

止 瀉 剤

カグダリン® 細 粒 0.1%
カグダリン® カプセル 1mg

CAGUDALIN FINE GRAN. 0.1%
CAGUDALIN CAP. 1mg

(ロペラミド塩酸塩製剤)

貯 法：室温保存
 使用期限：外箱に記載

	細 粒	カプセル
※承認番号	22100AMX00701000	22100AMX00700000
※薬価収載	2009.09	2009.09
販売開始	1992.09	1992.09

【禁 忌】

(次の患者には投与しないこと)

- ※※ (1) 出血性大腸炎の患者〔腸管出血性大腸菌(O157等)や赤痢菌等の重篤な感染性下痢患者では、症状の悪化、治療期間の延長をきたすおそれがある。〕
 (2) 抗生物質の投与に伴う偽膜性大腸炎の患者〔症状の悪化、治療期間の延長をきたすおそれがある。〕
 (3) 低出生体重児、新生児及び6ヵ月未満の乳児〔外国で、過量投与により、呼吸抑制、全身性痙攣、昏睡等の重篤な副作用の報告がある。〕
 (4) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者。

【原則禁忌】

(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)

- ※※ (1) 感染性下痢患者〔治療期間の延長をきたすおそれがある。〕
 (2) 潰瘍性大腸炎の患者〔中毒性巨大結腸を起こすおそれがある。〕
 (3) 6ヵ月以上2歳未満の乳幼児〔「小児等への投与」の項参照〕

※【組成・性状】

販売名	カグダリン細粒 0.1%
成分・含量	1g 中ロペラミド塩酸塩 1mg
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース
色・剤形	白色～淡黄色の細粒

販売名	カグダリンカプセル 1mg	
成分・含量	1カプセル中ロペラミド塩酸塩 1mg	
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ステアリン酸Mg、ラウリル硫酸Na、酸化チタン	
色・剤形	白色の硬カプセル	
外形	(KTB) (C-1)	
大きさ	長さ (mm)	重量 (mg)
	11.3	108
識別コード	KTB C-1	

【効能・効果】

下痢症

【用法・用量】

通常、成人にはロペラミド塩酸塩として1日1～2mgを1～2回に分割経口投与する。
 なお、症状により適宜増減する

【使用上の注意】

1. **慎重投与** (次の患者には慎重に投与すること)
 重篤な肝障害のある患者〔本剤の代謝及び排泄が遅延するおそれがある。〕
2. **重要な基本的注意**
 (1) 止瀉剤による治療は下痢の対症療法であるので、脱水症状がみられる場合、輸液等適切な水・電解質の補給に留意すること。
 (2) 本剤の薬理作用上、便秘が発現することがあるので、用量に留意し、便秘が発現した場合は投与を中止すること。また、特に便秘を避けねばならない肛門疾患等の患者には注意して投与すること。
 (3) 眠気、めまいが起こることがあるので、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従事させないよう**注意すること。

※※3. **相互作用**

本剤は主として肝代謝酵素 CYP3A4 及び CYP2C8 で代謝されることから、CYP3A4 又は CYP2C8 を阻害する薬剤と併用した際、本剤の代謝が阻害され血中濃度が上昇する可能性がある。また、本剤は P-糖蛋白の基質である。

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
ケイ酸アルミニウム タンニン酸アルブミン	本剤の効果が減弱するおそれがあるので、投与間隔をあけるなど注意すること。	これらの薬剤により、本剤が吸着されることが考えられる。
リトナビル キニジン	本剤の血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤の P-糖蛋白に対する阻害作用により、本剤の排出が阻害されると考えられる。
イトラコナゾール	本剤の血中濃度が上昇することがある。	イトラコナゾールの CYP3A4 及び P-糖蛋白に対する阻害作用により、本剤の代謝及び排出が阻害されると考えられる。

4. 副作用

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。

(1) 重大な副作用

- 1) **イレウス、巨大結腸** 消化器症状（「その他の副作用－消化器」の項参照）とともにイレウス、巨大結腸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すること。
- 2) **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があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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) **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、皮膚粘膜眼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) その他の副作用

種類	頻度	頻度不明
過敏症*		血管浮腫
中枢神経系		頭痛、傾眠傾向、鎮静、筋緊張低下、意識レベルの低下、筋緊張亢進、意識消失、昏迷、協調運動異常
肝臓		AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTPの上昇
消化器		腹部膨満、腹部不快感、悪心、腹痛、嘔吐、食欲不振、消化不良、口内不快感、味覚の変調、便秘、鼓腸
皮膚		発疹、蕁麻疹、そう痒感、多形紅斑、水疱性皮膚炎
泌尿器		尿閉
その他		口渇、眠気、めまい、発汗、倦怠感、疲労、体温低下、発熱、散瞳、縮瞳

* 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。

5. 高齢者への投与

用量に留意するなど、注意して投与すること。〔一般に高齢者では生理機能が低下している。〕

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦、妊娠している可能性のある婦人、又は授乳中の婦人には治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠・授乳期間中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳中の婦人には本剤投与中の授乳は避けさせること。〔ヒトで母乳中に移行することが報告されている。〕

7. 小児等への投与

- (1) 小児等に対する安全性は確立していないので、投与しないことが望ましい。
- (2) 外国で、乳幼児（特に2歳未満）に過量投与した場合、中枢神経系障害、呼吸抑制、腸管壊死に至る麻痺性イレウスを起こしたとの報告がある。

8. 過量投与

※※**徴候、症状**： 外国でロペラミド塩酸塩液剤の過量投与により、昏睡、呼吸抑制、縮瞳、協調異常、筋緊張低下、傾眠、閉尿等の中毒症状がみられ、また、腸管壊死に至る麻痺性イレウスにより死亡に至った例が報告されている。

処置： これらの症状が見られた場合にはナロキソン塩酸塩を投与する。本剤の作用持続性に比べ、ナロキソン塩酸塩の作用は短時間しか持続しないので、必要な場合にはナロキソン塩酸塩を反復投与する。

9. 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、更には穿孔を起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。〕

10. その他の注意

動物実験において、大量投与で薬物依存性が認められているので、観察を十分に行い、用量および使用期間に注意すること。

※【薬物動態】

溶出挙動¹⁾

カグダリン細粒0.1%及びカグダリンカプセル1mgは、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたロペラミド塩酸塩細粒及びロペラミド塩酸塩カプセルの溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

ラットを用いた試験において、ヒマシ油またはプロスタグランジンE₁誘発の下痢を抑制する。²⁾

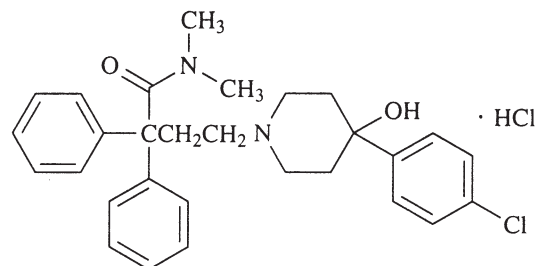
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ロペラミド塩酸塩 (Loperamide Hydrochloride)
化学名：4-[4-(p-chlorophenyl)-4-hydroxy-1-piperidyl]-N, N-dimethyl-2, 2-diphenylbutyramide hydrochloride

分子式：C₂₉H₃₃ClN₂O₂ · HCl

分子量：513.50

構造式：



融点：約225°C（分解）

性状：白色～微黄色の結晶性の粉末である。

酢酸（100）又はクロロホルムに溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすく、水、無水酢酸又はイソプロパノールに溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

※【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

カグダリン細粒 0.1%

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、カグダリン細粒 0.1%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。

カグダリンカプセル 1mg

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、41 ヶ月）の結果、カグダリンカプセル 1mg は通常の市場流通下において 3 年 5 ヶ月間安定であることが確認された。

【包 装】

カグダリン細粒 0.1%：（バラ）100g

カグダリンカプセル 1mg：(PTP) 100 カプセル
500 カプセル

※【主要文献】

- 1) カグダリン細粒 0.1%及びカグダリンカプセル 1mg の溶出挙動（寿製薬株式会社社内資料）
- 2) カグダリン細粒の生物学的同等性試験（薬理作用についての比較試験）（寿製薬株式会社社内資料）
- 3) カグダリン細粒 0.1%及びカグダリンカプセル 1mg の安定性試験（寿製薬株式会社社内資料）

※【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

寿 製 薬 株 式 会 社 開 発 部
〒 389-0697 長野県埴科郡坂城町大字坂城 6351
TEL：0268-82-2211 FAX：0268-82-2215

製造販売元  寿製薬株式会社
長野県埴科郡坂城町大字上五明字東川原 198

11.121