

**2018年6月改訂(第2版)
*2018年2月改訂(第1版、販売名変更に伴う改訂)

TRO(T)①

貯法：錠－室温保存、気密容器
細粒－室温保存、気密容器（開封後は湿気を避けて保存して下さい。）
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。

日本標準商品分類番号		
8 7 2 3 2 9		
	トロキシピド錠 100mg「オーハラ」	トロキシピド細粒 20%「オーハラ」
承認番号	23000AMX00080000	23000AMX00082000
薬価収載	2018年6月	2018年6月
販売開始	1994年7月	1996年7月

注：旧販売名 トロキシ[®]錠100mg
トロキシ[®]細粒20%

胃炎・胃潰瘍治療剤

日本薬局方 トロキシピド錠

***トロキシピド錠100mg「オーハラ」**

日本薬局方 トロキシピド細粒

***トロキシピド細粒20%「オーハラ」**

***TROXIPIDE TABLETS 100mg「OHARA」**

***TROXIPIDE FINE GRANULES 20%「OHARA」**

*【組成・性状】

販売名	トロキシピド錠100mg「オーハラ」		
成分・含量	1錠中日局トロキシピド100mgを含有		
添加物	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール1500、酸化チタン		
色調・剤形	白色・フィルムコーティング錠		
外形	表面	裏面	側面
	直径：7.1mm 厚さ：3.5mm		
重量(約)	140mg		
識別コード	トロキシ100		

販売名	トロキシピド細粒20%「オーハラ」		
成分・含量	1g中日局トロキシピド200mgを含有		
添加物	乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロース、セタノール、ラウリル硫酸ナトリウム、タルク、クエン酸トリエチル、ヒプロメロース、含水二酸化ケイ素		
色調・剤形	白色～微黄色・細粒剤		
識別コード	OH-235(分包剤)		

【効能・効果】

- 胃潰瘍
- 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

【用法・用量】

通常、成人にはトロキシピドとして1回100mg(錠剤1錠又は細粒剤0.5g)を1日3回食後に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 副作用

トロキシピド製剤の投与症例における副作用は、0.75% (91症例/12,092症例)に認められ、その主なものは便秘(0.19%)、下痢(0.02%)、嘔気・嘔吐(0.02%)、胸やけ(0.02%)等の消化器障害や発疹・痒痒感等(0.06%)の皮膚障害が認められている(厚生省薬務局発表、平成5年度「新医薬品等の副作用のまとめ」より)¹⁾。

(1)重大な副作用

- 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、蕁麻疹、呼吸困難、血圧低下等の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)肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、ALP、 γ -GTP、LDHの上昇等を伴う肝機能障害や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

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器	便秘	腹部膨満感、 胸やけ、嘔気 等	
過敏症		痒痒、発疹 等	
その他		頭重感、動悸、 全身倦怠感 等	浮腫

自発報告によるものについては頻度不明

2. 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ので、注意すること。

3. 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が確立していない。〕
- (2)本剤投与中は授乳を避けさせること。〔ラットにおいて乳汁への移行が認められている。〕

4. 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。(使用経験が少ない。)

5. 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。〕

6. その他の注意

- (1)ラット亜急性毒性試験で臨床用量の170倍(1,000mg/kg/日)以上を経口投与したとき、膀胱での炎症及び出血によると考えられる尿潜血が対照群に比較して多いという報告がある。

(2)動物実験でプロラクチン分泌異常に由来すると推定される性周期の乱れが報告されているので、月経異常、乳汁分泌などの観察を十分に行い、異常が認められた場合には、休薬又は中止等の適切な処置を行うこと。

【薬物動態】

* 1. 生物学的同等性試験

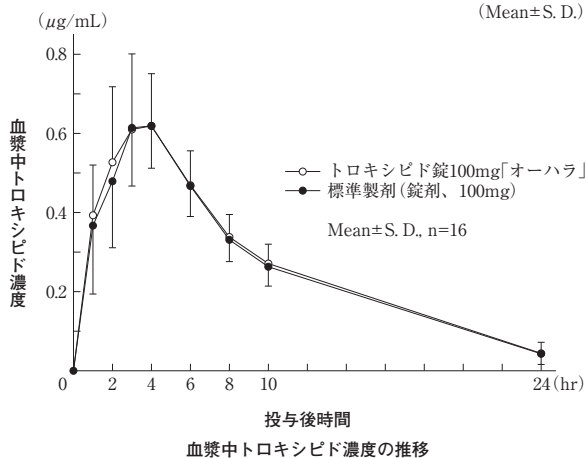
トロキシピド錠100mg「オーハラ」と標準製剤を、又はトロキシピド細粒20%「オーハラ」と標準製剤を、クロスオーバー法により1錠又は0.5g(いずれもトロキシピドとして100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された^{2),3)}。

(1)トロキシピド錠100mg「オーハラ」

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₂₄ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
トロキシピド錠 100mg「オーハラ」	16	6.54±0.99	0.71±0.13	3.1±1.2	5.9±0.8
標準製剤 (錠剤、100mg)	16	6.39±1.05	0.69±0.14	3.3±1.3	5.6±1.0

(Mean±S. D.)

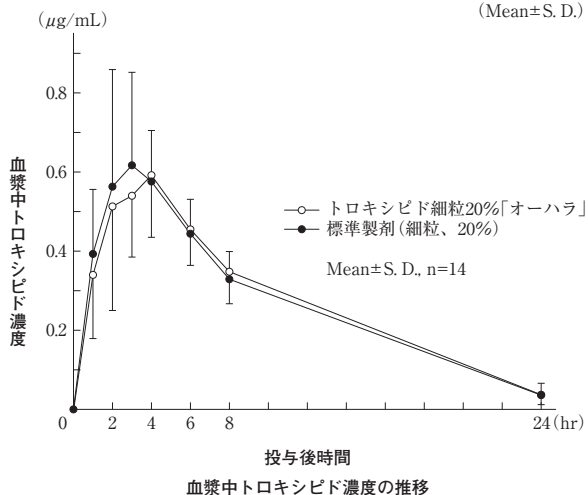


(2)トロキシピド細粒20%「オーハラ」

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₂₄ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
トロキシピド細粒 20%「オーハラ」	14	6.62±1.02	0.67±0.16	3.5±1.2	5.5±1.1
標準製剤 (細粒、20%)	14	6.57±1.40	0.71±0.20	2.9±1.3	5.4±0.8

(Mean±S. D.)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、血液の採取回数・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

トロキシピド錠100mg「オーハラ」及びトロキシピド細粒20%「オーハラ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたトロキシピド錠及びトロキシピド細粒の溶出規格に適合していることが確認されている⁴⁾。

【臨床成績】^{5),6)}

1. 胃炎に対する効果

二重盲検比較試験を含む臨床試験にて、急性胃炎又は慢性胃炎の急性胃粘膜病変に対し82.9%(257/310)の全般改善率が認められた。

2. 胃潰瘍に対する効果

塩酸セトラキサートを対照薬とした多施設二重盲検比較試験での胃潰瘍に対する4週治癒率は14%(対照19%)、8週治癒率は45%(対照49%)、12週治癒率は58%(対照56%)と優れた防御因子製剤であることが認められた。

【薬効薬理】^{5),6)}

1. 実験胃炎に対する治療及び予防作用

タウロコール酸ナトリウムによって惹起されるラットの実験的慢性萎縮性胃炎に対し治療及び予防効果を示した。

2. 急性胃粘膜病変抑制作用

ラットでのアスピリン、0.6N塩酸及び無水エタノール等での急性胃粘膜損傷に対し抑制作用を示した。

3. 胃粘膜組織修復作用

ラットでの各種実験潰瘍の組織学的検討で、胃粘膜再生と潰瘍底膠原線維の発育の促進と慢性潰瘍の治療の促進作用が認められた。

4. 抗潰瘍作用

ラットでのストレス、レセルピン、インドメタシン、アスピリン、ステロイド等の実験潰瘍での試験で、潰瘍の発生を抑制し、抗潰瘍効果と粘膜保護作用を示した。

5. 胃粘膜微小循環改善作用

家兎、イヌなどでの実験にて、胃粘膜血流量を増加させ、胃粘膜の循環異常を改善させた。

6. 胃粘膜代謝賦活作用

胃粘膜酸素消費量を増加させ、ATPレベルを上昇させることにより胃粘膜のエネルギー代謝を賦活させる、特に血流量が減少している潰瘍辺縁部粘膜で、その作用が強く認められた(ラット)。

7. 胃粘膜構成成分正常化作用

胃粘膜に含まれるムコ多糖体を増加させ、又、抗炎症薬やストレス負荷によるムコ多糖体の減少を抑制し、胃粘膜バリアーを増強させる(ラット)。

8. 胃粘膜内プロスタグランジン量増加作用

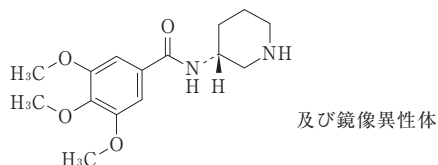
胃粘膜内で細胞保護作用のあるプロスタグランジンの量を増加させる(ラット)。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：トロキシピド(Troxipide)

化学名：3,4,5-Trimethoxy-N-[(3RS)-piperidin-3-yl]benzamide

構造式：



分子式：C₁₅H₂₂N₂O₄

分子量：294.35

性状：本品は白色の結晶性の粉末である。本品は無臭で、味は苦い。

本品は酢酸(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、水に溶けにくい。

本品は0.1mol/L塩酸試液に溶ける。

本品の1mol/L塩酸試液溶液(1→5)は旋光性を示さない。

融点：177～181℃

*【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(なりゆき温度及び湿度、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、トロキシピド錠100mg「オーハラ」及びトロキシピド細粒20%「オーハラ」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⁷⁾。

*【包装】

トロキシピド錠100mg「オーハラ」：

(PTP) 100錠(10錠×10)

1000錠(10錠×100)

(バラ) 1000錠

トロキシピド細粒20%「オーハラ」：

(H S) 0.5g×600包

(バラ) 100g

1kg(500g×2袋入)[アルミ・ラミネート製スタンドバック包装]

【主要文献】

- 1)厚生省薬務局：平成5年度「新医薬品等の副作用のまとめ」(平成7年3月)
- 2)大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(1991年)
- 3)大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(1994年)
- 4)大原薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験(2000年)
- 5)大阪府病院薬剤師会編：医薬品要覧、第5版、p.844(1992)
- 6)薬事日報社編：最近の新薬、第38集、p.276(1987)
- 7)大原薬品工業株式会社 社内資料：長期安定性試験

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

大原薬品工業株式会社 安全管理部 お客様相談室

〒104-6591 東京都中央区明石町8-1 聖路加タワー36階

☎ 0120-419-363 FAX 03-6740-7702

URL <http://www.ohara-ch.co.jp>



製造販売元

大原薬品工業株式会社

滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121-15

TRO(T)①