

※※2013年8月改訂（第6版）
 ※2010年6月改訂（第5版）

| |
|-------------|
| 日本標準商品分類番号 |
| 8 7 2 3 2 5 |

H₂受容体拮抗剤
 日本薬局方 ファモチジン錠

ブロスター[®]M錠10

Blostar M tab.10

ブロスター[®]M錠20







Blostar M tab.20

〔貯 法〕 室温保存
 〔使用期限〕 外箱又はラベルに表示の使用期限内に使用すること。
 ※※〔注 意〕 「取扱以上の注意」の項参照

| | | |
|------|------------------|------------------|
| | 10mg | 20mg |
| 承認番号 | 21500AMZ00156000 | 21500AMZ00157000 |
| 薬価収載 | 2003年7月 | 2003年7月 |
| 販売開始 | 2003年7月 | 2003年7月 |

【禁 忌】（次の患者には投与しないこと）
 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

| | | | | | | |
|---------------|---|---|---|---|---|---|
| 販売名 | ブロスターM錠10 | ブロスターM錠20 | | | | |
| 有効成分 （1錠中） | ファモチジン 10mg | ファモチジン 20mg | | | | |
| 添加物 | 軽質無水ケイ酸、ジメチルポリシロキサン（内服用）、ステビア抽出精製物、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、 <i>l</i> -メントール | | | | | |
| 性状・剤形 | 白色～微黄白色の割線入りの素錠 | | | | | |
| 外形 | 表 | 裏 | 側面 | 表 | 裏 | 側面 |
| |  |  |  |  |  |  |
| | 直径・質量・厚さ (mm) (mg) (mm) | 8.0 170 3.2 | 8.5 200 3.4 | | | |
| 識別コード | EE11 | | EE12 | | | |

【効能・効果】

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群
- 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】

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による）、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群
通常成人にはファモチジンとして1回20mgを1日2回（朝食後、夕食後または就寝前）経口投与する。また、1回40mgを1日1回（就寝前）経口投与することもできる。
なお、年齢・症状により適宜増減する。ただし、上部消化管出血の場合には通常注射剤で治療を開始し、内服可能になった後は経口投与に切りかえる。
- 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
通常成人にはファモチジンとして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。また、1回20mgを1日1回（就寝前）経口投与することもできる。
なお、年齢・症状により適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

腎機能低下患者への投与法

ファモチジンは主として腎臓から未変化体で排泄される。腎機能低下患者にファモチジンを投与すると、腎機能の低下とともに血中未変化体濃度が上昇し、尿中排泄が減少するので、次のような投与法を目安とする。

〈1回20mg 1日2回投与を基準とする場合〉

| クレアチニンクリアランス (mL/min) | 投 与 法 |
|--------------------------|-------------------------------|
| Ccr ≥ 60 | 1回20mg 1日2回 |
| 60 > Ccr > 30 | 1回20mg 1日1回 1回10mg 1日2回 |
| 30 ≥ Ccr | 1回20mg 2～3日に1回 1回10mg 1日1回 |
| 透析患者 | 1回20mg 透析後1回 1回10mg 1日1回 |

※※※【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)腎障害のある患者
〔血中濃度が持続するので、投与量を減るか投与間隔をあけて使用すること。〕
- (3)心疾患のある患者
〔心血管系の副作用を起こすおそれがある。〕
- (4)肝障害のある患者
〔症状が悪化するおそれがある。〕
- (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. 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 |
|-----------------------|------------------|------------------------------|
| アゾール系抗真菌薬 イトラコナゾール | 左記の薬剤の血中濃度が低下する。 | 本剤の胃酸分泌抑制作用が左記薬剤の経口吸収を低下させる。 |

※※※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。以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

（裏面につづく）

(1)重大な副作用 (頻度不明)

1) ショック、アナフィラキシー ショック、アナフィラキシー (呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫 (顔面浮腫、咽頭浮腫等)、蕁麻疹等) 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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

※2) 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少 (初期症状として全身倦怠感、脱力、皮下・粘膜下出血、発熱等) があらわれることがあるので、定期的に血液検査を実施し、異常が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

3) 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) 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) があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4) 肝機能障害、黄疸 AST (GOT)・ALT (GPT) 等の上昇、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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

5) 横紋筋融解症 横紋筋融解症があらわれることがあるので、高カリウム血症、ミオグロビン尿、血清逸脱酵素の著明な上昇、筋肉痛等が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

6) QT延長 QT延長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。特に心疾患 (心筋梗塞、弁膜症、心筋症等) を有する患者においてあらわれやすいので、投与後の患者の状態に十分注意すること。

7) 意識障害、痙攣 意識障害、全身痙攣 (痙直性、間代性、ミオクローヌス性) 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。特に腎機能障害を有する患者においてあらわれやすいので、注意すること。

8) 間質性腎炎、急性腎不全 間質性腎炎、急性腎不全があらわれることがあるので、初期症状として発熱、皮疹、腎機能検査値異常 (BUN・クレアチニン上昇等) 等が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

9) 間質性肺炎 発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

(2)重大な副作用 (類薬)

不全収縮 他のH₂受容体拮抗剤で不全収縮があらわれるとの報告がある。

(3)その他の副作用

| | 頻度不明 |
|----------------------|--|
| 過敏症 ^{注)} | 発疹・皮疹、蕁麻疹 (紅斑)、顔面浮腫 |
| ※血液 ^{注)} | 白血球減少、好酸球増多 |
| 消化器 | 便秘、下痢・軟便、口渇、悪心・嘔吐、腹部膨満感、食欲不振、口内炎 |
| 循環器 | 徐脈、頻脈、房室ブロック、血圧上昇、顔面潮紅、耳鳴 |
| 肝臓 | 肝機能異常、黄疸、AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、AI-P 上昇、総ビリルビン上昇、LDH 上昇 |
| ※精神神経系 | 可逆性の錯乱状態、うつ状態、痙攣、意識障害、めまい、全身倦怠感、無気力感、頭痛、眠気、不眠 |
| ※※内分泌系 ^{注)} | 乳汁漏出症、月経不順、女性化乳房 |
| ※※その他 | CK (CPK) 上昇、味覚異常、筋肉痛、背部痛 |

注) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では、本剤を減量するか投与間隔を延長するなど慎重に投与すること。

[本剤は主として腎臓から排泄されるが、高齢者では、腎機能が低下していることが多いため血中濃度が持続するおそれがある。]

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治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳婦に投与するときは授乳させないように注意すること。

[母乳中に移行することが報告されている。]

7. 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)。

8. 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)

9. 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】

1. 生物学的同等性試験

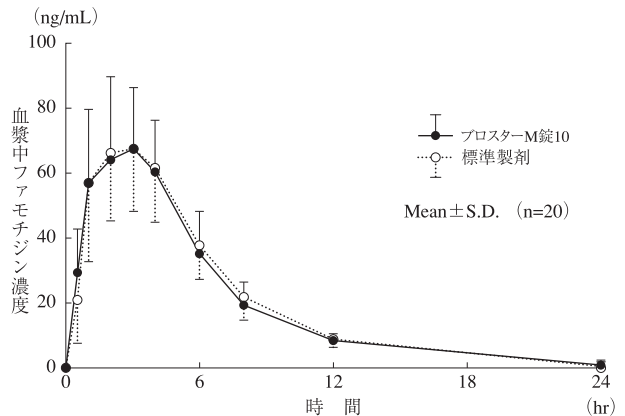
プロスターM錠10と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠 (ファモチジンとして20mg) 健康成人男性に絶食下単回経口投与して血漿中のファモチジン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、C_{max}) について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

プロスターM錠20と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠 (ファモチジンとして20mg) 健康成人男性に絶食下単回経口投与して血漿中のファモチジン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、C_{max}) 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。 (I)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|-----------|-------------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
| | AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL) | C _{max} (ng/mL) | T _{max} (hr) | T _{1/2} (hr) |
| プロスターM錠10 | 482.8 ± 132.6 | 75.92 ± 23.00 | 2.50 ± 1.05 | 3.63 ± 1.18 |
| 標準製剤 | 496.1 ± 108.6 | 75.95 ± 18.38 | 2.85 ± 1.23 | 3.26 ± 0.91 |

(Mean ± S.D., n=20)

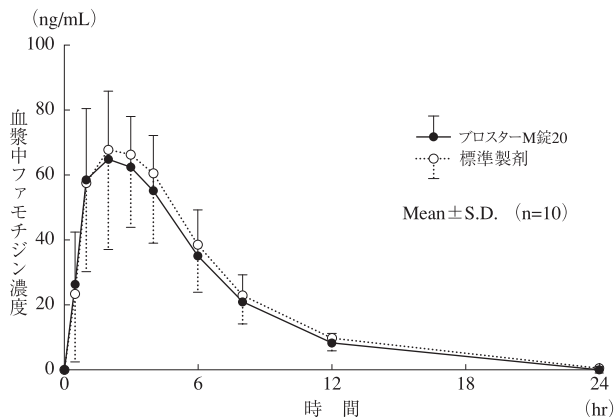


10mg錠2錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移



| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|-----------|-------------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
| | AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL) | C _{max} (ng/mL) | T _{max} (hr) | T _{1/2} (hr) |
| プロスターM錠20 | 468.9±143.4 | 73.36±18.58 | 1.90±0.88 | 3.20±0.48 |
| 標準製剤 | 508.0±184.6 | 75.10±28.91 | 2.10±0.88 | 3.37±0.78 |

(Mean ± S.D., n=10)



20mg錠1錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移

2. 溶出挙動

プロスターM錠10及びプロスターM錠20は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたファモチジン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。(2)

【薬効薬理】

胃酸分泌細胞（壁細胞）のヒスタミンH₂受容体を遮断して胃酸分泌を抑制する。生理的には、胃酸はヒスタミン、アセチルコリン、ガストリンによって分泌されるが、胃酸分泌に関与する受容体の中では、H₂受容体が最も重要な受容体であり、この受容体においてヒスタミンと拮抗すると最も強力な胃酸分泌抑制を示すことになる。H₂受容体は胃酸分泌に重要な役割を演じているが、中枢以外に重要な生理的役割を演じていないので、H₂受容体遮断に起因する副作用は少ない。(3)(4)

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ファモチジン (Famotidine)

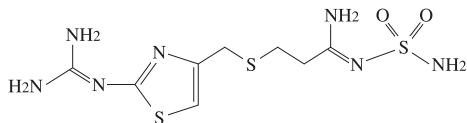
化学名：N-Aminosulfonyl-3-[[2-(diaminomethyleneamino)-1,3-thiazol-4-yl]methylsulfanyl] propanimidamide

分子式：C₈H₁₅N₇O₂S₃

分子量：337.45

融点：約164℃（分解）

構造式：



物理化学的性状：

ファモチジンは白色～帯黄白色の結晶である。

本品は酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(95)に溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

本品は0.5mol/L塩酸試液に溶ける。

本品は光によって徐々に着色する。

※【取扱い上の注意】

1. 加速試験

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、プロスターM錠10及びプロスターM錠20（最終包装）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。(5)

2. 本剤は水で服用する時の崩壊性を考慮し設計された製剤（湿製錠）のため、製剤の製法上、錠剤のエッジや側面が滑らかでないことがある。

3. 自動分包機を使用する場合は欠けることがあるため、カセットの位置および錠剤投入量などに配慮すること。

【包装】

プロスターM錠10……………500錠(バラ)

100錠(PTP)・1,000錠(PTP)

プロスターM錠20……………500錠(バラ)

100錠(PTP)・1,000錠(PTP)

【主要文献】

- ① 生物学的同等性に関する資料（サンノーバ株式会社 社内資料）
- ② 溶出性に関する資料（サンノーバ株式会社 社内資料）
- ③ 第十六改正日本薬局方解説書（廣川書店） C-3833（2011）
- ④ 第十六改正日本薬局方解説書（廣川書店） C-2017（2011）
- ⑤ 安定性に関する資料（サンノーバ株式会社 社内資料）

【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。

エルメッド エーザイ株式会社 FAX 03-3980-6634

〒170-0013 東京都豊島区東池袋3-23-5

【商品情報お問い合わせ先】

エルメッド エーザイ株式会社 商品情報センター ☎0120-223-698

エーザイ株式会社 hhcホットライン ☎0120-419-497

製造販売元



サンノーバ株式会社

群馬県太田市市良田町3038-2

販売元



エルメッド エーザイ株式会社

東京都豊島区東池袋3-23-5

販売提携



エーザイ株式会社

東京都文京区小石川4-6-10

A15521-6

