

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

尿失禁・尿意切迫感・頻尿治療剤

オキシブチニン塩酸塩錠1mg「サワイ」 オキシブチニン塩酸塩錠2mg「サワイ」 オキシブチニン塩酸塩錠3mg「サワイ」

OXYBUTYNIN HYDROCHLORIDE

オキシブチニン塩酸塩錠

剤形	錠1mg：フィルムコーティング錠 錠2mg：割線入りフィルムコーティング錠 錠3mg：割線入りフィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠1mg：1錠中オキシブチニン塩酸塩1mg含有 錠2mg：1錠中オキシブチニン塩酸塩2mg含有 錠3mg：1錠中オキシブチニン塩酸塩3mg含有
一般名	和名：オキシブチニン塩酸塩 洋名：Oxybutynin Hydrochloride
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：2015年2月12日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：2015年6月19日(販売名変更) 発売年月日：1996年7月5日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp

本IF2019年7月改訂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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>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、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。

- 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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	21
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	21
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	21
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	21
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	21
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	21
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	22
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	22
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	22
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	23
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	23
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	23
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	23
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	24
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	24
4. 有効成分の定量法	4	15. その他の注意	24
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他	24
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	25
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	25
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	25
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	X. 管理的事項に関する項目	26
5. 調製法及び溶解後の安定性	8	1. 規制区分	26
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	2. 有効期間又は使用期限	26
7. 溶出性	8	3. 貯法・保存条件	26
8. 生物学的試験法	11	4. 薬剤取扱い上の注意点	26
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	11	5. 承認条件等	26
10. 製剤中の有効成分の定量法	11	6. 包装	26
11. 力価	11	7. 容器の材質	27
12. 混入する可能性のある夾雑物	11	8. 同一成分・同効薬	27
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12	9. 国際誕生年月日	27
14. その他	12	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	27
V. 治療に関する項目	13	11. 薬価基準収載年月日	27
1. 効能又は効果	13	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	27
2. 用法及び用量	13	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	28
3. 臨床成績	13	14. 再審査期間	28
VI. 薬効薬理に関する項目	15	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	28
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	16. 各種コード	28
2. 薬理作用	15	17. 保険給付上の注意	28
VII. 薬物動態に関する項目	16	XI. 文献	29
1. 血中濃度の推移・測定法	16	1. 引用文献	29
2. 薬物速度論的パラメータ	18	2. その他の参考文献	29
3. 吸収	19	XII. 参考資料	30
4. 分布	19	1. 主な外国での発売状況	30
5. 代謝	20	2. 海外における臨床支援情報	30
6. 排泄	20	XIII. 備考	30
7. トランスポーターに関する情報	20	その他の関連資料	30
8. 透析等による除去率	20		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg/錠 2 mg/錠 3 mg「サワイ」は、オキシブチニン塩酸塩を含有する尿失禁・尿意切迫感・頻尿治療剤である。

オキシブチニン塩酸塩は、グリコール酸のブチルエステル誘導体¹⁾、神経因性膀胱等による頻尿・尿意切迫感・尿失禁に用いられる。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

	オリベート錠 1 / 錠 2 / 錠 3 (旧販売名)
承認申請に際し準拠した通知名	昭和55年 5月30日 薬発第698号
承認	1996年 1月
上市	1996年 7月

2012年 4月にメディサ新薬株式会社から沢井製薬株式会社に製造販売承認が承継された。

2015年 6月に「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年 9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づき、『オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg「サワイ」』、『オキシブチニン塩酸塩錠 2 mg「サワイ」』及び『オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」』に販売名を変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 苦味をマスキングしたフィルムコーティング錠である。
- 2) カルシウム拮抗作用による膀胱平滑筋直接作用と、抗ムスカリン作用による向神経作用の選択的かつ相加的作用で、膀胱の過緊張状態を抑制する。¹⁾
- 3) 重大な副作用として、血小板減少、麻痺性イレウス、尿閉が報告されている(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg「サワイ」

オキシブチニン塩酸塩錠 2 mg「サワイ」

オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」

2) 洋名

OXYBUTYNIN HYDROCHLORIDE

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

オキシブチニン塩酸塩(JAN)

2) 洋名(命名法)

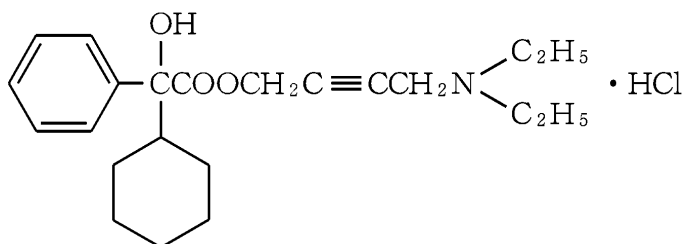
Oxybutynin Hydrochloride (JAN)

Oxybutynin (INN)

3) ステム

—verine : papaverine作用をもつ鎮けい剤

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{22}H_{31}NO_3 \cdot HCl$

分子量 : 393.95

5. 化学名(命名法)
4-Diethylamino-2-butynyl(±)-α-cyclohexyl-α-phenylglycollate hydrochloride

6. 慣用名、別名、略号、記号番号
別名：塩酸オキシブチニン

7. CAS登録番号
1508-65-2 [Oxybutynin Hydrochloride]
5633-20-5 [Oxybutynin]

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。
臭いはなく味は極めて苦い。²⁾

2) 溶解性

メタノールに極めて溶けやすく、水、エタノール(95)又は酢酸(100)に溶けやすく、無水酢酸にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
溶解度(37℃)³⁾ : pH1.2 : 420mg/mL、pH4.0 : 450mg/mL、pH6.8 : 23mg/mL、水 : 430mg/mL

3) 吸湿性

乾燥減量 : 3.0%以下(0.5g、105℃、4時間)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点 : 124~129℃

5) 酸塩基解離定数

$pK_a = 6.4$ ³⁾

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

旋光性 : 水溶液(1→50)は旋光性を示さない。
pH : 本品の水溶液(1→20)のpHは3.5~4.5である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

保存条件 : 遮光して保存する。

3. 有効成分の確認試験法

局外規「塩酸オキシブチニン」の確認試験に準ずる。

- 1) フェロシアン化カリウム試液による沈殿反応
- 2) 硝酸銀試液による沈殿反応
- 3) 赤外吸収スペクトル測定法










4. 有効成分の定量法

局外規「塩酸オキシブチニン」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、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
オキシブチニン 塩酸塩錠 1mg 「サワイ」	フィルムコー ティング錠	 6.1	 約99	 3.2	白色～帯黄白色
オキシブチニン 塩酸塩錠 2mg 「サワイ」	割線入り フィルムコー ティング錠	 6.1	 約99	 3.2	白色～帯黄白色
オキシブチニン 塩酸塩錠 3mg 「サワイ」	割線入り フィルムコー ティング錠	 7.1	 約130	 3.3	白色～帯黄白色

2) 製剤の物性

●オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、30分：80%以上)

●オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、30分：80%以上)

●オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、30分：75%以上)

3) 識別コード

●オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「サワイ」：SW 770

●オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「サワイ」：SW 771

●オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「サワイ」：SW 772

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量

- オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg「サワイ」：1錠中にオキシブチニン塩酸塩 1 mgを含有する。
- オキシブチニン塩酸塩錠 2 mg「サワイ」：1錠中にオキシブチニン塩酸塩 2 mgを含有する。
- オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」：1錠中にオキシブチニン塩酸塩 3 mgを含有する。

2) 添加物

添加物として、カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、乳糖、ヒプロメロース、マクロゴール6000を含有する。

3) その他

該当資料なし

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

●オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg「サワイ」⁴⁾

1) PTP包装品の安定性(長期保存試験)

オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(ポリエチレン袋)したのものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	室温・遮光 3年
性状	白色～帯黄白色のフィルムコーティング錠であった	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.8	97.7

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40℃3ヵ月)	湿度 (25℃75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.3	6.0	4.3	5.5
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.6	100.2	99.5

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●オキシブチニン塩酸塩錠 2 mg「サワイ」⁵⁾

1) PTP包装品の安定性(長期保存試験)

オキシブチニン塩酸塩錠 2 mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(ポリエチレン袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	室温・遮光 3年
性状	白色～帯黄白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.4	99.8

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

オキシブチニン塩酸塩錠 2 mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C 75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.6	5.7	4.3	5.7
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.6	100.0	100.1

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」⁶⁾

1) PTP包装品の安定性(長期保存試験)

オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(ポリエチレン袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	室温・遮光 3年
性状	白色～帯黄白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.2	99.5

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C 75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)
性 状	白色の割線入り フィルムコーテ ィング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬 度 (k g)	5.3	7.0	5.1	7.4
崩 壊 試 験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定 量 試 験 ※	100.0	99.5	100.1	99.5

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

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
本剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「サワイ」⁷⁾

通知等	「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16年4月12日 薬食審査発第0412007号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)
試験回数	6 ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH4.0>

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。

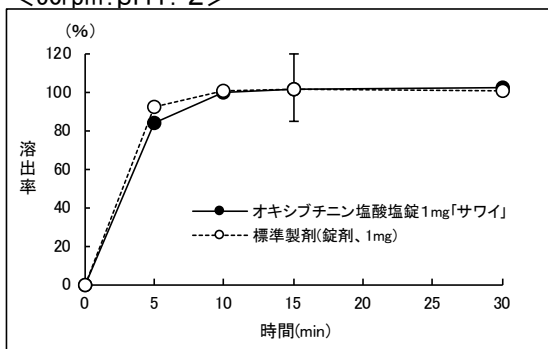
<50rpm : 水>

15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±15%の範囲にあった。

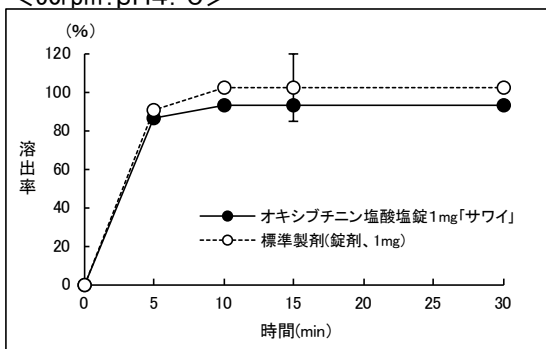
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

(溶出曲線)

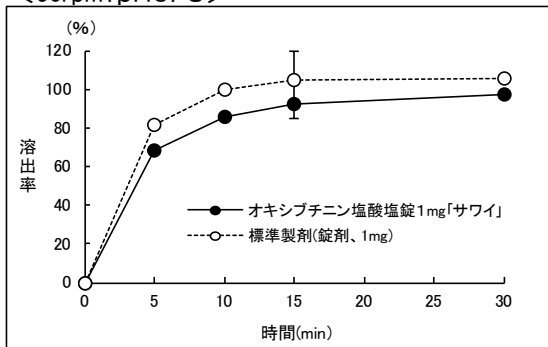
<50rpm: pH1. 2>



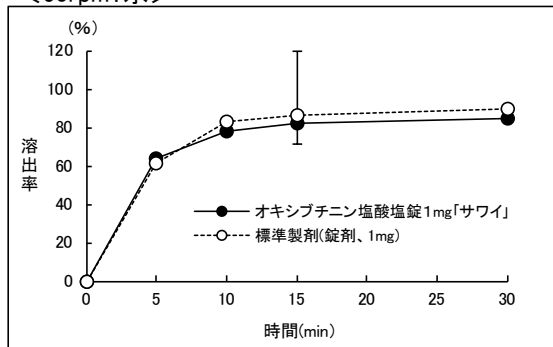
<50rpm: pH4. 0>



<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



([] : 判定基準の適合範囲)

●オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「サワイ」⁸⁾

通知等	「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16年4月12日 薬食審査発第0412007号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1. 2、4. 0、6. 8、水)
試験回数	6 ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH4. 0>

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。

<50rpm : 水>

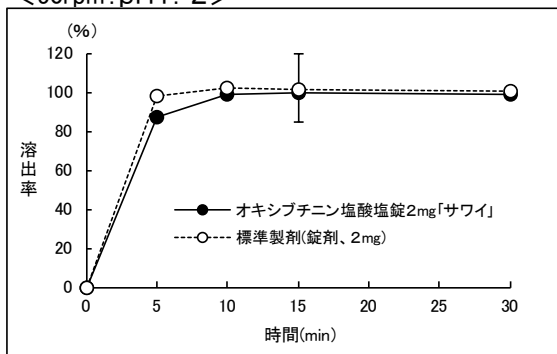
標準製剤の平均溶出率が60% (5分) 及び85% (15分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

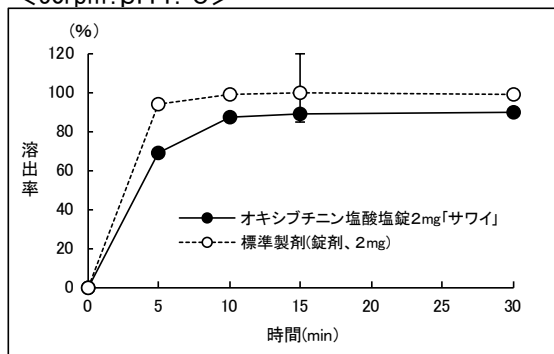
IV. 製剤に関する項目

(溶出曲線)

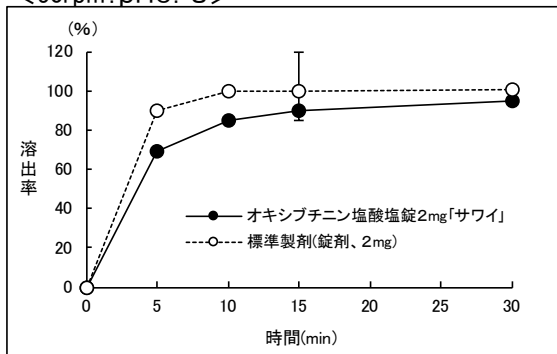
<50rpm: pH1. 2>



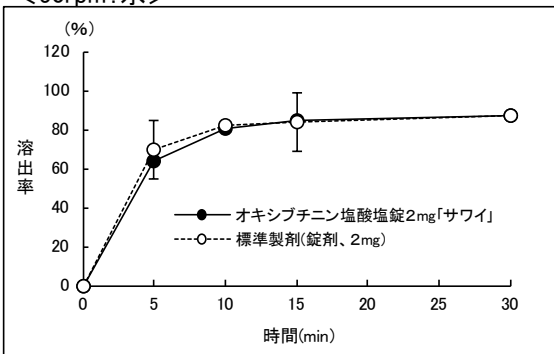
<50rpm: pH4. 0>



<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



([] : 判定基準の適合範囲)

●オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」⁹⁾

通知等	「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16年4月12日 薬食審査発第0412007号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1. 2、4. 0、6. 8、水)
試験回数	6 ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH4. 0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH6. 8>

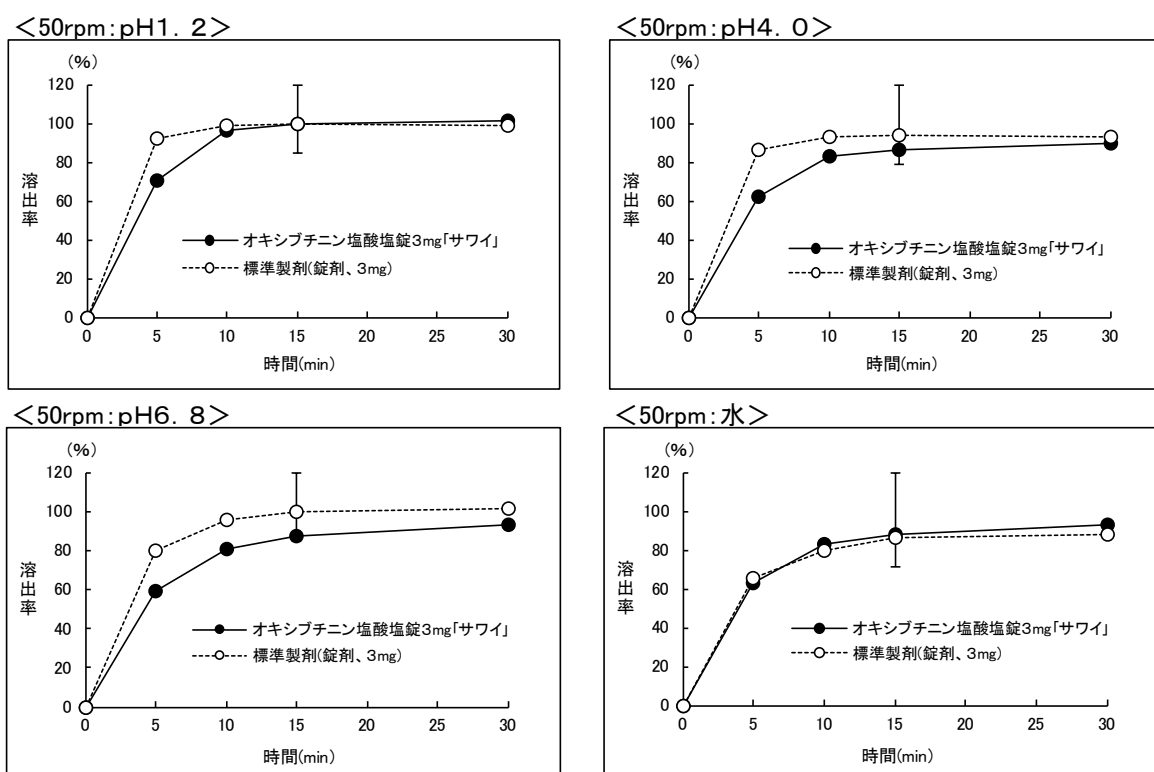
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

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した。

(溶出曲線)



(I : 判定基準の適合範囲)

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

- 1) ドラーゲンドルフ試液による沈殿反応
- 2) 紫外可視吸光度測定法
- 3) 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

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

IV. 製剤に関する項目

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報
 該当資料なし

14. その他
 該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果……………
 - 下記疾患又は状態における頻尿、尿意切迫感、尿失禁
神経因性膀胱
不安定膀胱(無抑制収縮を伴う過緊張性膀胱状態)

2. 用法及び用量……………
 - 通常成人1回オキシブチニン塩酸塩として2～3mgを1日3回経口投与する。
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
該当しない

 - 2) 臨床効果
該当資料なし

 - 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
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) 治療の使用
 - (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

V. 治療に関する項目

- (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……………

プロピペリン塩酸塩、酒石酸トルテロジン、コハク酸ソリフェナシン、イミダフェナシン等

2. 薬理作用……………

オキシブチニン塩酸塩の薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

カルシウム拮抗作用による膀胱平滑筋直接作用と、抗ムスカリン作用による向神経作用の選択的かつ相加的作用で、膀胱の過緊張状態を抑制する。¹⁾

2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

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

オキシブチニン塩酸塩錠剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

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

VII. -1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「サワイ」¹⁰⁾

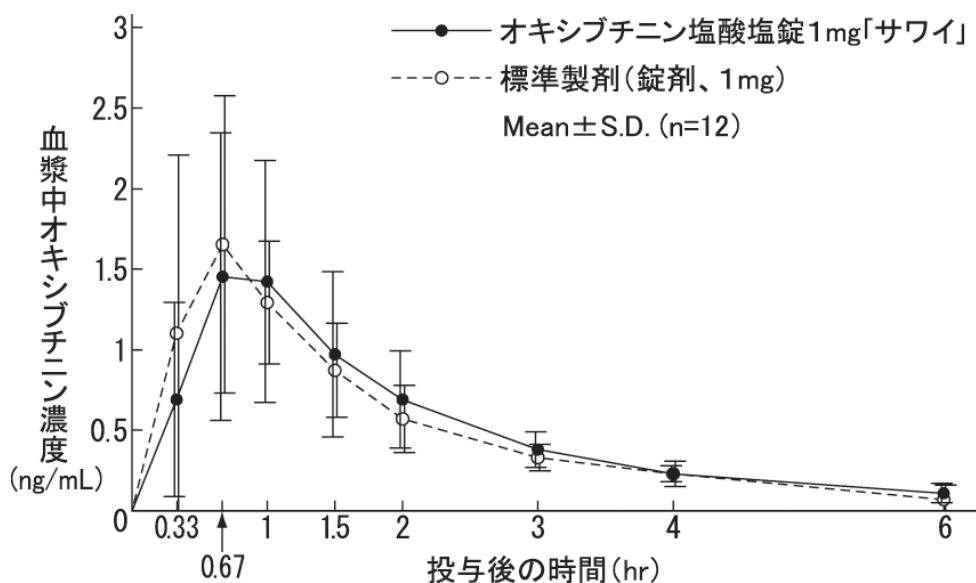
通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」： 昭和55年5月30日 薬審第718号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6 hr
休薬期間	7日間
測定方法	GC/MS法

オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ2錠(オキシブチニン塩酸塩として2mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オキシブチニン濃度を測定した。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。

各製剤2錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-6hr} (ng・hr/mL)
オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「サワイ」	1.69±0.76	0.8±0.3	1.8±0.5	3.14±1.09
標準製剤 (錠剤、1mg)	1.74±0.92	0.7±0.2	2.2±1.0	3.06±1.13

(Mean±S.D.)



●オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「サワイ」¹¹⁾

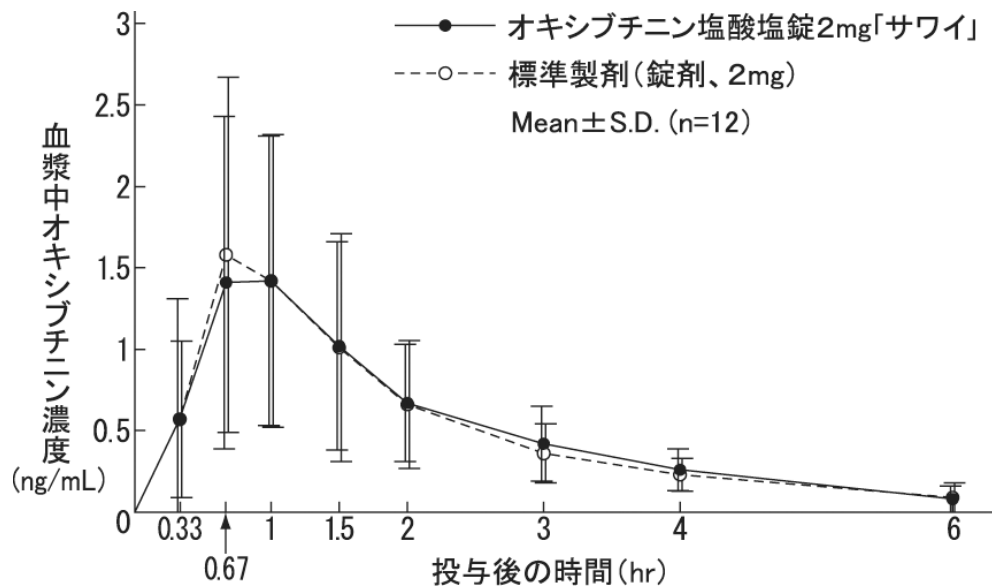
通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」： 昭和55年5月30日 薬審第718号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6 hr
休薬期間	7日間
測定方法	GC/MS法

オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(オキシブチニン塩酸塩として2mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オキシブチニン濃度を測定した。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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-6hr} (ng・hr/mL)
オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「サワイ」	1.72±1.06	0.8±0.2	1.5±0.4	3.15±1.74
標準製剤 (錠剤、2mg)	1.68±1.01	0.8±0.2	1.9±0.8	3.10±1.73

(Mean±S.D.)



●オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「サワイ」¹²⁾

通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」： 昭和55年5月30日 薬審第718号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6 hr
休薬期間	7日間
測定方法	GC/MS法

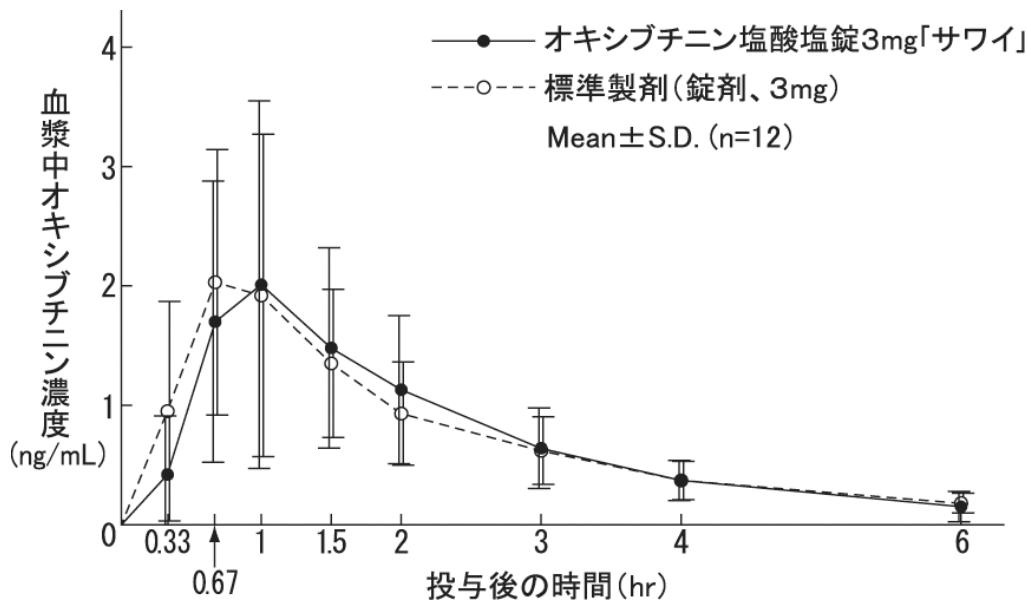
オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(オキシブチニン塩酸塩として3mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オキシブチニン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-6hr} (ng・hr/mL)
オキシブチニン塩酸塩錠3mg「サワイ」	2.31±1.42	0.9±0.3	1.7±0.4	4.45±2.36
標準製剤 (錠剤、3mg)	2.23±1.37	0.8±0.3	1.8±0.5	4.52±2.10

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびに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。

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

VII. -1. -3) 参照

4) 消失速度定数

- オキシブチニン塩酸塩錠 1 mg「サワイ」を健康成人男子に 2 錠(オキシブチニン塩酸塩として 2 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数¹⁰⁾
0.399±0.097hr⁻¹
- オキシブチニン塩酸塩錠 2 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(オキシブチニン塩酸塩として 2 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数¹¹⁾
0.475±0.107hr⁻¹
- オキシブチニン塩酸塩錠 3 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(オキシブチニン塩酸塩として 3 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数¹²⁾
0.428±0.093hr⁻¹

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

血漿蛋白結合率は高い。¹³⁾

3. 吸収.....
VII. -1. -3) 参照

4. 分布.....
1) 血液-脳関門通過性
＜参考＞VII. -4. -5) 参照

2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

3) 乳汁への移行性

＜参考＞動物実験で乳汁への移行が報告されている。

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

＜参考＞ラットに経口投与したところ、脳、肺、腎臓、肝臓で検出された。¹⁴⁾

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

オキシブチニンの代謝物には薬理活性のないフェニルシクロヘキシルグリコール酸やオキシブチニンと同程度の抗ムスカリン作用 (*in vitro*) があるデスエチルオキシブチニンがある。¹⁴⁾

2) 代謝に関与する酵素 (CYP450等) の分子種

主にCYP3A4で代謝される。¹⁴⁾

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

VII. -5. -1) 参照

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

オキシブチニン及びその代謝物は尿中及び糞中に排泄される。¹³⁾

2) 排泄率

該当資料なし

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)……………

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 明らかな下部尿路閉塞症状である排尿困難・尿閉等を有する患者〔排尿困難・尿閉等が更に悪化するおそれがある。〕
- 2) 閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕
- 3) 重篤な心疾患のある患者〔抗コリン作用により頻脈、心悸亢進を起こし心臓の仕事量が増加するおそれがある。〕
- 4) 麻痺性イレウスのある患者〔抗コリン作用により胃腸管の緊張、運動性は抑制され、胃腸管内容物の移動は遅延するため、麻痺性イレウスの患者では、胃腸管内容物の停滞により閉塞状態が強められるおそれがある。〕
- 5) 衰弱患者又は高齢者の腸アトニー、重症筋無力症の患者〔抗コリン作用により、症状を悪化させるおそれがある。〕
- 6) 授乳婦(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
- 7) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

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……………

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 排尿困難のおそれのある前立腺肥大患者〔前立腺肥大患者では、排尿障害を来していない場合でも、抗コリン剤の投与により排尿障害を起こすおそれがある。〕
- 2) 甲状腺機能亢進症の患者〔心拍数の増加等の症状の悪化を招くおそれがある。〕
- 3) うっ血性心不全の患者〔代償性交感神経系の亢進を更に亢進させるおそれがある。〕
- 4) 不整脈のある患者〔頻脈性の不整脈を有している患者では、副交感神経遮断作用により交感神経が優位にたち、心拍数の増加等が起こるおそれがある。〕
- 5) 潰瘍性大腸炎の患者〔中毒性巨大結腸があらわれるおそれがある。〕
- 6) 高温環境にある患者〔抗コリン作用により発汗抑制が起こり、外部の温度上昇に対する不耐性が生じて、急激に体温が上昇するおそれがある。〕
- 7) 重篤な肝又は腎疾患のある患者
- 8) パーキンソン症候群又は認知症・認知機能障害のある高齢者〔抗コリン作用により、症状を悪化させるおそれがある。〕

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

9) 開放隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

視調節障害、眠気を起こすことがあるので、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注意させること。

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

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
抗コリン剤 三環系抗うつ剤 フェノチアジン系薬剤 モノアミン酸化酵素阻害剤	口渇、便秘、排尿困難、目のかすみ等の副作用が増強されるおそれがある。	抗コリン作用が増強されるおそれがある。

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

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) 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) 痙攣性イレウス：痙攣性イレウスがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、著しい便秘、腹部膨満等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) 尿閉：尿閉があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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) その他の副作用

2) その他の副作用

	頻度不明
精神神経系	めまい、眠気、頭痛、しびれ、振戦、認知機能障害、抑うつ等
循環器	頻脈
消化器系	口渇、下痢、胃腸障害、胃部不快感、嘔気、食欲不振、胸やけ、便秘、腹部膨満感、口内炎、嘔吐、舌炎、嚥下障害等

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	頻度不明
過 敏 症	発疹、血管浮腫、蕁麻疹等
泌 尿 器 系	排尿困難、残尿等
肝 臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇
そ の 他	浮腫、倦怠感、口が苦い、発熱、熱感、目のかすみ、眼瞼結膜充血、汗が出なくなる、咽頭部痛、胸痛、皮膚乾燥、嗝声、眼乾燥、潮紅等

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

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

7) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

副作用	
2) その他の副作用	
	頻度不明
過 敏 症	発疹、血管浮腫、蕁麻疹等

9. 高齢者への投与

高齢者に投与する場合には少量から投与し、観察を十分行うとともに、過量投与にならぬよう注意すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、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が望ましい。動物実験で乳汁への移行が報告されているので授乳中の婦人には投与しないこと。

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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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

IX. 非臨床試験に関する項目

オキシブチニン塩酸塩の非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

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

LD₅₀ (mg/kg) ²⁾

動物種	性	経口	皮下注	腹腔内	静注
マウス	♀	1,200	2,225	280	77
ラット	♀	460	740	223	61

2) 反復投与毒性試験

1) 亜急性毒性試験

ラットへの最大無影響量(経口)：5 mg/kg/日(15週) 特記すべき異常所見なし²⁾

2) 慢性毒性試験

イヌへの最大無影響量(経口)：2 mg/kg/日以下(1年) 特記すべき異常所見なし²⁾

3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

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

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	劇薬

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)

くすりのしおり：有り

Ⅷ. -6. 及びⅧ. -14. 参照

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

●オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

●オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

●オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

7. 容器の材質……………
- PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]ポリエチレンフィルム
8. 同一成分・同効薬……………
- 同一成分：ポラキス錠1/錠2/錠3
同効薬：プロピペリン塩酸塩、酒石酸トルテロジン、コハク酸ソリフェナシン、イミダフェナシン等
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……………
- オキシブチニン塩酸塩錠1mg「サワイ」
製造販売承認年月日：2015年2月12日(販売名変更)、承認番号：22700AMX00177000
オリベート錠1(旧販売名)
製造販売承認年月日：1996年1月8日、承認番号：(08AM)0004
 - オキシブチニン塩酸塩錠2mg「サワイ」
製造販売承認年月日：2015年2月12日(販売名変更)、承認番号：22700AMX00178000
オリベート錠2(旧販売名)
製造販売承認年月日：1996年1月8日、承認番号：(08AM)0005
 - オキシブチニン塩酸塩錠3mg「サワイ」
製造販売承認年月日：2015年2月12日(販売名変更)、承認番号：22700AMX00179000
オリベート錠3(旧販売名)
製造販売承認年月日：1996年1月8日、承認番号：(08AM)0011
11. 薬価基準収載年月日……………
- オキシブチニン塩酸塩錠1mg「サワイ」：2015年6月19日(販売名変更)
オリベート錠1(旧販売名)：1996年7月5日
 - オキシブチニン塩酸塩錠2mg「サワイ」：2015年6月19日(販売名変更)
オリベート錠2(旧販売名)：1996年1月8日
 - オキシブチニン塩酸塩錠3mg「サワイ」：2015年6月19日(販売名変更)
オリベート錠3(旧販売名)：1996年1月8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

X. 管理的事項に関する項目

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

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。

16. 各種コード

品名	HOT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
オキシブチニン塩酸塩 錠 1 mg「サワイ」	105679201	2590005F3017	620567901
オキシブチニン塩酸塩 錠 2 mg「サワイ」	113720029	2590005F1014	621372029
オキシブチニン塩酸塩 錠 3 mg「サワイ」	105677805	2590005F2010	620567705

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。

XI . 文献

1. 引用文献
- 1) JAPAN DRUGS編集委員会編, JAPAN DRUGS 日本医薬品総覧, 2008～2009年版, メディカルレビュー社, 2008, p. 453-454.
 - 2) 薬事研究会編, 規制医薬品事典, 第5版, じほう, 1992, p. 92-93.
 - 3) 日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集, No. 23, 薬事日報社, 2005, p. 155.
 - 4)～6) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
 - 7)～9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
 - 10)～12) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]
 - 13) Martindale : The Complete Drug Reference 35th edition, 2007, p. 1985-1986.
 - 14) American Society of Health-System Pharmacists, AHFS Drug Information, 2011, p. 3603-3605.
2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

