



* 2013年8月改訂(第2版)
2012年8月作成

日本標準商品分類番号
872325

H₂受容体拮抗剤

* 日本薬局方 **ラフチジン錠**

ラフチジン錠5mg「TCK」 ラフチジン錠10mg「TCK」

LAFUTIDINE

貯法：気密容器、室温保存（【取扱い上の注意】の項参照）
使用期限：外装に表示

	錠 5mg	錠 10mg
承認番号	22400AMX01349000	22400AMX01350000
薬価収載	2012年12月	2012年12月
販売開始	2013年1月	2013年1月

【 禁忌 】(次の患者には投与しないこと)







本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

【 組成・性状 】

ラフチジン錠 5mg 「TCK」は1錠中にラフチジン(日局)を5mg含有する。

ラフチジン錠 10mg 「TCK」は1錠中にラフチジン(日局)を10mg含有する。

添加物としてそれぞれに、乳糖水和物、セルロース、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースNa、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール、タルク、カルナウバロウを含有する。

販売名	外 形			色 調 剤 形	識別コード
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)		
ラフチジン錠 5mg 「TCK」	 5.6	 2.7	 68	白色 フィルムコー ティング錠	TU 241
ラフチジン錠 10mg 「TCK」	 6.1	 2.8	 86	白色 フィルムコー ティング錠	TU 242

【 効能又は効果 】

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎
- 下記疾患の胃粘膜病変(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
- 麻酔前投薬

【効能又は効果に関連する使用上の注意】

重症(ロサンゼルス分類 Grade C又はD)の逆流性食道炎に対する有効性及び安全性は確立していない。

【 用法及び用量 】

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎
通常、成人にはラフチジンとして1回10mgを1日2回(朝食後、夕食後または就寝前)経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。
- 下記疾患の胃粘膜病変(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
通常、成人にはラフチジンとして1回10mgを1日1回(夕食後または就寝前)経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。
- 麻酔前投薬
通常、成人にはラフチジンとして1回10mgを手術前日就寝前及び手術当日麻酔導入2時間前の2回経口投与する。

【用法及び用量に関連する使用上の注意】

透析患者では非透析時の最高血中濃度が健康人の約2倍に上昇することが報告されているので、低用量から慎重に投与すること。

【 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) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- (2) 肝障害のある患者 [症状が悪化するおそれがある。]
- (3) 腎障害のある患者 [症状が悪化するおそれがある。]
- (4) 透析患者 [血中濃度の上昇が報告されている。]
- (5) 高齢者 [「高齢者への投与」の項参照]

2. 重要な基本的注意

治療にあたっては経過を十分に観察し、病状に応じ治療上必要最小限の使用にとどめ、本剤で効果がみられない場合には他の療法に切りかえること。なお、血液像、肝機能、腎機能等に注意すること。

3. 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を起こすことがあるので、観察を十分に行い、顔面蒼白、血圧低下、全身発赤、呼吸困難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。
- 2) 肝機能障害、黄疸：AST (GOT)、ALT (GPT)、γ-GTPの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。
- 3) 無顆粒球症、血小板減少：無顆粒球症(初期症状：咽頭痛、全身倦怠感、発熱等)、血小板減少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投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) 重大な副作用【類薬】(頻度不明)

他のH₂受容体拮抗剤で、汎血球減少症、再生不良性貧血、間質性腎炎、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell症候群)、横紋筋融解症、房室ブロック等の心ブロック、不全収縮が報告されている。

(3) その他の副作用

次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減量、休薬等の適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
過 敏 症	発疹、蕁麻疹、痒疹
血 液	白血球数増加、赤血球数減少、好酸球上昇、白血球数減少、ヘモグロビン減少、ヘマトクリット減少
肝 臓	ALT (GPT) 上昇、AST (GOT) 上昇、Al-P 上昇、γ-GTP 上昇、LDH 上昇、T-Bil 上昇、TTT 上昇
腎 臓	尿タンパク異常、BUN 上昇
精神神経系 ^{注)}	頭痛、不眠、眠気、めまい、可逆性の錯乱状態、幻覚、意識障害
循 環 器	動悸、熱感、顔面紅潮
消 化 器	便秘、下痢、硬便、嘔気・嘔吐、口渇、食欲不振、腹部膨満感
そ の 他	血清尿酸値上昇、生理遅延、Na 上昇、K 低下、Cl 上昇、浮腫、女性化乳房、倦怠感

注) 他のH₂受容体拮抗剤で、痙攣があらわれたとの報告がある。

4. 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、用量あるいは投与間隔に留意するなど、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

5. 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治療上の有益性が危険性を上回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。]
- (2) 投薬中は授乳させないよう注意すること。[動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。]

6. 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。[使用経験がない。]

7. 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。)

8. その他の注意

本剤の投与が胃痛による症状を隠蔽することがあるので、悪性でないことを確認のうえ投与すること。

【薬物動態】

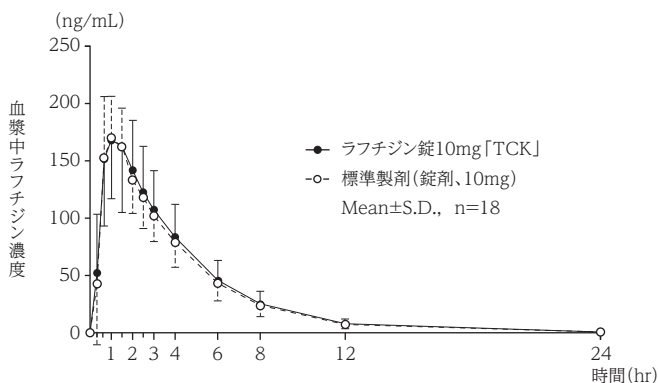
生物学的同等性試験

ラフチジン錠10mg「TCK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(ラフチジン10mg)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(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

また、ラフチジン錠5mg「TCK」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日薬食審査発第1124004号)」に基づき、ラフチジン錠10mg「TCK」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。¹⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→24 hr} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ラフチジン錠 10mg「TCK」	792.07±244.42	189.54±51.35	1.03±0.41	2.66±0.61
標準製剤 (錠剤、10mg)	759.23±198.44	182.36±36.17	0.96±0.33	2.61±0.59

(Mean±S.D.,n=18)



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。

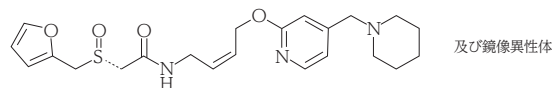
* 溶出挙動

ラフチジン錠5mg「TCK」及びラフチジン錠10mg「TCK」は、日本薬局方医薬品各条に定められた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】

一般名：ラフチジン (Lafutidine)
化学名：2-[(RS) -Furan-2-ylmethylsulfinyl]-N-(4-[4-(piperidin-1-ylmethyl) pyridin-2-yl]oxy- (2Z) -but-2-en-1-yl]acetamide
分子式：C₂₂H₂₉N₃O₄S
分子量：431.55

構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

酢酸(100)に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

メタノール溶液(1→100)は旋光性を示さない。

結晶多形が認められる。

【取扱い上の注意】

開封後室内散乱光下において、わずかに着色傾向が認められたため、開封後の保存に注意すること。

安定性試験

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ラフチジン錠5mg「TCK」及びラフチジン錠10mg「TCK」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】

ラフチジン錠5mg「TCK」：100錠(PTP)

ラフチジン錠10mg「TCK」：100錠(PTP) 500錠(PTP・バラ)

* 【主要文献】

- 1) 辰巳化学株式会社：生物学的同等性試験
- 2) 辰巳化学株式会社：溶出試験
- 3) 辰巳化学株式会社：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は下記にご請求下さい。

辰巳化学株式会社 薬事・学術課
〒921-8164 金沢市久安3丁目406番地
TEL 076-247-2132
FAX 076-247-5740



製造販売元
辰巳化学株式会社
金沢市久安3丁目406番地