

プロトンポンプインヒビター

※ 处方せん医薬品^{注)}

ランソプラゾールOD錠15mg「DK」 ランソプラゾールOD錠30mg「DK」

LANSPRAZOLE

(ランソプラゾール口腔内崩壊錠)

貯 法: 室温保存

使用期限: 包装箱に表示

注) 注意—医師等の処方せんにより使用すること

	15mg	30mg
承認番号	21900AMX00560	21900AMX00561
薬価収載	2007年7月	2007年7月
販売開始	2007年9月	2007年9月
※ 効能追加	2009年4月	2009年4月

【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

- (1) 本剤の成分に対する過敏症の既往歴のある患者
- (2) アザザナビル硫酸塩を投与中の患者(「相互作用」の項参照)

【組成・性状】

販売名	ランソプラゾールOD錠15mg「DK」	ランソプラゾールOD錠30mg「DK」
成分・含量	1錠中ランソプラゾール15mg	1錠中ランソプラゾール30mg
添加物	乳糖水和物、L-アルギニン、ヒプロメロース、D-マンニトール、酸化チタン、タルク、メタクリル酸コポリマー LD、ラウリル硫酸ナトリウム、アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマー、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、クエン酸トリエチル、マクロゴール、ステアリン酸グリセリン、ポリソルベート80、ステアリン酸マグネシウム、カラメル、無水クエン酸、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、香料、プロビレングリコール、エチルバニリン、バニリン、その他3成分	
剤形	白色～帯黄白色の素錠で淡褐色～暗褐色の斑点がある(腸溶性の粒を含む口腔内崩壊錠)	白色～帯黄白色の素錠で淡褐色～暗褐色の斑点がある(腸溶性の粒を含む口腔内崩壊錠)
外形	表面  裏面  側面 	表面  裏面  側面 
重量	340mg	680mg
直径	9.0mm	12.0mm
厚さ	4.7mm	5.4mm
識別コード (包装材料)	LP15	LP30

【効能・効果】

● OD錠15

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群、非びらん性胃食道逆流症、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助

● OD錠30

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助

【用法及び用量】

● 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison症候群の場合

通常、成人にはランソプラゾールとして1回30mgを1日1回経口投与する。

なお、通常、胃潰瘍、吻合部潰瘍では8週間まで、十二指腸潰瘍では6週間までの投与とする。

● 逆流性食道炎の場合

通常、成人にはランソプラゾールとして1回30mgを1日1回経口投与する。なお、通常8週間までの投与とする。さらに、再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法においては、1回15mgを1日1回経口投与するが、効果不十分の場合は、1日1回30mgを経口投与することができる。

※ ● 非びらん性胃食道逆流症の場合(OD錠15mgのみ)

通常、成人にはランソプラゾールとして1回15mgを1日

1回経口投与する。なお、通常4週間までの投与とする。
※ ● 胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助の場合

通常、成人にはランソプラゾールとして1回30mg、アモキシリン水和物として1回750mg(力価)及びクラリスロマイシンとして1回200mg(力価)の3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜增量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。

プロトンポンプインヒビター、アモキシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合は、これに代わる治療として、通常、成人にはランソプラゾールとして1回30mg、アモキシリン水和物として1回750mg(力価)及びメトロニダゾールとして1回250mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

【用法及び用量に関する使用上の注意】

- (1) 逆流性食道炎の維持療法において、1日1回30mgの投与は、1日1回15mg投与中に再発した例など15mgでは効果が不十分な場合に限る。
- (2) 本剤は口腔内で崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないと想定される。唾液又は水で飲み込むこと。(「適用上の注意」の項参照)

【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[本剤の代謝、排泄が遅延することがある。]
- (3) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 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ること。
- (2) 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍に使用する場合は、長期の使用経験は十分でないので、維持療法には用いないことが望ましい。
- (3) 逆流性食道炎の維持療法については、再発・再燃を繰り返す患者に対し投与することとし、本来維持療法の必要のない患者に投与することのないよう留意すること。また、1日1回30mg又は15mgの投与により寛解状態が長期にわたり継続する症例で、減量又は投与中止により再発するおそれがないと判断される場合は1日1回15mgに減量又は中止すること。なお、維持療法中は定期的に内視鏡検査を実施するなど観察を十分に行うことが望ましい。
- (4) 非びらん性胃食道逆流症の治療については、投与開始2週後を目安として効果を確認し、症状の改善傾向が認められない場合には、酸逆流以外の原因が考えられるため他の適切な治療への変更を考慮すること(「その他の注意」の項参照)。

※(5) 非びらん性胃食道逆流症の治療については、問診により胸やけ、呑酸等の酸逆流症状が繰り返しほられること(1週間あたり2日以上)を確認のうえ投与すること。なお、本剤の投与が胃癌、食道癌等の悪性腫瘍及び他の消化器疾患による症状を隠蔽することがあるので、内視鏡検査等によりこれらの疾患でないことを確認すること。

※(6) 本剤を、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助に用いる際には、除菌治療に用いられる他の薬剤の添付文書に記載されている禁忌、慎重投与、重大な副作用等の使用上の注意を必ず確認すること。

3. 相互作用

本剤は主として肝薬物代謝酵素CYP2C19又はCYP3A4で代謝される。

また、本剤の胃酸分泌抑制作用により、併用薬剤の吸收を促進又は抑制することがある。

(1)併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アタザナビル硫酸塩 レイアタツ	アタザナビル硫酸塩の作用を減弱するおそれがある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりアタザナビル硫酸塩の溶解性が低下し、アタザナビルの血中濃度が低下することがある。

(2)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
テオフィリン	テオフィリンの血中濃度が低下することがある。	本剤が肝薬物代謝酵素を誘導し、テオフィリンの代謝を促進することが考えられている。
タクロリムス水和物	タクロリムスの血中濃度が上昇することがある。	本剤が肝薬物代謝酵素におけるタクロリムスの代謝を競合的に阻害するためと考えられている。
ジゴキシン、メチルジゴキシン	左記薬剤の作用を増強する可能性がある。	本剤の胃酸分泌抑制作用によりジゴキシンの加水分解が抑制され、ジゴキシンの血中濃度が上昇する可能性がある。
イトラコナゾール、ゲフィチニブ	左記薬剤の作用を減弱する可能性がある。	本剤の胃酸分泌抑制作用により左記薬剤の血中濃度が低下する可能性がある。
フェニトイント、ジアゼパム	左記薬剤の代謝、排泄が遅延することが類薬（オメプラゾール）で報告されている。	

4. 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) アナフィラキシー反応（全身発疹、顔面浮腫、呼吸困難等）があらわれることがあり、ショックを起こした例もあるので、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) 汎血球減少、無顆粒球症、溶血性貧血、また、顆粒球減少、血小板減少、貧血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。

3) 黄疸、AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇等を伴う重篤な肝機能障害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) 中毒性表皮壊死症（Lyell症候群）、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。

※5) ヘリコバクター・ピロリの除菌に用いるアモキシリン水和物、クラリスロマイシンでは、偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれる

ことがあるので、腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には直ちに投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

6) 間質性肺炎があらわれることがあるので、発熱、咳嗽、呼吸困難、肺音の異常（捻髪音）等があらわれた場合には、速やかに胸部X線等の検査を実施し、本剤の投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

7) 間質性腎炎があらわれ、急性腎不全に至ることもあるので、腎機能検査値（BUN、クレアチニン上昇等）に注意し、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

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群、非びらん性胃食道逆流症の場合

	頻度 不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、瘙痒
肝臓 ^{注2)}	AST(GOT)、ALT(GPT)、AL-P、LDH、γ-GTPの上昇
血液	好酸球增多
消化器	便秘、下痢、口渴、腹部膨満感、恶心、嘔吐、食欲不振、腹痛、カンジダ症、味覚異常、口内炎、舌炎、大腸炎 ^{注3)}
精神神経系	頭痛、眠気、うつ状態、不眠、めまい、振戦
その他	発熱、総コレステロール、尿酸の上昇、女性化乳房 ^{注1)} 、浮腫、倦怠感、舌・口唇のしびれ感、四肢のしびれ感、筋肉痛、脱毛、かすみ目、脱力感、関節痛

注1) このような場合には投与を中止すること。

注2) 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。

注3) 下痢が継続する場合、内視鏡検査では腸管粘膜に異常を認めないが、組織学的に大腸粘膜下に膠原線維束の肥厚や炎症細胞の浸潤を伴う大腸炎が発現している可能性があるため、速やかに本剤の投与を中止すること。

胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助の場合

	頻度 不明
消化器	軟便、下痢、味覚異常、腹部膨満感、恶心、嘔吐、腹痛、便秘、口内炎、舌炎、口渴、胸やけ、胃食道逆流、食欲不振
肝臓 ^{注2)}	AST(GOT)、ALT(GPT)、AL-P、LDH、γ-GTP、ビリルビンの上昇
血液 ^{注2)}	好中球減少、好酸球增多、白血球增多、貧血、血小板減少
過敏症 ^{注1)}	発疹、瘙痒
精神神経系	頭痛、眠気、めまい、不眠、しびれ感、うつ状態
その他	トリグリセライド、尿酸の上昇、総コレステロールの上昇・低下、尿蛋白陽性、尿糖陽性、倦怠感

注1) このような場合には投与を中止すること。

注2) 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。

なお、外国で行われた試験で認められている副作用は次のとおりである。

	頻度 不明
消化器	下痢、味覚異常、恶心、嘔吐、口内炎、腹痛、排便回数増加
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇
過敏症	発疹
精神神経系	頭痛、めまい

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では酸分泌能は低下しており、その他

生理機能の低下もあるので低用量から投与を開始するなど慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

※(1)妊娠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。〔動物試験（ラット）において胎児血漿中濃度は母動物の血漿中濃度より高いことが認められている。また、ウサギ（経口30mg/kg/日）で胎児死亡率の増加が認められている。なお、ラットにランソプラゾール（50mg/kg/日）、アモキシシリン水和物（500mg/kg/日）及びクラリスロマイシン（160mg/kg/日）を併用投与した試験で、母動物での毒性の増強とともに胎児の発育抑制の増強が認められている。〕

(2)授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。〔動物試験（ラット）で母乳中へ移行することが報告されている。〕

7. 小児等への投与

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）。

8. 適用上の注意

(1)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。）

(2)服用時：本剤は舌の上にのせ唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

9. その他の注意

(1)類薬（オメプラゾール）で、視力障害が発現したとの報告がある。

(2)ラットに52週間強制経口投与した試験で、50mg/kg/日群（臨床用量の約100倍）において1例に良性の精巣間細胞腫が認められている。さらに、24カ月間強制経口投与した試験で、15mg/kg/日以上の群において良性の精巣間細胞腫の発生増加が、また、5mg/kg/日以上の群において胃のカルチノイド腫瘍が認められており、加えて、雌ラットの15mg/kg/日以上及び雄ラットの50mg/kg/日以上の群において網膜萎縮の発生頻度の増加が認められている。精巣間細胞腫及び網膜萎縮については、マウスのがん原性試験、イヌ、サルの毒性試験では認められず、ラットに特有な変化と考えられる。

※(3)ラットにランソプラゾール（15mg/kg/日以上）、アモキシシリン水和物（2,000mg/kg/日）を4週間併用経口投与した試験、及びイヌにランソプラゾール（100mg/kg/日）、アモキシシリン水和物（500mg/kg/日）、クラリスロマイシン（25mg/kg/日）を4週間併用経口投与した試験で、アモキシシリン水和物を単独あるいは併用投与した動物に結晶尿が認められているが、結晶はアモキシシリン水和物が排尿後に析出したものであり、体内で析出したものではないことが確認されている。

(4)本剤の投与が胃癌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。

(5)長期投与における安全性は確立していない（本邦においては長期投与の経験は十分でない）。

※(6)非びらん性胃食道逆流症の治療において、食道内酸逆流の高リスクである中高齢者、肥満者、裂孔ヘルニア所見ありのいずれにも該当しない場合には本剤の治療効果が得られにくいことが臨床試験により示されている。

※(7)ヘリコバクター・ピロリの除菌判定上の注意：ランソプラゾール等のプロトンポンプインヒビターやアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン等の抗生素及びメトロニダゾールの服用中や投与終了直後では、¹³C-尿素呼気試験の判定結果が偽陰性になる可能性があるため、¹³C-尿素呼気試験による除菌判定を行う場合には、これらの薬剤の投与終了後4週以降の時点で実施することが望ましい。

【薬物動態】¹⁾

1. 生物学的同等性試験

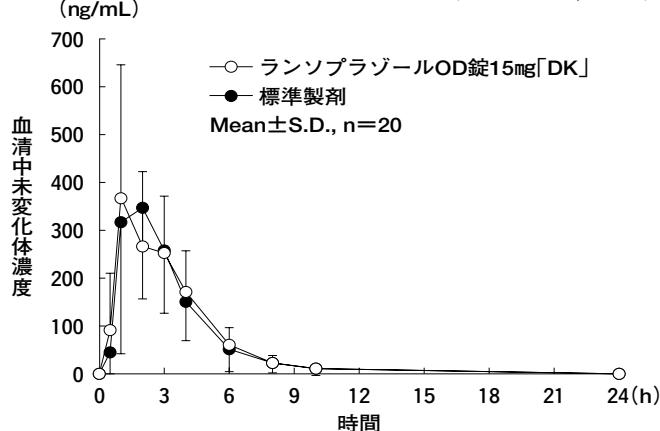
(1)ランソプラゾールOD錠15mg「DK」

ランソプラゾールOD錠15mg「DK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ランソプラゾールとして15mg）健康成人男子に絶食後、水あり及び水なし単回経口投与して血清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)～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。

水あり投与

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)
ランソプラゾールOD錠 15mg「DK」	1302.6±452.1	490.9±138.7	1.8±1.1	1.3±0.3
標準製剤 (錠剤、15mg)	1272.1±418.6	529.8±140.6	1.7±0.7	1.3±0.3

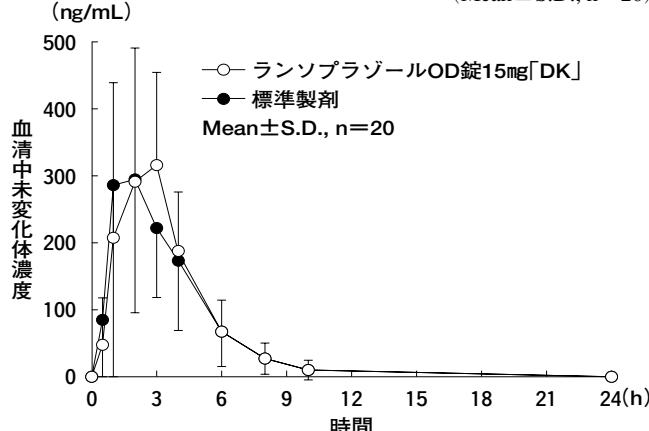
(Mean±S.D., n=20)



水なし投与

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)
ランソプラゾールOD錠 15mg「DK」	1339.6±579.3	453.8±132.7	2.1±0.9	1.3±0.4
標準製剤 (錠剤、15mg)	1294.7±529.0	460.4±193.5	2.1±1.2	1.4±0.4

(Mean±S.D., n=20)



血清中濃度並びに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。

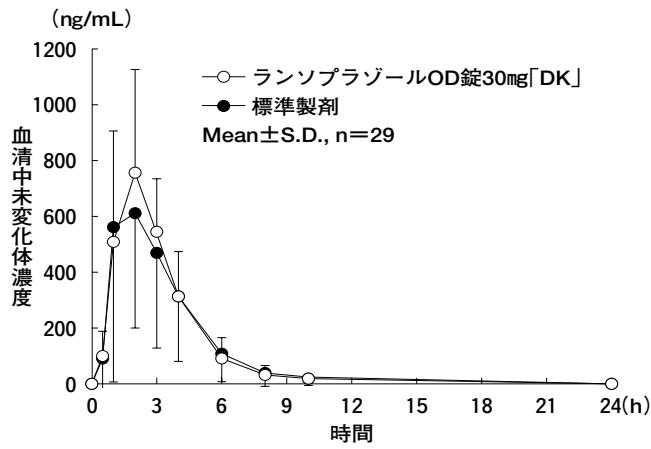
(2) ランソプラゾールOD錠30mg「DK」

ランソプラゾールOD錠30mg「DK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(ランソプラゾールとして30mg)健康成人男子に絶食後、水あり及び水なし単回経口投与して血清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。

水あり投与

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)
ランソプラゾールOD錠 30mg「DK」	2529.7±1130.9	893.6±276.6	2.0±0.7	1.1±0.3
標準製剤 (錠剤、30mg)	2409.2±1327.7	948.9±371.6	2.1±1.2	1.1±0.3

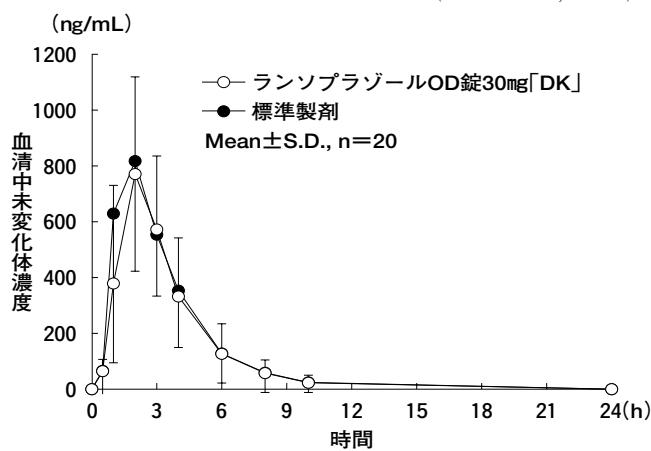
(Mean±S.D., n=29)



水なし投与

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)
ランソプラゾールOD錠 30mg「DK」	2641.9±1155.0	897.3±248.1	2.1±0.8	1.4±0.5
標準製剤 (錠剤、30mg)	2925.7±1323.4	1021.5±318.7	1.7±0.8	1.4±0.5

(Mean±S.D., n=20)



血清中濃度並びに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。

【有効成分に関する理化学的知見】

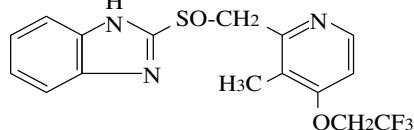
一般名：ランソプラゾール (Lansoprazole)

化学名：(±)-2-[[3-methyl-4-(2,2,2-trifluoroethoxy)-2-pyridyl]methyl]sulfanyl]benzimidazole

分子式： $C_{16}H_{14}F_3N_3O_2S$

分子量：369.36

構造式：



融 点：約166°C (分解)

性 状：ランソプラゾールは白色～帯褐色の結晶性の粉末である。

本品はN,N-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、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。

本品のN,N-ジメチルホルムアミド溶液(1→10)は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

安定性試験結果²⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40°C、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ランソプラゾールOD錠15mg「DK」及びランソプラゾールOD錠30mg「DK」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】

ランソプラゾールOD錠15mg「DK」:100錠(PTP10錠×10)、500錠(PTP10錠×50)

ランソプラゾールOD錠30mg「DK」:100錠(PTP10錠×10)、500錠(PTP10錠×50)

※【主要文献及び文献請求先】

<主要文献>

1)大興製薬社内資料：生物学的同等性試験(2007)

2)大興製薬社内資料：安定性試験(2007)

<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。

アイロム製薬株式会社 学術部

〒141-0032 東京都品川区大崎1-2-2

TEL 03-5759-8111

FAX 03-5759-8115

販売元
アイロム製薬株式会社
神奈川県厚木市旭町四丁目18番29号

製造販売元
大興製薬株式会社
埼玉県川越市下赤坂560番地1