

ポラチール[®] 1mg 錠
ポラチール[®] 2mg 錠
ポラチール[®] 3mg 錠

PORATILE 1mg TAB.
PORATILE 2mg TAB.
PORATILE 3mg TAB.

(オキシブチニン塩酸塩製剤)

貯 法：室温保存
 使用期限：外箱に記載

	1mg	2mg	3mg
承認番号	22200AMX00560000	20800AMZ00485000	20800AMZ00486000
薬価収載	2010. 11	1996. 07	1996. 07
販売開始	2010. 11	1996. 07	1996. 07

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) 緑内障の患者〔眼圧の上昇を招き、症状を悪化させるおそれがある。〕
- (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（「6. 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

【組成・性状】

販売名	ポラチール 1mg 錠		
成分・含量	1錠中オキシブチニン塩酸塩 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、結晶セルロース、ステアリン酸 Mg、ヒプロメロース、マクロゴール、酸化チタン		
色・剤形	白色のフィルムコート錠		
外形	表面	裏面	側面
大きさ	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
	7	約 3	135
識別コード	KTB 114		

販売名	ポラチール 2mg 錠		
成分・含量	1錠中オキシブチニン塩酸塩 2mg		
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸 Mg、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、マクロゴール、酸化チタン		
色・剤形	白色の割線入りフィルムコート錠		
外形	表面	裏面	側面
大きさ	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
	7.1	3.5	135
識別コード	KTB 22		

販売名	ポラチール 3mg 錠		
成分・含量	1錠中オキシブチニン塩酸塩 3mg		
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸 Mg、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、マクロゴール、酸化チタン		
色・剤形	白色の割線入りフィルムコート錠		
外形	表面	裏面	側面
大きさ	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
	7.1	3.5	135
識別コード	KTB 23		

【効能・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）

【用法・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。

【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）

- (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。〕

2. 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。

3. 相互作用

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。

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) **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) **麻痺性イレウス** 麻痺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。

※※(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
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、嘔声、眼乾燥、潮紅等

5. 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。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 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。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳中の婦人には投与しないこと。〔動物実験で乳汁への移行が報告されている。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8. 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。〕

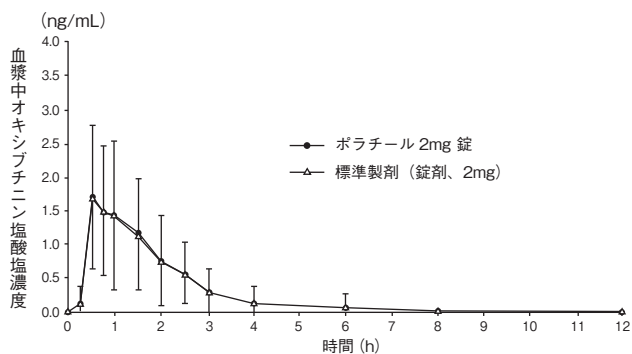
【薬物動態】

生物学的同等性¹⁾

ポラチール 2mg 錠と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠（オキシブチニン塩酸塩 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（AUCt、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。

	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ポラチール 2mg 錠	3.09±2.14	2.10±1.07	0.75±0.46	0.81±0.48
標準製剤（錠剤、2mg）	3.09±2.12	2.07±1.07	0.71±0.41	0.79±0.43

(Mean±S.D., n=14)

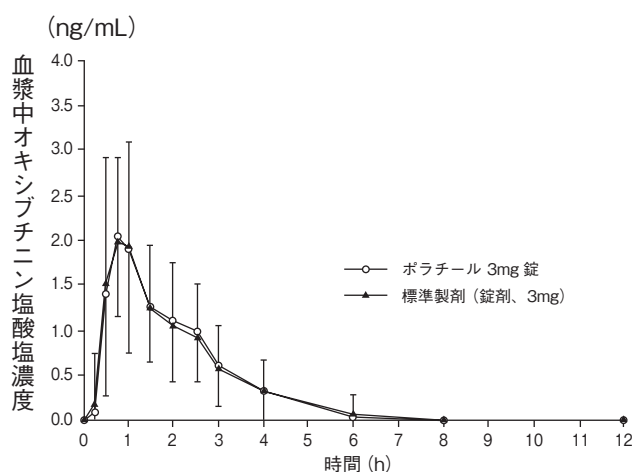


血漿中濃度並びに AUCt、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

ポラチール 3mg 錠と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（オキシブチニン塩酸塩 3mg）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（AUCt、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。

	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ポラチール 3mg 錠	4.30±2.20	2.51±1.20	0.77±0.21	0.97±0.63
標準製剤 (錠剤, 3mg)	4.35±2.23	2.60±1.27	0.77±0.21	1.01±0.55

(Mean±S.D., n=14)



血漿中濃度並びに AUCt、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。

ポラチール 1mg 錠は「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（平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査発第 1124004 号）」に基づき、ポラチール 2mg 錠を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

溶出挙動²⁾

ポラチール 1mg 錠、ポラチール 2mg 錠及びポラチール 3mg 錠は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたオキシブチニン塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オキシブチニン塩酸塩

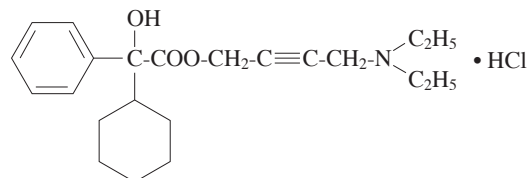
(Oxybutynin Hydrochloride)

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

分子式：C₂₂H₃₁NO₃・HCl

分子量：393.95

構造式：



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（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。水溶液（1→50）は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

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、ポラチール 1mg 錠、ポラチール 2mg 錠及びポラチール 3mg 錠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。

【包装】

ポラチール 1mg 錠：(PTP) 100 錠

ポラチール 2mg 錠：(PTP) 100 錠

ポラチール 3mg 錠：(PTP) 100 錠

【主要文献】

- 1) 寿製薬株式会社社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 寿製薬株式会社社内資料：溶出試験
- 3) 寿製薬株式会社社内資料：安定性試験

【文献請求先】

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

13.9 J