

※※2018年4月改訂(第3版)
※2014年8月改訂

粘膜防御性 胃炎・胃潰瘍治療剤

日本標準商品分類番号
872329

セトラキサート塩酸塩

カプセル200mg「YD」

セトラキサート塩酸塩

細粒40%「YD」

CETRAXATE HYDROCHLORIDE CAPSULES
CETRAXATE HYDROCHLORIDE FINE GRANULES

(セトラキサート塩酸塩製剤)

	カプセル200mg	細粒40%
承認番号	22500AMX00513	22500AMX00514
薬価収載	2013年6月	2013年6月
販売開始	2013年6月	2013年6月

貯法：室温保存、気密容器
使用期限：外箱に表示の使用期限内に
使用すること。
注意：取扱い上の注意の項参照。

[組成・性状]

1. 組成

セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」
1カプセル中、セトラキサート塩酸塩200mgを含有する。
添加物として、デキストリン、ステアリン酸Mg、カルナウバロウ、ゼラチン、酸化チタン、ラウリル硫酸Na、青色1号を含有する。

セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」
1g中、セトラキサート塩酸塩400mgを含有する。
添加物として、D-マンニトール、ポビドン、ヒプロメロース、エチルセルロース、ハッカ油を含有する。

2. 性状

セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」
キャップ部が青色不透明、ボディ部が白色不透明の硬カプセル剤である。

	外形	サイズ	識別コード(PTP)
セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」		2号カプセル	YD 386

セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」
白色～微黄白色の細粒剤で、味はわずかに甘く清涼感がある。
識別コード：YD492

[効能・効果]

- 下記の疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善
急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期
- 胃潰瘍

[用法・用量]

通常成人は、セトラキサート塩酸塩として1回200mg(1カプセル又は細粒0.5g)1日3～4回食後及び就寝前に経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

[使用上の注意]

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
 - (1)血栓のある患者(脳血栓、心筋梗塞、血栓性静脈炎等)
[本剤は代謝されてトラネキサム酸を生じるので、血栓を安定化させるおそれがある。]
 - (2)消費性凝固障害のある患者
[本剤は代謝されてトラネキサム酸を生じるので、血栓を安定化させるおそれがある。]
- 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。
下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
消化器	口渇、悪心・嘔吐、下痢、便秘、胃部不快感・膨満感
過敏症	発疹、そう痒感
その他	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇等

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある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。
[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

4. 適用上の注意

薬剤交付時(カプセルのみ)
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報告されている)

[薬物動態]

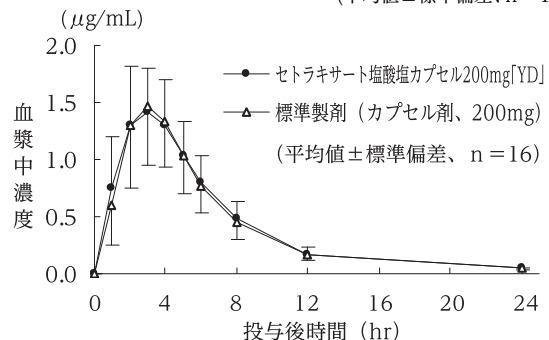
セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」

(1)生物学的同等性試験

セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル(セトラキサート塩酸塩として200mg)、健康成人男子16名に絶食単回経口投与してセトラキサートの代謝物である血漿中トラネキサム酸濃度を測定した。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。¹⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」	10.10±2.46	1.52±0.49	2.8±0.9	4.1±0.3
標準製剤 (カプセル剤、200mg)	9.75±1.97	1.59±0.47	2.8±0.8	4.1±0.3

(平均値±標準偏差、n=16)



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

セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩酸セトラキサート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。

セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」

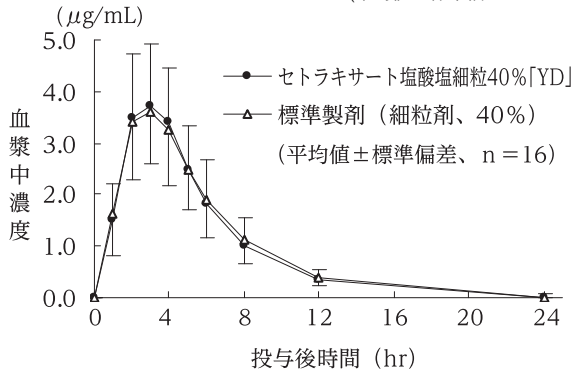
(1) 生物学的同等性試験

セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1.5g(セトラキサート塩酸塩として600mg)、健康成人男子16名に絶食単回経口投与してセトラキサートの代謝物である血漿中トラネキサム酸濃度を測定した。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。²⁾

(注)本剤の承認された用法・用量は「通常成人は、セトラキサート塩酸塩として1回200mg(細粒0.5g)1日3～4回食後及び就寝前に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」	23.2±5.9	4.03±1.19	2.8±0.8	2.7±0.9
標準製剤 (細粒剤、40%)	23.6±7.2	3.79±1.03	2.9±0.8	2.6±0.3

(平均値±標準偏差、n=16)



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

セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩酸セトラキサート細粒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：セトラキサート塩酸塩

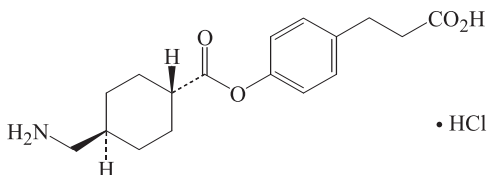
(Cetraxate Hydrochloride)

化学名：3-[4-[trans-4-(Aminomethyl)cyclohexyl-carbonyloxy]phenyl]propanoic acid monohydrochloride

分子式：C₁₇H₂₃NO₄・HCl

分子量：341.83

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノールにやや溶けやすく、水又はエタノール(95)にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

融点：約236℃(分解)

[取扱い上の注意]

セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」

(1) 保管方法

湿気を避けて保存して下さい。

(2) 安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」

(1) 保管方法

湿気を避けて保存して下さい。

(2) 安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。⁴⁾

[包装]

セトラキサート塩酸塩カプセル200mg「YD」

PTP：100カプセル、1000カプセル

バラ：1000カプセル

セトラキサート塩酸塩細粒40%「YD」

SP：0.5g×1200包

バラ：1000g

[主要文献]

- 1) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験
- 2) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験
- 3) (株)陽進堂社内資料：安定性試験
- 4) (株)陽進堂社内資料：安定性試験

※※[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。

株式会社 陽進堂 お客様相談室
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号
☎ 0120-647-734

製造販売元

 株式会社 陽進堂
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号