

5-HT₃受容体拮抗型制吐剤

ラモセトロン^{塩酸塩注射液} 0.3mg「EMEC」

Ramosetron Hydrochloride injection 0.3mg「EMEC」

| | |
|------|------------------|
| 承認番号 | 22200AMX00488000 |
| 薬価収載 | 2010年11月 |
| 販売開始 | 2010年11月 |

〈ラモセトロン^{塩酸塩注射液}〉

〔貯 法〕 遮光、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〕 注意－医師等の処方箋により使用すること

※ 【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 | ラモセトロン ^{塩酸塩注射液} 0.3mg「EMEC」 |
| 有効成分 | 1管（2mL）中 ラモセトロン ^{塩酸塩} 0.3mg |
| 添加物 | 塩化ナトリウム、乳酸、塩酸、水酸化ナトリウム |
| 剤形 | 注射剤 |
| 性状 | 無色澄明の液 |
| 容器 | 褐色ガラスアンプル |
| pH | 4.0～5.0 |
| 浸透圧比 | 0.9～1.3（生理食塩液に対する比） |

【効能・効果】

抗悪性腫瘍剤（シスプラチン等）投与に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）

【用法・用量】

通常、成人にはラモセトロン^{塩酸塩}として0.3mgを1日1回静脈内投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。また、効果不十分な場合には、同用量を追加投与できる。

ただし、1日量として0.6mgを超えないこととする。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

本剤は強い悪心、嘔吐が生じる抗悪性腫瘍剤（シスプラチン等）の投与の場合に限り使用すること。

2. 相互作用

本剤は、主として肝臓の薬物代謝酵素CYP1A2及びCYP2D6により代謝される。

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 |
|---------|------------------------------|--|
| フルボキサミン | 本剤の血中濃度が上昇し、副作用が増強されるおそれがある。 | フルボキサミンのCYP1A2阻害作用により本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。 |

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）

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（気分不良、胸内苦悶感、呼吸困難、喘鳴、顔面潮紅、発赤、痒痒感、チアノーゼ、血圧低下等）を起こす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) 重大な副作用（類薬）

てんかん様発作 他の5-HT₃受容体拮抗型制吐剤で、外国において、てんかん様発作があらわれたとの報告がある。

(3) その他の副作用

| | 頻度不明 |
|------------------|--|
| 過敏症 [※] | 皮疹、痒痒感、発赤 |
| 精神神経系 | 頭痛、頭重 |
| 消化器 | 下痢、便秘 |
| 腎 臓 | BUN上昇、血中クレアチニン上昇 |
| 肝 臓 | 肝機能異常（AST（GOT）上昇、ALT（GPT）上昇、 γ -GTP上昇、ビリルビン上昇等） |
| その他 | 体熱感、しゃっくり、頭部のほてり、舌のしびれ感 |

〔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。

4. 高齢者への投与

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。副作用が発現した場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

〔一般に高齢者では生理機能が低下している。〕

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦等

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されていない。〕

(2) 授乳婦

授乳中の婦人に投与する場合には授乳を中止させること。〔ラットにおいて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（使用経験が少ない）。

7.適用上の注意

(1)調製時

現在までに下記に示す注射液との配合変化を起こすことが確認されているので、混合しないこと。

D-マンニトール注射液、ルネトロン注射液、ラシックス注

なお、ラシックス注については、フロセミド20mgを含むラシックス注に生理食塩液200mLを加え本剤1アンプルと混合する場合には差し支えない。

(2)アンプルカット時

本品は、ワンポイントカットアンプルであるが、アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

【薬効薬理】

5-HT₃受容体は求心性の迷走神経や求心性の迷走神経から刺激を受けるNTS（迷走神経の孤束核）や最後野などの嘔吐に関係する様々な部位に存在する。セロトニンは化学療法剤に反応して小腸のエンテロクロマフィン enterochromaffin 細胞から分泌され、迷走神経を刺激することで5-HT₃受容体を介し嘔吐反射を引き起こす。

CNSに5-HT₃受容体をもっとも高濃度に存在する部位はNTSとCTZ（化学受容器引金帯）であり、5-HT₃受容体拮抗薬はこれらの部位にも作用し、悪心、嘔吐を抑えていると考えられている。

【有効成分に関する理化学的知見】

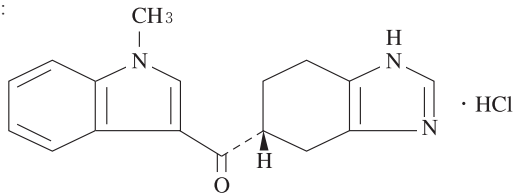
一般名：ラモセトロン塩酸塩 (Ramosetron Hydrochloride)

化学名：(-)-(R)-5-[(1-Methyl-1H-indol-3-yl)carbonyl]-4,5,6,7-tetrahydro-1H-benzimidazole monohydrochloride

分子式：C₁₇H₁₇N₃O · HCl

分子量：315.80

構造式：



物理化学的性状：

ラモセトロン塩酸塩は白色～微黄白色の結晶性の粉末である。本品は、水又はメタノールに溶けやすく、エタノール（95）又は酢酸（100）にやや溶けやすく、アセトニトリル又は無水酢酸に極めて溶けにくく、テトラヒドロフラン又はエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

※※安定性試験

長期保存試験（25℃、相対湿度60%、36ヵ月）の結果、ラモセトロン塩酸塩注射液0.3mg「EMEC」（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確認された。（①）

【包装】

ラモセトロン塩酸塩注射液0.3mg「EMEC」…………… 2mL×5管

【主要文献】

① 安定性に関する資料（高田製薬株式会社 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は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

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1

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