

頻尿治療剤

アポラキート[®]錠200mg

《フラボキサート塩酸塩錠》
 APOLAKEAT[®] TABLETS 200mg




貯 法：室温保存
 使用期限：外箱、ラベルに記載

日本標準商品分類番号 87259			
承認番号	薬価収載	販売開始	再評価(品質)
21800AMX10637	2006年12月	1987年10月	2001年12月

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- 1) 幽門、十二指腸及び腸管が閉塞している患者〔弱い副交感神経抑制作用により、腸管運動が抑制される。〕
- 2) 下部尿路に高度の通過障害のある患者〔弱い副交感神経抑制作用があるので、排尿筋を弛緩、膀胱括約筋を収縮させるおそれがある。〕

※【組成・性状】

1錠中の有効成分	日局 フラボキサート塩酸塩 ……………200mg		
添加物	セルロース、無水ケイ酸、クエン酸、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースCa、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、タルク、マクロゴール、酸化チタン		
性状	白色の胃溶性フィルムコーティング錠		
識別コード	本体	Tw/FB(表/裏)	
	包装	Tw, FB	
※ 外形	表	裏	側面
			
	錠径(mm)	9.1	
※ 厚さ(mm)	4.7		
※ 質量(mg)	255		

【効能・効果】

下記疾患に伴う頻尿、残尿感
 神経性頻尿、慢性前立腺炎、慢性膀胱炎

【用法・用量】

通常成人1回1錠、1日3回経口投与する。
 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) 緑内障の患者〔弱い副交感神経抑制作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させるおそれがある。〕
 - 2) 肝障害あるいはその既往歴のある患者〔副作用として肝障害が報告されている。〕
2. 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（頻度不明）
 - (1) 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、蕁麻疹、冷汗、呼吸困難、喉頭浮腫、血圧低下等の異常が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- (2) 肝機能障害、黄疸（初期症状：全身けん怠感、食欲不振、発熱、そう痒、眼球黄染等）：AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、Al-P、ビリルビンの著しい上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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し、適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
消化器	胃部不快感、食欲不振、悪心、口渇、下痢、便秘、嘔吐、胃痛、腹痛、胸やけ等
過敏症 ^{注)}	発疹、そう痒感等の過敏症状
精神神経系	ねむけ、不眠、頭痛、めまい、頭部のふらふら感、しびれ感等
眼	つかれ目、眼圧亢進、調節障害
血液 ^{注)}	好酸球増多、白血球減少
泌尿器	排尿困難、尿閉
その他	下腹部膨満感、顔面熱感、動悸、胸部不快感、熱感、咽頭部異和感、嗝声等

注) 投与を中止すること。

3. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、減量するなど注意すること。

4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

動物実験（マウス、ラット）で胎児毒性が認められているので、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。

5. 小児等への投与

小児に対する臨床評価及び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。

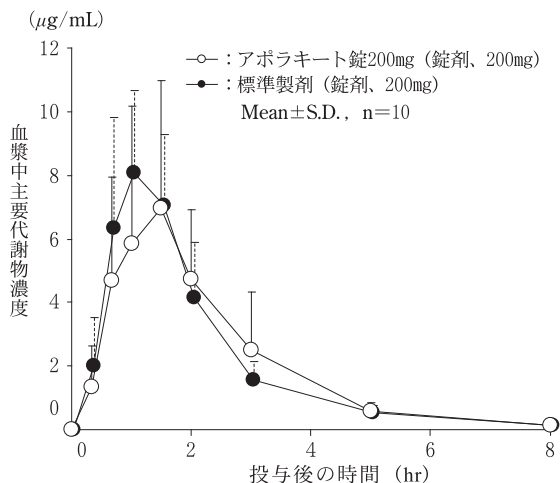
6. 適用上の注意

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】

1. 生物学的同等性試験

アポラキート錠200mgと標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（フラボキサート塩酸塩として200mg）健康成人男子（n=10）に絶食単回経口投与して主要代謝物である3-methylflavone-8-carboxylic acidの血漿中濃度を測定し、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（昭和55年5月30日 薬審第718号に基づく）¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₈ (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
アポラキート錠200mg (錠剤, 200mg)	16.92 ± 3.06	9.76 ± 2.02	1.43 ± 0.69	1.34 ± 0.26
標準製剤 (錠剤, 200mg)	16.73 ± 2.89	9.54 ± 1.54	1.17 ± 0.30	1.45 ± 0.25

(Mean ± S. D., n=10)

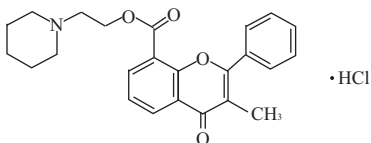
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

アポラキート錠200mgは、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩酸フラボキサート錠の溶出規格に適合していることが確認されている²⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：フラボキサート塩酸塩 (Flavoxate Hydrochloride)

別名：塩酸フラボキサート

化学名：2-(Piperidin-1-yl)ethyl 3-methyl-4-oxo-2-phenyl-4H-chromene-8-carboxylate monohydrochloride

分子式：C₂₄H₂₅NO₄ · HCl

分子量：427.92

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。酢酸(100)又はクロロホルムにやや溶けにくく、水又はエタノール(95)に溶けにくく、アセトニトリル又は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

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、アポラキート錠200mg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³⁾。

【包装】

アポラキート錠200mg：100錠、1000錠 (PTP)
1000錠 (バラ)

※【主要文献】

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター(24時間受付対応)

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



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