

# 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2018(2019年更新版)に準拠して作成

## プロトンポンプ・インヒビター

# エソメプラゾールカプセル 10mg「サワイ」 エソメプラゾールカプセル 20mg「サワイ」

## ESOMEPRAZOLE Capsules [SAWAI]

### エソメプラゾールマグネシウムカプセル

剤形	硬カプセル剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注)注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	カプセル10mg：1カプセル中エソメプラゾールとして10mg含有 カプセル20mg：1カプセル中エソメプラゾールとして20mg含有
一般名	和名：エソメプラゾールマグネシウム水和物(JAN) 洋名：Esomeprazole Magnesium Hydrate(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2022年8月15日 薬価基準収載年月日：2022年12月9日 販売開始年月日：2023年1月27日
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：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2022年11月改訂の電子添文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。

## 医薬品インタビューフォーム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)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り、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

### 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	10. 特定の背景を有する患者	32
1. 開発の経緯	1	11. その他	33
2. 製品の治療学的特性	1		
3. 製品の製剤学的特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	34
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	1. 警告内容とその理由	34
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	2. 禁忌内容とその理由	34
6. RMPの概要	3	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	34
		4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	34
II. 名称に関する項目	4	5. 重要な基本的注意とその理由	34
1. 販売名	4	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	34
2. 一般名	4	7. 相互作用	35
3. 構造式又は示性式	4	8. 副作用	37
4. 分子式及び分子量	4	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	39
5. 化学名(命名法)又は本質	5	10. 過量投与	39
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	5	11. 適用上の注意	39
		12. その他の注意	39
III. 有効成分に関する項目	6		
1. 物理化学的性質	6	IX. 非臨床試験に関する項目	40
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6	1. 薬理試験	40
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6	2. 毒性試験	40
IV. 製剤に関する項目	7	X. 管理的事項に関する項目	41
1. 剤形	7	1. 規制区分	41
2. 製剤の組成	8	2. 有効期間	41
3. 添付溶解液の組成及び容量	8	3. 包装状態での貯法	41
4. 力価	8	4. 取扱い上の注意	41
5. 混入する可能性のある夾雑物	8	5. 患者向け資材	41
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	6. 同一成分・同効薬	41
7. 調製法及び溶解後の安定性	13	7. 国際誕生年月日	41
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	13	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	41
9. 溶出性	13	9. 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	42
10. 容器・包装	18	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	42
11. 別途提供される資材類	18	11. 再審査期間	42
12. その他	19	12. 投薬期間制限に関する情報	42
		13. 各種コード	42
V. 治療に関する項目	20	14. 保険給付上の注意	42
1. 効能又は効果	20		
2. 効能又は効果に関連する注意	20	XI. 文献	43
3. 用法及び用量	21	1. 引用文献	43
4. 用法及び用量に関連する注意	22	2. その他の参考文献	44
5. 臨床成績	23		
		XII. 参考資料	45
VI. 薬効薬理に関する項目	26	1. 主な外国での発売状況	45
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	26	2. 海外における臨床支援情報	45
2. 薬理作用	26		
		XIII. 備考	46
VII. 薬物動態に関する項目	27	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	46
1. 血中濃度の推移	27	2. その他の関連資料	50
2. 薬物速度論的パラメータ	30		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	31		
4. 吸収	31		
5. 分布	31		
6. 代謝	31		
7. 排泄	32		
8. トランスポーターに関する情報	32		
9. 透析等による除去率	32		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

エソメプラゾールカプセル10mg/カプセル20mg「サワイ」は、エソメプラゾールマグネシウム水和物を含有するプロトンポンプ・インヒビターである。

胃壁細胞の細胞膜上に存在する受容体へ各種酸分泌刺激物質が結合することにより、胃壁細胞内において一連の胃酸分泌反応がおきる。この反応の最終過程では、胃壁細胞内からH<sup>+</sup>を放出し、代わりにK<sup>+</sup>を取り込むプロトンポンプと呼ばれる酵素が働いている。エソメプラゾールは、このプロトンポンプの働きを阻害することによって、胃酸分泌を抑制する。<sup>1)</sup>

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2022年8月
上市	2023年1月

### 2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤は、プロトンポンプの働きを阻害することによって、胃酸分泌を抑制する<sup>1)</sup>。
- 2) 本剤の有効成分であるエソメプラゾールはラセミ体であるオメプラゾールの一方の光学異性体(S体)である(VI. -2. 参照)。
- 3) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、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)、間質性肺炎、間質性腎炎、急性腎障害、横紋筋融解症、低ナトリウム血症、錯乱状態、視力障害が報告されている(VIII. -8. 参照)。

### 3. 製品の製剤学的特性

- 1) カプセルに成分名、含量を印字している(IV. -1. 参照)。
- 2) カプセル内容物は腸溶性顆粒である(IV. -1. 参照)。
- 3) PTPシートに「胃酸を抑える薬」と表示している(裏面)。

I. 概要に関する項目

4. 適正使用に関して周知すべき特性 .....

適正使用に関する資材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	有：I. -6. 参照
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 .....

1) 承認条件

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

## 6. RMPの概要

## 医薬品リスク管理計画書(RMP)の概要

1. 1. 安全性検討事項		
【重要な特定されたリスク】	【重要な潜在的リスク】	【重要な不足情報】
汎血球減少症、無顆粒球症、血小板減少	溶血性貧血	なし
ショック、アナフィラキシー	視力障害	
肝障害(劇症肝炎、肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全)	急性腎障害	
	骨折	
中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群)及び多形紅斑を含む重症皮膚障害	クロストリジウム・デオフィシルによる胃腸感染	
間質性腎炎	肺炎	
間質性肺炎		
横紋筋融解症		
低ナトリウム血症		
錯乱状態		
1. 2. 有効性に関する検討事項		
使用実態下における小児での有効性		
↓ 上記に基づく安全性監視のための活動		↓ 上記に基づくリスク最小化のための活動
2. 医薬品安全性監視計画の概要	4. リスク最小化計画の概要	
通常の医薬品安全性監視活動	通常のリスク最小化活動	
副作用、文献・学会情報及び外国措置報告等の収集・確認・分析に基づく安全対策の検討(及び実行)	電子添文及び患者向医薬品ガイドによる情報提供・注意喚起	
追加の医薬品安全性監視活動	追加のリスク最小化活動	
なし	なし	
3. 有効性に関する調査・試験の計画の概要		
なし		

(2022年12月9日時点)

最新の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ「RMP提出品目一覧」

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/items-information/rmp/0001.html>

にてご確認ください。

## 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

エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」

エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」

##### 2) 洋名

ESOMEPRAZOLE Capsules [SAWAI]

##### 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)

エソメプラゾールマグネシウム水和物(JAN)

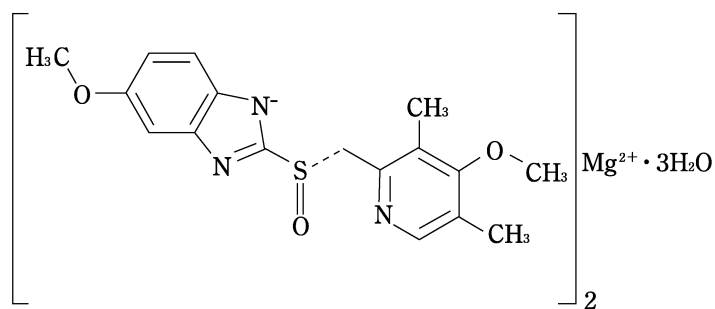
##### 2) 洋名(命名法)

Esomeprazole Magnesium Hydrate(JAN)、esomeprazole(INN)

##### 3) ステム(stem)

-prazole : benzimidazole誘導体(抗潰瘍剤)

#### 3. 構造式又は示性式 .....



#### 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 :  $\text{C}_{34}\text{H}_{36}\text{N}_6\text{O}_6\text{S}_2\text{Mg} \cdot 3\text{H}_2\text{O}$

分子量 : 767.17



5. 化学名(命名法)又は本質.....  
Bis{5-methoxy-2-[(S)-(4-methoxy-3,5-dimethylpyridin-2-yl)methanesulfinyl]-  
1*H*-benzimidazol-1-yl} monomagnesium trihydrate
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....  
特になし

---

### 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～ごく薄い灰色又はごく薄い黄色の粉末である。

2) 溶解性

メタノールにやや溶けやすく、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：約172～176℃

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

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性……………

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法……………

<確認試験法>

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法

<定量法>

液体クロマトグラフィー

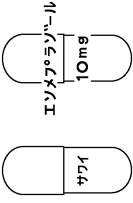
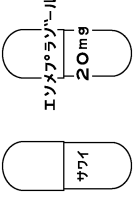
## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

## 1) 剤形の区別

硬カプセル剤

## 2) 製剤の外観及び性状

品名	外形 全長(mm)・重量(mg)・カプセル号数			性状	
	エソメプラゾール カプセル10mg 「サワイ」		11.3		約69
エソメプラゾール カプセル20mg 「サワイ」		11.3	約111	5	頭部：濃い青色 胴部：ごくうすい黄赤色 内容物：白色～ごくうすい黄色の腸溶性顆粒である。褐色の腸溶性顆粒を認めることがある。

## 3) 識別コード

## ●エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」

表示部位：カプセル

表示内容：エソメプラゾール 10mg サワイ

## ●エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」

表示部位：カプセル

表示内容：エソメプラゾール 20mg サワイ

## 4) 製剤の物性

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：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## 5) その他

該当しない

IV. 製剤に関する項目

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

品名		エソメプラゾールカプセル 10mg「サワイ」	エソメプラゾールカプセル 20mg「サワイ」
有効成分 [1カプセル中]		エソメプラゾールマグネシウム水和物 (エソメプラゾールとして)	
		11.1mg (10mg)	22.3mg (20mg)
添加剤	カプセル 内容物	クエン酸トリエチル、ステアリン酸Mg、タルク、トウモロコシデンプン、 二酸化ケイ素、白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、 ポリソルベート80、メタクリル酸コポリマーLD、モノステアリン酸グリ セリン、ラウリル硫酸Na	
	カプセル 本体	塩化K、カラギーナン、酸化チタン、三二酸化鉄、ジメチルポリシロキサ ン、ソルビタン脂肪酸エステル、ヒプロメロース	
		酸化鉄	青色1号、赤色102号

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

●エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」

1) 長期保存試験<sup>2)</sup>

目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を確認するため、長期保存試験を実施する。

方法

「安定性試験実施方法のガイドライン」(平成3年2月15日 薬審第43号)及び「安定性試験ガイドラインの改定について」(平成15年6月3日 医薬審発第0603001号)に基づいて、本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

## 試験条件及び検体

保存条件	25±2℃/60±5%RH	
保存期間	36ヵ月	
試験回数	3回/ロット	
保存形態	PTP包装	PTP(ポリクロロトリフルオロエチレン/アルミニウム箔)/紙箱
	バラ包装	バラ(白色ポリエチレン瓶/白色ポリプロピレンキャップ/乾燥剤)/紙箱
ロット番号	PTP包装	①714K1SD407、②714K1SD408、③714K1SD409
	バラ包装	④714K1SD407、⑤714K1SD408、⑥714K1SD409

## 結果

PTP包装		36ヵ月後		
ロット番号		①	②	③
試験項目				
性状		キャップ部灰紫色、ボディ部うすい黄色の硬カプセル剤で、内容物は帯微赤黄色の腸溶性顆粒		
確認試験		適合	適合	適合
純度試験(類縁物質)		適合	適合	適合
含量均一性試験		適合	適合	適合
溶出試験		適合	適合	適合
定量試験		適合	適合	適合

バラ包装		36ヵ月後		
ロット番号		④	⑤	⑥
試験項目				
性状		キャップ部灰紫色、ボディ部うすい黄色の硬カプセル剤で、内容物はごくうすい黄色の腸溶性顆粒		
確認試験		適合	適合	適合
純度試験(類縁物質)		適合	適合	適合
含量均一性試験		適合	適合	適合
溶出試験		適合	適合	適合
定量試験		適合	適合	適合

※試験実施時の規格による判定(現在の規格では未実施)

## 結論

長期保存試験(36ヵ月)の結果、本製剤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。

2)無包装下の安定性試験<sup>3)</sup>

## 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

IV. 製剤に関する項目

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件		
714K1SD407	温度	40℃、遮光気密容器	
	湿度	25℃/75%RH、遮光開放	
	室温	25℃/60%RH、遮光開放	
	光	25℃/60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx)、開放	

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・純度試験(類縁物質)・溶出試験(第1液、第2液)・定量試験	1回

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	純度試験 (類縁物質)	溶出試験		定量試験※
			第1液	第2液	
イニシャル	(a)	適合	適合	適合	100.0
温度(13週)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 98.7
湿度	5週	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 98.8
	13週	変化あり (規格内) (b)	変化なし	変化なし	変化なし 98.7
室温(13週)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.1
光(120万lx・hr)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 97.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：キャップ部灰紫色、ボディ部うすい黄色の硬カプセル剤で、内容物はごくうすい黄色の腸溶性顆粒

(b)：キャップ部灰紫色、ボディ部うすい黄色の硬カプセル剤で、内容物は帯微赤黄色の腸溶性顆粒

A) 評価分類基準

【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり(規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合

【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 参考文献

(社)日本病院薬剤師会 “錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申), 平成11年8月20日” 西岡豊他. 錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報. 改訂6版, 医薬ジャーナル社, 2009, p441-444

## ●エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」

1) 長期保存試験<sup>4)</sup>

## 目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を確認するため、長期保存試験を実施する。

## 方法

「安定性試験実施方法のガイドライン」(平成3年2月15日 薬審第43号)及び「安定性試験ガイドラインの改定について」(平成15年6月3日 医薬審発第0603001号)に基づいて、本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

## 試験条件及び検体

保存条件	25±2℃/60±5%RH	
保存期間	36ヵ月	
試験回数	3回/ロット	
保存形態	PTP包装	PTP(ポリクロロトリフルオロエチレン/アルミニウム箔)/紙箱
	バラ包装	バラ(白色ポリエチレン瓶/白色ポリプロピレンキャップ/乾燥剤)/紙箱
ロット番号	PTP包装	①714K2SD407、②714K2SD408、③714K2SD409
	バラ包装	④714K2SD407、⑤714K2SD408、⑥714K2SD409

## 結果

PTP包装		36ヵ月後		
ロット番号		①	②	③
試験項目				
性状		キャップ部濃い青色、ボディ部ごくうすい黄赤色の硬カプセル剤で、内容物は帯微赤黄色の腸溶性顆粒		
確認試験		適合	適合	適合
純度試験(類縁物質)		適合	適合	適合
含量均一性試験		適合	適合	適合
溶出試験		適合	適合	適合
定量試験		適合	適合	適合

バラ包装		36ヵ月後		
ロット番号		④	⑤	⑥
試験項目				
性状		キャップ部濃い青色、ボディ部ごくうすい黄赤色の硬カプセル剤で、内容物はごくうすい黄色の腸溶性顆粒		
確認試験		適合	適合	適合
純度試験(類縁物質)		適合	適合	適合
含量均一性試験		適合	適合	適合
溶出試験		適合	適合	適合
定量試験		適合	適合	適合

## 結論

長期保存試験(36ヵ月)の結果、本製剤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。

IV. 製剤に関する項目

2) 無包装下の安定性試験<sup>5)</sup>

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
714K2SD407	温度	40℃、遮光気密容器
	湿度	25℃/75%RH、遮光開放
	室温	25℃/60%RH、遮光開放
	光	25℃/60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx)、開放

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・純度試験(類縁物質)・溶出試験(第1液、第2液)・定量試験	1回

結果

試験項目 保存条件・期間		性状	純度試験 (類縁物質)	溶出試験		定量試験※
				第1液	第2液	
イニシャル		(a)	適合	適合	適合	100.0
温度(13週)		変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.0
湿度	5週	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.1
	13週	変化あり (規格内) (b)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.4
室温(13週)		変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.7
光(120万lx・hr)		変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：キャップ部濃い青色、ボディ部ごくうすい黄赤色の硬カプセル剤で、内容物はごくうすい黄色の腸溶性顆粒

(b)：キャップ部濃い青色、ボディ部ごくうすい黄赤色の硬カプセル剤で、内容物は帯微赤黄色の腸溶性顆粒



## A) 評価分類基準

## 【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり(規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合

## 【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 参考文献

(社)日本病院薬剤師会 “錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申), 平成11年8月20日” 西岡豊他. 錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報. 改訂6版, 医薬ジャーナル社, 2009, p441-444

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

## 8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

## 9. 溶出性

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」<sup>6)</sup>

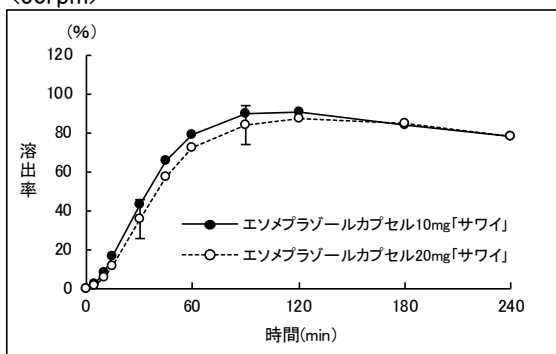
目的	「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。 なお、エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」は、エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」と同一処方、同一製造方法であり1カプセル中の内容量が異なる製剤(容れ目違い製剤)である。 本試験は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)のQ&Aを参考に、両製剤に製剤間差がない事を確認する方法として設定された。
----	---

IV. 製剤に関する項目

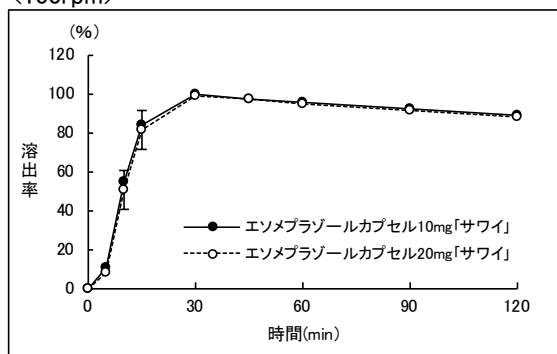
溶出試験(1)

方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
条件	回転数・試験液	50rpm、100rpm ※0.1mol/L塩酸試液300mLで2時間攪拌した後、0.086mol/Lリン酸水素二ナトリウム溶液700mLを加えて試験を実施する
	試験液量	1000mL 0.086mol/Lリン酸水素二ナトリウム溶液/0.1mol/L塩酸試液混液(7:3)
	液温度	37±0.5℃
	試験数	12ベッセル
検体	試験製剤	エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」(ロット番号:714K1SD407)
	標準製剤	エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」(ロット番号:714K2SD407)
結果	<p>&lt;50rpm&gt; 標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(90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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(90分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものなかった。</p> <p>&lt;100rpm&gt; 標準製剤の平均溶出率が60%(10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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものなかった。</p>	
	溶出試験(1)の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。	

<50rpm>



<100rpm>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

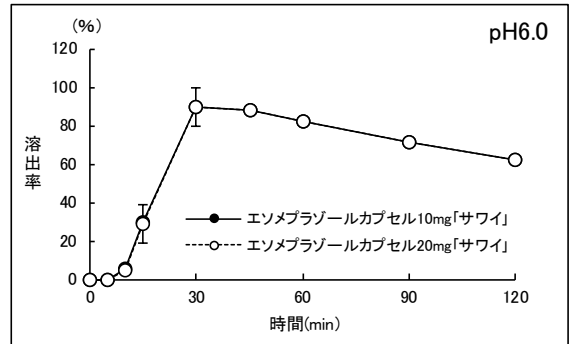
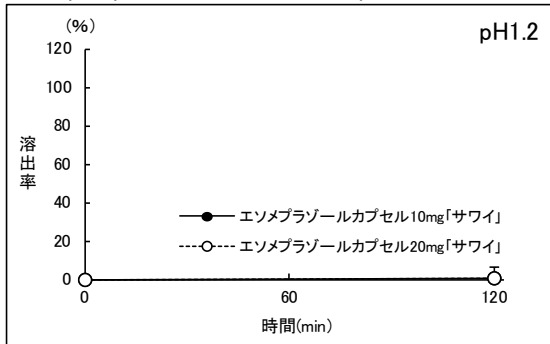
## 溶出試験(2)

方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 回転バスケット法	
条件	回転数・試験液	100rpm : pH1.2、pH6.0、pH6.8、低イオン強度のpH6.0 ※pH1.2で2時間攪拌後、ベッセル内をpH6.0、pH6.8、低イオン強度のpH6.0に入れ替えて攪拌する
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5℃
	試験数	12ベッセル
検体	試験製剤	エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」(ロット番号：714K1SD407)
	標準製剤	エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」(ロット番号：714K2SD407)
結果	<p>&lt;100rpm : pH1.2で2時間攪拌後、pH6.0&gt;</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・100rpm : pH1.2</li> </ul> <p>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±6%の範囲にあった。</p> <p>最終比較時点(120分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・100rpm : pH6.0</li> </ul> <p>標準製剤の平均溶出率が60%(15分)及び85%(30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±10%の範囲にあった。</p> <p>最終比較時点(30分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>&lt;100rpm : pH1.2で2時間攪拌後、pH6.8&gt;</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・100rpm : pH1.2</li> </ul> <p>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±6%の範囲にあった。</p> <p>最終比較時点(120分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・100rpm : pH6.8</li> </ul> <p>標準製剤の平均溶出率が60%(10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±10%の範囲にあった。</p> <p>最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p>	

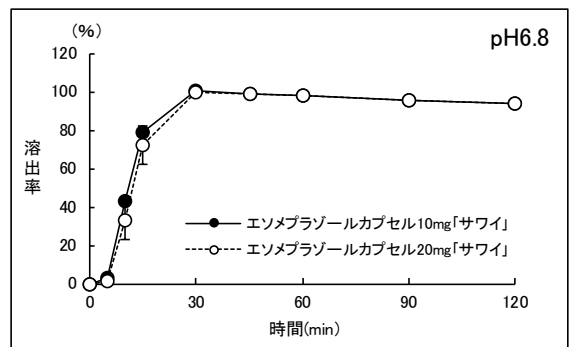
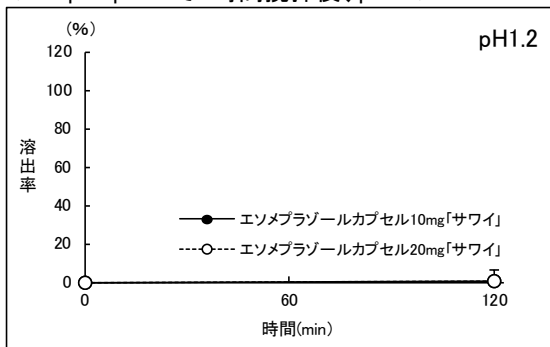
IV. 製剤に関する項目

<p>結果</p>	<p>&lt;100rpm : pH1.2で2時間攪拌後、低イオン強度のpH6.0&gt;          ・ 100rpm : pH1.2          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±6%の範囲にあった。          最終比較時点(120分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。          ・ 100rpm : 低イオン強度のpH6.0          標準製剤が規定された試験時間(90分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(45分)及び規定された試験時間(90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±8%の範囲にあった。          最終比較時点(90分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがなかった。          溶出試験(2)の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p>
<p>結論</p>	<p>以上の結果より、エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」は、容れ目違いであるエソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」と溶出挙動が同等であり、製剤間に差がないことが確認された。</p>

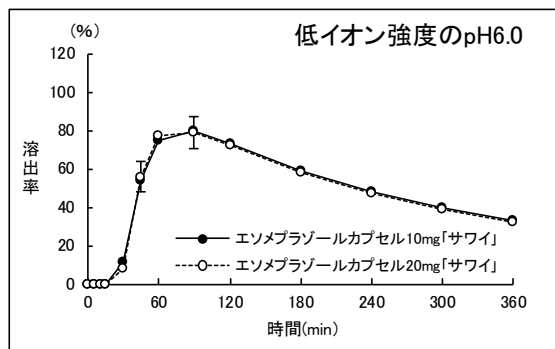
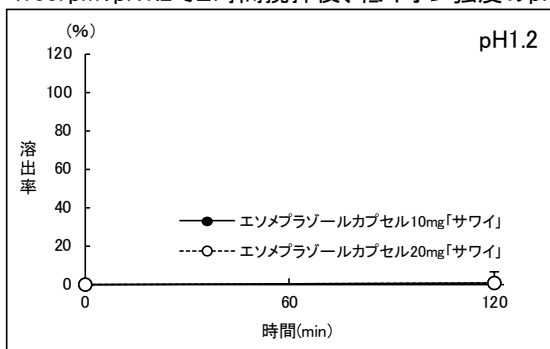
<100rpm : pH1.2で2時間攪拌後、pH6.0>



<100rpm : pH1.2で2時間攪拌後、pH6.8>



<100rpm : pH1.2で2時間攪拌後、低イオン強度のpH6.0>



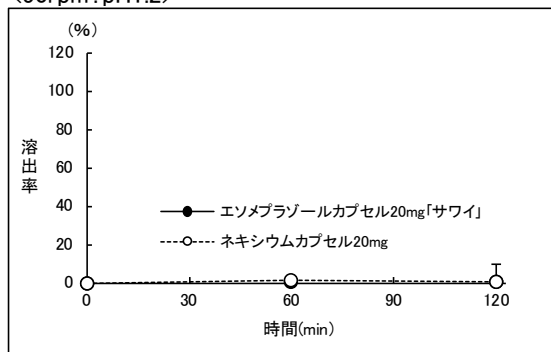
( I : 判定基準の適合範囲)

●エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」<sup>7)</sup>

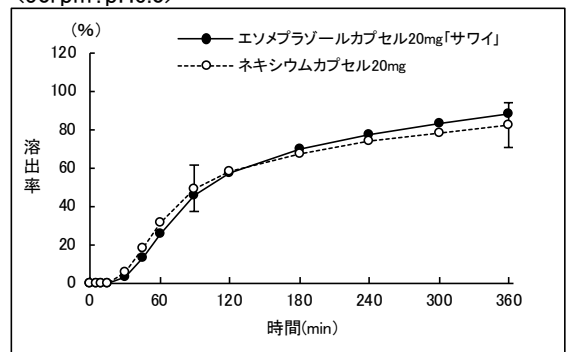
目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性の判定を行うため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。	
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
条件	回転数・試験液	50rpm : pH1.2、50rpm : pH6.0、50rpm : pH6.8、100rpm : pH6.0
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5℃
	試験数	12ベッセル
検体	試験製剤	エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」(ロット番号 : 714K2SD407)
	標準製剤	ネキシウムカプセル20mg(ロット番号 : 73380)
結果	<p>&lt;50rpm : pH1.2&gt; 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。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.0&gt; 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(90分)及び規定された試験時間(360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±12%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt; 標準製剤の平均溶出率が40%(60分)及び85%(120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。</p> <p>&lt;100rpm : pH6.0&gt; 標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(60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。</p>	
結論	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した。	

IV. 製剤に関する項目

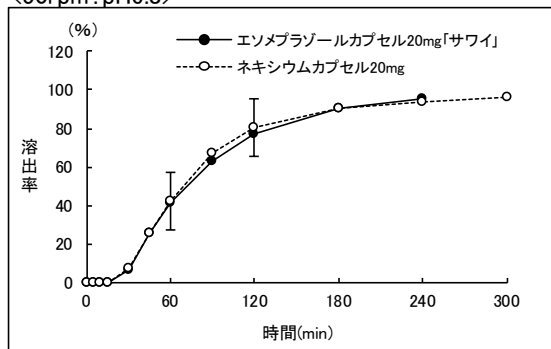
<50rpm : pH1.2>



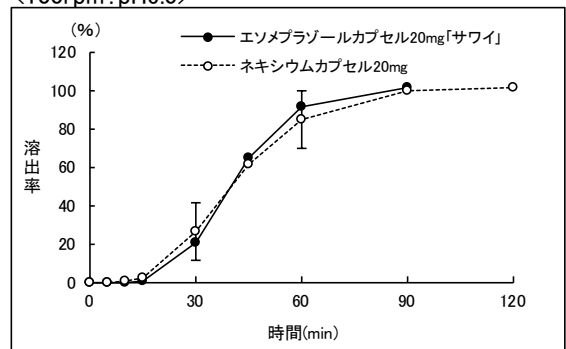
<50rpm : pH6.0>



<50rpm : pH6.8>



<100rpm : pH6.0>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

10. 容器・包装

1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

<エソメプラゾールカプセル10mg/カプセル20mg「サワイ」>

PTP : 100カプセル(10Cap×10)、500カプセル(10Cap×50)

バラ[乾燥剤入り] : 200カプセル

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP : [PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレン、アルミニウム箔

バラ : [本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. 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

#### 4. 効能又は効果

##### <カプセル10mg>

○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、非ステロイド性抗炎症薬投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制、低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制

○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

##### <カプセル20mg>

○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、非ステロイド性抗炎症薬投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制、低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制

○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

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

##### <非ステロイド性抗炎症薬投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制>

5.1 関節リウマチ、変形性関節症等における疼痛管理等のために非ステロイド性抗炎症薬を長期継続投与している患者を投与対象とし、投与開始に際しては、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の既往を確認すること。

##### <低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制>

5.2 血栓・塞栓の形成抑制のために低用量のアスピリンを継続投与している患者を投与対象とし、投与開始に際しては、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の既往を確認すること。

##### <ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助>

5.3 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。

5.4 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。

5.5 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。

5.6 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。



## 3. 用法及び用量

## 1) 用法及び用量の解説

## 6. 用法及び用量

<カプセル10mg>

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

**成人**

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。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。

**小児**

通常、1歳以上の幼児及び小児にはエソメプラゾールとして、体重20kg未満では1回10mgを、体重20kg以上では症状に応じて1回10～20mgを1日1回経口投与する。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**

**成人**

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。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回10～20mgを1日1回経口投与する。

**小児**

通常、1歳以上の幼児及び小児にはエソメプラゾールとして、体重20kg未満では1回10mgを、体重20kg以上では症状に応じて1回10～20mgを1日1回経口投与する。なお、通常、8週間までの投与とする。

**非びらん性胃食道逆流症**

**成人**

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回10mgを1日1回経口投与する。なお、通常、4週間までの投与とする。

**小児**

通常、1歳以上の幼児及び小児にはエソメプラゾールとして、1回10mgを1日1回経口投与する。なお、通常、4週間までの投与とする。

**非ステロイド性抗炎症薬投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制**

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。

**低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制**

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。

**ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助**

通常、成人にはエソ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、成人にはエソ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。

## V. 治療に関する項目

### <カプセル20mg>

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

##### 成人

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。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。

##### 小児

通常、体重20kg以上の幼児及び小児にはエソメプラゾールとして、症状に応じて1回10～20mgを1日1回経口投与する。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

##### 成人

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。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回10～20mgを1日1回経口投与する。

##### 小児

通常、体重20kg以上の幼児及び小児にはエソメプラゾールとして、症状に応じて1回10～20mgを1日1回経口投与する。なお、通常、8週間までの投与とする。

#### 非ステロイド性抗炎症薬投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。

#### 低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制

通常、成人にはエソメプラゾールとして1回20mgを1日1回経口投与する。

#### ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助

通常、成人にはエソ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、成人にはエソ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。

## 2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

## 4. 用法及び用量に関連する注意

### 7. 用法及び用量に関連する注意

#### <逆流性食道炎>

7.1 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。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。

#### <非びらん性胃食道逆流症>

7.2 投与開始2週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. 臨床成績

エソメプラゾール製剤の臨床試験成績が以下のとおり報告されている。

## 1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

## 2) 臨床薬理試験

該当資料なし

## 3) 用量反応探索試験

該当資料なし

## 4) 検証的試験

## (1) 有効性検証試験

## &lt;逆流性食道炎&gt;

## 17.1.1 国内第Ⅲ相試験(成人)

逆流性食道炎を対象とした二重盲検比較試験では、オメプラゾール20mg、エソメプラゾール20mg又は40mgが1日1回最大8週間投与され、投与8週時のそれぞれの治癒率[95%信頼区間]は87.4%(166/190例)[81.9%、91.4%]、87.3%(165/189例)[81.8%、91.3%]及び90.0%(171/190例)[84.9%、93.5%]であり、オメプラゾール20mgに対するエソメプラゾール20mg及び40mgの非劣性が認められている。

副作用発現頻度は、エソメプラゾール20mg群で7.9%(15/189例)であった。主な副作用は下痢2例(1.1%)、アラニン・アミノトランスフェラーゼ増加2例(1.1%)及び血中クレアチンホスホキナーゼ増加2例(1.1%)であった<sup>8)</sup>。

## 17.1.2 国内第Ⅲ相試験(成人)

逆流性食道炎の治癒患者を対象とした二重盲検比較試験において、オメプラゾール10mgと比較したエソメプラゾール10mg及び20mgの1日1回24週間投与時における逆流性食道炎の再発抑制効果が認められている。

	エソメプラゾール 20mg(188例)	エソメプラゾール 10mg(188例)	オメプラゾール 10mg(187例)
再発例数	14例	22例	31例
投与24週後の 非再発率 <sup>a)</sup> [95%信頼区間]	92.0% [88.0~96.0%]	87.5% [82.7~92.4%]	82.7% [77.2~88.3%]
ハザード比 [95%信頼区間]	0.62[0.32~1.21] (エソメプラゾール20mg群vsエソメプラゾール10mg群) 0.43[0.23~0.80] (エソメプラゾール20mg群vsオメプラゾール10mg群)		
p値 <sup>b)</sup>	p=0.158 (エソメプラゾール20mg群vsエソメプラゾール10mg群) p=0.007 (エソメプラゾール20mg群vsオメプラゾール10mg群)		

a) Kaplan-Meier法による推定

b) Log-rank検定、有意水準 両側5%、Hochbergの方法による検定の多重性の調整

副作用発現頻度は、エソメプラゾール20mg群で9.0%(17/188例)及びエソメプラゾール10mg群で8.0%(15/188例)であった。主な副作用はエソメプラゾール20mg群で血中クレアチンホスホキナーゼ増加2例(1.1%)であり、エソメプラゾール10mg群で下痢2例(1.1%)及び血中クレアチンホスホキナーゼ増加2例(1.1%)であった<sup>9,10)</sup>。

V. 治療に関する項目

＜非ステロイド性抗炎症薬(NSAID)投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制＞

17.1.3 国内第Ⅲ相試験(成人)

消化性潰瘍の既往を有するNSAID継続服用患者を対象とした二重盲検比較試験においてエソメプラゾール20mgの1日1回24週間投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制効果が認められている。

	エソメプラゾール20mg(173例)	プラセボ(168例)
発症例数	6例	56例
投与24週後の 非発症率 <sup>a)</sup> [95%信頼区間]	96.0% [92.8~99.1%]	64.4% [56.8~71.9%]
ハザード比 [95%信頼区間]	0.09[0.04~0.20]	
p値 <sup>b)</sup>	p<0.001	

a) Kaplan-Meier法による推定 b) Log-rank検定、有意水準 両側5%

副作用発現頻度は、エソメプラゾール20mg群で13.9%(24/173例)であった。主な副作用は上腹部痛2例(1.2%)、下痢2例(1.2%)、便秘2例(1.2%)、嘔吐2例(1.2%)及び肝機能異常2例(1.2%)であった<sup>11)</sup>。

＜低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制＞

17.1.5 アジア共同第Ⅲ相試験(成人)

消化性潰瘍の既往を有する低用量アスピリン(81~324mg)継続服用患者(日本人患者含む)を対象としたアジア共同第Ⅲ相比較試験の中間解析における結果において、エソメプラゾール20mgの1日1回48週間投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制効果が認められている。さらに、中間解析以降、エソメプラゾール群の被験者のみ投与が継続され、エソメプラゾール20mgを1日1回最長72週間投与時において、投与72週後の非発症率は96.4%であった。なお、本試験においてはエソメプラゾール群、プラセボ群ともに全例ゲファルナートを併用していた。

	エソメプラゾール20mg(182例)	プラセボ(182例)
発症例数	2例	22例
投与48週後の 非発症率 <sup>a)</sup> [96.65%信頼区間]	98.3% [95.7~100%]	81.2% [72.7~89.7%]
ハザード比 [96.65%信頼区間]	0.09[0.02~0.41]	
p値 <sup>b)</sup>	p<0.001	

a) Kaplan-Meier法による推定 b) Log-rank検定、有意水準 両側3.35%

エソメプラゾール20mg投与例数214例中31例(14.5%)の副作用が報告されている。主な副作用は、下痢2例(0.9%)、びらん性胃炎2例(0.9%)、腹部膨満2例(0.9%)、胃ポリープ2例(0.9%)、貧血2例(0.9%)等であった<sup>12,13)</sup>。

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

17.1.6 国内第Ⅰ/Ⅲ相試験(幼児及び小児)

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、非びらん性胃食道逆流症、逆流性食道炎、又はZollinger-Ellison症候群を有する又は有する疑いのある1~14歳の患者50例を対象とした非盲検試験では、体重10kg以上20kg未満(10例[第1群])にエソメプラゾール1回10mgを、20kg以上に1回10mg(1~11歳10例[第2群]、12~14歳10例[第4群])又は1回20mg(1~11歳10例[第3群]、12~14歳10例[第5群])を1日1回最大8週間投与した。各投与群の上部消化器症状(胸やけ、呑酸、心窩部痛、及び上腹部不快感)は、投与前に症状を有していた患者の40%以上の割合で消失した。また、投与前に内視鏡的評価が実施できた患者のうち病理学的所見が認められた3例すべてにおいて投与後に所見が消失した。

投与群 (投与例数)	第1群 (10例)	第2群 (10例)	第3群 (10例)	第4群 (10例)	第5群 (10例)
年齢	1歳以上	1～11歳		12～14歳	
体重	10kg以上 20kg未満	20kg以上			
投与量	10mg	10mg	20mg	10mg	20mg
Kaplan-Meier法による最終時点の累積持続消失率					
胸やけ	100% (2例)	66.7% (3例)	100% (1例)	50% (2例)	75% (4例)
呑酸	75% (4例)	100% (3例)	80% (5例)	50% (4例)	100% (4例)
心窩部痛	100% (2例)	50% (6例)	100% (6例)	40% (5例)	57.1% (7例)
上腹部不快感	100% (3例)	66.7% (6例)	100% (4例)	60% (5例)	50% (6例)

( ) 投与前に症状を有していた例数  
 1～14歳の患者50例中2例(4.0%)の副作用が報告されている。その内訳は、下痢及び腹痛、光線過敏性反応各1例(2.0%)であった<sup>14)</sup>。

## (2) 安全性試験

<非ステロイド性抗炎症薬(NSAID)投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制>

## 17.1.4 国内長期投与試験(成人)

消化性潰瘍の既往を有するNSAID継続服用患者を対象としたエソメプラゾール20mgの1日1回52週間投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の非発症率は以下のとおりである。

投与群	52週後非発症率(Kaplan-Meier法)
エソメプラゾール20mg群(130例)	95.9%

副作用発現頻度は、エソメプラゾール20mg群で16.9%(22/130例)であった。主な副作用は筋痙縮2例(1.5%)、 $\gamma$ -グルタミルトランスフェラーゼ増加2例(1.5%)、頭痛2例(1.5%)及び肝機能異常2例(1.5%)であった<sup>15)</sup>。

## 5) 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(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

## 7) その他

該当資料なし

## 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

プロトンポンプ阻害作用：オメプラゾール、ランソプラゾール、ラベプラゾールナトリウム、ボノプラザンフマル酸<sup>16)</sup>

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

エソメプラゾール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

##### 18.1 作用機序

胃壁細胞の細胞膜上に存在する受容体へ各種酸分泌刺激物質が結合することにより、胃壁細胞内において一連の胃酸分泌反応がおきる。この反応の最終過程では、胃壁細胞内から $H^+$ を放出し、代わりに $K^+$ を取り込むプロトンポンプと呼ばれる酵素が働いている。エソメプラゾールは、このプロトンポンプの働きを阻害することによって、胃酸分泌を抑制する<sup>1)</sup>。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 ヒトでの作用

###### 18.2.1 胃内pHに及ぼす影響

健康成人において、エソメプラゾール10mg、20mg及び40mg投与により24時間中に胃内pHが4以上を示す時間の割合は、それぞれ $48 \pm 23\%$ 、 $62 \pm 14\%$ 及び $68 \pm 8\%$ であった<sup>17)</sup>。  
小児患者5例において、エソメプラゾール10mg及び20mg投与により12時間中に胃内pHが4以上を示す時間の割合は、51.2%～98.3%であった<sup>14)</sup>。

###### 18.3 非臨床試験における作用

###### 18.3.1 プロトンポンプ阻害作用

ウサギ胃粘膜由来のプロトンポンプ( $H^+$ ,  $K^+$ -ATPase)に対して阻害作用を示した<sup>18)</sup>。

###### 18.3.2 胃酸分泌抑制作用

単離ウサギ胃底腺における胃酸産生に対して抑制作用を示した<sup>19)</sup>。

胃瘻ラット及びHeidenhain Pouchイヌにおいて、刺激薬に惹起された胃酸分泌に対して抑制作用を示した<sup>20,21)</sup>。

本剤の有効成分であるエソメプラゾールは、ラセミ体であるオメプラゾールの一方の光学異性体(S体)である。

#### 3) 作用発現時間・持続時間

VI. -2. -2) 参照

## VII. 薬物動態に関する項目

エソメプラゾール製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

## 1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

## 2) 臨床試験で確認された血中濃度

## 16.1.1 単回投与

健康成人男性被験者 (n=24、CYP2C19のhomo EM、hetero EM及びPM<sup>註</sup>) が同数) にエソメプラゾール10mg及び20mgを空腹時に単回経口投与したときの未変化体の薬物動態パラメータは以下のとおりである<sup>22)</sup>。

投与量	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC (ng・hr/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)
10mg	247	1.00-5.00	565 <sup>a)</sup>	1.19 <sup>a)</sup>
20mg	489	0.75-6.00	1085	1.08

Tmaxは最小値-最大値、それ以外は幾何平均、

a) n=23

## 16.1.2 反復投与

健康成人男性被験者 (n=24、CYP2C19のhomo EM、hetero EM及びPM<sup>註</sup>) が同数) にエソメプラゾール10mg及び20mgを1日1回5日間反復経口投与したときの第5日目(空腹投与)の未変化体の薬物動態パラメータは以下のとおりである<sup>22)</sup>。

投与量	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC (ng・hr/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)
10mg	376	1.00-5.00	825 <sup>a)</sup>	1.16 <sup>a)</sup>
20mg	883	1.00-4.00	2083	1.23

Tmaxは最小値-最大値、それ以外は幾何平均、

a) n=23

投与3日目及び5日目のCmaxは同程度であったことから、反復投与開始後3日には血漿中エソメプラゾール濃度は定常状態に到達したと考えられた。投与5日目の投与後12時間における血漿中エソメプラゾール濃度はほぼ検出限界以下に低下し、1日1回反復投与しても累積は認められなかった<sup>22)</sup>。

## 16.1.3 幼児及び小児

幼児及び小児患者にエソメプラゾール10mg及び20mgを1日1回5日間以上反復経口投与したところ、未変化体の薬物動態パラメータは以下のとおりであった<sup>14)</sup>。

被験者の年齢及び体重	投与量	n	エソメプラゾールの薬物動態パラメータ			
			Cmax (ng/mL)	Tmax(hr) <sup>b)</sup>	AUC τ (ng・hr/mL) <sup>a)</sup>	T <sub>1/2</sub> (hr) <sup>c)</sup>
1歳以上 10kg以上 20kg未満	10mg	9	853 (141.7%)	1.58 (1.03-5.92)	2259 (42.6%) <sup>d)</sup>	0.80±0.18 <sup>d)</sup>
1~11歳 20kg以上	10mg	10	535 (110.4%)	1.52 (0.92-6.00)	995 (78.3%) <sup>e)</sup>	0.97±0.55 <sup>e)</sup>
	20mg	10	1907 (41.5%)	1.47 (0.93-1.52)	3454 (50.9%)	1.08±0.44
12~14歳 20kg以上	10mg	9	311 (91.7%)	1.57 (0.93-2.95)	618 (105.5%)	1.37±0.88
	20mg	10	981 (51.3%)	1.75 (0.95-3.00)	1917 (33.6%)	1.06±0.25

a) 幾何平均値(変動係数) b) 中央値(最小値-最大値)

c) 平均値±標準偏差 d) n=7 e) n=9

## VII. 薬物動態に関する項目

### <生物学的同等性試験>

#### ●エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」<sup>6)</sup>

エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」は、容れ目違いであるエソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」と溶出挙動が同等であり、製剤間に差がないことが確認された。

#### ●エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」<sup>23, 24)</sup>

##### 目的

エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

##### 方法

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号 以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」と標準製剤をそれぞれ1カプセル(エソメプラゾールとして20mg)健康成人男性(肝代謝酵素CYP2C19の遺伝子型がhomo EM\*の被験者)に空腹時および食後単回経口投与し、血漿中エソメプラゾール濃度を測定する。

\* Extensive Metabolizer

採血時点	空腹時	0、0.5、0.75、1、1.5、2、2.5、3、3.5、4、4.5、5、5.5、6、8hr
	食後	0、1、1.5、2、2.5、3、3.5、4、4.5、5、5.5、6、6.5、7、8、9、10hr
休薬期間	7日間	
測定方法	LC/MS法	
試験製剤	エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」(ロット番号：714K2SD407)	
標準製剤	ネキシウムカプセル20mg(ロット番号：73380)	

##### 評価

ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUCtおよびCmaxの対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれ $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

##### 結果

各製剤1カプセル投与時の薬物動態パラメータ

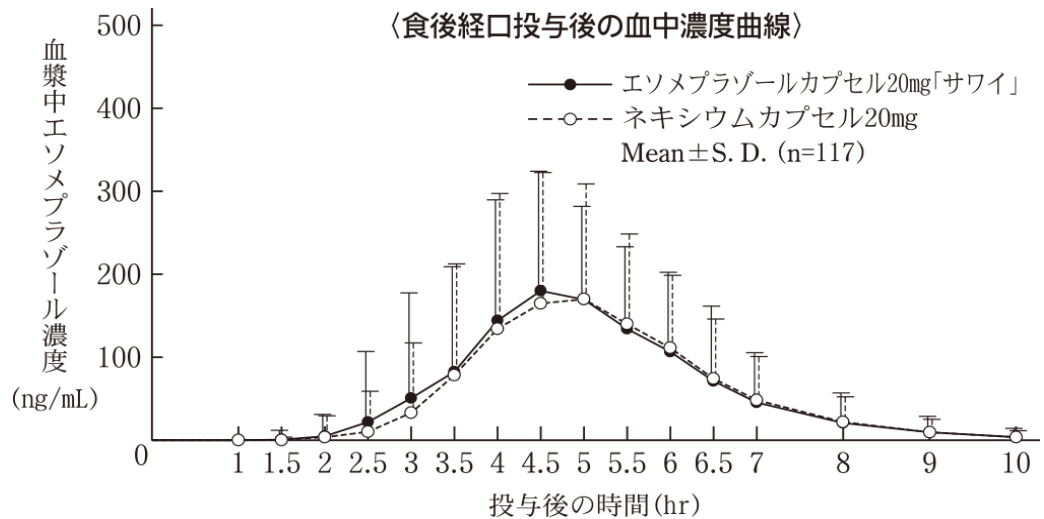
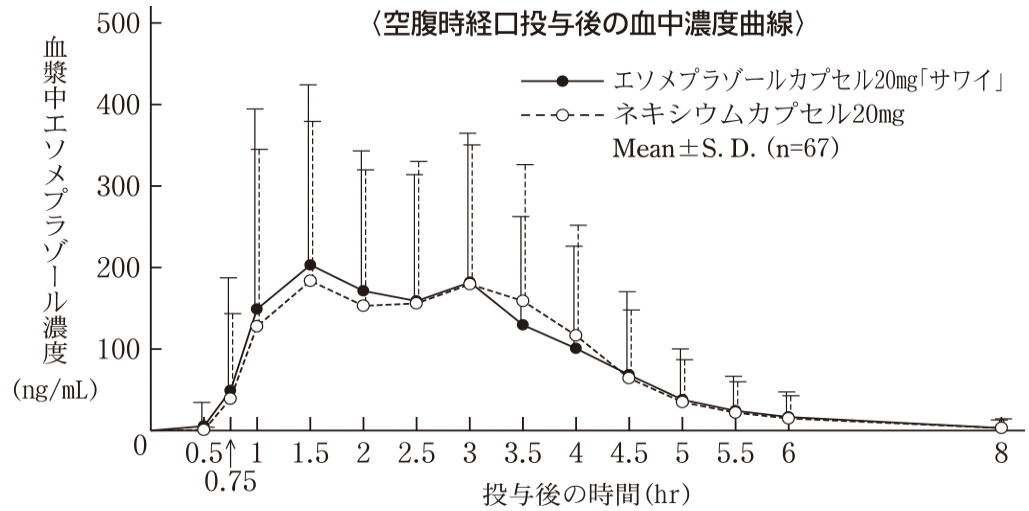
		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)	AUCt* (ng・hr/mL)
空腹時 (n=67)	エソメプラゾール カプセル20mg「サワイ」	445.8±190.9	2.1±1.0	0.7±0.3	630.2±383.7
	ネキシウムカプセル20mg	422.3±180.6	2.2±1.0	0.7±0.2	612.8±374.8
食後 (n=117)	エソメプラゾール カプセル20mg「サワイ」	294.6±153.2	4.6±1.0	0.8±0.6	548.9±310.6
	ネキシウムカプセル20mg	298.8±158.2	4.8±1.0	0.7±0.2 <sup>†</sup>	528.6±296.4

\* 空腹時：AUC<sub>0-8hr</sub>、食後：AUC<sub>0-10hr</sub>

(Mean±S.D.)

† n=116





		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
空腹時	AUC <sub>0-8hr</sub>	log(1.02)	log(0.98) ~ log(1.07)
	C <sub>max</sub>	log(1.05)	log(0.96) ~ log(1.14)
食後	AUC <sub>0-10hr</sub>	log(1.05)	log(1.00) ~ log(1.11)
	C <sub>max</sub>	log(1.00)	log(0.93) ~ log(1.08)

血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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。

**結論**

得られた薬物動態パラメータ (AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>) の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準であるlog(0.80) ~ log(1.25) の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

## VII. 薬物動態に関する項目

### 3) 中毒域

該当資料なし

### 4) 食事・併用薬の影響

#### 16.7 薬物相互作用

##### 16.7.1 ジアゼパム、フェニトイン又はワルファリン

発現系CYP2C19及びヒト肝ミクロソームを用いる *in vitro* 試験においてエソメプラゾールはCYP2C19の活性を阻害した ( $K_i$ 値: 7.9及び8.6  $\mu$ M) が、CYP2A6、CYP1A2、CYP2D6、CYP2E1、CYP2C9及びCYP3A4の活性については阻害しないかわずかな阻害作用を示した<sup>25, 26)</sup>。

外国人のデータでは、ジアゼパム、フェニトイン又はワルファリン (*R*-ワルファリン) (以上、CYP2C19の基質) とエソメプラゾールの併用により、ジアゼパム、フェニトインのAUCはそれぞれ81%、13%増大し、*R*-ワルファリンの血漿中トラフ濃度は13%上昇した<sup>26)</sup>。[10.2参照]

##### 16.7.2 その他の薬剤

エソメプラゾールとクラリスロマイシン及びアモキシシリン水和物の併用により、クラリスロマイシン及びアモキシシリン水和物の血漿中濃度に影響しなかったが、クラリスロマイシンの14位水酸化代謝物のAUC<sub>τ</sub>は増大した。また、エソメプラゾールのAUC<sub>τ</sub>は非併用時の約2倍に増大した<sup>27)</sup>。キニジン<sup>27)</sup>、ナプロキセン<sup>28)</sup>、ロキソプロフェンナトリウム<sup>29)</sup>、アスピリン<sup>30)</sup>とエソメプラゾールの併用では相互作用は認められなかった。

## VIII. -7. 参照

## 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) 消失速度定数

- エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」を健康成人男性に1カプセル(エソメプラゾールとして20mg)空腹時及び食後単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>24)</sup>  
[空腹時]1.057±0.262hr<sup>-1</sup>、[食後]1.027±0.325hr<sup>-1</sup>

### 4) クリアランス

該当資料なし

### 5) 分布容積

該当資料なし

### 6) その他

該当資料なし

## 3. 母集団(ポピュレーション)解析 .....

## 1) 解析方法

該当資料なし

## 2) パラメータ変動要因

該当資料なし

## 4. 吸収 .....

消化管から吸収される。

## 5. 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

<参考>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。

## 3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>本剤のラセミ体であるオメプラゾールでの動物実験(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

## 6) 血漿蛋白結合率

## 16.3.1 血漿蛋白結合

エソメプラゾール(添加濃度: 2又は20 $\mu$ mol/L)のヒト血漿蛋白結合率(*in vitro*)は97%であった<sup>31)</sup>。

## 6. 代謝 .....

## 1) 代謝部位及び代謝経路

肝臓

## VII. 薬物動態に関する項目

### 2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

#### 16.4 代謝

*in vitro*肝代謝試験の結果から、ヒドロキシ体、5-*O*-脱メチル体の生成にはCYP2C19、スルホン体の生成にはCYP3A4が関与し、これら3種の代謝物への代謝クリアランスは同程度であると報告されている<sup>32)</sup>。エソメプラゾールの*in vitro*肝代謝において、ヒドロキシ体及び5-*O*-脱メチル体の生成に関与するCYP2C19の寄与率(代謝固有クリアランス: CL<sub>int</sub>)は73%であった<sup>32)</sup>。外国人のデータでは、健康成人に<sup>14</sup>C標識エソメプラゾールを単回経口投与したとき、血漿中の主代謝物はスルホン体及びヒドロキシ体であった<sup>31)</sup>。  
[9.3、10.参照]

### 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活性比、存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

#### 16.5 排泄

外国人のデータでは、<sup>14</sup>C標識エソメプラゾールを単回経口投与したとき、投与放射能の約95%が48時間までに尿中及び糞中に排泄され、尿中排泄量と糞便中排泄量の比は約4対1であった<sup>31)</sup>。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

該当資料なし

## 10. 特定の背景を有する患者

#### 16.6 特定の背景を有する患者

##### 16.6.1 高齢者

外国人のデータでは、エソメプラゾールを健康高齢被験者に1日1回5日間反復経口投与したとき、投与5日目のAUC及びC<sub>max</sub>は非高齢の症候性胃食道逆流症患者よりも高い傾向を示し、幾何平均の比(健康高齢/非高齢患者)は各々1.25(95%信頼区間: 0.94-1.67)、1.18(同: 0.91-1.52)であった<sup>33)</sup>。

##### 16.6.2 肝機能障害患者

外国人のデータでは、エソメプラゾールを肝機能障害患者に1日1回5日間反復経口投与したとき、AUC<sub>τ</sub>は、肝機能低下のない症候性胃食道逆流症患者に比べ、重度の肝機能障害患者では約2.3倍高く、軽度～中程度の肝機能障害患者でもその比は1.4~1.8であった<sup>34)</sup>。

11. その他.....  
    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……………  
設定されていない

2. 禁忌内容とその理由……………

- 2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)
- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 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[10.1参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………  
V. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………  
V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由……………

- 8. 重要な基本的注意
- <効能共通>
- 8.1 血液像、肝機能、腎機能等に注意すること。
- <逆流性食道炎>
- 8.2 逆流性食道炎の維持療法については、再発・再燃を繰り返す患者に対し投与することとし、本来維持療法の必要のない患者に投与することのないよう留意すること。また、維持療法中は定期的に内視鏡検査を実施するなど観察を十分に行うことが望ましい。なお、次の事項に十分注意すること。
- 8.2.1 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。
- 8.2.2 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。
- 8.2.3 定期的に血液像、肝機能、腎機能等の検査を行うことが望ましい。
- <非びらん性胃食道逆流症>
- 8.3 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見られること(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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………

1) 合併症・既往歴等のある患者

- 9.1 合併症・既往歴等のある患者
- 9.1.1 薬物過敏症の既往歴のある患者

2) 腎機能障害患者

設定されていない

3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

肝代謝型であり、血中濃度が高くなるおそれがある。[16.4参照]

4) 生殖能を有する者

設定されていない

5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。本剤のラセミ体であるオメプラゾールでの動物実験(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。

7) 小児等

9.7 小児等

国内において、低出生体重児、新生児、乳児を対象とした臨床試験は実施していない。

8) 高齢者

9.8 高齢者

低用量から投与を開始すること。一般に肝機能、その他生理機能が低下していることが多い。

7. 相互作用

主として肝代謝酵素CYP2C19及び一部CYP3A4で代謝される。

また、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。[16.4参照]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1) 併用禁忌とその理由

10.1 併用禁忌(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) [2.2参照]	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) [2.2参照]	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。

2) 併用注意とその理由

10.2 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
ジアゼパム フェニトイン シロスタゾール [16.7.1参照]	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 [16.7.1参照]	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	タクロリムスの作用を増強することがある。	これらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。
メトトレキサート	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。	
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 チロシンキナーゼ阻害剤 ゲフィチニブ ニロチニブ エルロチニブ	これらの薬剤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これらの薬剤の溶解性が低下し、これらの薬剤の血中濃度が低下することがある。



薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ポリコナゾール	本剤の作用を増強することがある。	本剤のCmax及びAUCが増加するおそれがある。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	ネルフィナビルの作用を減弱することがある。	相互作用の機序は不明である。ネルフィナビルの血中濃度が低下することがある。
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	本剤の作用を減弱することがある。	セイヨウオトギリソウが本剤の代謝酵素(CYP2C19及びCYP3A4)を誘導し、本剤の代謝が促進され血中濃度が低下することが考えられる。

## 8. 副作用

## 11. 副作用

次の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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

## 1) 重大な副作用と初期症状

## 11.1 重大な副作用

## 11.1.1 ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

ショック、アナフィラキシー(血管浮腫、気管支痙攣等)があらわれることがある。

## 11.1.2 汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血(いずれも頻度不明)、血小板減少(1%未満)

## 11.1.3 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全(いずれも頻度不明)

## 11.1.4 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)(いずれも頻度不明)

## 11.1.5 間質性肺炎(頻度不明)

咳嗽、呼吸困難、発熱、肺音の異常(捻髪音)等が認められた場合には、速やかに胸部X線、胸部CT等の検査を実施すること。間質性肺炎が疑われた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

## 11.1.6 間質性腎炎、急性腎障害(いずれも頻度不明)

腎機能検査値(BUN、クレアチニン等)に注意すること。

## 11.1.7 横紋筋融解症(頻度不明)

筋肉痛、脱力感、CK上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等があらわれることがある。

## 11.1.8 低ナトリウム血症(頻度不明)

## 11.1.9 錯乱状態(頻度不明)

錯乱、激越、攻撃性、幻覚等があらわれることがある。

## 11.1.10 視力障害(頻度不明)

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

2) その他の副作用

11.2 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、非ステロイド性抗炎症薬投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制、低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制>

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
過 敏 症		発疹、皮膚炎、そう痒症、蕁麻疹	光線過敏、多形紅斑
消 化 器		腹痛、下痢、嘔吐、便秘、口内炎、カンジダ症、口渇	鼓腸、悪心、顕微鏡的大腸炎 (collagenous colitis、lymphocytic colitis)
肝 臓	肝酵素上昇		
血 液		白血球数減少	
精神神経系		頭痛、錯感覚、傾眠、浮動性めまい	不眠症、うつ病
そ の 他		CK上昇、回転性めまい、女性化乳房、味覚障害	脱毛症、関節痛、筋痛、霧視、倦怠感、多汗症、筋力低下、低マグネシウム血症(低カルシウム血症、低カリウム血症を伴うことがある)、末梢性浮腫

頻度は成人を対象としたカプセル剤の臨床試験(初回承認時及びアジア共同第Ⅲ相比較試験)に基づき算出している。

<ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助>

副作用の頻度については、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍における、本剤のラセミ体のオメプラゾール、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与の成績に基づく。

	5%以上	1～5%未満	1%未満 <sup>注)</sup>
過 敏 症		発疹	
消 化 器	下痢・軟便(33.4%)、味覚異常(10.5%)	口内炎、腹痛、食道炎、悪心、腹部膨満感、便秘	舌炎、口渇、十二指腸炎
肝 臓		AST上昇	肝機能異常、ALT上昇、Al-P上昇、ビリルビン上昇、LDH上昇
血 液			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		尿糖陽性	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、動悸、霧視

注)頻度不明を含む。

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

## ＜ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助＞

エソ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、<sup>13</sup>C-尿素呼気試験の判定が偽陰性になる可能性があるため、<sup>13</sup>C-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。

## 10. 過量投与

設定されていない

## 11. 適用上の注意

## 14. 適用上の注意

## 14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

## 12. その他の注意

## 1) 臨床使用に基づく情報

## 15.1 臨床使用に基づく情報

## ＜効能共通＞

15.1.1 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。

15.1.2 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。

15.1.3 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。

15.1.4 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。

## ＜非びらん性胃食道逆流症＞

15.1.5 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。

## 2) 非臨床試験に基づく情報

## 15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 ラットに本剤のラセミ体であるオメプラゾール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。

15.2.2 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。

---

## 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) 安全性薬理試験  
該当資料なし
  - 3) 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  
該当資料なし
  - 3) 遺伝毒性試験  
該当資料なし
  - 4) がん原性試験  
該当資料なし
  - 5) 生殖発生毒性試験  
VIII. -6. 及びVIII. -12. 参照
  - 6) 局所刺激性試験  
該当資料なし
  - 7) 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	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	該当しない

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

## 2. 有効期間

有効期間：3年

## 3. 包装状態での貯法

室温保存

## 4. 取扱い上の注意

VIII. -11. 参照

## 5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

## 6. 同一成分・同効薬

同一成分：ネキシウムカプセル10mg/カプセル20mg/懸濁用顆粒分包10mg/懸濁用顆粒分包20mg

同効薬：プロトンポンプ阻害作用

オメプラゾール、ランソプラゾール、ラベプラゾールナトリウム、ボノプラザンフマル酸<sup>16)</sup>

## 7. 国際誕生年月日

該当しない

## 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

●エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2022年8月15日、承認番号：30400AMX00356000

薬価基準収載年月日：2022年12月9日

販売開始年月日：2023年1月27日

X. 管理的事項に関する項目

●エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2022年8月15日、承認番号：30400AMX00357000

薬価基準収載年月日：2022年12月9日

販売開始年月日：2023年1月27日

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

13. 各種コード

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
エソメプラゾール カプセル 10mg 「サワイ」	2329029M1078	2329029M1078	129246601	622924601
エソメプラゾール カプセル 20mg 「サワイ」	2329029M2074	2329029M2074	129247301	622924701

14. 保険給付上の注意

特になし

---

**XI . 文 献**


---

1. 引用文献
- 1)作用機序(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.6.2.1)
  - 2)沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験] エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」
  - 3)沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」
  - 4)沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験] エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」
  - 5)沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」
  - 6)沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」
  - 7)沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」
  - 8)木下芳一他, 日消誌, 110(2), 234(2013).
  - 9)木下芳一他, 日消誌, 110(8), 1428(2013).
  - 10)国内第Ⅲ相試験(成人)(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.7.6.2)
  - 11)Sugano, K. et al., Aliment. Pharmacol. Ther., 36(2), 115(2012).
  - 12)Sugano, K. et al., Gut, 63(7), 1061(2014).
  - 13)アジア共同第Ⅲ相試験(成人)(ネキシウムカプセル：2012年6月22日承認、審査報告書)
  - 14)日本人小児患者における第Ⅰ/Ⅲ相試験(ネキシウムカプセル/懸濁用顆粒分包：2018年1月19日承認申請資料概要2.7.6.2)
  - 15)Sugano, K. et al., BMC Gastroenterology, 13, 54(2013).
  - 16)薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>  
(2022/11/1 アクセス)
  - 17)長嶋浩貴他, 臨床医薬, 27(10), 735(2011).
  - 18)ウサギH<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>-ATPaseに対する作用(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.6.2.2)
  - 19)単離ウサギ胃底腺における作用(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.6.2.2)
  - 20)胃瘻ラットにおける作用(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.6.2.2)
  - 21)Heidenhain Pouchイヌにおける作用(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.6.2.2)
  - 22)日本人健康成人被験者における反復投与試験(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.2.3, 2.7.6.2)
  - 23)沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」
  - 24)干野英明他, 診療と新薬, 59(10), 545(2022).
  - 25)Li, X. Q. et al., Drug Metab. Dispos., 32(8), 821(2004).
  - 26)in vitro代謝酵素阻害(ネキシウムカプセル：2011年7月1日承認、申請資料概要2.7.2.3)
  - 27)Andersson, T. et al., Clin. Pharmacokinet., 40(7), 523(2001).
  - 28)Hassan-Alin, M, et al., Clin. Drug Investig., 25(11), 731(2005).
  - 29)八木道夫, 臨床医薬, 27(10), 747(2011).
  - 30)Niazi, M. et al., Int. J. Clin. Pharmacol. Ther., 47(9), 64(2009).
  - 31)Andersson, T. et al., Clin. Pharmacokinet., 40(6), 411(2001).
  - 32)Äbelö, A, et al., Drug Metab. Dispos., 28(8), 966(2000).
  - 33)Hasselgren, G. et al., Clin. Pharmacokinet., ; 40(2), 145 (2001)
  - 34)Sjövall, H. et al. : Eur. J. Gastroenterol. Hepatol., 14(5), 491 (2002)

## X I. 文献

- 35) 沢井製薬(株) 社内資料[脱カプセル後の安定性試験] エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」
- 36) 沢井製薬(株) 社内資料[脱カプセル後の安定性試験] エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」
- 37) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」
- 38) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」

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 .....
  
  2. 海外における臨床支援情報 .....
- 該当資料なし

### XIII. 備考

#### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### 1) 粉砕

本製剤のカプセル内容物は腸溶性コーティングを施しているため、粉砕は不可である。

(IV. -1. 参照)

なお、参考として本製剤のカプセル内容物の安定性試験結果を以下に示す。

#### <参考>脱カプセル後の安定性試験

#### ●エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」<sup>35)</sup>

##### 目的

本製剤の脱カプセル後の安定性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

本製剤を脱カプセルし、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>B)</sup>に従い評価する。

##### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
	714K1SD407	室温
光		25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx)、開放シャーレ*

\*：通気性を確保し異物混入を防ぐ程度にポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆う

##### 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・純度試験(類縁物質)・定量試験	1回

##### 結果

試験項目	性状	純度試験 (類縁物質)	定量試験※
保存条件・期間			
イニシャル	(a)	適合	100.0
室温(13週)	変化なし	変化なし	変化なし 99.6
光(総照度60万lx・hr)	変化なし	変化なし	変化なし 98.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：ごくうすい黄色の腸溶性顆粒

●エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」<sup>36)</sup>

目的

本製剤の脱カプセル後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を脱カプセルし、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>B)</sup>に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
714K2SD407	室温	25°C/60%RH、遮光、開放シャーレ
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx)、開放シャーレ*

\*：通気性を確保し異物混入を防ぐ程度にポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆う

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・純度試験(類縁物質)・定量試験	1回

結果

試験項目	性状	純度試験(類縁物質)	定量試験*
保存条件・期間			
イニシャル	(a)	適合	100.0
室温(13週)	変化なし	変化なし	変化なし 99.4
光(総照度60万lx・hr)	変化なし	変化なし	変化なし 99.1

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：ごくうすい黄色の腸溶性顆粒

B) 評価分類基準

【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり	形状変化や色調変化が認められる場合

【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

参考文献

(社)日本病院薬剤師会“錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申),平成11年8月20日”西岡豊他.錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報.改訂6版,医薬ジャーナル社,2009,p441-444

## 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### ●エソメプラゾールカプセル10mg「サワイ」<sup>37)</sup>

#### 1) シリンジによる試験

##### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、シリンジによる試験を実施する。

##### 方法

1. 本製剤を1カプセル、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、カプセルを入れてピストン部を戻す)、お湯(約55℃)20mLを吸い取る。
2. 5分間放置後、シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認する。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返す。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液をチューブに注入し、水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。

##### 使用器具

シリンジ：テルモカテーテルチップシリンジ 20mL

チューブ：ジェイフィード栄養カテーテル[120cm、8Fr.(外径2.7mm)]

ロット番号	714K1SD408
試験回数	1回

#### 結果

崩壊・懸濁状態	5分後	カプセルの一部が溶解したが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	10分後	カプセルの溶解が進んだが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	15分後	カプセルの溶解が進んだが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	20分後	カプセルは完全に溶解したが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
チューブ通過性	一部の腸溶性顆粒は通過したが、残りはシリンジやチューブに付着し、通過しなかった。	
チューブ通過液のpH	約6.9	

#### 2) けんだくボトルによる試験

##### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、けんだくボトルによる試験を実施する。

##### 方法

1. 本製剤を1カプセル、けんだくボトルに入れ、お湯(約55℃)20mLを加える。
2. 5分間放置後、ボトルを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認する。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返す。(最大20分まで)
3. ボトル内の液をチューブに注入し、水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。
4. 再度水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。

##### 使用器具

ボトル：けんだくボトルB型 100mL

チューブ：ジェイフィード栄養カテーテル[120cm、8Fr.(外径2.7mm)]

ロット番号	714K1SD408
試験回数	1回

## 結果

崩壊・懸濁状態	5分後	カプセルが崩壊し始め、腸溶性顆粒が沈殿した。また、転倒混和によりカプセルが完全に崩壊し、腸溶性顆粒が沈殿した。
	10分後	カプセルの溶解が進んだが、腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	15分後	カプセルの溶解が進み、転倒混和によりカプセルは完全に溶解したが、腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	20分後	腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
チューブ通過性	腸溶性顆粒が全て通過した。 チューブやボトルに腸溶性顆粒が詰まりやすいため注意が必要である。	
チューブ通過液のpH	約6.4	

## ●エソメプラゾールカプセル20mg「サワイ」<sup>38)</sup>

### 1) シリンジによる試験

#### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、シリンジによる試験を実施する。

#### 方法

1. 本製剤を1カプセル、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、カプセルを入れてピストン部を戻す)、お湯(約55℃)20mLを吸い取る。
2. 5分間放置後、シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認する。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返す。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液をチューブに注入し、水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。

#### 使用器具

シリンジ：テルモカテーテルチップシリンジ 20mL

チューブ：ジェイフィールド栄養カテーテル[120cm、8Fr.(外径2.7mm)]

ロット番号	714K2SD408
試験回数	1回

## 結果

崩壊・懸濁状態	5分後	カプセルの一部が溶解したが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	10分後	カプセルの溶解が進んだが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	15分後	カプセルの溶解が進んだが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	20分後	カプセルは完全に溶解したが、内容物の腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
チューブ通過性	一部の腸溶性顆粒は通過したが、残りはシリンジやチューブに付着し、通過しなかった。	
チューブ通過液のpH	約7.0	

### 2) けんだくボトルによる試験

#### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、けんだくボトルによる試験を実施する。

## 方法

1. 本製剤を1カプセル、けんだくボトルに入れ、お湯(約55℃)20mLを加える。
2. 5分間放置後、ボトルを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認する。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返す。(最大20分まで)
3. ボトル内の液をチューブに注入し、水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。
4. 再度水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。

### 使用器具

ボトル：けんだくボトルB型 100mL

チューブ：ジェイフィード栄養カテーテル[120cm、8Fr.(外径2.7mm)]

ロット番号	714K2SD408
試験回数	1回

## 結果

崩壊・懸濁状態	5分後	カプセルが崩壊し始め、腸溶性顆粒が沈殿した。また、転倒混和によりカプセルが完全に崩壊し、腸溶性顆粒が沈殿した。
	10分後	カプセルの溶解が進んだが、腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	15分後	カプセルの溶解が進んだが、腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
	20分後	カプセルの溶解が進んだが、腸溶性顆粒は沈殿したままであった。
チューブ通過性	フラッシュ1回後はボトル内及びチューブ内にわずかに腸溶性顆粒が残り、フラッシュ2回後に腸溶性顆粒が全て通過した。 チューブやボトルに腸溶性顆粒が詰まりやすいため注意が必要である。	
チューブ通過液のpH	約6.1	

## 2. その他の関連資料 .....

該当資料なし



