

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領 2018（2019年更新版）に準拠して作成

過活動膀胱治療剤

イミダフェナシン製剤

イミダフェナシン錠0.1mg [JG]

イミダフェナシンOD錠0.1mg [JG]

Imidafenacin Tablets, OD Tablets

処方箋医薬品^{注)}

剤形	錠 0.1mg：フィルムコーティング錠 OD 錠 0.1mg：素錠（口腔内崩壊錠）
製剤の規制区分	処方箋医薬品 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠 0.1mg：1錠中 イミダフェナシン 0.1mg を含有 OD 錠 0.1mg：1錠中 イミダフェナシン 0.1mg を含有
一般名	和名：イミダフェナシン 洋名：Imidafenacin
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2020年2月17日 薬価基準収載年月日：2020年6月19日 販売開始年月日：2020年6月19日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室 TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/

本 IF は 2023 年 8 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「I F記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたI Fは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I Fの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってI Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I Fの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I Fが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、
「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには
十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I Fは
日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正
使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性
及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オ
ブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承
認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うこ
とは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自ら
がI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得ら
れる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは
薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	10
1. 開発の経緯	1	9. 溶出性	11
2. 製品の治療学的特性	1	10. 容器・包装	13
3. 製品の製剤学的特性	1	(1)注意が必要な容器・包装、外観が特殊な 容器・包装に関する情報	13
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	13
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	13
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	13
(2)流通・使用上の制限事項	1	11. 別途提供される資材類	13
6. RMPの概要	2	12. その他	13
II. 名称に関する項目	3	V. 治療に関する項目	14
1. 販売名	3	1. 効能又は効果	14
(1)和名	3	2. 効能又は効果に関連する注意	14
(2)洋名	3	3. 用法及び用量	14
(3)名称の由来	3	(1)用法及び用量の解説	14
2. 一般名	3	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	14
(1)和名（命名法）	3	4. 用法及び用量に関連する注意	14
(2)洋名（命名法）	3	5. 臨床成績	14
(3)ステム（stem）	3	(1)臨床データパッケージ	14
3. 構造式又は示性式	3	(2)臨床薬理試験	15
4. 分子式及び分子量	3	(3)用量反応探索試験	15
5. 化学名（命名法）又は本質	3	(4)検証的試験	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	1)有効性検証試験	15
III. 有効成分に関する項目	4	2)安全性試験	15
1. 物理化学的性質	4	(5)患者・病態別試験	17
(1)外観・性状	4	(6)治療的使用	17
(2)溶解性	4	1)使用成績調査（一般使用成績調査、特 定使用成績調査、使用成績比較調査）、 製造販売後データベース調査、製造販 売後臨床試験の内容	17
(3)吸湿性	4	2)承認条件として実施予定の内容又は実 施した調査・試験の概要	17
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	4	(7)その他	17
(5)酸塩基解離定数	4	VI. 薬効薬理に関する項目	18
(6)分配係数	4	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18
(7)その他の主な示性値	4	2. 薬理作用	18
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(1)作用部位・作用機序	18
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	(2)薬効を裏付ける試験成績	18
IV. 製剤に関する項目	5	(3)作用発現時間・持続時間	18
1. 剤形	5	VII. 薬物動態に関する項目	19
(1)剤形の区別	5	1. 血中濃度の推移	19
(2)製剤の外観及び性状	5	(1)治療上有効な血中濃度	19
(3)識別コード	5	(2)臨床試験で確認された血中濃度	19
(4)製剤の物性	5	(3)中毒域	22
(5)その他	5	(4)食事・併用薬の影響	22
2. 製剤の組成	5	2. 薬物速度論的パラメータ	22
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	5	(1)解析方法	22
(2)電解質等の濃度	6	(2)吸収速度定数	22
(3)熱量	6	(3)消失速度定数	23
3. 添付溶解液の組成及び容量	6		
4. 力価	6		
5. 混入する可能性のある夾雑物	6		
6. 製剤の各種条件下における安定性	6		
7. 調製法及び溶解後の安定性	10		

(4)クリアランス	23	(1)臨床使用に基づく情報	31
(5)分布容積	23	(2)非臨床試験に基づく情報	31
(6)その他	23		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	23	IX. 非臨床試験に関する項目	32
(1)解析方法	23	1. 薬理試験	32
(2)パラメータ変動要因	24	(1)薬効薬理試験	32
4. 吸収	24	(2)安全性薬理試験	32
5. 分布	24	(3)その他の薬理試験	32
(1)血液－脳関門通過性	24	2. 毒性試験	32
(2)血液－胎盤関門通過性	24	(1)単回投与毒性試験	32
(3)乳汁への移行性	24	(2)反復投与毒性試験	32
(4)髄液への移行性	24	(3)遺伝毒性試験	32
(5)その他の組織への移行性	24	(4)がん原性試験	32
(6)血漿蛋白結合率	25	(5)生殖発生毒性試験	32
6. 代謝	25	(6)局所刺激性試験	32
(1)代謝部位及び代謝経路	25	(7)その他の特殊毒性	32
(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	25	X. 管理的事項に関する項目	33
(3)初回通過効果の有無及びその割合	25	1. 規制区分	33
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	25	2. 有効期間	33
7. 排泄	25	3. 包装状態での貯法	33
8. トランスポーターに関する情報	25	4. 取扱い上の注意	33
9. 透析等による除去率	25	5. 患者向け資材	33
10. 特定の背景を有する患者	26	6. 同一成分・同効薬	33
11. その他	26	7. 国際誕生年月日	33
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	27	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	33
1. 警告内容とその理由	27	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	33
2. 禁忌内容とその理由	27	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	34
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	27	11. 再審査期間	34
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	27	12. 投薬期間制限に関する情報	34
5. 重要な基本的注意とその理由	27	13. 各種コード	34
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	28	14. 保険給付上の注意	34
(1)合併症・既往歴等のある患者	28	X I. 文献	35
(2)腎機能障害患者	28	1. 引用文献	35
(3)肝機能障害患者	28	2. その他の参考文献	36
(4)生殖能を有する者	28	X II. 参考資料	37
(5)妊婦	28	1. 主な外国での発売状況	37
(6)授乳婦	29	2. 海外における臨床支援情報	37
(7)小児等	29	X III. 備考	38
(8)高齢者	29	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	38
7. 相互作用	29	(1)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	40
(1)併用禁忌とその理由	29	2. その他の関連資料	40
(2)併用注意とその理由	29		
8. 副作用	29		
(1)重大な副作用と初期症状	29		
(2)その他の副作用	30		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	30		
10. 過量投与	30		
11. 適用上の注意	31		
12. その他の注意	31		

略語表

略語	略語内容
AUC	血漿中濃度－時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC _{0→12}	投与 12 時間後までの AUC (AUC from zero to 12 hours)
AUC ₀₋₂₄	投与 24 時間後までの AUC (AUC from zero to 24 hours)
AUC _{0→∞}	無限大時間までの AUC (AUC from zero to infinity)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
ALP	アルカリホスファターゼ (Alkaline phosphatase)
CL/F	経口クリアランス (Apparent total body clearance after oral administration)
Cmax	最高血漿中濃度 (Maximum plasma concentration)
CYP	チトクローム P450 (Cytochrome P450)
γ -GTP	γ -グルタミルトランスぺプチターゼ (γ -Glutamyl transpeptidase)
kel	消失速度定数 (Elimination rate constant)
LDH	乳酸脱水素酵素 (Lactate dehydrogenase)
RH	相対湿度 (Relative humidity)
S.D.	標準偏差 (Standard deviation)
T _{1/2}	消失半減期 (Elimination half-life)
Tmax	最高血漿中濃度到達時間 (Time to maximum plasma concentration)

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、イミダフェナシンを有効成分とする過活動膀胱治療剤である。

本剤は後発医薬品として、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2020 年 2 月に承認を得て、2020 年 6 月発売に至った。

なお、イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」は、長生堂製薬株式会社が開発を企画、イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」は、長生堂製薬株式会社及び沢井製薬株式会社の 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、過活動膀胱治療剤で、過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁に対し効果が認められている。（〔V.1.効能又は効果〕の項参照）
- (2) 重大な副作用として、急性緑内障、尿閉、肝機能障害、麻痺性イレウス、幻覚・せん妄、QT 延長、心室性頻拍があらわれるとの報告がある。（〔VIII.8.（1）重大な副作用と初期症状〕の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

- (1) イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」は、錠剤本体の両面に成分名、含量及び屋号を印字し、イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」は、錠剤本体の両面に成分名、口腔内崩壊錠であること（OD）、含量及び屋号を印字し、識別性を向上させている。（〔IV.1.（2）製剤の外観及び性状〕の項参照）
- (2) イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」は、水なしでも服用可能な口腔内崩壊錠である。（〔IV.1.（2）製剤の外観及び性状〕の項参照）

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル・参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

イミダフェナシン錠 0.1mg 「JG」

イミダフェナシン OD 錠 0.1mg 「JG」

(2) 洋名

Imidafenacin Tablets 0.1mg “JG”

Imidafenacin OD Tablets 0.1mg “JG”

(3) 名称の由来

一般的名称+剤形+含量+「JG」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

イミダフェナシン（JAN）

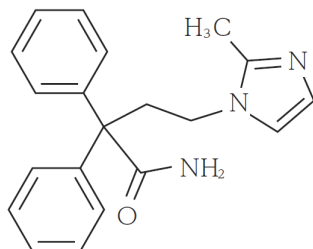
(2) 洋名（命名法）

Imidafenacin（JAN、INN）

(3) ステム（s t e m）

ムスカリン受容体拮抗薬：-fenacin

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₀H₂₁N₃O

分子量：319.40

5. 化学名（命名法）又は本質

4-(2-Methyl-1*H*-imidazol-1-yl)-2,2-diphenylbutanamide (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

酢酸（100）に溶けやすく、*N,N*-ジメチルホルムアミド又は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、アセトニトリルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

溶解度（37℃）：pH1.2：27.96mg/mL、pH3.0：11.49mg/mL、
pH4.0：7.082mg/mL、pH5.0：3.077mg/mL、
pH6.8：0.4035mg/mL、水：0.0963mg/mL

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：192～196℃

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー



IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

〔1. (2) 製剤の外観及び性状〕の項参照

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」	イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」
色調・剤形		淡赤色～淡赤褐色又は淡赤紫色の フィルムコーティング錠	白色の素錠
外形			
大きさ	直径	7.2mm	7.6mm
	厚さ	3.4mm	3.8mm
重量		138mg	160mg

(3) 識別コード

錠 0.1mg

錠剤本体：イミダフェナシン 0.1 JG

OD 錠 0.1mg

錠剤本体：イミダフェナシン OD 0.1 JG

(4) 製剤の物性

錠 0.1mg：該当資料なし

OD 錠 0.1mg：本剤は、日本薬局方 崩壊試験法により試験を行うとき、規格に適合する。

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分（活性成分）の含量

錠 0.1mg：1 錠中 イミダフェナシン 0.1mg 含有

OD 錠 0.1mg：1 錠中 イミダフェナシン 0.1mg 含有

添加剤

錠 0.1mg	OD 錠 0.1mg
乳糖水和物、結晶セルロース、アルファー化デンプン、ステアリン酸マグネシウム、含水二酸化ケイ素、ヒプロメロース、酸化チタン、ヒドロキシプロピルセルロース、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、タルク	D-マンニトール、部分アルファー化デンプン、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート、クロスポビドン、ステアリン酸マグネシウム、含水二酸化ケイ素

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

錠 0.1mg¹⁾

加速試験（40℃、 相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

包装形態：PTP 包装（PTP シート+アルミピロー）

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
含量均一性試験 (%)	1.1 ~ 5.8	—	—	2.5 ~ 4.3
溶出性 (%)	91 ~ 100	95 ~ 109	92 ~ 101	93 ~ 101
含量 (%)	98.8	98.3	98.5	98.1

含量均一性、溶出性：最小値～最大値、含量：平均値

OD錠 0.1mg²⁾

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

包装形態：PTP 包装（PTP シート+アルミピロー（乾燥剤入り））

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合
含量均一性試験 (%)	1.0 ~ 1.9	—	—	1.5 ~ 2.8
崩壊性 (秒)	9 ~ 17	8 ~ 19	7 ~ 16	7 ~ 12
溶出性 (%)	95 ~ 105	95 ~ 103	93 ~ 102	95 ~ 103
含量 (%)	99.9	100.0	99.6	98.3

含量均一性、崩壊性、溶出性：最小値～最大値、含量：平均値

(2) 無包装状態での安定性試験

錠 0.1mg³⁾

保存条件

- ① 温度：40±2℃、3 ヶ月〔遮光・気密容器〕
- ② 湿度：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月〔遮光・開放〕
- ③ 光：120 万 lux・hr (2000lux) 25±2℃/60±5%RH〔シャーレ+ラップ〕

	性状	含量	硬度	溶出性	純度	評価
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（平成 11 年 8 月 20 日（社）日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会）の評価分類基準に準じる（一部改変）。

◎：全ての試験項目で変化を認めない

（性状：外観上の変化をほとんど認めない。含量：含量低下が 3%未満。硬度：硬度変化が 30%未満。溶出性：規格値内。純度：規格値内。）

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認める

（性状：わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：含量低下が 3%以上で、規格値内。硬度：硬度変化が 30%以上で、硬度が 2kgf 以上。）

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認める

（性状：形状変化や著しい変化を認め、規格を逸脱している。含量：規格値外。硬度：硬度変化が 30%以上で、硬度が 2kgf 未満。溶出性：規格値外。純度：規格値外。）

OD錠 0.1mg⁴⁾

①温度：40±2℃、3ヵ月〔遮光・気密容器〕

	3ヵ月
性状	変化なし
含量	変化なし
硬度	変化なし
崩壊性	変化なし
溶出性	変化なし
純度	変化なし
総合評価	◎

②湿度：25±2℃/75±5%RH、3ヵ月〔遮光・開放〕

	3ヵ月
性状	変化なし
含量	変化なし
硬度	変化あり（規格内）
崩壊性	変化なし
溶出性	変化なし
純度	変化なし
総合評価	○

③光：120万 lux・hr（2000lux）25±2℃/60±5%RH〔シャーレ+ラップ〕

	30万 lux・hr	60万 lux・hr	120万 lux・hr
性状	—	—	変化なし
含量	—	—	変化なし
硬度	—	—	変化なし
崩壊性	—	—	変化なし
溶出性	—	—	変化なし
純度※	変化あり （規格内）	変化あり （規格外）	変化あり （規格外）
総合評価	○	△	△

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（平成11年8月20日（社）日本病院薬剤師会学術第5小委員会）の評価分類基準に準じる（一部改変）。

◎：全ての試験項目で変化を認めない

（性状：外観上の変化をほとんど認めない。含量：含量低下が3%未満。硬度：硬度変化が30%未満。崩壊性・溶出性：規格値内。純度：報告の必要な閾値である0.1%を超えない場合。）

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認める

(性状：わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：含量低下が3%以上で、規格値内。硬度：硬度変化が30%以上で、硬度が2kgf以上。純度：報告の必要な閾値である0.1%を超えるが、安全性確認の必要な閾値である1.0%を超えない場合。)

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認める

(性状：形状変化や著しい変化を認め、規格を逸脱している。含量：規格値外。硬度：硬度変化が30%以上で、硬度が2kgf未満。崩壊性・溶出性：規格値外。純度：安全性確認の必要な閾値である1.0%を超える場合。)

※規格及び試験方法が設定されていないため、「新有効成分含有医薬品のうち製剤の不純物に関するガイドライン」を参考とした。

(3) 一次包装品での安定性試験

錠 0.1mg⁵⁾

保存条件

- ①温度：40±2℃、3ヵ月〔遮光〕
- ②湿度：25±2℃/75±5%RH、3ヵ月〔遮光〕
- ③光：120万lux・hr（2000lux）25±2℃/60±5%RH

	性状	含量	硬度	溶出性	純度	評価
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（平成11年8月20日（社）日本病院薬剤師会学術第5小委員会）の評価分類基準に準じる（一部改変）。

◎：全ての試験項目で変化を認めない

(性状：外観上の変化をほとんど認めない。含量：含量低下が3%未満。硬度：硬度変化が30%未満。溶出性：規格値内。純度：規格値内。)

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認める

(性状：わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：含量低下が3%以上で、規格値内。硬度：硬度変化が30%以上で、硬度が2kgf以上。)

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認める

(性状：形状変化や著しい変化を認め、規格を逸脱している。含量：規格値外。硬度：硬度変化が30%以上で、硬度が2kgf未満。溶出性：規格値外。純度：規格値外。)

OD錠 0.1mg⁶⁾

保存条件

- ①温度：40±2℃、3ヵ月〔遮光〕
- ②湿度：25±2℃/75±5%RH、3ヵ月〔遮光〕
- ③光：120万lux・hr（2000lux）25±2℃/60±5%RH

	性状	含量	硬度	崩壊性	溶出性	純度※	評価
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内)	○

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（平成11年8月20日（社）日本病院薬剤師会学術第5小委員会）の評価分類基準に準じる（一部改変）。

◎：全ての試験項目で変化を認めない

（性状：外観上の変化をほとんど認めない。含量：含量低下が3%未満。硬度：硬度変化が30%未満。崩壊性・溶出性：規格値内。純度：報告の必要な閾値である0.1%を超えない場合。）

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認める

（性状：わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：含量低下が3%以上で、規格値内。硬度：硬度変化が30%以上で、硬度が2kgf以上。純度：報告の必要な閾値である0.1%を超えるが、安全性確認の必要な閾値である1.0%を超えない場合。）

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認める

（性状：形状変化や著しい変化を認め、規格を逸脱している。含量：規格値外。硬度：硬度変化が30%以上で、硬度が2kgf未満。崩壊性・溶出性：規格値外。純度：安全性確認の必要な閾値である1.0%を超える場合。）

※規格及び試験方法が設定されていないため、「新有効成分含有医薬品のうち製剤の不純物に関するガイドライン」を参考とした。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

(1) 溶出規格

錠 0.1mg

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条件：回転数 50rpm

試験液 水

結果：15 分間 80%以上

OD 錠 0.1mg

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条件：回転数 50rpm

試験液 pH6.8（溶出試験第 2 液）

結果：15 分間 85%以上

(2) 生物学的同等性試験における溶出試験結果

錠 0.1mg⁷⁾

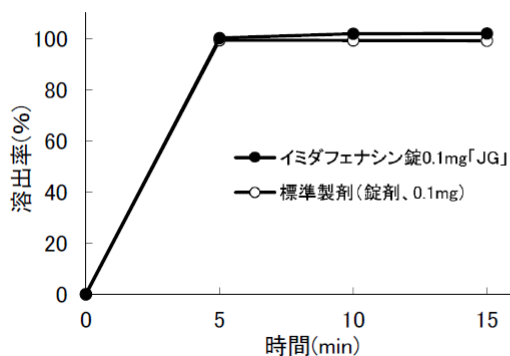
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に従い、ウリトス錠 0.1mg を標準製剤として溶出挙動の類似性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は類似していると判断された。

試験法	試験液/回転数
パドル法	①pH1.2/50rpm
	②pH5.0/50rpm
	③pH6.8/50rpm
	④水/50rpm

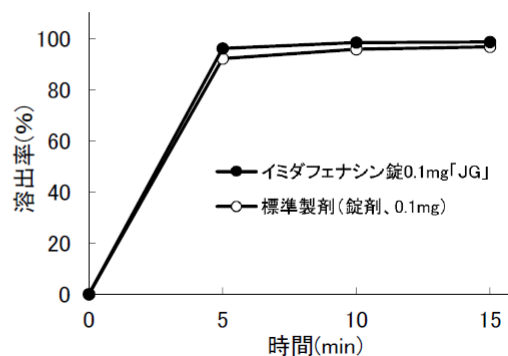
[判定基準]

①②③④：試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

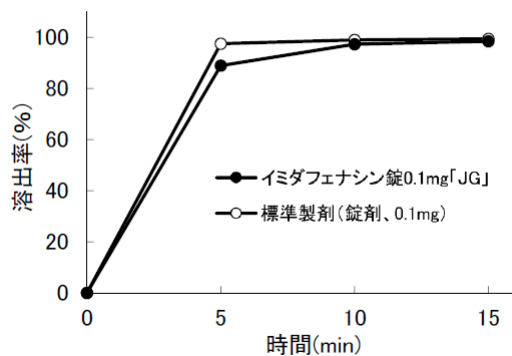
① pH1.2、50rpm



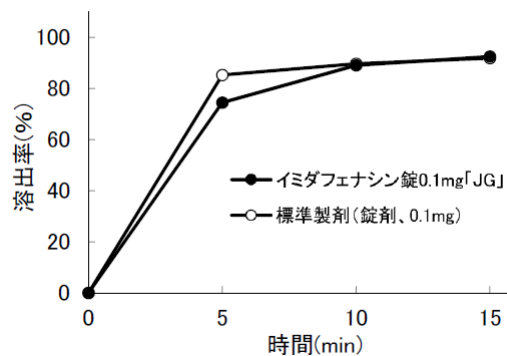
② pH5.0、50rpm



③pH6.8、50rpm



④水、50rpm

OD錠 0.1mg⁸⁾

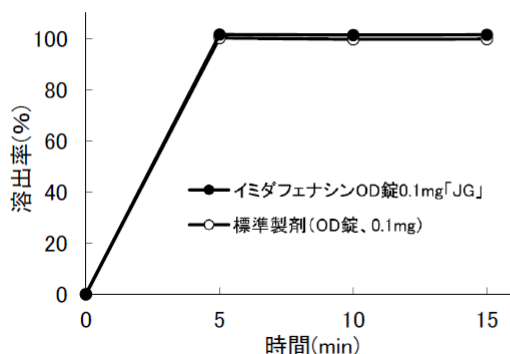
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号）」に従い、ウリトス OD錠 0.1mg を標準製剤として溶出挙動の類似性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は類似していると判断された。

試験法	試験液/回転数
パドル法	①pH1.2/50rpm
	②pH5.0/50rpm
	③pH6.8/50rpm
	④水/50rpm

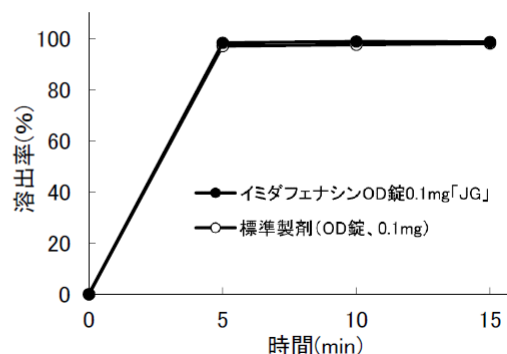
[判定基準]

- ①②③：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
- ④：標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。

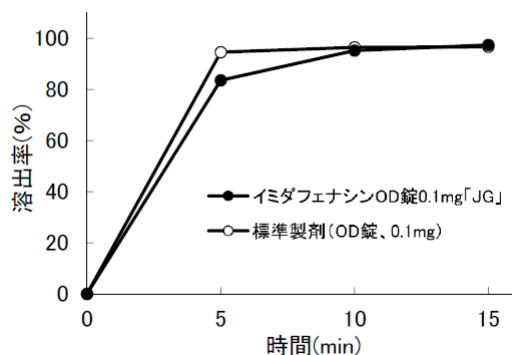
①pH1.2、50rpm



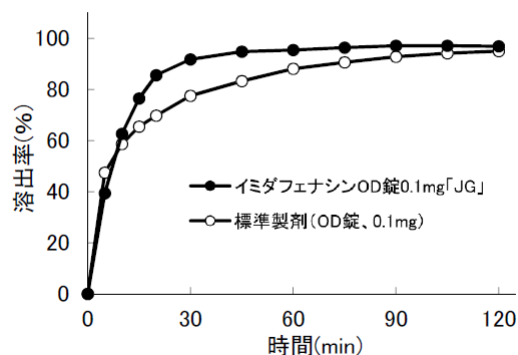
② pH5.0、50rpm



③ pH6.8、50rpm



④ 水、50rpm



10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

<p>22. 包装</p> <p><イミダフェナシン錠 0.1mg 「JG」></p> <p>100 錠 [10 錠 (PTP) ×10]</p> <p><イミダフェナシン OD 錠 0.1mg 「JG」></p> <p>100 錠 [10 錠 (PTP) ×10、乾燥剤入り]</p>

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

錠 0.1mg

PTP (ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔)、ピロー (アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム)、紙箱

OD 錠 0.1mg

PTP (ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔)、ピロー (アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム)、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

- 5.1 本剤を適用する際、十分な問診により臨床症状を確認するとともに、類似の症状を呈する疾患（尿路感染症、尿路結石、膀胱癌や前立腺癌等の下部尿路における新生物等）があることに留意し、尿検査等により除外診断を実施すること。なお、必要に応じて専門的な検査も考慮すること。
- 5.2 下部尿路閉塞疾患（前立腺肥大症等）を合併している患者では、それに対する治療を優先させること。
- 5.3 過活動膀胱の症状を明確に認識できない認知症又は認知機能障害患者は本剤の投与対象とはならない。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

通常、成人にはイミダフェナシンとして1回0.1mgを1日2回、朝食後及び夕食後に経口投与する。効果不十分な場合は、イミダフェナシンとして1回0.2mg、1日0.4mgまで増量できる。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

- 7.1 イミダフェナシンとして1回0.1mgを1日2回投与し、効果不十分かつ安全性に問題がない場合に増量を検討すること。本剤を1回0.2mg1日2回で投与開始した場合の有効性及び安全性は確立していない。
- 7.2 中等度以上の肝障害のある患者については、1回0.1mgを1日2回投与とする。[9.3.1 参照]
- 7.3 重度の腎障害のある患者については、1回0.1mgを1日2回投与とする。[9.2.1 参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.1.1 国内第Ⅲ相プラセボ対照二重盲検比較試験

過活動膀胱患者 781 例を対象として、イミダフェナシン 0.1mg を 1 日 2 回 12 週間経口投与する試験を実施した。主要評価項目である 1 週間あたりの合計尿失禁回数の投与前値に対する変化率において、イミダフェナシン群はプラセボ群に対し有意な改善効果を示した。また、1 日あたりの平均排尿回数及び 1 日あたりの平均尿意切迫感回数の投与前値に対する変化についても、プラセボ群に対し有意な改善効果を示した^{9, 10)}。

副作用集計の対象となったイミダフェナシン群 321 例中 130 例 (40.5%) に副作用 (臨床検査値の異常を含む) が認められ、主な副作用は口渇 87 例 (27.1%)、便秘 30 例 (9.3%) であった¹⁰⁾。

評価項目	投与群 ^{注1)}	投与前 ^{注2)}	4 週間後	12 週間後 又は中止時
1 週間あたりの 合計尿失禁回数 (変化率：%)	プラセボ群	17.55±11.18	-33.50±51.34	-49.50±57.22
	イミダフェ ナシン群	18.56±14.81	-48.67±44.75 ^{##}	-68.24±36.90 ^{###}
1 日あたりの 平均排尿回数 (変化量：回)	プラセボ群	11.47±2.50	-1.04±1.74	-1.08±1.62
	イミダフェ ナシン群	11.20±2.28	-1.19±1.58	-1.52±1.70 [#]
1 日あたりの平均 尿意切迫感回数 (変化率：%)	プラセボ群	5.42±3.57	-20.83±46.24	-35.63±53.71
	イミダフェ ナシン群	4.87±2.90	-34.58±43.83 ^{##}	-53.39±41.35 ^{###}

注 1)：プラセボに対する優越性及びプロピペリン塩酸塩に対する非劣性の検証を目的とした第Ⅲ相比較試験の成績より抜粋

プラセボ群 143 例、イミダフェナシン群 318 例

平均値±標準偏差 #：p<0.05、##：p<0.01、###：p<0.001 [vs プラセボ]

注 2)：投与前は各評価項目とも実測値 (回)

2) 安全性試験

17.1.2 国内第Ⅲ相長期投与試験

過活動膀胱患者 481 例を対象とし、イミダフェナシン 0.1mg を 1 日 2 回 52 週間経口投与する試験を実施した。1 週間あたりの合計尿失禁回数、1 日あたりの平均排尿回数及び 1 日あたりの平均尿意切迫感回数の投与前値に対する変化において改善が認められ、投与 52 週間後まで減弱することなく維持された^{11, 12)}。

副作用集計の対象となった 478 例中 223 例 (46.7%) に副作用 (臨床検査値の異常を含む) が認められ、主な副作用は口渇 164 例 (34.3%)、便秘 43 例 (9.0%) であった¹²⁾。

評価項目	投与前 ^{注3)}	12週間後	28週間後	52週間後 又は中止時
症例数	364	355	355	363
1週間あたりの 合計尿失禁回数 (変化率：%)	14.53±14.47	-55.92±72.52 [#]	-70.83±50.56 [#]	-83.51±35.48 [#]
1日あたりの 平均排尿回数 (変化量：回)	11.56±2.81	-1.65±2.12 [#]	-2.05±2.26 [#]	-2.35±2.14 [#]
1日あたりの平均 尿意切迫感回数 (変化率：%)	4.84±3.18	-45.81±53.37 [#]	-55.67±48.65 [#]	-70.53±38.37 [#]

平均値±標準偏差 #：p<0.05 [vs 投与前値]

注3)：投与前は各評価項目とも実測値(回)

17.1.3 国内第Ⅲ相増量長期投与試験

過活動膀胱患者 435 例を対象とし、イミダフェナシン 0.1mg を 1 日 2 回 12 週間経口投与し、その後増量基準^{注4)}に従い、増量例はイミダフェナシン 0.2mg を 1 日 2 回 52 週間経口投与し、非増量例はイミダフェナシン 0.1mg を 1 日 2 回 40 週間経口投与する試験を実施した。0.4mg/日に増量した結果、1 週間あたりの合計尿失禁回数、1 日あたりの平均排尿回数及び 1 日あたりの平均尿意切迫感回数の投与前値に対する変化において改善が認められ、その効果は 64 週間後(増量 52 週間後)まで減弱することなく維持された¹³⁾。

副作用集計の対象となった 435 例中 215 例(49.4%)に副作用(臨床検査値の異常を含む)が認められ、増量例は 182 例中 114 例(62.6%)、非増量例は 253 例中 101 例(39.9%)であった。主な副作用は増量例では口内乾燥 97 例(53.3%)、便秘 34 例(18.7%)、非増量例では口内乾燥 67 例(26.5%)、便秘 25 例(9.9%)であった¹³⁾。

増量長期投与試験 0.4mg/日(増量例)での成績

評価項目	投与前 ^{注5)}	12週間後	24週間後 (増量 12週間後)	64週間後 (増量 52週間後) 又は中止時
症例数	159	159	158	159
1週間あたりの 合計尿失禁回数 (変化率：%)	14.01±13.29	-22.92±75.22 ^{###}	-69.97±42.93 ^{###}	-79.30±41.01 ^{###}
1日あたりの 平均排尿回数 (変化量：回)	11.86±2.44	-0.82±1.70 ^{###}	-2.03±2.01 ^{###}	-2.11±2.06 ^{###}
1日あたりの平均 尿意切迫感回数 (変化率：%)	4.96±2.99	-23.67±43.29 ^{###}	-58.58±40.25 ^{###}	-65.62±38.69 ^{###}

平均値±標準偏差 ###：p<0.001 [vs 投与前値]

注4)：増量基準：投与 12 週後の来院時において、過活動膀胱のいずれの症状も正常化の定義(1日あたりの尿意切迫感の平均回数：0 回(消失)、1日あたりの平均排尿回数：8 回未満、1週間あたりの合計切迫性尿失禁回数：0 回(消失))を満たさ

ない場合を参考に、治験担当医師が増量を必要と判断し、かつ被験者も増量を希望した場合に増量した。ただし、投与 12 週後の来院時までには中等度以上の副作用が発現した場合は、増量しないこととした。

注 5)：投与前は各評価項目とも実測値（回）

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

オキシブチニン塩酸塩、プロピペリン塩酸塩、コハク酸ソリフェナシン等

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

膀胱収縮は、アセチルコリンにより誘発され、膀胱平滑筋のムスカリン性アセチルコリン受容体サブタイプ M3 を介していることが知られている。また、膀胱の神経終末からのアセチルコリン遊離はムスカリン性アセチルコリン受容体サブタイプ M1 刺激により促進されると考えられている。

イミダフェナシンは *in vitro* において受容体サブタイプ M3 及び M1 に対して拮抗作用を示し、膀胱においては M1 拮抗によるアセチルコリン遊離抑制と M3 拮抗による膀胱平滑筋収縮抑制作用を示す。唾液腺の分泌抑制作用に比べ膀胱の収縮抑制作用が相対的に強く、臨床における本剤の有効性と安全性に寄与していることが推察される¹⁴⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ムスカリン性アセチルコリン受容体サブタイプに対する作用

18.2.1 ウサギ及びモルモットの摘出組織標本を用いて精管 (M1)、心房 (M2) 及び回腸 (M3) におけるムスカリン性アゴニストの反応に対する拮抗作用を検討した結果、心房 (M2) に比べ回腸 (M3) 及び精管 (M1) に強い拮抗作用を示した (*in vitro*)。ヒト主代謝物は、ムスカリン性アセチルコリン受容体に対する拮抗作用を示さなかった (*in vitro*)¹⁵⁾。

18.2.2 受容体結合試験において、組み換えヒトムスカリン受容体サブタイプ M1、M2 及び M3 に対する拮抗作用を検討した結果、M3 及び M1 受容体に高親和性を示した (*in vitro*)¹⁵⁾。

18.2.3 ラット摘出膀胱の M3 及び M1 受容体に拮抗しアセチルコリン遊離及び膀胱収縮に対して抑制効果を示した (*in vitro*)^{15, 16)}。

18.3 膀胱に対する作用

18.3.1 ラットを用いた検討において、律動的膀胱収縮を用量依存的に低下させた¹⁷⁾。

18.3.2 ラットを用いた検討において、カルバコールにより誘発した膀胱容量の減少を、用量依存的に抑制した¹⁷⁾。

18.4 膀胱選択性

18.4.1 ラットを用いた検討において、律動的膀胱収縮抑制作用とカルバコール刺激唾液分泌抑制作用との作用比は、プロピペリン塩酸塩に比べ約 10 倍大きく、イミダフェナシンは高い膀胱選択性を示した¹⁷⁾。

18.4.2 ラットのモリス水迷路を用いた空間認知機能の評価において、イミダフェナシンの M1 受容体拮抗作用により空間認知機能が障害される可能性は低いと推測された¹⁷⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与（生物学的同等性試験）

健康成人男性を対象としたイミダフェナシン錠 0.1mg（普通錠）及びイミダフェナシン OD 錠 0.1mg（口腔内崩壊錠）のクロスオーバー法による水なし（24 例）及び水あり（24 例）の空腹時単回経口投与における同等性試験において、それぞれ生物学的に同等であることが確認された¹⁸⁾。

水なし投与試験

製剤	Tmax (hr)	Cmax (pg/mL)	AUC _{0→12} (pg・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
OD 錠	1.4±0.7	487±137	1830±492	3.09±0.46
普通錠	1.1±0.3	552±140	1810±467	3.04±0.41

平均値±標準偏差

水あり投与試験

製剤	Tmax (hr)	Cmax (pg/mL)	AUC _{0→12} (pg・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
OD 錠	1.0±0.2	495±99.8	1810±449	3.08±0.44
普通錠	1.0±0.2	541±119	1860±381	3.15±0.52

平均値±標準偏差

16.1.2 反復投与

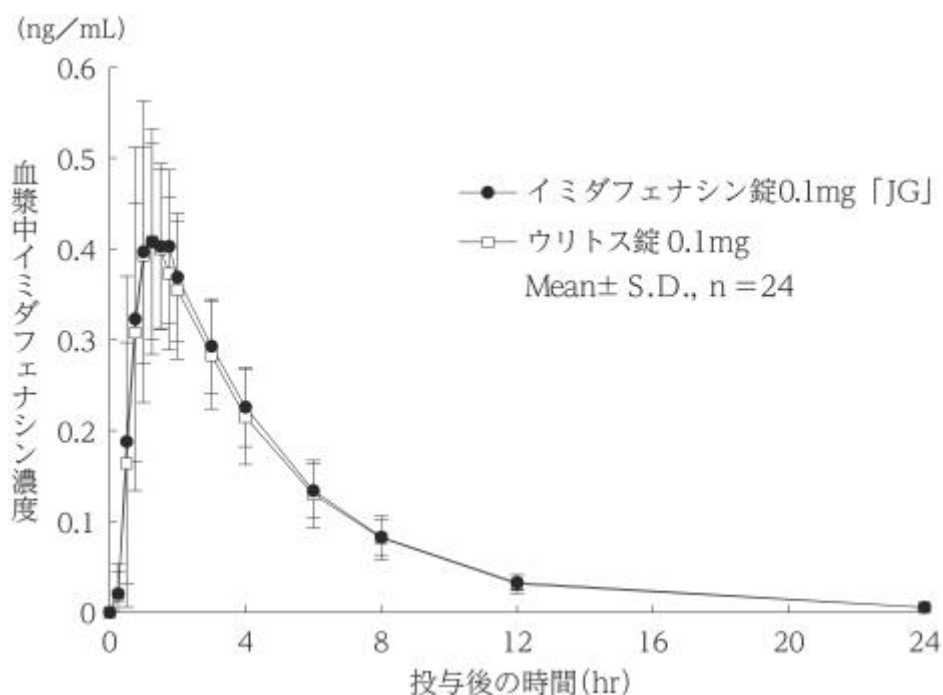
健康成人男性 5 例にイミダフェナシン 0.25mg を 1 日 2 回 5 日間反復投与した時^{注)}、初回投与後と最終回投与後の血漿中濃度推移はほぼ同様であった。また、薬物動態パラメータにも変動は認められず、反復投与による蓄積性は認められなかった¹⁹⁾。

注)本剤の承認された用量は 0.2mg/日、効果不十分な場合は 0.4mg/日まで増量である。

生物学的同等性試験

錠 0.1mg

イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」とウリトス錠 0.1mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（イミダフェナシンとして 0.1mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中イミダフェナシン濃度を測定し、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²⁰⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」	2.209±0.451	0.457±0.126	1.35±0.38	3.89±0.42
ウリトス錠 0.1mg	2.132±0.459	0.443±0.090	1.39±0.44	3.81±0.54

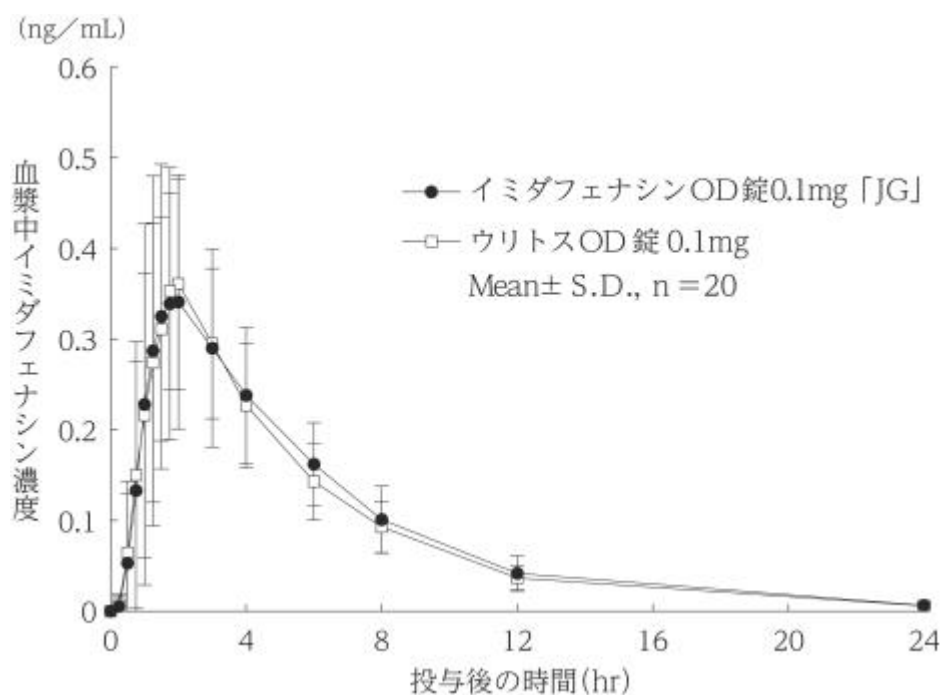
(Mean±S.D., n=24)

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。

OD 錠 0.1mg

① 水なしで服用

イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」とウリトス OD 錠 0.1mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（イミダフェナシンとして 0.1mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中イミダフェナシン濃度を測定し、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²¹⁾。



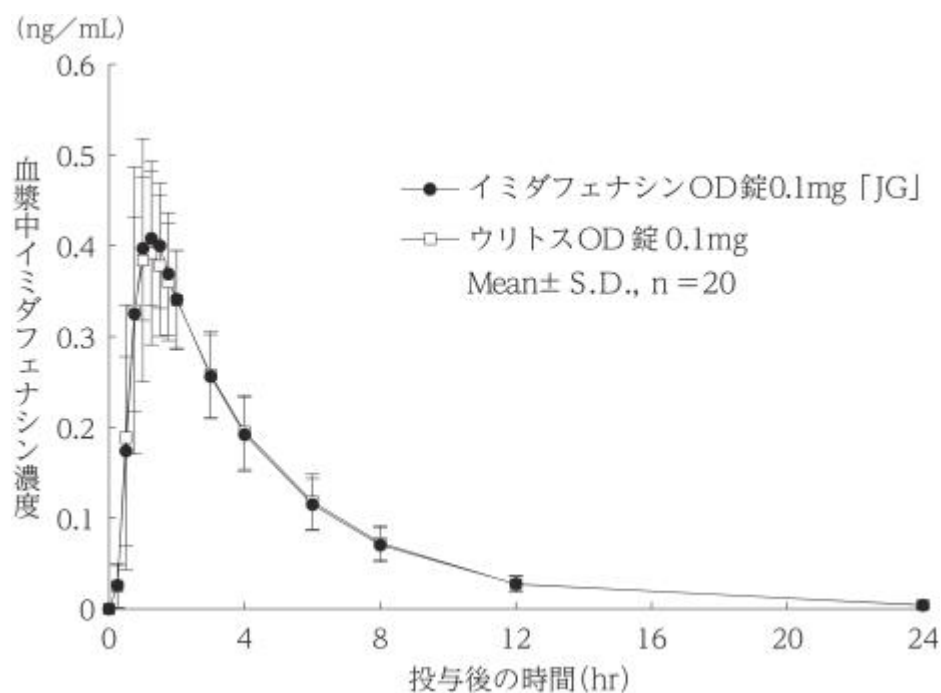
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
イミダフェナシン OD 錠 0.1mg 「JG」	2.203 ± 0.527	0.409 ± 0.114	2.13 ± 1.24	3.83 ± 0.63
ウリトス OD 錠 0.1mg	2.098 ± 0.532	0.394 ± 0.116	1.98 ± 1.08	3.83 ± 0.60

(Mean ± S.D., n=20)

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。

②水で服用

イミダフェナシン OD 錠 0.1mg 「JG」とウリトス OD 錠 0.1mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（イミダフェナシンとして 0.1mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中イミダフェナシン濃度を測定し、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²¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
イミダフェナシン OD錠 0.1mg 「JG」	1.967 ± 0.385	0.427 ± 0.076	1.25 ± 0.21	3.60 ± 0.69
ウリトス OD錠 0.1mg	1.977 ± 0.397	0.430 ± 0.108	1.28 ± 0.37	3.60 ± 0.64

(Mean ± S.D., n=20)

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

〔VII.4.吸収〕、〔VIII.7.相互作用〕の項参照

16.7 薬物相互作用

16.7.1 イトラコナゾール

健康成人男性 10 例に対して、イトラコナゾール 200mg を 1 日 1 回 9 日間反復投与時に、イミダフェナシン 0.1mg を経口投与した時、イミダフェナシンの Cmax 及び AUC_{0→∞} は単独投与時と比較して、それぞれ 1.3 倍及び 1.8 倍に上昇した²²⁾。〔10.2 参照〕

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

錠 0.1mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 (1 錠、n=24)

kel (hr⁻¹) : 0.180576±0.022745

OD 錠 0.1mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 [水なし (1 錠、n=20)]

kel (hr⁻¹) : 0.186738±0.037331

健康成人男子空腹時単回経口投与 [水あり (1 錠、n=20)]

kel (hr⁻¹) : 0.200440±0.043522

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

(1) 解析方法

16.8 その他

16.8.1 母集団薬物動態 (PPK) 解析

NONMEM による母集団薬物動態解析には、吸収のラグタイムがある 1 次吸収を伴う 2-コンパートメントモデルを用いた。長期投与試験及び増量長期投与試験の過活動膀胱患者 (20 ~ 85 歳) 852 例と、健康成人 (20 ~ 75 歳) 90 例の計 3,168 時点の血漿中濃度を測定した。体重、年齢、性差、飲酒歴、喫煙歴、肝機能指標 (AST、ALT、 γ -GTP、アルカリホスファターゼ (ALP)、乳酸脱水素酵素、総ビリルビン)、腎機能指標 (血清クレアチニン、血中尿素窒素)、血中アルブミン値とイミダフェナシンの経口クリアランス (CL/F) との関係の評価したところ、アルカリホスファターゼが正常な患者に対して軽度異常患者の CL/F は 4%低かった。また、非高齢者に対して高齢者の CL/F は 14%低かった。腎機能指標 (血清クレアチニン、血中尿素窒素) を含むその他の共変量は CL/F に影響を及ぼさなかった。[9.2.1、9.3.1、9.3.2 参照]

母集団パラメータ	推定値 (95%信頼区間)	個体間変動
全身クリアランス (L/hr)	23.1 (21.2-25.0)	32.4%
中心コンパートメントの分布容積 (L)	109 (102-116)	23.3%
コンパートメント間のクリアランス (L/hr)	3.50 (2.95-4.05)	
末梢コンパートメントの分布容積 (L)	44.3 (33.8-54.8)	
吸収速度定数 (1/hr)	3.07 (2.55-3.59)	136.7%
吸収のラグタイム (hr)	0.436 (0.422-0.450)	
個体内変動	37.3%	

なお、増量長期投与試験を含む臨床試験の 0.2mg/日及び 0.4mg/日投与例において、中等度以上の肝障害患者及び重度の腎障害患者での使用経験はなかった^{23, 24)}。

注)本剤の承認された用量は 0.2mg/日、効果不十分な場合は 0.4mg/日まで増量である。

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

16.2.1 食事の影響

健康成人男性 12 例にイミダフェナシン 0.1mg を空腹時に単回経口投与した時、血漿中濃度は投与後 1.5 時間で最高に達し、その濃度は 471pg/mL で、消失半減期は 2.9 時間であった。また、食後投与では空腹時投与に比し Cmax は 1.3 倍、AUC_{0→12} は 1.2 倍であった²⁵⁾。

投与条件	Tmax (hr)	Cmax (pg/mL)	AUC _{0→12} (pg・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
空腹時	1.5	471±107	2230±540	2.9±0.2
食後	1.3	611±113	2690±470	2.9±0.2

平均値±標準偏差、Tmax のみ中央値

16.2.2 絶対的バイオアベイラビリティ

外国人健康成人男性において、イミダフェナシンは消化管からほぼ 100%吸収され、絶対的バイオアベイラビリティは 57.8%であった²⁶⁾。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

〔Ⅷ.6. (5) 妊婦〕の項参照

(3) 乳汁への移行性

〔Ⅷ.6. (6) 授乳婦〕の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

16.3 分布

16.3.1 動物における分布

イミダフェナシンをラットに単回経口投与した時、膀胱組織中濃度は 1 時間後に最大値を示し、1.8 時間の半減期で血清中濃度よりも緩徐に消失した。膀胱における Cmax 及び AUC_{0→12} は、それぞれ血清中の 10.7 及び 25.4 倍高い値を示した²⁷⁾。

(6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

16.3.2 蛋白結合

血漿蛋白結合率は、87.1～88.8%であり、主結合蛋白はアルブミン及び α_1 -酸性糖蛋白であった²⁸⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

イミダフェナシンは経口投与後に約40%が肝臓で初回通過効果を受ける。血漿中主代謝物は、メチルイミダゾール基が酸化されたM-2、またM-2のメチルイミダゾール基が環開裂を受けたM-4及び未変化体のN-グルクロン酸抱合体であるM-9であった。M-2及びM-4への代謝には主としてCYP3A4が、M-9への代謝には主としてUGT1A4が関与する^{29, 30)}。[10.参照]

また、イミダフェナシン及びその主代謝物M-2、M-4、M-9は、ヒトCYP分子種(CYP1A2、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6、CYP2E1及びCYP3A4)を阻害しなかった(*in vitro*)²⁹⁾。

(2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

[VII.6. (1) 代謝部位及び代謝経路]の項参照

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

[VII.6. (1) 代謝部位及び代謝経路]の項参照

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

外国人健康成人男性6例に、¹⁴C イミダフェナシンを0.25mgの用量で空腹時に単回経口投与した時^{注)}、投与量の95%が投与後192時間までに尿及び糞中に排泄された(尿中65.6%、糞中29.4%)。未変化体の尿中排泄率は10%未満であり、糞中への未変化体の排泄は認められなかった³¹⁾。

注)本剤の承認された用量は0.2mg/日、効果不十分な場合は0.4mg/日まで増量である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 高齢者

健康な非高齢男性 6 例及び 65 歳以上の高齢者 9 例にイミダフェナシン 0.1mg を空腹時に単回経口投与した時、高齢者では Cmax が非高齢男性に比べて 1.2 倍高かったが、AUC_{0→∞}はほぼ同様であった^{32, 33}。[9.8 参照]

	Tmax (hr)	Cmax (pg/mL)	AUC _{0→∞} (pg・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
非高齢	1.5	382±106	2010±1050	2.6±0.7
高齢	1.0	445±136	2140±480	3.1±0.4

平均値±標準偏差、Tmax のみ中央値

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 尿閉を有する患者

〔抗コリン作用により排尿時の膀胱収縮が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.2 参照〕

2.2 幽門、十二指腸又は腸管が閉塞している患者及び麻痺性イレウスのある患者

〔抗コリン作用により胃腸の平滑筋の収縮及び運動が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.4 参照〕

2.3 消化管運動・緊張が低下している患者

〔抗コリン作用により胃腸の平滑筋の収縮及び運動が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕

2.4 閉塞隅角緑内障の患者

〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.1 参照〕

2.5 重症筋無力症の患者

〔抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。〕

2.6 重篤な心疾患の患者

〔期外収縮等の心電図異常が報告されており、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.6 参照〕

2.7 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

〔V.2.効能又は効果に関連する注意〕を参照すること

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

〔V.4.用法及び用量に関連する注意〕を参照すること

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 眼調節障害（羞明、霧視、眼の異常感等）、めまい、眠気があらわれることがあるので、本剤投与中の患者には、自動車の運転等、危険を伴う機械の操作に注意させること。

8.2 本剤投与により効果が認められない場合には、漫然と投与せず、適切な治療を考慮すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 前立腺肥大症等の下部尿路閉塞疾患を有する患者

本剤投与前に残尿量測定を実施し、必要に応じて、専門的な検査をすること。投与後は残尿量の増加に注意し、十分な経過観察を行うこと。[11.1.2 参照]

9.1.2 排尿困難のある患者

抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。[11.1.2 参照]

9.1.3 不整脈のある患者

抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。

9.1.4 認知症又は認知機能障害のある患者

抗コリン作用により、症状が悪化するおそれがある。

9.1.5 パーキンソン症状又は脳血管障害のある患者

症状の悪化あるいは精神神経症状があらわれるおそれがある。

9.1.6 潰瘍性大腸炎の患者

中毒性巨大結腸があらわれるおそれがある。

9.1.7 甲状腺機能亢進症の患者

抗コリン作用により、頻脈等の交感神経興奮症状が悪化するおそれがある。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重度の腎障害のある患者

腎排泄が遅延するおそれがある。[7.3、16.8.1 参照]

9.2.2 軽度又は中等度の腎障害のある患者

腎排泄が遅延するおそれがある。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 中等度以上の肝障害のある患者

主として肝で代謝されるため、副作用が発現しやすくなるおそれがある。[7.2、16.8.1 参照]

9.3.2 軽度の肝障害のある患者

主として肝で代謝されるため、副作用が発現しやすくなるおそれがある。[16.8.1 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。動物実験（ラット）において胎児への移行が報告されている。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

一般に、生理機能が低下している。[16.6.1 参照]

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は、主として肝の薬物代謝酵素 CYP3A4 により代謝される。[16.4 参照]

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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
CYP3A4 を阻害する薬剤 イトラコナゾール エリスロマイシン クラリスロマイシン等 [16.7.1 参照]	健康成人男性においてイトラコナゾールと併用したとき、本剤の C_{max} は約 1.3 倍上昇し、AUC は約 1.8 倍に上昇した。	本剤は主として CYP3A4 で代謝されるので、これらの薬剤により本剤の代謝が阻害される。
抗コリン作用を有する薬剤 三環系抗うつ剤 フェノチアジン系薬剤 モノアミン酸化酵素阻害剤	口内乾燥、便秘、排尿困難等があらわれるおそれがある。	抗コリン作用が増強されるおそれがある。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 急性緑内障（0.06%）

眼圧亢進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投与を中止し、直ちに適切な処置を行うこと。[2.4 参照]

11.1.2 尿閉（頻度不明）

[2.1、9.1.1、9.1.2 参照]

11.1.3 肝機能障害（頻度不明）

AST、ALT、ビリルビンの上昇等を伴う肝機能障害があらわれることがある。

11.1.4 麻痺性イレウス（頻度不明）

著しい便秘、腹部膨満感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。[2.2 参照]

11.1.5 幻覚・せん妄（頻度不明）

11.1.6 QT 延長、心室性頻拍（いずれも頻度不明）

QT 延長、心室性頻拍、房室ブロック、徐脈等があらわれるとの報告がある。[2.6 参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1 ~ 5%未満	頻度不明
過敏症		発疹、そう痒 等	
精神神経系		眠気、味覚異常、めまい、頭痛	しびれ
消化器	便秘	胃・腹部不快感、悪心、腹痛、腹部膨満、下痢、食欲不振、消化不良、胃炎、嘔吐、口唇乾燥、異常便、口内炎	
循環器		動悸、期外収縮、血圧上昇	
呼吸器		咽喉頭疼痛、咳嗽、咽喉乾燥、嘔声	
血液		赤血球減少、白血球減少、血小板減少	
泌尿器・腎臓		排尿困難、残尿、尿中白血球・赤血球陽性、尿路感染（膀胱炎、腎盂腎炎等）、尿中蛋白陽性、クレアチニン増加	
眼		羞明、霧視、眼の異常感、眼球乾燥、眼精疲労、眼瞼浮腫、複視	
肝臓		γ-GTP、アルカリホスファターゼ、AST、ALT、ビリルビンの上昇	
その他	口渇・口内乾燥 (33.1%)	トリグリセリド増加、浮腫、LDH 増加、血中尿酸上昇、倦怠感、コレステロール増加、胸痛、背部痛、脱力感、皮膚乾燥	

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

尿閉、散瞳、興奮、頻脈等

13.2 処置

胃洗浄又は活性炭投与を行い、次にアトロピン過量投与の場合と同様の処置を行う。また、尿閉に対しては導尿等、散瞳に対してはピロカルピン投与等、各症状に応じて適切な処置を行う。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

〈製剤共通〉

14.1.1 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ある。

〈OD 錠〉

14.1.2 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

14.1.3 寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

マウスに2年間経口投与したがん原性試験(30、100及び300mg/kg)において、雌雄の300mg/kg群で肝細胞腺腫の増加が認められたとの報告がある。また、ラットに2年間経口投与したがん原性試験(3、7、15及び30mg/kg)において、肝細胞腺腫の増加は認められなかったとの報告がある。

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

〔VI.薬効薬理に関する項目〕の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

〔VIII.12.その他の注意〕の項参照

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

(1) 製剤：処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

(2) 有効成分：劇薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

〈OD錠〉

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資材

- ・患者向医薬品ガイド：有り
- ・くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ウリトス[®]錠 0.1mg、ウリトス[®]OD錠 0.1mg、ステープラ[®]錠 0.1mg、ステープラ[®]OD錠 0.1mg

同効薬：オキシブチニン塩酸塩、プロピペリン塩酸塩、コハク酸ソリフェナシン等

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」	2020年2月17日	30200AMX00198000	2020年6月19日	2020年6月19日
イミダフェナシンOD錠 0.1mg「JG」	2020年2月17日	30200AMX00153000	2020年6月19日	2020年6月19日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算 コード
イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」	2590013F1043	2590013F1043	128047001	622804701
イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」	2590013F2040	2590013F2040	128048701	622804801

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品である。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」の加速試験)
- 2) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」の加速試験)
- 3) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」の無包装状態での安定性試験)
- 4) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」の無包装状態での安定性試験)
- 5) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」の PTP 包装状態での安定性試験)
- 6) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」の PTP 包装状態での安定性試験)
- 7) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」の溶出試験)
- 8) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」の溶出試験)
- 9) Homma, Y. et al. :Int. J. Urol. 2009 ;16 :499-506
- 10) 過活動膀胱患者に対するプラセボおよび塩酸プロピペリンを対照とした多施設共同二重盲検無作為化並行群間比較試験 (ウリトス錠・ステープラ錠 :2007 年 4 月 18 日承認, 申請資料概要 2.7.6.3)
- 11) Homma, Y. et al. :Int. J. Urol. 2008 ;15 :986-991
- 12) 過活動膀胱患者に対する長期投与試験 (ウリトス錠・ステープラ錠 :2007 年 4 月 18 日承認, 申請資料概要 2.7.6.3)
- 13) 山口脩, 他. :薬理と治療. 2009 ;37 :909-930
- 14) 小林文義, 他. :日本排尿機能学会誌. 2007 ;18 (2) :292-298
- 15) Kobayashi, F. et al. :Arzneimittelforschung. 2007 ;57 (2) :92-100
- 16) 宇野隆司, 他. :日本薬理学雑誌. 2008 ;131 :379-387
- 17) Kobayashi, F. et al. :Arzneimittelforschung. 2007 ;57 (3) :147-154
- 18) 島田英世, 他. :臨床医薬. 2011 ;27 (2) :171-182
- 19) 島田英世, 他. :臨床医薬. 2007 ;23 (4) :249-262
- 20) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン錠 0.1mg「JG」の生物学的同等性試験)
- 21) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (イミダフェナシン OD 錠 0.1mg「JG」の生物学的同等性試験)
- 22) Ohno, T. et al. :J. Clin. Pharmacol. 2008 ;48 :330-334
- 23) Hasegawa, C. et al. :Drug Metab. Pharmacokinet. 2013 ;28 (3) :203-212
- 24) 安全性について (ウリトス錠・ステープラ錠 :2009 年 12 月 18 日承認, 審査報告書)
- 25) 島田英世, 他. :臨床医薬. 2007 ;23 (4) :273-285
- 26) Ohno, T. et al. :Br. J. Clin. Pharmacol. 2008 ;65 (2) :197-202
- 27) 膀胱組織への移行性 (ウリトス錠・ステープラ錠 :2007 年 4 月 18 日承認, 申請資料概要 2.6.4.4)
- 28) ヒト生体試料を用いた *in vitro* 試験 (ウリトス錠・ステープラ錠 :2007 年 4 月 18 日承認, 申請資料概要 2.7.2.2)
- 29) Kanayama, N. et al. :Xenobiotica. 2007 ;37 (2) :139-154
- 30) マスバランス (ウリトス錠・ステープラ錠 :2007 年 4 月 18 日承認, 申請資料概要 2.7.2.2)

- 31) Ohmori, S. et al. :Drug Metab. Dispos. 2007 ;35 (9) :1624-1633
32) 島田英世, 他. :臨床医薬. 2007 ;23 (4) :233-248
33) 島田英世, 他. :臨床医薬. 2007 ;23 (4) :263-272

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

粉砕

1. 保存条件

温度に対する安定性試験：40±2℃、4週〔遮光・気密容器〕

湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、4週〔遮光・開放〕

光に対する安定性試験：30万lx・hr〔シャーレ+ラップ〕※

※2000lx/hr 25±2℃/60±5%RH

2. 試験項目

性状、純度試験、含量

3. 試験結果

錠 0.1mg

試験項目		性状	純度試験	含量 (%) [残存率 (%)]
製剤の規格 (参考) (粉砕前の状態)		(1)	(2)	(3)
試験開始時		淡赤褐色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	適合	100.7 [100]
①温度	4週後	淡赤褐色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	適合	99.7 [99.0]
②湿度	4週後	淡赤褐色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	適合	96.5 [95.8]
③光	30万lx・hr	淡赤褐色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	不適合	86.5 [85.9]

(1) 淡赤色～淡赤褐色又は淡赤紫色のフィルムコーティング錠

(2) 個々の類縁物質 0.5%以下、総類縁物質 1.0%以下

(3) 表示量の 95.0～105.0%

OD 錠 0.1mg

試験項目		性状	含量 (%) [残存率 (%)]	純度試験 (%)
製剤の規格 (参考) (粉碎前の状態)		(1)	(2)	(3)
試験開始時		白色の粉末	98.6 [100]	未検出
①温度	4 週後	白色の粉末	98.4 [99.8]	未検出
②湿度	4 週後	白色の粉末	96.7 [98.1]	0.73
③光	30 万 lx·hr	白色の粉末	94.1 [95.4]	1.85
	60 万 lx·hr	白色の粉末	93.7 [95.0]	—※

※30 万 lx·hr において安全性確認及び構造決定の閾値である 1.0%を超える類縁物質の増加を認めことから以降の試験は中止した。

- (1) 白色の素錠
- (2) 表示量の 95.0 ~ 105.0%
- (3) 個々の類縁物質質量<参考値>

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

1. 試験方法

崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。チューブサイズは 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr.、と通過するまで変更する。

2. 試験結果

崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
イミダフェナシン錠 0.1mg 「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。
イミダフェナシン OD 錠 0.1mg 「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

通過性試験結果

品目名	通過性
イミダフェナシン錠 0.1mg 「JG」	8Fr.のチューブを通過した。
イミダフェナシン OD 錠 0.1mg 「JG」	8Fr.のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし

Memo

