

# ※ オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」

## OXATOMIDE Syrup for pediatric 0.2% [Pfizer]

### オキサトミドシロップ

貯法：室温保存  
使用期限：最終年月を外箱等に記載  
(取扱い上の注意参照)

※ 承認番号	22700AMX00228
※ 薬価収載	2015年6月
※ 販売開始	1998年7月

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔妊婦、産婦、授乳婦等への投与〕の項参照]

#### ※【組成・性状】

##### 1. 組成

1 mL中：

成分	販売名	オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」
有効成分		オキサトミド 2.0mg
添加物		D-ソルビトール、結晶セルロース、カルメロースナトリウム、ポビドン、ポリソルベート80、ソルビタンセスキオレイン酸エステル、安息香酸ナトリウム、亜硫酸水素ナトリウム、ジメチルポリシロキサン（内服用）、香料、pH調整剤

##### 2. 性状

本剤は白色の水懸濁液で特異なおいがあり、味は甘く、pHは次のとおりである。

pH	3.0～5.0
----	---------

#### 【効能・効果】

小児：気管支喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、痒疹

#### 【用法・用量】

通常、小児には1回オキサトミドとして0.5mg/kg（シロップとして0.25mL/kg）を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、1回最高用量はオキサトミドとして0.75mg/kg（シロップとして0.375mL/kg）を限度とする。

#### ※※【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) 肝障害又はその既往歴のある患者〔肝障害が悪化又は再燃するおそれがある。〕
- (2) 幼児〔小児等への投与〕の項参照]

##### 2. 重要な基本的注意

- (1) 眠気を催すことがあるので、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は従事させないよう十分注意すること。
- (2) 本剤は気管支拡張剤並びに全身性ステロイド剤と異なり、既に起こっている喘息発作を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことは患者に十分注意しておく必要がある。
- (3) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (4) 本剤により、末梢血中好酸球が増加することがあるので、このような場合には経過観察を十分に行うこと。

##### 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
アルコール性飲料 中枢神経抑制剤 麻薬性鎮痛剤 鎮静剤 催眠剤等	眠気、倦怠感等が強くあらわれるおそれがある。	相加的に作用する。

#### 4. 副作用

総症例80例中、2例（2.5%）に眠気が認められた。（承認時）

##### (1) 重大な副作用

1) 肝炎、肝機能障害（0.5%）、黄疸：AST（GOT）、ALT（GPT）、γ-GTP、ビリルビン、Al-P、LDHの著しい上昇等を伴う肝炎、肝機能障害、黄疸（初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気・嘔吐等）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) ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、全身紅潮、咽頭・喉頭浮腫等の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。

※※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）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。

4) 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) その他の副作用

下記のような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減量・休薬等の適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
錐体外路症状 <sup>注1)</sup>		硬直（口周囲、四肢）、眼球偏位、後屈頸、攣縮、振戦	
過敏症 <sup>注2)</sup>	発疹	浮腫（顔面、手足等）	
内分泌		月経障害、乳房痛	女性化乳房 <sup>注2)</sup>
精神神経系	眠気、倦怠感、口渴	頭痛・頭重、めまい・ふらつき・立ちくらみ、しびれ感	
泌尿器			膀胱炎様症状（頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等）、排尿困難
消化器	嘔気・嘔吐、胃部不快感、下痢	便秘、胃痛、腹痛、食欲不振、食欲亢進、にがみ、腹部不快感、口内炎、舌のあれ	
循環器		動悸	
その他	好酸球増多	ほてり、鼻出血	発熱

注1：このような症状が発現した場合には、必要に応じて抗パーキンソン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

注2：このような場合には投与を中止すること。

#### 5. 高齢者への投与

本剤は、主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能が低下していることが多いので、慎重に投与すること。

#### 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。〔動物実験（ラット）で口蓋裂、合指症、指骨の形成不全等の奇形作用が報告されている。〕

(2) 授乳婦に投与する場合には、授乳を中止させること。〔動物実験（イヌ）で乳汁移行が認められている。〕

## 7. 小児等への投与

幼児（特に2歳以下）において錐体外路症状が発現するおそれがあるため、過量投与を避けること。

## 8. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与は、アレルギー皮内反応を抑制し、アレルギーの確認に支障を来すので、アレルギー皮内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。

## 9. 過量投与

頸部硬直等の錐体外路症状、痙攣、意識障害、傾眠、血圧低下、洞性徐脈、縮瞳等が発現した例があるので、過量に服用した場合には、支持・対症療法等適切な処置を行うこと。

## 10. 適用上の注意

### 他の液シロップ剤との混合

本剤は、他の液シロップ剤と混合した場合に分散性が低下するので、配合しないこと（正確な用量調整が困難である）。

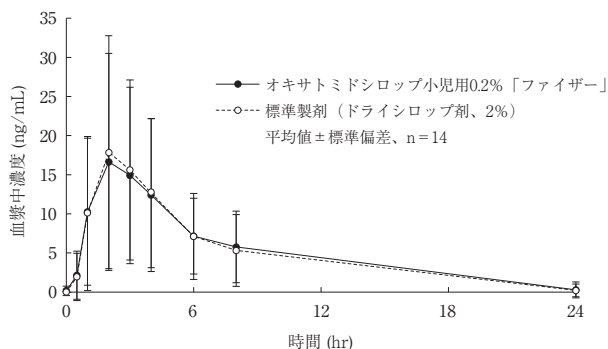
## ※【薬物動態】

### 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」30mLと標準製剤（ドライシロップ剤、2%）3.0g（それぞれオキサトミドとして60mg）をクロスオーバー法により健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中オキサトミド濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C<sub>max</sub>）の平均値の差は標準製剤の20%以内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-24</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
オキサトミドシロップ 小児用0.2%「ファイザー」	127.40±103.88	17.12±13.68	2.57±0.65	4.76±1.70
標準製剤 (ドライシロップ剤、2%)	124.85±104.84	18.24±14.63	2.36±0.63	3.58±1.33

(平均値±標準偏差、n=14)



血漿中濃度並びにAUC、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。

## 【臨床成績】

### 1. 気管支喘息<sup>2)</sup>

国内2施設で実施された臨床試験での有用率（有用以上）は、62.5%（25/40）であった。

### 2. アトピー性皮膚炎<sup>3)</sup>

国内2施設で実施された臨床試験での有用率（有用以上）は、60.0%（24/40）であった。

## 【薬効薬理】

### 1. ケミカルメディエーターの遊離抑制作用

アレルギー反応による肥満細胞からのケミカルメディエーター（ヒスタミン、ロイコトリエン等）の遊離を抑制する。

ロイコトリエンに対しては合成酵素5-lipoxygenaseに対する阻害作用を示す。

### 2. ケミカルメディエーター拮抗作用

遊離したケミカルメディエーター（ロイコトリエン、ヒスタミン、セロトニン、アセチルコリン、ブラディキニン）に対する拮抗作用も認められている。

血小板活性化因子（PAF）による気道抵抗上昇に対しても抑制作用を示す。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

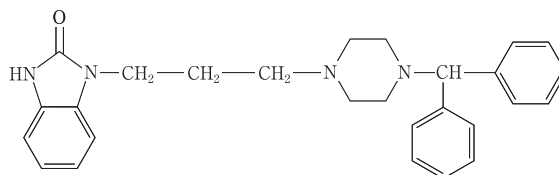
一般名：オキサトミド（Oxatamide）

化学名：1-[3-[4-(Diphenylmethyl)-1-piperazinyl]propyl]-2-benzimidazol-2(3H)-one

分子式：C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O

分子量：426.55

構造式：



性状：白色～微黄白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）にやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点：155～161℃

## ※【取り扱い上の注意】

1. 使用期限内であっても、開栓後は速やかに使用すること。

2. 用時よく振って用いること。

### 3. 安定性試験<sup>4)</sup>

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」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】

オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」：500mL

## ※【主要文献】

- 社内資料：生物学的同等性試験（オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」） [L20140303087]
- 豊田 茂ほか：医学と薬学 36(4)：655-662, 1996 [L20131024017]
- 豊田 茂ほか：医学と薬学 36(4)：647-654, 1996 [L20131024018]
- 社内資料：安定性試験（加速試験）（オキサトミドシロップ小児用0.2%「ファイザー」） [L20140303086]

## 【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ください。

ファイザー株式会社 製品情報センター  
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7  
学術情報ダイヤル 0120-664-467  
FAX 03-3379-3053

## 【製造販売元】

マイラン製薬株式会社  
大阪市中央区本町2丁目6番8号

## 【販売】

ファイザー株式会社  
東京都渋谷区代々木3-22-7

