

尿失禁・尿意切迫感・頻尿治療剤

オキシブチニン塩酸塩錠

オキシブチニン塩酸塩錠1mg「トーフ」

オキシブチニン塩酸塩錠2mg「トーフ」

オキシブチニン塩酸塩錠3mg「トーフ」

OXYBUTYNIN HYDROCHLORIDE TABLETS 1mg “TOWA”/
TABLETS 2mg “TOWA”/ TABLETS 3mg “TOWA”

貯 法：室温保存
有効期間：3年

	錠1mg	錠2mg	錠3mg
承認番号	22500AMX01117	22500AMX01118	22500AMX01122
販売開始	2011年6月	1996年7月	

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 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。〕
[11. 1. 3参照]
- 2.2 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。〕
- 2.3 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。〕
- 2.4 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。〕 [11. 1. 2参照]
- 2.5 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。〕
- 2.6 授乳婦 [9. 6参照]
- 2.7 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「トーフ」	オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「トーフ」	オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「トーフ」
1錠中の有効成分	オキシブチニン塩酸塩 ……1mg	オキシブチニン塩酸塩 ……2mg	オキシブチニン塩酸塩 ……3mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒプロメロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、マクロゴール6000、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸

3.2 製剤の性状

販売名	オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「トーフ」	オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「トーフ」	オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「トーフ」
性状・剤形	白色～帯黄白色のフィルムコーティング錠	白色の割線入りの素錠で、においはなく、味は苦い。	白色の割線入りの素錠で、においはなく、味は苦い。
識別コード	本体 包装 Tw156	Tw107	Tw108
外形	表		
	裏		
	側面		
直径(mm)	6.1	8.0	8.0
厚さ(mm)	3.2	3.4	3.4
質量(mg)	99	178	178

4. 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）

6. 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。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 眼調節障害、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。
- 8.2 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ため、高温環境下で使用する場合は体温の上昇に注意させること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。

9.1.2 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。

9.1.3 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。

9.1.4 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。

9.1.5 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。

9.1.6 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。

9.1.7 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。

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重篤な腎疾患のある患者

腎障害患者において臨床試験は実施されていない。

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝疾患のある患者

肝障害患者において臨床試験は実施されていない。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。

9.6 授乳婦

投与しないこと。動物実験（ラット）で乳汁への移行が報告されている。[2. 6参照]

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

少量から投与し、観察を十分行うとともに、過量投与にならないよう注意すること。

10. 相互作用

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
抗コリン作用を有する薬剤 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	口内乾燥、便秘、排尿困難、目のかすみ等があらわれるおそれがある。	抗コリン作用が増強されるおそれがある。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 血小板減少（0.1%未満）

11.1.2 麻痺性イレウス（頻度不明）

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。〔2.4参照〕

11.1.3 尿閉（0.28%）

〔2.1参照〕

11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
精神神経系		めまい、眠気、頭痛	しびれ、振戦等	認知機能障害、抑うつ
循環器				頻脈
消化器	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、舌炎等	嚥下障害
過敏症		発疹等		血管浮腫、蕁麻疹
泌尿器		排尿困難、残尿等		
肝臓		AST、ALT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、嗝声等	眼乾燥、潮紅

注）発現頻度は使用成績調査を含む。

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。

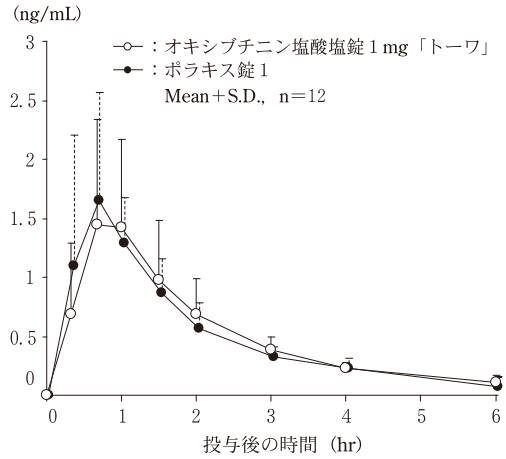
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

〈オキシブチニン塩酸塩錠1mg「トーワ」〉

オキシブチニン塩酸塩錠1mg「トーワ」とボラキス錠1を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（オキシブチニン塩酸塩として2mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、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。¹⁾



	製剤投与量 (オキシブチニン塩酸塩として)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₆ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
オキシブチニン塩酸塩錠 1mg「トーワ」	2錠 (2mg)	3.14 ± 1.09	1.69 ± 0.76	0.8 ± 0.3	1.8 ± 0.5
ボラキス錠1	2錠 (2mg)	3.06 ± 1.13	1.74 ± 0.92	0.7 ± 0.2	2.2 ± 1.0

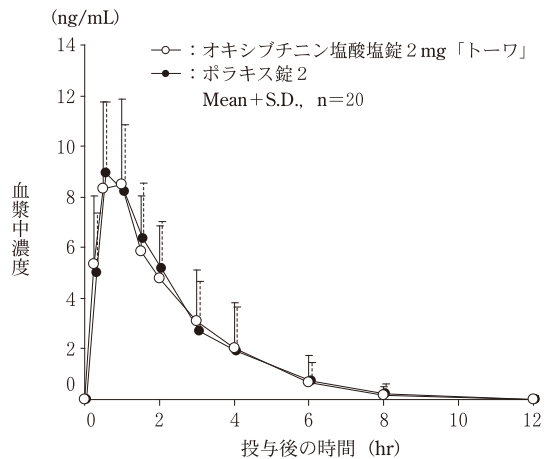
(Mean ± S.D., n=12)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

〈オキシブチニン塩酸塩錠2mg「トーワ」〉

オキシブチニン塩酸塩錠2mg「トーワ」とボラキス錠2を、クロスオーバー法によりそれぞれ3錠（オキシブチニン塩酸塩として6mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、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。²⁾

（注）6mg単回経口投与は承認外用量である。



	製剤投与量 (オキシブチニン塩酸塩として)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₁₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
オキシブチニン塩酸塩錠 2mg「トーワ」	3錠 (6mg)	23.22 ± 9.60	10.15 ± 3.25	0.68 ± 0.28	1.89 ± 1.36
ボラキス錠2	3錠 (6mg)	23.55 ± 8.52	9.68 ± 2.87	0.66 ± 0.26	1.87 ± 1.31

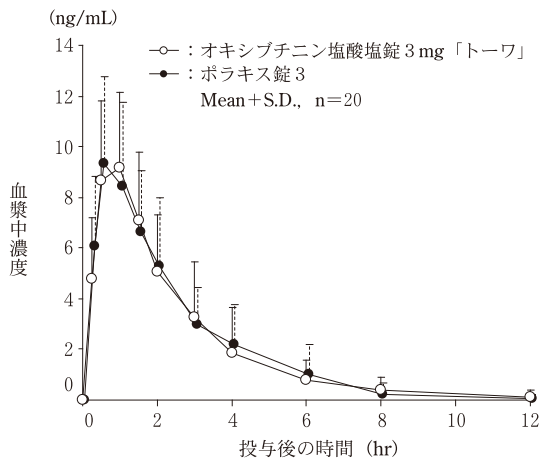
(Mean ± S.D., n=20)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

〈オキシブチニン塩酸塩錠3mg「トーワ」〉

オキシブチニン塩酸塩錠3mg「トーワ」とボラキス錠3を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（オキシブチニン塩酸塩として6mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、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。³⁾

（注）6mg単回経口投与は承認外用量である。



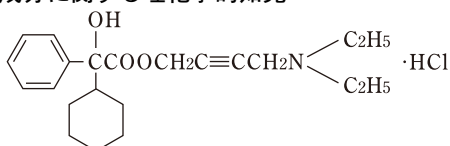
	製剤投与量 (オキシブチニン 塩酸塩として)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₁₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
オキシブチニン塩酸塩錠 3mg「トーワ」	2錠 (6mg)	25.32±10.73	10.30±3.37	0.80±0.30	1.86±0.95
ボラキス錠3	2錠 (6mg)	25.53±11.04	10.17±3.48	0.71±0.39	2.26±1.58

(Mean±S.D., n=20)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

19. 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：オキシブチニン塩酸塩 (Oxybutynin Hydrochloride)

化学名：4-diethylamino-2-butynyl(±)-α-cyclohexyl-α-phenylglycolate hydrochloride

分子式：C₂₂H₃₁NO₃・HCl

分子量：393.95

性状：白色の結晶性の粉末である。メタノールに極めて溶けやすく、水、エタノール又は酢酸(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。水溶液(1→50)は旋光性を示さない。

融点：124~129℃

22. 包装

〈オキシブチニン塩酸塩錠1mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

〈オキシブチニン塩酸塩錠2mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

1000錠 [バラ]

〈オキシブチニン塩酸塩錠3mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験(錠1mg)
- 社内資料：生物学的同等性試験(錠2mg)
- 社内資料：生物学的同等性試験(錠3mg)

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター

〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号

☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号