

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

コハク酸ソリフェナシン口腔内崩壊錠

ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠 2.5mg「JG」 ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠 5mg「JG」

Solifenacin Succinate OD tablets

剤形	口腔内崩壊錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	錠 2.5mg：1錠 コハク酸ソリフェナシン 2.5mg 含有 錠 5mg：1錠 コハク酸ソリフェナシン 5.0mg 含有
一般名	和名：コハク酸ソリフェナシン（JAN） 洋名：Solifenacin Succinate（JAN）
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：2021年2月15日 薬価基準収載年月日：2021年6月18日 販売開始年月日：2021年6月18日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本ジェネリック株式会社
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 お客様相談室 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 10 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIF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IF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IF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、「IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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IF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IF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。

IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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、IF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、IF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、IF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	15
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	15
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	15
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	15
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	16
(2)流通・使用上の制限事項	1	11. 別途提供される資材類	16
6. RMPの概要	1	12. その他	16
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	17
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	17
(1)和名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	17
(2)洋名	2	3. 用法及び用量	17
(3)名称の由来	2	(1)用法及び用量の解説	17
2. 一般名	2	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	17
(1)和名（命名法）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	17
(2)洋名（命名法）	2	5. 臨床成績	17
(3)ステム（stem）	2	(1)臨床データパッケージ	17
3. 構造式又は示性式	2	(2)臨床薬理試験	18
4. 分子式及び分子量	2	(3)用量反応探索試験	18
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(4)検証的試験	18
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1)有効性検証試験	18
III. 有効成分に関する項目	3	2)安全性試験	19
1. 物理化学的性質	3	(5)患者・病態別試験	19
(1)外観・性状	3	(6)治療的使用	19
(2)溶解性	3	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	19
(3)吸湿性	3	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	19
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(7)その他	19
(5)酸塩基解離定数	3	VI. 薬効薬理に関する項目	20
(6)分配係数	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	20
(7)その他の主な示性値	3	2. 薬理作用	20
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1)作用部位・作用機序	20
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	20
IV. 製剤に関する項目	4	(3)作用発現時間・持続時間	20
1. 剤形	4	VII. 薬物動態に関する項目	21
(1)剤形の区別	4	1. 血中濃度の推移	21
(2)製剤の外観及び性状	4	(1)治療上有効な血中濃度	21
(3)識別コード	4	(2)臨床試験で確認された血中濃度	21
(4)製剤の物性	4	(3)中毒域	23
(5)その他	4	(4)食事・併用薬の影響	24
2. 製剤の組成	4	2. 薬物速度論的パラメータ	24
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	4	(1)解析方法	24
(2)電解質等の濃度	5	(2)吸収速度定数	24
(3)熱量	5	(3)消失速度定数	24
3. 添付溶解液の組成及び容量	5		
4. 力価	5		
5. 混入する可能性のある夾雑物	5		
6. 製剤の各種条件下における安定性	5		
7. 調製法及び溶解後の安定性	10		

(4)クリアランス	24	(1)臨床使用に基づく情報	32
(5)分布容積	24	(2)非臨床試験に基づく情報	32
(6)その他	24		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	24	IX. 非臨床試験に関する項目	33
(1)解析方法	24	1. 薬理試験	33
(2)パラメータ変動要因	24	(1)薬効薬理試験	33
4. 吸収	24	(2)安全性薬理試験	33
5. 分布	24	(3)その他の薬理試験	33
(1)血液－脳関門通過性	24	2. 毒性試験	33
(2)血液－胎盤関門通過性	24	(1)単回投与毒性試験	33
(3)乳汁への移行性	25	(2)反復投与毒性試験	33
(4)髄液への移行性	25	(3)遺伝毒性試験	33
(5)その他の組織への移行性	25	(4)がん原性試験	33
(6)血漿蛋白結合率	25	(5)生殖発生毒性試験	33
6. 代謝	25	(6)局所刺激性試験	33
(1)代謝部位及び代謝経路	25	(7)その他の特殊毒性	33
(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	34
(3)初回通過効果の有無及びその割合	25	1. 規制区分	34
(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	34
7. 排泄	25	3. 包装状態での貯法	34
8. トランスポーターに関する情報	25	4. 取扱い上の注意	34
9. 透析等による除去率	25	5. 患者向け資材	34
10. 特定の背景を有する患者	26	6. 同一成分・同効薬	34
11. その他	26	7. 国際誕生年月日	34
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	35
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	35
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	35
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	35
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	35
5. 重要な基本的注意とその理由	27	13. 各種コード	35
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	27	14. 保険給付上の注意	35
(1)合併症・既往歴等のある患者	27	X I. 文献	36
(2)腎機能障害患者	28	1. 引用文献	36
(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)粉碎	38
(1)併用禁忌とその理由	29	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	39
(2)併用注意とその理由	29	2. その他の関連資料	41
8. 副作用	30		
(1)重大な副作用と初期症状	30		
(2)その他の副作用	30		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	31		
10. 過量投与	32		
11. 適用上の注意	32		
12. その他の注意	32		

略語表

略語	略語内容
Al-P	アルカリホスファターゼ (Alkaline Phosphatase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
AUC	血漿中濃度-時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC _{24h}	投与 24 時間後までの AUC (AUC from zero to 24 hours)
AUC ₀₋₁₆₈	投与 168 時間後までの AUC (AUC from zero to 168 hours)
BUN	血中尿素窒素 (Blood urea nitrogen)
CK	クレアチンキナーゼ (Creatine kinase)
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)
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

本邦でコハク酸ソリフェナシンは 2006 年に発売されている。

本剤は日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成 26 年 11 月 21 日 薬食発 1121 第 2 号）」に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2021 年 2 月に製造販売承認を得て、2021 年 6 月に販売開始した。

2. 製品の治療学的特性

重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、肝機能障害、尿閉、QT 延長、心室頻拍（Torsades de Pointes を含む）、房室ブロック、洞不全症候群、高度徐脈、麻痺性イレウス、幻覚・せん妄、急性緑内障発作が報告されている（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 - 8. 副作用（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) 錠剤本体の両面に成分名の一部（ソリフェナシン）、口腔内崩壊錠であること（OD）、含量及び屋号を印刷し、識別性を向上させている（「Ⅳ. 製剤に関する項目 - 1. 剤型（2）製剤の外観及び性状」の項参照）。

(2) 本剤はコハク酸ソリフェナシン特有の苦みをマスクしたストロベリー風味の製剤である（「Ⅳ. 製剤に関する項目 - 1. 剤型（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材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	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

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」

(2) 洋名

Solifenacin Succinate OD tablets 2.5mg “JG”

Solifenacin Succinate OD tablets 5mg “JG”

(3) 名称の由来

「一般的名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」より命名

〔「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）

コハク酸ソリフェナシン（JAN）

(2) 洋名（命名法）

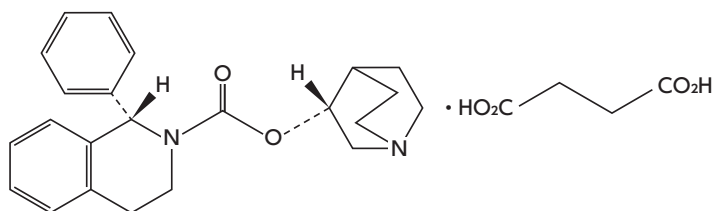
Solifenacin Succinate（JAN）

Solifenacin（INN）

(3) ステム（stem）

該当資料なし

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₃H₂₆N₂O₂・C₄H₆O₄

分子量：480.55

5. 化学名（命名法）又は本質

(3*R*)-1-Azabicyclo [2,2,2] oct-3-yl (1*S*)-1-phenyl-3,4-dihydroisoquinoline-2 (1*H*)-carboxylate monosuccinate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

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

水又はメタノールに溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：144～149℃

(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

- (1) 塩化鉄（Ⅲ）試液による褐色沈殿反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 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

口腔内崩壊錠

(2) 製剤の外観及び性状

本剤はストロベリー風味の製剤である。

販 売 名	ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」	ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」
色 ・ 剤 形	円形の白色の錠剤	円形の帯黄白色の錠剤
外 形		
大きさ (mm)	直径：7.0 厚さ：3.4	直径：8.5 厚さ：4.5
重 量 (mg)	130	260

(3) 識別コード

- ・ ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」
錠剤本体に記載：ソリフェナシン OD 2.5 JG
- ・ ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」
錠剤本体に記載：ソリフェナシン OD 5 JG

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(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

- ・ ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」
1 錠中 コハク酸ソリフェナシンとして 2.5mg 含有
- ・ ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」
1 錠中 コハク酸ソリフェナシンとして 5.0mg 含有

添加剤

- ・ ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」
乳糖水和物、結晶セルロース、ヒプロメロース、酒石酸、メチルセルロース、ポリオキシエチレン (105) ポリオキシプロピレン (5) グリコール、ステアリン酸マグネシウム、D-マンニトール、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール（完全けん化物）、クロスポビドン、β-シクロデキストリン、アスパルテム（L-フェニルアラニン化合物）、バニリン、エチルバニリン、香料、フマル酸ステアリルナトリウム

- ・ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」

乳糖水和物、結晶セルロース、ヒプロメロース、酒石酸、メチルセルロース、ポリオキシエチレン (105) ポリオキシプロピレン (5) グリコール、ステアリン酸マグネシウム、D-マンニトール、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール (完全けん化物)、クロスポビドン、β-シクロデキストリン、アスパルテーム (L-フェニルアラニン化合物)、バニリン、エチルバニリン、香料、黄色三二酸化鉄、フマル酸ステアリルナトリウム

(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

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」

◎加速試験¹⁾

包装形態：PTP/アルミピロー包装

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験、崩壊試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験	純度試験	製剤均一性試験	崩壊試験	溶出試験	定量試験 (%)
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	適合	100.3
1 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	適合	99.9
3 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	適合	100.8
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	適合	100.8

(1) 円形の白色の錠剤である。

(2) 液体クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得た主ピークの保持時間は等しい。また、それらのピークの吸収スペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

(3) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT*約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物質は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

- (4) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。
- (5) 2 分以内に崩壊する。
- (6) 15 分間、85%以上（溶出試験第 2 液 900mL、パドル法、50rpm）
- (7) 表示量の 95.0～105.0%

※RRT：相対保持時間

最終包装製品を用いた加速試験（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。

◎アルミピロー開封後の安定性試験²⁾

包装形態：PTP シート

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月（遮光）

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月（遮光）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr/25℃（約 4000lx）

試験項目：性状、純度試験、崩壊試験、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	純度試験	崩壊試験	溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)
試験開始時		適合	適合	適合	適合	103.0	41
①温度	3 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	101.3	33
②湿度	3 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	102.5	26
③光	120 万 lx・hr	適合	適合	適合	適合	102.5	33

(1) 円形の白色の錠剤である。

(2) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT*約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物質は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

(3) 2 分以内に崩壊する。

(4) 15 分間、85%以上（溶出試験第 2 液 900mL、パドル法、50rpm）

(5) 表示量の 95.0～105.0%

(6) 参考値

※RRT：相対保持時間

◎無包装状態での安定性試験³⁾

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

③湿度に対する安定性試験：25±2℃/60±5%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

④光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr/25℃（約 4000lx・シャーレ+ラップ（フタ））

試験項目：性状、純度試験、崩壊試験、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目	性状	純度試験 (%)				崩壊試験	溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)	
		RRT* 約 0.6 の類縁 物質	RRT* 約 0.8 の類縁 物質	その他 の個々 の類縁 物質	類縁 物質の 合計					
規格	(1)	(2)				(3)	(4)	(5)	(6)	
試験開始時	適合	0.03	0.12	0.07	0.32	適合	適合	103.0	41	
①温度	3 ヶ月後	適合	0.11	0.16	0.11	0.52	適合	適合	101.1	38
②湿度	1 ヶ月後	適合	0.04	0.16	0.06	0.41	適合	適合	101.9	25 (変化あり)
	3 ヶ月後	適合	0.06	0.26	0.12	0.57	適合	適合	101.1	20 (変化あり)
③湿度	1 ヶ月後	適合	0.04	0.15	0.07	0.41	適合	適合	100.8	27 (変化あり)
	3 ヶ月後	適合	0.04	0.23	0.14	0.52	適合	適合	100.1	27 (変化あり)
④光	120 万 lx・hr	適合	0.06	0.12	0.15	0.55	適合	適合	101.7	37

(1) 円形の白色の錠剤である。

(2) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT*約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物質は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

(3) 2 分以内に崩壊する。

(4) 15 分間、85%以上（溶出試験第 2 液 900mL、パドル法、50rpm）

(5) 表示量の 95.0~105.0%

(6) 参考値

※RRT：相対保持時間

安定性の評価は「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」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」

◎加速試験⁴⁾

包装形態：PTP/アルミピロー包装

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験、崩壊試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験	純度試験	製剤均一性試験	崩壊試験	溶出試験	定量試験 (%)
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	適合	100.2
1 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	適合	100.0
3 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	適合	100.7
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	適合	100.2

(1) 円形の帯黄白色の錠剤である。

(2) 液体クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得た主ピークの保持時間は等しい。また、それらのピークの吸収スペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

(3) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT^{*}約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物質は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

(4) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。

(5) 2 分以内に崩壊する。

(6) 15 分間、85%以上（溶出試験第 2 液 900mL、パドル法、50rpm）

(7) 表示量の 95.0～105.0%

※RRT：相対保持時間

最終包装製品を用いた加速試験（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。

◎アルミピロー開封後の安定性試験⁵⁾

包装形態：PTP シート

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月（遮光）

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月（遮光）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr/25℃（約 4000lx）

試験項目：性状、純度試験、崩壊試験、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	純度試験	崩壊試験	溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)
試験開始時		適合	適合	適合	適合	101.0	55
①温度	3 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	99.4	48
②湿度	3 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	99.8	43
③光	120 万 lx・hr	適合	適合	適合	適合	100.8	49

(1) 円形の帯黄白色の錠剤である。

(2) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT*約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物資は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

(3) 2 分以内に崩壊する。

(4) 15 分間、85%以上（溶出試験第 2 液 900mL、パドル法、50rpm）

(5) 表示量の 95.0~105.0%

(6) 参考値

※RRT：相対保持時間

◎無包装状態での安定性試験⁶⁾

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

③湿度に対する安定性試験：25±2℃/60±5%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

④光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr/25℃（約 4000lx・シャーレ+ラップ（フタ））

試験項目：性状、純度試験、崩壊試験、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目	性状	純度試験 (%)				崩壊試験	溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)	
		RRT* 約 0.6 の類縁物質	RRT* 約 0.8 の類縁物質	その他 の個々の類縁物質	類縁物質の合計					
規格	(1)	(2)				(3)	(4)	(5)	(6)	
試験開始時	適合	0.02	0.13	0.07	0.32	適合	適合	101.0	55	
①温度	3 ヶ月後	適合	0.11	0.17	0.11	0.53	適合	適合	100.0	50
②湿度	1 ヶ月後	適合	0.04	0.18	0.07	0.44	適合	適合	99.6	30 (変化あり)
	3 ヶ月後	適合	0.06	0.29	0.16	0.70	適合	適合	99.3	25 (変化あり)
③湿度	1 ヶ月後	適合	0.03	0.15	0.07	0.40	適合	適合	100.6	35 (変化あり)
	3 ヶ月後	適合	0.04	0.24	0.14	0.59	適合	適合	99.7	34 (変化あり)
④光	120 万 lx・hr	適合	0.03	0.11	0.09	0.35	適合	適合	100.7	45

(1) 円形の帯黄白色の錠剤である。

(2) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT*約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物質は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

(3) 2 分以内に崩壊する。

(4) 15 分間、85%以上（溶出試験第 2 液 900mL、パドル法、50rpm）

(5) 表示量の 95.0~105.0%

(6) 参考値

※RRT：相対保持時間

安定性の評価は「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」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

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

【溶出挙動の同等性又は類似性】

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」⁷⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について 別紙 2 含量が異なる経口固形製剤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）」に従う。

- ・ 標準製剤：ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」
- ・ 処方変更水準：A 水準

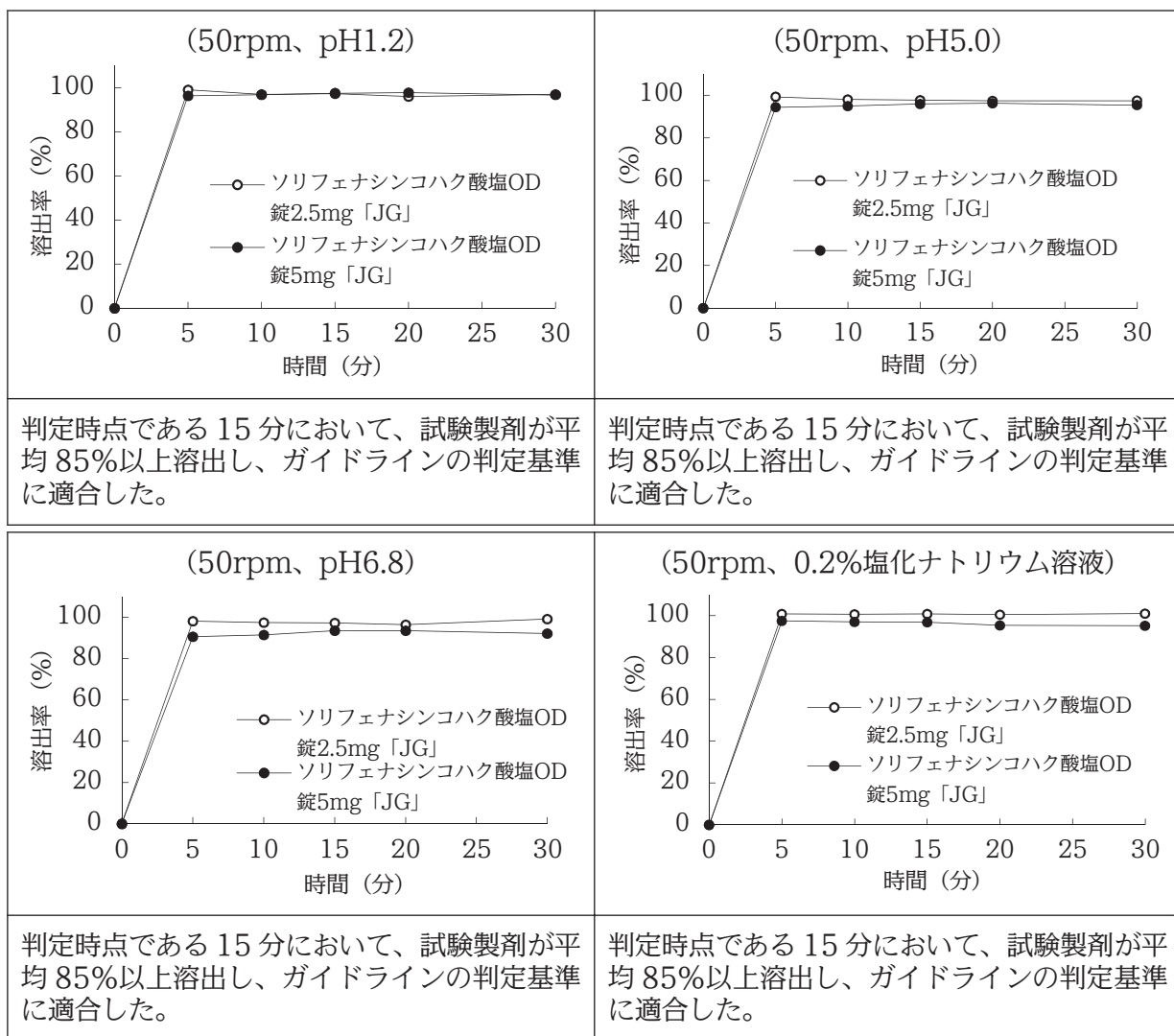
試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
			pH5.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 溶出試験第 2 液
			0.2%塩化ナトリウム溶液	0.2%塩化ナトリウム溶液
	100rpm	pH6.8	日本薬局方 溶出試験第 2 液	
試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

- ・ 判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	(1) 平均溶出率 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 ±10%の範囲にある。 (2) 個々の溶出率 試験製剤の平均溶出率 ±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。
	pH5.0	
	pH6.8	
	0.2%塩化ナトリウム溶液	
100	pH6.8 [※]	

※ガイドラインに「パドル法、100 回転で実施すべき試験液性において、パドル法、50、75 回転の溶出試験で、30 分以内に標準製剤、試験製剤ともに平均 85%以上溶出する場合、パドル法、100 回転の溶出試験を省略してもよい。」と記載されていることから、100rpm の溶出試験を省略した。

・試験結果



溶出挙動の同等性の判定 (平均溶出率)

回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤 (ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」)	試験製剤 (ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」)	
50	pH1.2	15	97.5	97.3	適合
	pH5.0	15	96.0	97.8	適合
	pH6.8	15	93.5	97.3	適合
	0.2%塩化ナトリウム溶液	15	96.8	100.8	適合

溶出挙動の同等性の判定（個々の溶出率）

回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (min)	個々の溶出率 (%)	平均溶出率との差		判定
			最小値～最大値	±15%超	±25%超	
50	pH1.2	15	93.5～99.8	0 個	0 個	適合
	pH5.0	15	96.0～99.8	0 個	0 個	適合
	pH6.8	15	95.9～99.2	0 個	0 個	適合
	0.2%塩化ナトリウム溶液	15	98.8～103.2	0 個	0 個	適合

・結論

試験製剤と標準製剤の溶出挙動の同等性を判定したところ、いずれの試験条件においても「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合していた。

以上より、両製剤は生物学的に同等とみなされた。

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」⁸⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に従う。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
			pH5.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 溶出試験第 2 液
			水	日本薬局方 精製水
	100rpm	pH6.8	日本薬局方 溶出試験第 2 液	
試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

・判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 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。
	pH5.0	
	pH6.8	
	水	
100	pH6.8*	

※ガイドラインに「パドル法、100 回転で実施すべき試験液性において、パドル法、50、75 回転の溶出試験で、30 分以内に標準製剤、試験製剤ともに平均 85%以上溶出する場合、パドル法、100 回転の溶出試験を省略してもよい。」と記載されていることから、100rpm の溶出試験を省略した。

・試験結果

<p>(50rpm、pH1.2)</p> <p>溶出率 (%)</p> <p>時間 (分)</p> <p>ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠5mg「JG」</p> <p>標準製剤 (ベシケアOD錠5mg)</p>	<p>(50rpm、pH5.0)</p> <p>溶出率 (%)</p> <p>時間 (分)</p> <p>ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠5mg「JG」</p> <p>標準製剤 (ベシケアOD錠5mg)</p>
<p>判定時点である15分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲外であったが、f2関数の値は42以上であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である15分及び20分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲外、f2関数の値は42未満であり、ガイドラインの判定基準に適合しなかった。</p>
<p>(50rpm、pH6.8)</p> <p>溶出率 (%)</p> <p>時間 (分)</p> <p>ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠5mg「JG」</p> <p>標準製剤 (ベシケアOD錠5mg)</p>	<p>(50rpm、水)</p> <p>溶出率 (%)</p> <p>時間 (分)</p> <p>ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠5mg「JG」</p> <p>標準製剤 (ベシケアOD錠5mg)</p>
<p>判定時点である15分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲外、f2関数の値は42未満であり、ガイドラインの判定基準に適合しなかった。</p>	<p>判定時点である10分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲外であったが、f2関数の値は42以上であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>

溶出挙動の類似性の判定（平均溶出率）

回転数 (rpm)	試験液	判定 時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤 (ベシケア OD 錠 5mg)	試験製剤 (ソリフェナシンコハク酸 塩 OD 錠 5mg 「JG」)	
50	pH1.2	15	77.5	97.5	適合
		20	93.2	97.7	
		f2 関数の値：46.5			
	pH5.0	15	50.2	96.0	不適
		20	75.0	96.3	
		f2 関数の値：28.8			
	pH6.8	15	53.9	93.5	不適
		20	81.3	93.5	
		f2 関数の値：31.8			
	水	10	48.1	92.1	適合
		20	88.4	93.0	
		f2 関数の値：58.8			

・結論

試験製剤と標準製剤の溶出挙動の類似性を判定したところ、50rpm の pH1.2 及び水では基準に適合したが、50rpm の pH5.0 及び pH6.8 では基準に適合しなかった。しかし、生物学的同等性試験ガイドラインにおいて、「本試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない」と記載されている。試験製剤の溶出挙動は、標準製剤の溶出挙動と類似していないと判定されたが、体内薬物動態を確認したところ、両製剤の生物学的同等性が確認された。

「VII. 薬物動態に関する項目 -1.血中濃度の推移・測定法 (2) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

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

- ・ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」
PTP：100 錠（10 錠×10、乾燥剤入り）
- ・ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」
PTP：100 錠（10 錠×10、乾燥剤入り）

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP 包装：ポリ塩化ビニル・ポリエチレン・ポリ塩化ビニリデン複合シート/アルミニウム箔
(PTP シート)、乾燥剤 (ゼオライト)、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフ
ィルム (ピロー)、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 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、膀胱癌や前立腺癌など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（ α_1 遮断薬等）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

通常、成人にはコハク酸ソリフェナシンとして5mgを1日1回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、1日最高投与量は10mgまでとする。

(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 中等度の肝機能障害患者（Child-Pugh分類B）への投与は1日1回2.5mgから開始し、慎重に投与する。投与量の上限は1日1回5mgまでとする。軽度の肝機能障害患者（Child-Pugh分類A）への投与は1日1回5mgから開始し、増量に際しては副作用発現に留意し、患者の状態を十分に観察しながら慎重に行うこと。[9.3.2、9.3.3、9.8 参照]

7.2 重度の腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス30mL/min未満）への投与は1日1回2.5mgから開始し、慎重に投与する。投与量の上限は1日1回5mgまでとする。軽度及び中等度の腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス30mL/min以上かつ80mL/min以下）への投与は1日1回5mgから開始し、増量に際しては副作用発現に留意し、患者の状態を十分に観察しながら慎重に行うこと。[9.2.1、9.2.2、9.8 参照]

7.3 高齢者では1日1回5mgから投与を開始し、増量に際しては副作用発現に留意し、患者の状態を十分に観察しながら慎重に行うこと。[9.8 参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(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

【国内第Ⅲ相試験】

国内で実施された過活動膀胱患者を対象とした無作為化二重盲検並行群間比較試験における成績は以下のとおりであった。コハク酸ソリフェナシン錠 5mg あるいは 10mg を 1 日 1 回経口投与したときの結果は、主要評価項目である 24 時間あたりの平均排尿回数の変化量、副次的評価項目である 24 時間あたりの平均尿意切迫感回数の変化量、24 時間あたりの平均切迫性尿失禁回数の変化量及び 24 時間あたりの平均尿失禁回数の変化量に関してコハク酸ソリフェナシン錠 5mg 群、10mg 群ともプラセボ群に比し有意な減少が認められた。^{9,10)}

副作用の発現率は、コハク酸ソリフェナシン錠 5mg 群で 33.6%、10mg 群で 52.8%、プラセボ群で 16.8%であり、コハク酸ソリフェナシン錠投与群において発現率が 2%以上であった副作用は、口内乾燥、便秘、霧視、排尿困難であった。¹¹⁾

最終評価時の24時間あたりの平均排尿回数変化量

投与群	症例数	平均値	標準偏差	両側95%信頼区間	
				下限	上限
プラセボ	395	-0.94	2.286	-1.164	-0.712
コハク酸ソリフェナシン錠5mg	383	-1.93	1.974	-2.133	-1.736
コハク酸ソリフェナシン錠10mg	371	-2.19	2.090	-2.406	-1.979

最終評価時の24時間あたりの平均尿意切迫感回数変化量

投与群	症例数	平均値	標準偏差	両側95%信頼区間	
				下限	上限
プラセボ	395	-1.28	2.899	-1.563	-0.989
コハク酸ソリフェナシン錠5mg	383	-2.41	2.877	-2.697	-2.119
コハク酸ソリフェナシン錠10mg	371	-2.78	2.819	-3.072	-2.497

最終評価時の24時間あたりの平均切迫性尿失禁回数変化量

投与群	症例数	平均値	標準偏差	両側95%信頼区間	
				下限	上限
プラセボ	260	-0.69	2.002	-0.932	-0.443
コハク酸ソリフェナシン錠5mg	235	-1.45	1.886	-1.688	-1.204
コハク酸ソリフェナシン錠10mg	255	-1.52	1.771	-1.735	-1.298

最終評価時の24時間あたりの平均尿失禁回数変化量

投与群	症例数	平均値	標準偏差	両側95%信頼区間	
				下限	上限
プラセボ	283	-0.72	1.951	-0.950	-0.493
コハク酸ソリフェナシン錠5mg	274	-1.59	2.117	-1.843	-1.339
コハク酸ソリフェナシン錠10mg	270	-1.60	1.810	-1.817	-1.383

2) 安全性試験

該当資料なし

(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

【QT 間隔に対する影響】

コハク酸ソリフェナシン錠反復投与時の QT 間隔に及ぼす影響を検討することを目的として、健康成人女性 86 例を対象に二重盲検比較対照試験を実施した。コハク酸ソリフェナシン錠 10mg 投与時の定常状態において、QT 間隔の変化はプラセボと同程度であった。一方、コハク酸ソリフェナシン錠 30mg 投与時の定常状態、及びモキシフロキサシン 400mg の単回投与時において QT 間隔の増加が認められた¹²⁾ (外国人データ)。

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 2. 禁忌の内容とその理由 2.7、- 7. 相互作用、- 8. 副作用（1）重大な副作用と初期症状 11.1.4」の項参照

定常状態におけるQT間隔のベースラインからの変化量
(プラセボとの差)

薬剤	QTc ^{注1)} (msec)	90%信頼区間	
		下限	上限
コハク酸ソリフェナシン10mg/日	0	-5	5
コハク酸ソリフェナシン30mg/日 ^{注)}	6	1	11
モキシフロキサシン400mg/日	10	6	13

注1) 被験者毎に補正したQTcの推定値。被験者毎にQT及びRR間隔の実測値を直線回帰式に当てはめ、QTcを求めた。

注) 国内で承認された本剤の1日最高投与量は10mgである。

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

イミダフェナシン、オキシブチニン塩酸塩、トルテロジン酒石酸塩、フェソテロジンフマル酸塩、プロピペリン塩酸塩

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

作用機序

膀胱平滑筋において、ムスカリン M₃ 受容体拮抗作用を示すことにより、膀胱の過緊張状態を抑制し、過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁を改善する¹³⁾。

ムスカリン受容体に対する親和性

ヒトムスカリン受容体を用いた結合実験において、ムスカリン M₃ 受容体に対する親和性はムスカリン M₁、M₂、M₄ 及び M₅ 受容体に対する親和性より高かった¹³⁾ (*in vitro*)。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

ムスカリン受容体拮抗作用

1) ラット及びモルモット膀胱平滑筋標本を用いた摘出実験において、カルバコール刺激による収縮に対して濃度依存的かつ競合的な拮抗作用を示した¹⁴⁾。また、ラット及びカニクイザルの膀胱平滑筋細胞及び顎下腺細胞において、カルバコール刺激による細胞内カルシウム濃度上昇に対して濃度依存的な抑制作用を示したが、顎下腺よりも膀胱平滑筋に対する抑制作用がそれぞれ 3.6 倍及び 2.1 倍強かった^{15, 16)} (*in vitro*)。

2) 麻酔ラットにおいて、カルバコール刺激による膀胱内圧上昇及び唾液分泌に対して用量依存的な抑制作用を示した。膀胱内圧上昇及び唾液分泌をそれぞれ 30%及び 50%抑制する用量で比較すると、唾液分泌よりも膀胱内圧上昇に対する抑制作用がそれぞれ 6.5 倍及び 3.7 倍強かった¹⁵⁾ (*in vivo*)。

排尿機能に対する作用

麻酔ラットの膀胱内圧測定試験（シストメトリー）において、用量依存的な膀胱容量増加作用を示した¹⁴⁾。また、無麻酔脳梗塞ラットにおいて、排尿圧及び残尿量に影響を及ぼすことなく、用量依存的な膀胱容量及び排尿量増加作用を示した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

【単回投与】

健康成人男性にコハク酸ソリフェナシン錠を絶食下单回経口投与したときの Cmax 及び AUC は、投与量にほぼ比例して上昇した。Tmax、T_{1/2} 及び CL/F の平均値は各用量間でほぼ一定であった¹⁸⁾。

単回投与時のパラメータ

投与量 (mg)	例 数	Cmax (ng/mL)	Tmax (h)	AUCinf (ng・h/mL)	T _{1/2} (h)	CL/F (L/h)
5	12	6.54±2.41	5.50±1.17	314.57±110.61	38.03±7.48	13.68±5.81
10	12	14.87±3.41	5.67±0.78	751.65±255.96	40.28±9.21	11.04±3.46
20 ^{注)}	12	25.94±4.01	5.67±1.15	1,191.59±316.94	36.94±8.51	13.57±3.74
40 ^{注)}	12	53.09±9.18	5.33±1.23	2,535.55±613.92	40.55±13.17	12.54±2.89
80 ^{注)}	12	100.31±27.54	4.08±1.78	4,144.65±1,571.57	34.20±4.79	16.43±6.17

(Mean±S.D.)

注) 国内で承認された本剤の1日最高投与量は10mgである。

【反復投与】

健康高齢・非高齢男女にコハク酸ソリフェナシン錠10mgを1日1回28日間反復経口投与したときの血漿中濃度は、投与後2~3週間で定常状態に達した。また、反復投与により血漿中濃度は単回投与時に比べ2~4倍に上昇した^{19~21)}。

反復投与時のパラメータ

対象	例 数	Cmax (ng/mL)	Tmax (h)	AUC _{24h} (ng・h/mL)	T _{1/2} (h)	CL/F (L/h)
非高齢 男性	15	34.47±11.12	3.9±1.1	624.71±226.48	44.0±10.1	13.76±5.20
非高齢 女性	14	37.57±18.31	5.2±1.4	732.82±375.83	39.2±9.1	12.83±5.71
高齢 男性	16	52.89±23.47	4.6±1.6	1,091.27±493.88	71.1±28.3	8.60±4.68
高齢 女性	16	53.82±10.27	5.6±1.8	1,095.61±213.19	61.3±13.1	7.18±1.69

(Mean±S.D.)

【過活動膀胱患者】

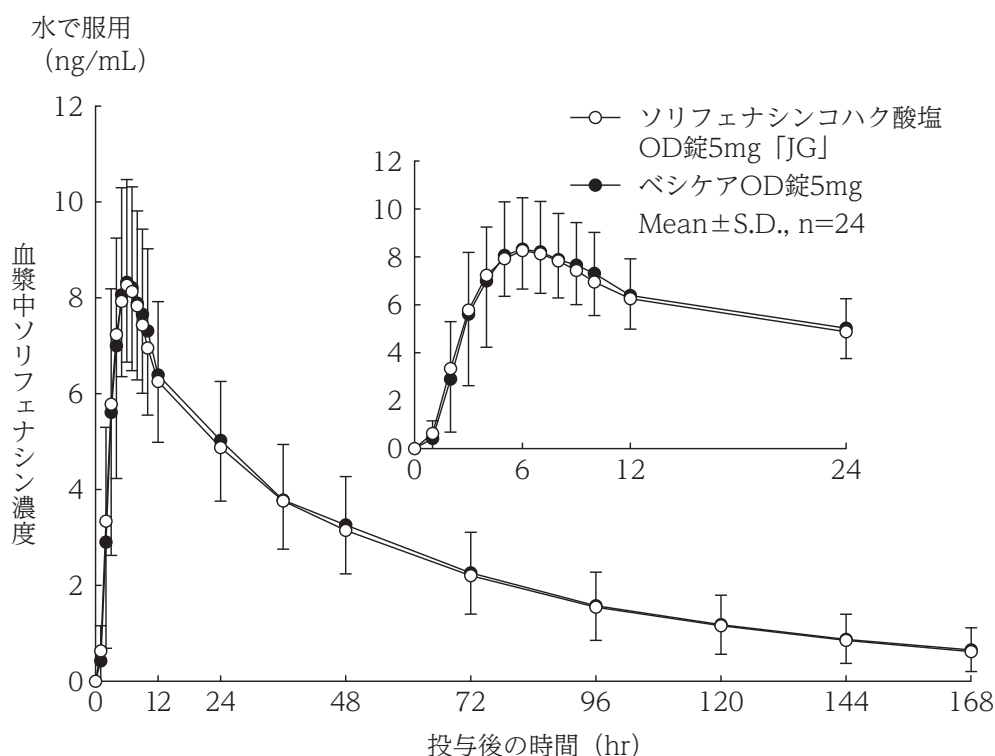
第Ⅱ相試験において、母集団薬物動態解析により推定した過活動膀胱患者における CL/F の母集団平均値は、男性が6.95L/h、女性が5.76L/hであった。母集団推定値から予想される10mg投与時の定常状態における AUC_{24h} は、男性が1,085ng・h/mL、女性が1,309ng・h/mLであり、コハク酸ソリフェナシン錠を10mg投与したときの血漿中濃度は健康高齢者とほぼ同じと考えられた^{22, 23)}。

【生物学的同等性試験】²⁴⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成24年2月29日薬食審査発0229第10号）」に従う。

ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠5mg「JG」とベシケア OD錠5mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（コハク酸ソリフェナシンとして5mg）健康成人男子に水150mLと共にあるいは水なしで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。

<水で服用>



<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₆₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠5mg「JG」	416.65±124.30	8.43±1.68	6.1±1.1	51.7±12.9
標準製剤 (ベシケア OD錠5mg)	425.20±135.56	8.61±2.16	6.1±1.4	52.1±14.2

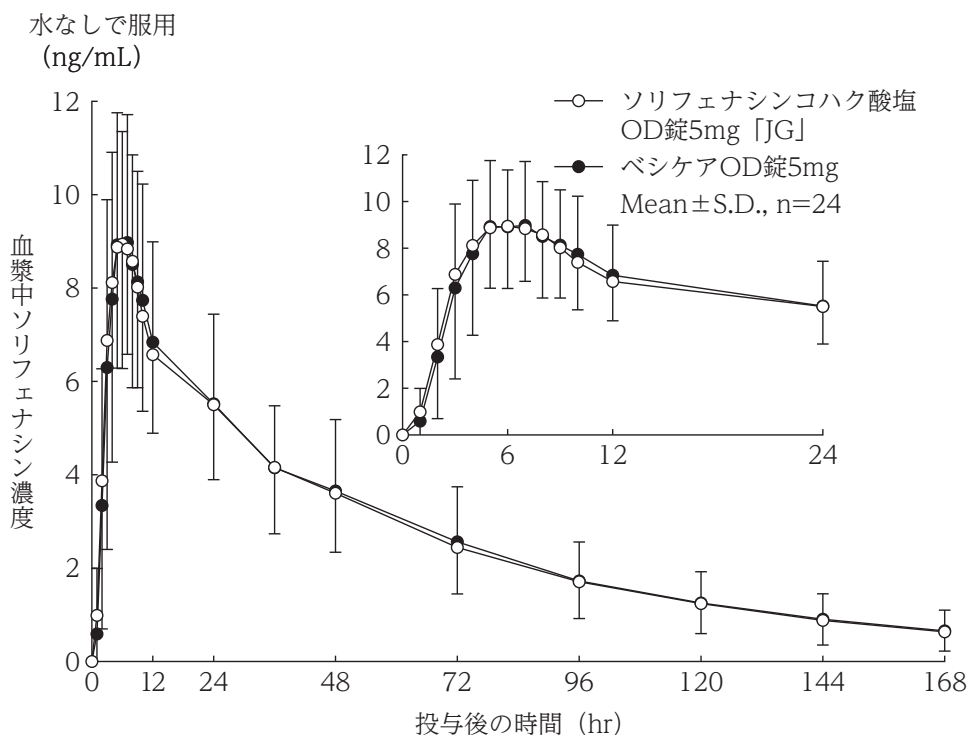
(Mean±S.D., n=24)

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。

<同等性の判定結果>

	AUC ₀₋₁₆₈	Cmax
2 製剤の平均値の差	log (0.9854)	log (0.9880)
90%信頼区間	log(0.9435)~log(1.0293)	log(0.9341)~log(1.0449)

<水なしで服用>



<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₆₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠 5mg [JG]	459.04 ± 155.31	9.39 ± 2.46	5.7 ± 1.2	47.7 ± 10.2
標準製剤 (ベシケア OD錠 5mg)	465.21 ± 180.53	9.42 ± 2.87	5.9 ± 1.4	48.7 ± 14.2

(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。

<同等性の判定結果>

	AUC ₀₋₁₆₈	Cmax
2 製剤の平均値の差	log (0.9958)	log (1.0054)
90%信頼区間	log(0.9164)~log(1.0820)	log(0.9291)~log(1.0879)

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

コハク酸ソリフェナシン錠 5mg を食後に投与したときの Cmax 及び AUC は絶食時とほぼ同じであり、食事の影響は認められなかった。²⁵⁾

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 7. 相互作用」の項参照

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

健康成人男子

薬剤名	投与量	投与方法		kel (hr ⁻¹)
ソリフェナシンコハク酸塩 OD錠 5mg「JG」	1錠 (コハク酸ソリフェナシンとして 5mg)	絶食単回 経口投与	水と服用	0.014±0.004
			水なしで 服用	0.015±0.003

(Mean±S.D.,n=24)

(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

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

コハク酸ソリフェナシン錠 10mg を単回経口投与したときの絶対バイオアベイラビリティは 88% であった²⁶⁾ (外国人データ)。

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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意（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

静脈内投与時の定常状態における分布容積は 600L であった²⁶⁾（外国人データ）。

(6) 血漿蛋白結合率

血漿蛋白結合率は 96% であり、主結合蛋白は α_1 酸性糖蛋白質であった²⁷⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

コハク酸ソリフェナシンは肝臓において、主として CYP3A4 によって代謝され、一部 CYP1A1、2C8、2C19、2D6 及び 3A5 並びにグルクロン酸抱合酵素も代謝に関与していた。コハク酸ソリフェナシン錠を経口投与後、未変化体の他に薬理的に活性のある代謝物 4*R*-水酸化体と、活性がない 3 種の代謝物 *N*-グルクロン酸抱合体、*N*-酸化体及び 4*R*-水酸化-*N*-酸化体が血漿中及び尿中に認められた。血漿中では大部分が未変化体として存在し、4*R*-水酸化体の薬効への寄与は未変化体よりも低いと考えられた。未変化体及びこれら 4 種の代謝物は、コハク酸ソリフェナシン錠 10mg 投与時に予想される曝露レベルにおいて、CYP1A2、2C9、2C19、2D6 及び 3A4 の代謝活性に影響を及ぼさなかった^{28, 29)}。

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 7. 相互作用」の項参照

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 - 6. 代謝（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

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 - 6. 代謝（1）代謝部位及び代謝経路」の項参照

7. 排泄

¹⁴C 標識体 10mg を単回経口投与した後、投与量の 69.2% の放射活性が尿中に、22.5% が糞中に回収された。尿中では投与量の 15% 未満が未変化体として排泄され、17.8% が *N*-酸化体、8.9% が 4*R*-水酸化-*N*-酸化体、そして 8.3% が 4*R*-水酸化体としてそれぞれ排泄された²⁸⁾（外国人データ）

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

1. 腎機能障害患者

軽度（クレアチニンクリアランス 50～80mL/min）から中等度（クレアチニンクリアランス 30～49mL/min）の腎機能障害を持つ患者では、コハク酸ソリフェナシン錠 10mg 投与時の AUC は健康成人と比べてそれぞれ 1.4 倍及び 1.3 倍高かった。重度の腎機能障害（クレアチニンクリアランス 30mL/min 未満）を持つ患者では、健康成人と比べて AUC が 2.1 倍高かった³⁰⁾（外国人データ）。

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意（2）腎機能障害患者」の項参照

2. 肝機能障害患者

中等度（Child-Pugh 分類 B）の肝機能障害を持つ患者では、コハク酸ソリフェナシン錠 10mg 投与時の AUC は健康成人と比べて 1.6 倍高く、 $T_{1/2}$ は 2 倍に延長した³¹⁾（外国人データ）。

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意（3）肝機能障害患者」の項参照

3. 高齢者

健康高齢者（65～75 歳）にコハク酸ソリフェナシン錠 10mg を投与したときの C_{max} 及び AUC は、非高齢者（21～34 歳）と比べて 1.5～1.8 倍高く、 $T_{1/2}$ は 1.4～1.6 倍に延長した^{19, 20)}。「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意（8）高齢者」の項参照

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 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 尿閉を有する患者 [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。] [11.1.3 参照]

2.3 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。] [11.1.7 参照]

2.4 幽門部、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 [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。] [11.1.5 参照]

2.5 胃アトニー又は腸アトニーのある患者 [抗コリン作用により消化管運動が低下するため症状が悪化するおそれがある。]

2.6 重症筋無力症の患者 [抗コリン作用により筋緊張の低下がみられ症状が悪化するおそれがある。]

2.7 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。] [11.1.4、17.3.1 参照]

2.8 重度の肝機能障害患者（Child-Pugh 分類 C） [9.3.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 2. 効能又は効果に関連する注意」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 4. 用法及び用量に関連する注意」の項参照

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（霧視等）、傾眠が起こることがあるので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う作業に従事する場合には注意させること。

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 排尿困難のある患者（下部尿路閉塞疾患（前立腺肥大症等）又は排尿筋収縮障害等）

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考慮すること。また、投与中も十分に観察を行い、排尿困難の増悪を来していないかを定期的に確認すること。[11.1.3 参照]

9.1.2 下部尿路閉塞疾患（前立腺肥大症等）を合併している患者

抗コリン作用により、尿閉を誘発するおそれがある。[11.1.3 参照]

9.1.3 QT 延長症候群患者

過量投与に注意すること。[11.1.4、17.3.1 参照]

9.1.4 潰瘍性大腸炎のある患者

中毒性巨大結腸があらわれるおそれがある。

9.1.5 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。

9.1.6 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、症状を悪化させるおそれがある。

9.1.7 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。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重度の腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス 30mL/min 未満）

血中濃度が上昇するおそれがある。[7.2、16.6.1 参照]

9.2.2 軽度又は中等度の腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス 30mL/min 以上かつ 80mL/min 以下）

血中濃度が上昇するおそれがある。[7.2、16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝機能障害患者（Child-Pugh 分類 C）

投与しないこと。血中濃度が過度に上昇するおそれがある。[2.8、16.6.2 参照]

9.3.2 中等度の肝機能障害患者（Child-Pugh 分類 B）

血中濃度が上昇するおそれがある。[7.1、16.6.2 参照]

9.3.3 軽度の肝機能障害患者（Child-Pugh 分類 A）

血中濃度が上昇するおそれがある。[7.1、16.6.2 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。

(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。動物実験で乳汁中移行が報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした国内の臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

肝機能、腎機能が低下していることが多い。[7.1-7.3、16.6.3 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
抗コリン作用を有する薬剤 抗コリン剤 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。
アゾール系抗真菌剤 イトラコナゾール フルコナゾール ミコナゾール [16.7.1 参照]	口内乾燥、便秘、排尿困難等があらわれるおそれがあるので、減量するなど注意すること。	これらの薬剤は CYP3A4 を強力に阻害し、併用により本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。
リファンピシン フェニトイン カルバマゼピン	本剤の作用が減弱する可能性がある。	これらの薬剤は CYP3A4 を誘導し、併用により本剤の血中濃度が低下する可能性がある。
QT 延長を起こすことが知られている薬剤 [11.1.4、17.3.1 参照]	QT 延長があらわれるおそれがあるので、過量投与に注意すること。	これらの薬剤により QT が延長している患者に本剤が過量投与された場合、本剤の QT 延長作用が相加的に作用する可能性がある。

<解説>

16.7.1 ケトコナゾール

コハク酸ソリフェナシン錠 10mg をケトコナゾール 200mg 及び 400mg と併用したとき、コハク酸ソリフェナシンの AUC_{inf} は併用によりそれぞれ 2 倍及び 2.8 倍に上昇した^{32, 33)} (外国人データ)。[10.2 参照]

17.3.1 QT 間隔に対する影響

「V. 治療に関する項目 - 5. 臨床成績 (7) その他」の項参照

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 ショック、アナフィラキシー (いずれも頻度不明)

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。

11.1.2 肝機能障害

AST、ALT、 γ -GTP、Al-P、総ビリルビンの上昇 (各 0.1~5%未満) 等を伴う肝機能障害があらわれることがある。

11.1.3 尿閉 (頻度不明)

[2.2、9.1.1、9.1.2 参照]

11.1.4 QT 延長、心室頻拍 (Torsades de Pointes を含む)、房室ブロック、洞不全症候群、高度徐脈 (いずれも頻度不明)

[2.7、9.1.3、10.2、17.3.1 参照]

11.1.5 麻痺性イレウス (頻度不明)

著しい便秘、腹部膨満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。[2.4 参照]

11.1.6 幻覚・せん妄 (頻度不明)

11.1.7 急性緑内障発作 (頻度不明)

眼圧亢進、嘔気、頭痛を伴う眼痛、視力低下等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。[2.3 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
血液及びリンパ系障害		白血球数増多、白血球数減少、血小板数増多、血小板数減少	

	5%以上	0.1~5%未満	頻度不明
心臓障害		狭心症、上室性期外収縮、心室性期外収縮	徐脈、心房細動、頻脈、動悸
耳及び迷路障害		回転性めまい	
眼障害		霧視、調節障害、乾性角結膜炎、視力低下	
胃腸障害	口内乾燥 (28.3%)、便秘 (14.4%)	腹部不快感、腹部膨満、腹痛、下腹部痛、上腹部痛、下痢、消化不良、硬便、胃炎、萎縮性胃炎、舌炎、悪心、胃不快感、口内炎、舌変色	嘔吐、胃食道逆流性疾患、口感覚鈍麻
全身障害及び投与局所様態		胸部不快感、胸痛、倦怠感、発熱	浮腫
感染症		膀胱炎、尿路感染、気管支炎、鼻咽頭炎、上気道感染、尿沈渣陽性	
代謝及び栄養障害		CK 上昇、尿酸上昇、総コレステロール上昇、K 上昇、尿糖陽性	食欲減退
筋骨格系及び結合組織障害		関節痛、背部痛、側腹部痛	筋力低下
神経系障害		浮動性めまい、味覚異常、頭痛、傾眠	認知機能障害
精神障害		不眠症	
腎及び尿路障害		排尿困難、膿尿、排尿躊躇、クレアチニン上昇、BUN 上昇、尿蛋白陽性	
呼吸器、胸郭及び縦隔障害		咳嗽、鼻乾燥、咽頭不快感	発声障害
皮膚及び皮下組織障害		皮膚乾燥、湿疹、そう痒症、発疹、蕁麻疹	血管浮腫、多形紅斑、剥脱性皮膚炎
血管障害		潮紅、高血圧	

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、肝機能障害等

13.2 処置

胃洗浄又は活性炭を投与し、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

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。

14.1.2 本剤をかみ砕かないで服用するよう患者に指導すること。本剤をかみ砕いた際にマスキング粒が壊れ、有効成分由来の刺激性を感じる可能性がある。

14.1.3 本剤は舌の上の上に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。

14.1.4 本剤は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

設定されていない

(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

設定されていない

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

該当資料なし

(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

製 剤	ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」 ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」	処方箋医薬品※
有 効 成 分	コハク酸ソリフェナシン	該当しない

※注意－医師等の処方箋により使用すること

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

本品はアルミ袋により品質保持をはかっているため、アルミ袋開封後は湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資材

- ・くすりのしおり：有り
- ・患者様用指導箋：有り

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg 「JG」 服用される患者さまへ
https://medical.nihon-generic.co.jp/uploadfiles/materials/SLFNC00_GUIDE.pdf

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ベシケア錠 2.5mg/5mg/OD 錠 2.5mg/5mg

同 効 薬：イミダフェナシン、オキシブチニン塩酸塩、トルテロジン酒石酸塩、ビベグロン、フェソテロジンフマル酸塩、プロピペリン塩酸塩、ミラベグロン

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
ソリフェナシン コハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」	2021年2月15日	30300AMX00124000	2021年6月18日	2021年6月18日
ソリフェナシン コハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」	2021年2月15日	30300AMX00125000	2021年6月18日	2021年6月18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（あるいは投与）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	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ソリフェナシンコハク酸 塩 OD 錠 2.5mg 「JG」	2590011F3039	2590011F3039	128680901	622868001
ソリフェナシンコハク酸 塩 OD 錠 5mg 「JG」	2590011F4035	2590011F4035	128681601	622868101

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) 社内資料：加速試験 (OD 錠 2.5mg)
- 2) 社内資料：アルミピロー開封後の安定性試験 (OD 錠 2.5mg)
- 3) 社内資料：無包装状態の安定性試験 (OD 錠 2.5mg)
- 4) 社内資料：加速試験 (OD 錠 5mg)
- 5) 社内資料：アルミピロー開封後の安定性試験 (OD 錠 5mg)
- 6) 社内資料：無包装状態の安定性試験 (OD 錠 5mg)
- 7) 社内資料：溶出試験 (OD 錠 2.5mg)
- 8) 社内資料：溶出試験 (OD 錠 5mg)
- 9) Yamaguchi, O. et al. : BJU Int. 2007 ; 100 (3) : 579-587
- 10) 国内二重盲検群間比較試験 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.7.3.3)
- 11) 国内二重盲検群間比較試験 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.7.4.7)
- 12) 海外健康成人・二重盲検比較対照試験 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.7.6.17)
- 13) Ohtake, A. et al. : Biol. Phar. Bull. 2007 ; 30 (1) : 54-58
- 14) ムスカリン M₃ 受容体拮抗、排尿機能 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.6.2.1)
- 15) Ohtake, A. et al. : Eur. J. Pharmacol. 2004 ; 492 (2-3) : 243-250
- 16) Kobayashi, S. et al. : Life Sci. 2004 ; 74 (7) : 843-853
- 17) Suzuki, M. et al. : Eur. J. Pharmacol. 2005 ; 512 (1) : 61-66
- 18) 田中孝典 他：薬理と治療 2006 ; 34 (Suppl.1) : S5-S13
- 19) 鈴木真奈絵 他：薬理と治療 2006 ; 34 (Suppl.1) : S29-S40
- 20) 国内高齢者・性差試験 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.7.2.2)
- 21) 田中孝典 他：薬理と治療 2006 ; 34 (Suppl.1) : S15-S27
- 22) 山口脩 他：薬理と治療 2006 ; 34 (Suppl.1) : S47-S68
- 23) 過活動膀胱患者における薬物動態 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.5.3.7)
- 24) 社内資料：生物学的同等性試験 (OD 錠 5mg)
- 25) 田中孝典 他：薬理と治療 2006 ; 34 (Suppl.1) : S41-S45
- 26) Kuipers, M. E. et al. : Drugs in R&D. 2004 ; 5 (2) : 73-81
- 27) 分布 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.6.4.4)
- 28) 海外健康成人・代謝 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.7.6.6)
- 29) 代謝 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.6.4.5、2.7.2.2、2.7.2.3)
- 30) Smulders, R. A. et al. : J. Pharmacol. Sci. 2007 ; 103 (1) : 67-74
- 31) Kuipers, M. et al. : J. Pharmacol. Sci. 2006 ; 102 (4) : 405-412
- 32) Swart, P. J. et al. : Basic Clin. Pharmacol. Toxicol. 2006 ; 99 (1) : 33-36
- 33) 海外健康成人・相互作用 (ベシケア錠：2006年4月20日承認、申請資料概要 2.7.6.12)

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

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

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。

(1) 粉砕

1. 保存条件

- ① 温度に対する安定性試験：40±2℃、4週〔遮光・気密容器〕
- ② 湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、4週〔遮光・開放〕
- ③ 光に対する安定性試験：60万lx・hr/25℃（約4000lx）〔シャーレ+ラップ（フタ）〕

2. 試験項目

性状、純度試験（類縁物質）、定量試験

3. 試験結果

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」

試験項目	性状	純度試験 (%)				定量試験 (%)
		RRT※ 約 0.6 の 類縁物質	RRT※ 約 0.8 の 類縁物質	その他の 個々の 類縁物質	類縁物質 の合計	
製剤の規格<参考> (粉砕前の状態)	(1)	(2)				(3)
試験開始時	白色の粉末	0.03	0.12	0.07	0.32	104.1
①温度	4 週後	0.06	0.14	0.08	0.43	102.8
②湿度	4 週後	0.03	0.17	0.06	0.41	104.2
③光	60 万 lx・hr	0.04	0.11	0.11	0.44	101.5

(1) 円形の白色の錠剤である。

(2) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT※約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物質は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

(3) 表示量の 95.0～105.0%

※RRT：相対保持時間

ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」

試験項目	性状	純度試験 (%)				定量試験 (%)	
		RRT* 約 0.6 の 類縁物質	RRT* 約 0.8 の 類縁物質	その他の 個々の 類縁物質	類縁物質 の合計		
製剤の規格<参考> (粉碎前の状態)	(1)	(2)				(3)	
試験開始時	帯黄白色の 粉末	0.02	0.13	0.07	0.32	100.3	
①温度	4 週後	帯黄白色の 粉末	0.05	0.14	0.08	0.42	101.7
②湿度	4 週後	帯黄白色の 粉末	0.03	0.17	0.06	0.40	102.4
③光	60 万 lx・hr	帯黄白色の 粉末	0.03	0.11	0.09	0.34	100.4

(1) 円形の帯黄白色の錠剤である。

(2) 類縁物質：試料溶液のソリフェナシンに対する RRT*約 0.6 は 0.5%以下であり、ソリフェナシンに対する RRT 約 0.8 は 0.3%以下であり、試料溶液のソリフェナシン及び上記以外の個々の類縁物質は 0.2%以下である。また、試料溶液のソリフェナシン以外の類縁物質の合計は 1.3%以下である。

(3) 表示量の 95.0~105.0%

※RRT：相対保持時間

4. 備考

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 11. 適用上の注意 14.1.2」の項参照

(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。

通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管栄養チューブの注入端より約 20mL/10 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
ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。
ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

通過性試験：

品目名	通過性
ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 2.5mg 「JG」	8Fr.のチューブを通過した。
ソリフェナシンコハク酸塩 OD 錠 5mg 「JG」	8Fr.のチューブを通過した。

8Fr：8 フレンチ 約 2.7 mm<外径>

2. その他の関連資料

該当資料なし

