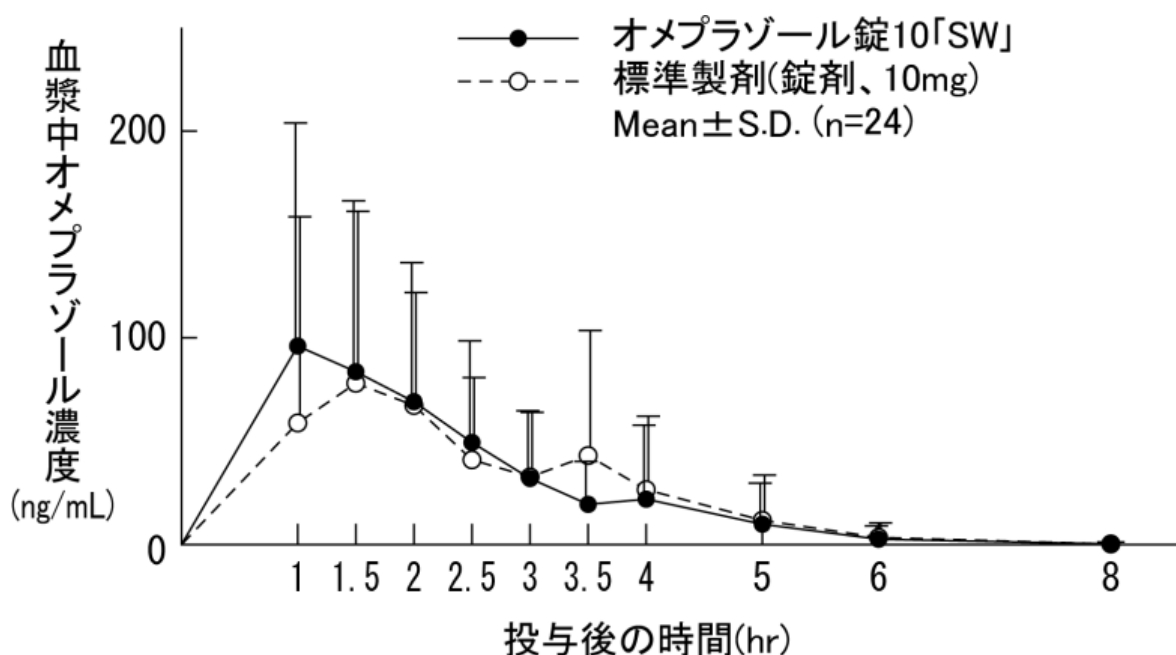
<オメプラゾール錠10「SW」>

オメプラゾール錠10「SW」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(オメプラゾールとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法；休薬期間7日間)し、血漿中オメプラゾール濃度を測定した(測定方法：HPLC法)。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。⁸⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (ng・hr/mL)
オメプラゾール錠10「SW」	172±86	1.8±0.9	0.64±0.11	229±113
標準製剤(錠剤、10mg)	158±78	2.0±1.1	0.63±0.17	211±112
両製剤の対数値の平均値の差の90%信頼区間	AUC _{0-8hr} : log(0.96)~log(1.23) C _{max} : log(0.90)~log(1.26)			
両製剤の対数値の平均値の差	C _{max} : log(1.07)			

(Mean±S.D., n=24)



VII. 薬物動態に関する項目

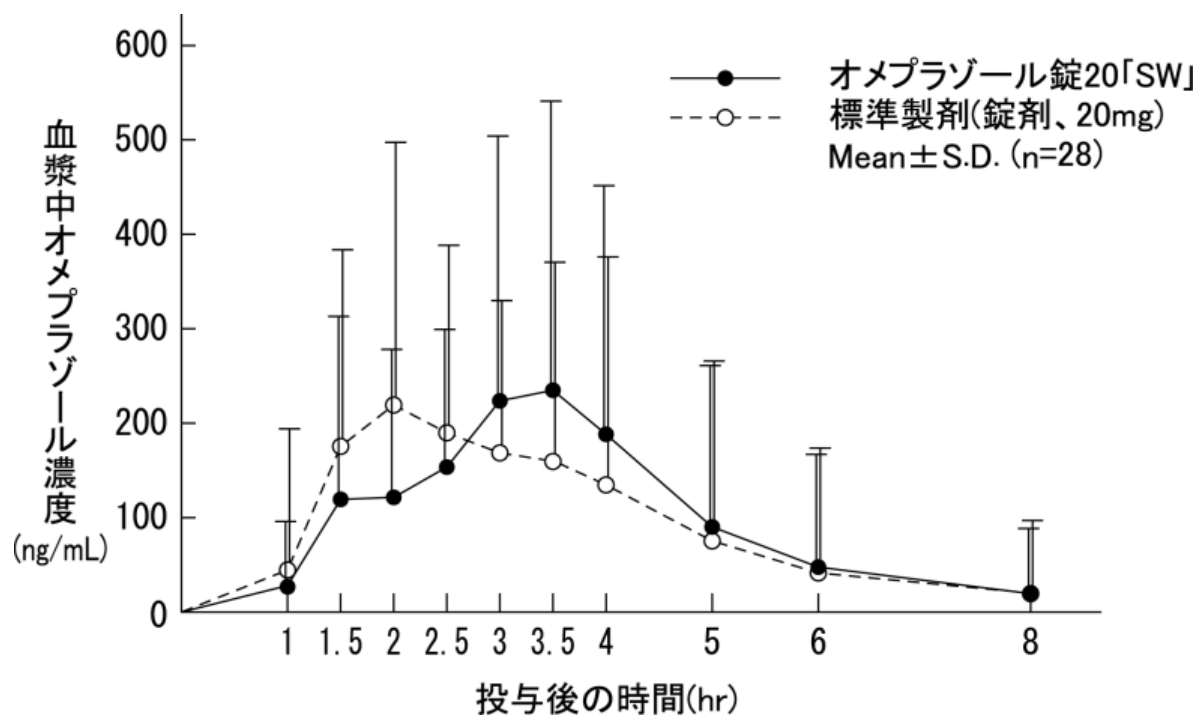
〈 オメプラゾール錠 20「SW」 〉

オメプラゾール錠 20「SW」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ 1 錠(オメプラゾールとして 20mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法; 休薬期間 7 日間)し、血漿中オメプラゾール濃度を測定した(測定方法: HPLC 法)。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。⁹⁾

各製剤 1 錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (ng·hr/mL)
オメプラゾール錠20「SW」	402±293	2.6±1.0	0.76±0.41	770±859
標準製剤(錠剤、20mg)	413±284	2.3±0.8	0.79±0.45	748±869
両製剤の対数値の平均値の差の90%信頼区間	AUC _{0-8hr} : log(0.97)~log(1.13) C _{max} : log(0.81)~log(1.08)			

(Mean±S.D., n=28)



(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 7. 相互作用」の項を参照のこと。

(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

VII. 薬物動態に関する項目

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル

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

オメプラゾール錠 10「SW」 : $1.12 \pm 0.19 \text{ hr}^{-1}$

オメプラゾール錠 20「SW」 : $1.05 \pm 0.31 \text{ hr}^{-1}$

(5) クリアランス

該当資料なし

<外国人のデータ>

オメプラゾールを健常成人に 10mg 単回静脈内投与したとき、全身クリアランスは 530 mL/min と報告されている。¹⁾

(6) 分布容積

該当資料なし

<外国人のデータ>

オメプラゾールを健常成人に 10mg 単回静脈内投与したとき、分布容積は 0.3 L/kg と報告されている。¹⁾

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

オメプラゾールに関し、血漿蛋白結合率は 96~98% と報告されている。¹⁾

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

(2) 血液－胎盤関門通過性

<参考>

「VIII. -10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

動物実験(ウサギ経口 138mg/kg)で胎児毒性(死亡吸収胚率の増加)が報告されている。

(3) 乳汁への移行性

<参考>

「VIII. -10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

動物実験(ラット経口 5mg/kg)で、母乳中へ移行することが報告されている。

(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

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

主として肝代謝酵素 CYP2C19 及び一部 CYP3A4 で代謝される。

CYP2C19 には遺伝多型が存在し、遺伝学的に CYP2C19 の機能を欠損する個体(PM)は日本人を含むモンゴル系人種で 13~20%、コーカサス系人種で 3~4%と報告されている。¹⁾

(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

オメプラゾールに関し次のように報告されている。¹⁾

健常成人に経口投与時、血漿中主代謝物はオメプラゾールスルホン、ヒドロキシオメプラゾールであるが、いずれの代謝物も胃酸分泌抑制作用をほとんど示さない。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

オメプラゾールに関し次のように報告されている。¹⁾

ほとんどが腎で排泄されるが、一部は腸肝循環を経てふん中に排泄される。

(2) 排泄率

該当資料なし

オメプラゾールに関し次のように報告されている。¹⁾

¹⁴C-標識体投与時、約 80%が尿中に、約 20%がふん中に排泄される。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

腹膜透析：該当資料なし

血液透析：該当資料なし

直接血液灌流：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)

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- 1) 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- 2) アタザナビル硫酸塩、リルピビリン塩酸塩を投与中の患者（「VIII. -7. 相互作用」の項参照）

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

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

（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〔肝代謝性であり、血中濃度が高くなるおそれがある。〕
- 3) 高齢者（「VIII. -9. 高齢者への投与」の項参照）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- 1) 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ること**。また、**血液像、肝機能、腎機能等に注意すること**。
- 2) 再発の既往のない逆流性食道炎患者では、逆流性食道炎治癒後直ちに維持療法に移行せず、経過観察により、維持療法の必要性を判断すること。
- 3) 再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法を目的として本剤を投与する場合は、経過観察(定期的な内視鏡検査等を含む)を十分行うとともに、次の事項に十分注意すること。
 - (1) 再発の既往歴、症状の程度等を考慮して維持療法の用量を選択すること。
 - (2) 寛解状態が良好に保たれていると判断された場合は休薬又は減量を考慮すること。
 - (3) 1日10mgの維持療法で再発が認められた場合は1日20mgで再治療を行うこと。治癒後の維持療法においても再発の既往歴、症状の程度等を考慮して用量を選択すること。ただし、1日20mgの維持療法で再発が認められた場合、あるいは予期せぬ体重減少、吐血、嚥下障害等の症状が認められた場合は、改めて内視鏡検査等を行い、その結果に基づいて他の適切な治療法に切り替えることを考慮すること。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

- (4) 定期的に肝機能、腎機能、血液像等の検査を行うことが望ましい。
- 4) 非びらん性胃食道逆流症患者の治療を目的として本剤を投与する場合は、次の事項に十分注意すること。
- (1) 投与に際しては問診により胸やけ、胃液逆流感等の酸逆流症状が繰り返しみられること(1週間あたり2日以上)を確認の上投与すること。なお、本剤の投与が胃癌、食道癌等の悪性腫瘍及び他の消化器疾患による症状を隠蔽することがあるので、内視鏡検査等によりこれらの疾患でないことを確認すること。
- (2) 非びらん性胃食道逆流症の治療については、投与開始2週間後を目安として効果を確認し、症状の改善傾向が認められない場合には、酸逆流以外の原因が考えられるため他の適切な治療への変更を考慮すること。
- 5) 本剤をヘリコバクター・ピロリの除菌の補助に用いる際には、除菌治療に用いられる他の薬剤の添付文書に記載されている禁忌、慎重投与、重大な副作用等の使用上の注意を必ず確認すること。

7. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素 CYP2C19 及び一部 CYP3A4 で代謝される。
また、本剤の胃酸分泌抑制作用により、併用薬剤の吸収を上昇又は低下させることがある。

(1) 併用禁忌とその理由

(併用しないこと)		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アタザナビル硫酸塩 (レイアタツ)	アタザナビル硫酸塩の作用を減弱するおそれがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりアタザナビル硫酸塩の溶解性が低下し、アタザナビルの血中濃度が低下することがある。
リルピピリン塩酸塩 (エジュラント)	リルピピリン塩酸塩の作用を減弱するおそれがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりリルピピリン塩酸塩の吸収が低下し、リルピピリンの血中濃度が低下することがある。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) 併用注意とその理由

(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
ジアゼパム フェニトイン シロスタゾール	これらの薬剤の作用を増強することがある。	本剤は主に肝臓のチトクローム P450 系薬物代謝酵素 CYP2C19 で代謝されるため、本剤と同じ代謝酵素で代謝される薬物の代謝、排泄を遅延させるおそれがある。
ワルファリン	抗凝血作用を増強し、出血に至るおそれがある。プロトロンビン時間国際標準比 (INR) 値等の血液凝固能の変動に十分注意しながら投与すること。	
タクロリムス水和物	タクロリムスの血中濃度が上昇することがある。	相互作用の機序は不明である。
ジゴキシン メチルジゴキシン	これらの薬剤の作用を増強することがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりジゴキシンの加水分解が抑制され、ジゴキシンの血中濃度が上昇することがある。
イトラコナゾール	イトラコナゾールの作用を減弱することがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりイトラコナゾールの溶解性が低下し、イトラコナゾールの血中濃度が低下することがある。
チロシンキナーゼ阻害剤 ゲフィチニブ エルロチニブ	これらの薬剤の血中濃度が低下することがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりこれらの薬剤の溶解性が低下し、吸収が低下することがある。
ポリコナゾール	本剤のCmax及びAUCが増加したとの報告がある。	ポリコナゾールは本剤の代謝酵素 (CYP2C19 及び CYP3A4) を阻害することが考えられる。
ネルフィナビルメシル酸塩	ネルフィナビルの血中濃度が低下するおそれがある。	相互作用の機序は不明である。
サキナビルメシル酸塩	サキナビルの血中濃度が上昇するおそれがある。	相互作用の機序は不明である。
クロピドグレル硫酸塩	クロピドグレル硫酸塩の作用を減弱するおそれがある。	本剤が CYP2C19 を阻害することにより、クロピドグレル硫酸塩の活性代謝物の血中濃度が低下する。
セイヨウオトギリソウ (St. John's Wort, セント・ジョーンズ・ワート) 含有食品	本剤の代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがある。	セイヨウオトギリソウが本剤の代謝酵素 (CYP2C19 及び CYP3A4) を誘導することが考えられる。
メトトレキサート	メトトレキサートの血中濃度が上昇することがある。高用量のメトトレキサートを投与する場合は、一時的に本剤の投与を中止することを考慮すること。	相互作用の機序は不明である。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

(頻度不明)

- (1) **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(血管浮腫、気管支痙攣等)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し、適切な処置を行うこと。
- (2) **汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少**：汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、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し、適切な処置を行うこと。
- (3) **劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全**：劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全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) **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、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。
- (5) **視力障害**：視力障害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投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (6) **間質性腎炎、急性腎不全**：間質性腎炎、急性腎不全があらわれることがあるので、腎機能検査値(BUN、クレアチニン等)に注意し、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。
- (7) **低ナトリウム血症**：低ナトリウム血症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投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (8) **間質性肺炎**：間質性肺炎があらわれることがあるので、発熱、咳嗽、呼吸困難、肺音の異常(捻髪音)等が認められた場合には投与を中止し、速やかに胸部X線等の検査を実施し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- (9) **横紋筋融解症**：筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (10) **錯乱状態**：せん妄、異常行動、失見当識、幻覚、不安、焦躁、攻撃性等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投与を中止し、適切な処置を行うこと。

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

○胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、非びらん性胃食道逆流症、Zollinger-Ellison 症候群の場合

	頻度不明
過 敏 症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、痒痒感、多形紅斑、光線過敏症
消 化 器	下痢・軟便、便秘、悪心、嘔吐、鼓腸放屁、腹部膨満感、カンジダ症、口渇、腹痛、口内炎、舌炎、顕微鏡的大腸炎(collagenous colitis、lymphocytic colitis)
肝 臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、A1-P上昇、 γ -GTP上昇、LDH上昇
血 液	白血球数減少、血小板数減少、貧血
精神神経系	頭痛、眠気、しびれ感、めまい、振戦、傾眠、不眠(症)、異常感覚、うつ状態
そ の 他	霧視、発熱、浮腫、女性化乳房、脱毛、倦怠感、関節痛、BUN上昇、クレアチニン上昇、尿酸上昇、トリグリセライド上昇、血清カリウム上昇、総コレステロール上昇、頻尿、味覚異常、動悸、月経異常、筋肉痛、発汗、筋力低下、低マグネシウム血症

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。

○ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助の場合

	頻度不明
過 敏 症 ^{注1)}	発疹
消 化 器	下痢・軟便、味覚異常、口内炎、腹痛、食道炎、腹部膨満感、便秘、舌炎、悪心、口渇、十二指腸炎
肝 臓 ^{注2)}	肝機能異常、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、A1-P上昇、ビリルビン上昇、LDH上昇
血 液 ^{注2)}	好酸球数増多、血小板数減少、貧血、白血球数増多、白血球分画異常
精神神経系	頭痛、しびれ感、めまい、睡眠障害
そ の 他	尿蛋白陽性、尿酸上昇、総コレステロール上昇、QT延長、発熱、倦怠感、カンジダ症、尿糖陽性、動悸、霧視

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)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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(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

「VIII. -2. 禁忌内容とその理由」の項、「VIII. -5. 慎重投与内容とその理由」の項、「VIII. -8. -(2). 重大な副作用と初期症状」の項、及び「VIII. -8. -(3). その他の副作用」の項参照

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

9. 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、その他生理機能が低下していることが多いので、低用量から投与を開始するなど慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) **妊婦等**：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。〔動物実験(ウサギ経口 138mg/kg)で胎児毒性(死亡吸収胚率の増加)が報告されている。〕
- 2) **授乳婦**：授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット経口 5mg/kg)で、母乳中へ移行することが報告されている。〕

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

該当資料なし

13. 過量投与

- 1) **徴候、症状**：オメプラゾールの過量投与により、悪心、嘔吐、めまい、腹痛、下痢、頭痛等が報告されている。
- 2) **処置**：症状に応じて適切な処置を行うこと。

14. 適用上の注意

- 1) **服用時**：本剤は腸溶錠であり、服用にあたっては、噛んだり、砕いたりせずに、飲みくだすよう患者に指導すること。
- 2) **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)

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

15. その他の注意

- 1) ラットに 1.7mg/kg 以上を 2 年間経口投与した毒性試験で、胃にカルチノイドの発生がみられたとの報告がある。このカルチノイドの発生にはラットに種特異性が認められている。
- 2) 本剤の長期投与中に良性の胃ポリープを認めたとの報告がある。
- 3) 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して投与すること。
- 4) 非びらん性胃食道逆流症の治療において、食道内酸逆流の高リスクであると考えられる中高齢者、裂孔ヘルニアを合併する患者のいずれにも該当しない場合には本剤の治療効果が得られにくい可能性がある。
- 5) 海外における複数の観察研究で、プロトンポンプインヒビターによる治療において骨粗鬆症に伴う股関節骨折、手関節骨折、脊椎骨折のリスク増加が報告されている。特に、高用量及び長期間(1年以上)の治療を受けた患者で、骨折のリスクが増加した。
- 6) 海外における主に入院患者を対象とした複数の観察研究で、プロトンポンプインヒビターを投与した患者においてクロストリジウム・ディフィシルによる胃腸感染のリスク増加が報告されている。
- 7) **ヘリコバクター・ピロリの除菌判定上の注意**：オメプラゾール等のプロトンポンプインヒビターやアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン等の抗生物質及びメトロニダゾールの服用中や投与終了直後では、¹³C-尿素呼気試験の判定が偽陰性になる可能性があるため、¹³C-尿素呼気試験による除菌判定を行う場合には、これらの薬剤の投与終了後 4 週以降の時点で実施することが望ましい。
- 8) ラットに類薬であるランソプラゾール(50mg/kg/日)、アモキシシリン水和物(500mg/kg/日)及びクラリスロマイシン(160mg/kg/日)を併用投与した試験で、母動物での毒性の増強とともに胎児の発育抑制の増強が認められている。

16. その他

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) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

「VIII. -15. その他の注意」の項参照

ラットに1.7mg/kg以上を2年間経口投与した毒性試験で、胃にカルチノイドの発生がみられたとの報告がある。このカルチノイドの発生にはラットに種特異性が認められている。

(3) 生殖発生毒性試験

「VIII. -10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

動物実験(ウサギ経口138mg/kg)で胎児毒性(死亡吸収胚率の増加)が報告されている。

(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：処方箋医薬品※（※注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱いについて

該当しない

(2) 薬剤交付時の注意(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

- 1) 服 用 時：本剤は腸溶錠であり、服用にあたっては、嚙んだり、砕いたりせずに、飲みくだすよう患者に指導すること。
- 2) 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)

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

オメプラゾール錠 10「SW」 PTP：100錠(10錠×10)

オメプラゾール錠 20「SW」 PTP：100錠(10錠×10)

バラ：500錠

7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

ピロー包装：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム(アルミ袋)

バラ：ポリエチレン(ポリ袋)、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム(アルミ袋)

X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬

同一成分: オメプラール錠 10/錠 20/注用 20(アストラゼネカ株式会社)

オメプラゾン錠 10mg/錠 20mg(田辺三菱製薬株式会社)

同効薬: ランソプラゾール、ラベプラゾールナトリウム、エソメプラゾールマグネシウム水和物

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

オメプラゾール錠 10「SW」

製造販売承認年月日: 2006年2月27日

承認番号: 21800AMZ10106000

オメプラゾール錠 20「SW」

製造販売承認年月日: 2004年2月25日

承認番号: 21600AMZ00397000

11. 薬価基準収載年月日

オメプラゾール錠 10「SW」: 2006年7月7日

オメプラゾール錠 20「SW」: 2004年7月9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

オメプラゾール錠 20「SW」

承認年月日: 2005年8月24日

用法・用量内容: 逆流性食道炎の項に「さらに再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法においては、1日1回10~20mgを経口投与する。」を追加した。

オメプラゾール錠 10/錠 20「SW」

承認年月日: 2007年11月21日

効能・効果内容: 「胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能・効果を追加した。

用法・用量内容: 効能・効果追加に伴い、下記の用法・用量を追加した。

「胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」

「通常、成人にはオメプラゾールとして1回20mg、アモキシシリンとして1回750mg(力価)及びクラリスロマイシンとして1回200mg(力価)の3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。」

X. 管理的事項に関する項目

オメプラゾール錠 20「SW」

承認年月日：2009年4月23日

用法・用量内容：胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助の項に「プロトンポンプインヒビター、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合は、これに代わる治療として、通常、成人にはオメプラゾールとして1回20mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びメトロニダゾールとして1回250mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。」を追加した。

オメプラゾール錠 10「SW」

承認年月日：2009年6月10日

効能・効果内容：「非びらん性胃食道逆流症」の効能・効果を追加した。

用法・用量内容：下記の用法・用量を追加した。

○「非びらん性胃食道逆流症」

「通常、成人にはオメプラゾールとして1日1回10mgを経口投与する。なお、通常、4週間までの投与とする。」

○「胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」

「プロトンポンプインヒビター、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合は、これに代わる治療として、通常、成人にはオメプラゾールとして1回20mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びメトロニダゾールとして1回250mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。」

オメプラゾール錠 10/錠 20「SW」

承認年月日：2010年9月13日

効能・効果内容：「胃 MALT リンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能・効果を追加した。

用法・用量内容：効能・効果追加に伴い、用法・用量を一部変更した。

オメプラゾール錠 10/錠 20「SW」

承認年月日：2013年6月18日

効能・効果内容：「ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能・効果を追加した。

13. 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

X. 管理的事項に関する項目

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

本剤は厚生労働省告示第75号(平成24年3月5日付)による「投与期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

なお、通常、胃潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎では8週間まで、十二指腸潰瘍では6週間まで、非びらん性胃食道逆流症では4週間までの投与とする。

また、ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助においては7日間経口投与する。

16. 各種コード

販売名	HOT 番号 (13桁)	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
オメプラゾール錠 10「SW」 PTP	1174052020101	2329022H2090	620003914
オメプラゾール錠 20「SW」 PTP	1162561010101	2329022H1094	620001985
オメプラゾール錠 20「SW」 バラ	1162561010201		

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編, “第十七改正 日本薬局方解説書”, 廣川書店, 東京, 2016, C-1175-C-1179.
- 2) 蓮沼智子他, 医学と薬学, **52**(1), 67(2004).
- 3) 日本公定書協会編, “医療用医薬品品質情報集 No. 25,” 薬事日報社, 東京, 2006, p. 164.
- 4)～5) メディサ新薬(株)社内資料[安定性試験]
- 6)～7) メディサ新薬(株)社内資料[溶出試験]
- 8)～9) メディサ新薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]

2. その他の参考文献

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

オメプラゾールは、1987年フランスで承認されたのを初めとして、スウェーデン、イギリス、アメリカ、ドイツ等100カ国以上の国々で承認されている。

2. 海外における臨床支援情報

XⅢ. 備考

その他の関連資料

旭化成ファーマ株式会社