

# 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

消化管粘膜局麻剤  
オキセサゼイン錠剤

**ストロカイン<sup>®</sup>錠 5mg**

Strocain<sup>®</sup> Tablets

剤形	錠剤(素錠)	
製剤の規制区分	該当しない	
規格・含量	1錠中オキセサゼイン 5mg 含有	
一般名	和名: オキセサゼイン (JAN) 洋名: Oxethazaine (JAN)	
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日	2007年8月31日(販売名変更による)
薬価基準収載・ 販売開始年月日	薬価基準収載年月日	2007年12月21日(販売名変更による)
	販売開始年月日	1962年3月1日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元: アルフレッサ ファーマ株式会社 販売元: エーザイ株式会社	
医薬情報担当者の 連絡先		
問い合わせ窓口	エーザイ株式会社 hhc ホットライン フリーダイヤル 0120-419-497 FAX 03-3811-5033 <a href="https://www.eisai.co.jp">https://www.eisai.co.jp</a>	

本IFは2023年9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。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

— 日本病院薬剤師会 —

(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(<http://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

IF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。IF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・表現には薬機法の広告規則や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、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IF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、IFを活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. 開発の経緯……………1
2. 製品の治療学的特性……………1
3. 製品の製剤学的特性……………1
4. 適正使用に関して周知すべき特性……………1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項……………2
6. RMPの概要……………2

## II. 名称に関する項目

1. 販売名……………3
2. 一般名……………3
3. 構造式又は示性式……………3
4. 分子式及び分子量……………3
5. 化学名(命名法)又は本質……………3
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号……………3

## III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………4
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………4
3. 有効成分の確認試験法, 定量法……………4

## IV. 製剤に関する項目

1. 剤形……………5
2. 製剤の組成……………5
3. 添付溶解液の組成及び容量……………5
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……………6
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)……………6
9. 溶出性……………6
10. 容器・包装……………7
11. 別途提供される資材類……………7
12. その他……………7

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果……………8
2. 効能又は効果に関連する注意……………8
3. 用法及び用量……………8
4. 用法及び用量に関連する注意……………8
5. 臨床成績……………8

## VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群……………10
2. 薬理作用……………10

## VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移……………11
2. 薬物速度論的パラメータ……………11
3. 母集団(ポピュレーション)解析……………11
4. 吸収……………11
5. 分布……………12
6. 代謝……………13
7. 排泄……………13
8. トランスポーターに関する情報……………13
9. 透析等による除去率……………13
10. 特定の背景を有する患者……………13
11. その他……………13

## 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……………14
2. 禁忌内容とその理由……………14
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………14
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………14
5. 重要な基本的注意とその理由……………14
6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………14
7. 相互作用……………15
8. 副作用……………15
9. 臨床検査結果に及ぼす影響……………16
10. 過量投与……………16
11. 適用上の注意……………16
12. その他の注意……………17

## IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 .....18
2. 毒性試験 .....18

## X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分 .....20
2. 有効期間 .....20
3. 包装状態での貯法 .....20
4. 取扱い上の注意 .....20
5. 患者向け資材 .....20
6. 同一成分・同効薬 .....20
7. 国際誕生年月日 .....20
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 .....20
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 .....20
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその  
内容 .....21
11. 再審査期間 .....21
12. 投薬期間制限に関する情報 .....21
13. 各種コード .....21
14. 保険給付上の注意 .....21

## XI. 文献

1. 引用文献 .....22
2. その他の参考文献 .....22

## XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 .....23
2. 海外における臨床支援情報 .....23

## 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 .....24
2. その他の関連資料 .....24

## 略 語 表

なし（個別に各項目において解説する.）

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

1911年、Zeliony & Savichらは胃幽門洞粘膜にコカイン溶液をあらかじめ塗布しておくこと、肉エキス投与による胃酸分泌が著明に抑制される現象を報告した。

1934年、Bayerは胃疾患に伴う疼痛あるいは不定愁訴へプロカインを投与した。

しかし、先のコカインは効力は強いが毒性も強く、耐性も生じやすいため、またコカイン、プロカインとも強い酸性下（pH3.0以下）では効力を発揮しないなどの理由により、なかなか実用的には至らなかった。

1957年、Wyeth Laboratoriesで合成されたオキセサゼインは、局所麻酔作用がプロカインの4,000倍もありながら毒性は極めて低く、しかもpHによる影響は受けないという画期的なもので、1962年3月、国内においては消化管粘膜局麻剤としてストロカイン錠、顆粒<sup>注)</sup>の販売名で発売した。

なお、医療事故防止対策に伴い販売名が変更され、「ストロカイン錠」は「ストロカイン錠 5mg」として2007年8月に製造販売承認され現在に至っている。

注) 現在は製造販売を中止している。

## 2. 製品の治療学的特性

- (1) ストロカインは、酸性下でも効果を発揮する消化管粘膜局麻剤である。本剤はガストリンの遊離を抑制し、二次的に胃酸分泌を抑制する。臨床的には胃炎、消化性潰瘍等の消化管粘膜疾患に伴う心窩部痛をはじめ、悪心・嘔吐、胸やけ、噯気、胃部不快感、便意逼迫等の自覚症状を改善する。（「V. 治療に関する項目」「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照）
- (2) 主な副作用は、発疹、便秘、食欲不振、口渇、悪心、下痢、頭痛、眩暈、眠気、脱力感であった。（「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の項参照）

## 3. 製品の製剤学的特性

製剤上の特徴：溶出パターンにすぐれる。

## 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

## I. 概要に関する項目

---

### 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（RMP 策定対象外の事例）

## Ⅱ.名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ストロカイン<sup>®</sup>錠 5mg

#### (2) 洋名

Strocain<sup>®</sup> Tablets 5mg

#### (3) 名称の由来

gastro（胃との関係を表す接頭語）と caine（局麻剤を表す接尾語）をあわせて、ストロカインと命名した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名(命名法)

オキセサゼイン (JAN)

オキセタカイン (INN)

#### (2) 洋名(命名法)

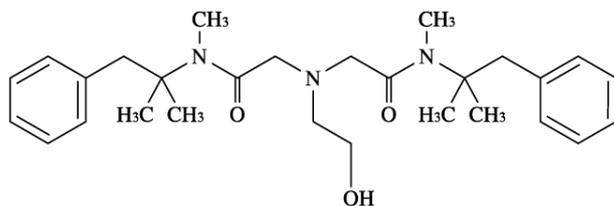
Oxethazaine (JAN)

Oxetacaine (INN)

#### (3) ステム(stem)

局所麻酔薬：-caine

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>28</sub>H<sub>41</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>

分子量：467.64

### 5. 化学名(命名法)又は本質

2, 2'-(2-Hydroxyethylimino) bis [*N*-(1, 1-dimethyl-2-phenylethyl)-*N*-methylacetamide]

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

別名：オキセタカイン

治験番号：E-0004

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

### 1. 物理化学的性質

#### (1) 外観・性状

本品は白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

#### (2) 溶解性

本品は酢酸（100）に極めて溶けやすく、メタノール又はエタノール（95）に溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

#### (3) 吸湿性

該当資料なし

#### (4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点：101～104℃

#### (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

紫外可視吸収スペクトル

本品のエタノール（95）溶液（1→2500）につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 252nm、259nm 及び 265nm に吸収の極大を示す。

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

温度及び光に対しては安定であるが湿気により分解する。

### 3. 有効成分の確認試験法, 定量法

確認試験法

日本薬局方「オキセサゼイン」の確認試験法による。

- ・紫外可視吸光度測定法
- ・赤外吸収スペクトル測定法

定量法

日本薬局方「オキセサゼイン」の定量法による。

- ・滴定終点検出法 指示薬法

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

錠剤（素錠）

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	剤形	色	外形		
			表	裏	側面
ストロカイン錠 5mg	素錠	わずかに褐色を帯びた白色			
			直径 (mm)・質量 (mg)・厚さ (mm) 10.6                  440                  4.0		

#### (3) 識別コード

販売名	ストロカイン錠 5mg	
識別コード	EISAI SR005	
表示部位	錠剤	PTP シート

#### (4) 製剤の物性

硬 度：68.6N 以上

崩壊性：日本薬局方一般試験法 崩壊試験法 即放性製剤の項により試験を行うとき、これに適合する。

#### (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

販売名	有効成分	添加剤
ストロカイン錠 5mg	1 錠中オキセサゼイン 5mg	含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、水酸化アルミニウム、ステアリン酸カルシウム、タルク、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム、トウモロコシデンプン

#### (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

## IV. 製剤に関する項目

### 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

試験方法		保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果
長期保存試験		25°C/60%RH	PTP+乾燥剤+アルミ袋+紙箱	36 カ月	性状 溶出性 乾燥減量 含量	いずれの試験項目においても規格内。
開封後	湿度	25°C/75%RH	PTP	6 カ月	性状 崩壊性 乾燥減量 含量	いずれの試験項目においても規格内。
苛酷試験	温度	40°C	ガラス瓶 (密栓)	3 カ月	性状 硬度 溶出性 含量	いずれの試験項目においても規格内。
	湿度	25°C/75%RH	シャーレ (開放)	3 カ月		1 カ月後硬度低下、その他の試験項目においては規格内。
	光	2 万 lx	シャーレ (蓋)	60 時間*		いずれの試験項目においても規格内。

※キセノンランプを 60 時間 (総照度 120 万 lx・hr、総近紫外放射エネルギー 200W・h/m<sup>2</sup>) 照射

### 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)

本剤は錠剤であり配合変化試験を行っていない。

### 9. 溶出性

方法：日本薬局方一般試験法 (パドル法)

条件：回転数 50rpm

試験液 pH4.0 の 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 900mL

測定法 液体クロマトグラフィー (波長 259nm)

結果：本品の 45 分間の溶出率が 70%以上のとき適合する。

### 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

100錠 [10錠 (PTP) ×10、乾燥剤入り]、1000錠 [10錠 (PTP) ×100、乾燥剤入り]

#### (3) 予備容量

該当しない

#### (4) 容器の材質

PTP包装：ポリプロピレン、アルミニウム箔

アルミ袋（乾燥剤入り）：ポリエチレン、アルミニウム、ポリプロピレン

### 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

下記疾患に伴う疼痛・酸症状・あい気・悪心・嘔吐・胃部不快感・便意ひっ迫  
食道炎、胃炎、胃・十二指腸潰瘍、過敏性大腸症（イリタブルコロン）

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

オキセサゼインとして、通常成人 1 日 15～40mg を 3～4 回に分割経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

#### (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

設定されていない

### 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

腹痛、胸やけ、悪心、腹部膨満感などを主訴とする胃炎、消化性潰瘍を対象に、本剤（1 回 2 錠、1 日 3 回、1 週間食前経口投与）とプラセボによる二重盲検比較試験を実施した。その結果、本剤はプラセボに比べて、服用後 1 週間時点で腹痛（ $P < 0.05$ ）、吞酸（ $P = 0.0482$ （中間日は  $P < 0.05$ ））、胃のもたれ（ $P < 0.05$ ）、食欲不振（ $P < 0.05$ ）について有意な改善を示し、中間日時点で胸やけ（ $P < 0.05$ （1 週間時点は  $P < 0.10$ ））は有意な改善を示した。また、全般改善度（ $P < 0.05$ ）においても本剤はプラセボより有意に優れていた（ $\chi^2$ 検定、ただし吞酸の 1 週間時点は Fisher の直接確率計算法による）。なお、1 週間の観察期間中、副作用や臨床検査値異常は認められなかった<sup>1)</sup>。

※中間日は、投与後第 4～5 日

**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**

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

アミノ安息香酸エチル、コカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩、テトラカイン塩酸塩、プロカイン塩酸塩、リドカイン塩酸塩等

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

作用部位：消化管粘膜

作用機序：本薬は、ガストリン分泌細胞の刺激感受部位といわれている胃内腔に突起している微絨毛を麻酔することにより、その刺激感受性を低下させ、血中へのガストリン分泌を抑制すると考えられている。また、粘膜面の神経レセプターを介する迷走神経や交感神経線維中を上行する刺激をブロックすることにより、種々の愁訴を除去すると考えられる。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 局所麻酔作用

本薬の局所麻酔作用は、ウサギの角膜においてプロカインの 4,000 倍、コカインの 500 倍を示す。また、本薬の局所麻酔作用は pH1.0~2.0 の強酸性下でも影響を受けず、強力な局所麻酔作用を示す<sup>2,3)</sup>。

##### 2) ガストリン遊離抑制作用

Heidenhain pouch イヌを用いた実験では、本薬の経口投与により、アセチルコリン刺激による胃幽門部からのガストリンの遊離を抑制する<sup>4)</sup>。

##### 3) 胃酸分泌抑制作用

イヌを用いた実験では、本薬の経口投与により、ペプタガストリン又は食餌刺激による胃酸分泌を抑制する<sup>5)</sup>。

消化性潰瘍患者に本薬を経口投与し、胃内 pH の変動を pH 電極を胃内に挿入して測定すると、投与 1 時間後には全例の胃内 pH は 3 以上に上昇する<sup>6)</sup>。

##### 4) 胃腸管運動抑制作用

麻酔イヌに本薬を経口投与すると胃の自律運動は抑制され、更に塩化バリウムによって実験的に引き起こされた胃、十二指腸の運動亢進を本薬は緩解させる<sup>7)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

### 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

該当資料なし

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

### 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

該当資料なし

#### (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

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

〈参考：ラット〉

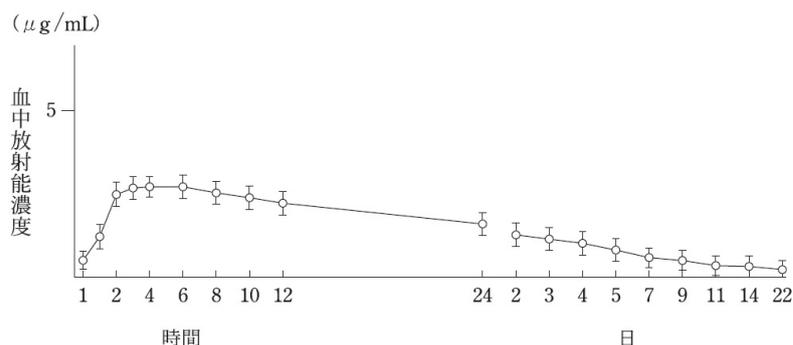
$^{14}\text{C}$ -オキセサゼイン  $5\text{mg}/\text{kg}$  を単回経口投与したところ、投与 4 時間後に最高血中放射能濃度（オキセサゼイン当量として  $2.7\ \mu\text{g}/\text{mL}$ ）に達し、以後緩徐に低下し、投与後 22 日においても  $0.34\ \mu\text{g}/\text{mL}$  の血中放射能濃度（オキセサゼイン当量）を示した。

この長時間にわたって残存する血中の放射能は、以下の理由によりオキセサゼイン及びその

## VII. 薬物動態に関する項目

代謝物の残留性を示すものではない。「VII.-7-(2) 排泄率」の項で後述するように、呼気中に<sup>14</sup>C-炭酸ガスとして放射能が排泄されるが、これは<sup>14</sup>C-オキセサゼインの<sup>14</sup>C 標識部位-<sup>\*</sup>CH<sub>2</sub>\*CH<sub>2</sub>OH 基が酸化的にN-脱離し、これがC<sub>1</sub>単位として蛋白や脂質等の生体成分の合成に利用されたことを意味している。なお、血中の未変化体濃度は1時間後に0.1 μg/mL、2時間後にはほとんど消失した。

ラットにおける<sup>14</sup>C-オキセサゼイン単回経口投与時の血中放射能濃度（オキセサゼイン当量）の推移



### 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

該当資料なし

#### (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

〈参考：ラット〉

<sup>14</sup>C-オキセサゼイン 5mg/kg を単回経口投与した。その結果、投与4時間後における組織内分布では脳、神経、精巣、筋肉及び脂肪への放射能の取り込みは少なかった。血液より高い放射能濃度を示す臓器として、肝、脾、胃、腎、副腎及び脾臓があり、特に肝臓は著しく高い放射能濃度を示していた。

投与12日後ではほとんどの組織に放射能がほぼ一様に分布しており、体内残留は投与量の11.7%であった。この見かけ上の放射能残留も、「VII.-4 吸収」の項で述べた理由による。

#### (6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

### 6. 代謝

#### (1) 代謝部位及び代謝経路

〈参考〉

オキセサゼインは主に肝で代謝され、ヒドロキシルアミン又はジメチルヒドロキシエチルアミンが遊離し、さらに代謝される。また一部は、アミダーゼ及びペプチダーゼにより局部的に加水分解される。メフェンテルミン (N-methyl- $\omega$ -phenyl-tert-butylamine) 部分は、さらにN-脱メチル化され、ノルメフェンテルミンに、*p*位の水酸化によって *p*-ヒドロキシメフェンテルミンに代謝される。

#### (2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種,寄与率

該当資料なし

#### (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

該当資料なし

### 7. 排泄

#### (1) 排泄部位及び経路

尿中、糞中、呼気中

#### (2) 排泄率

〈参考：ラット〉

<sup>14</sup>C-オキセサゼイン 5mg/kg を単回経口投与した。その結果、投与後 12 日間の累積尿中排泄率は投与量の 21.3%であり、その 83%が 24 時間以内に排泄された。また、12 日間の累積糞中排泄は投与量の 25.5%であり、その 86%が 24 時間以内に排泄された。さらに、投与後 7 日間の呼気への累積排泄率は投与量の 26.9%であった。

### 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

該当資料なし

### 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)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

(解説)

本剤の成分に対し過敏症を有する患者は、重篤なアレルギー反応を示す可能性が高い。

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 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 長期連続投与は避けること。

(解説)

本剤は局麻作用により消化器疾患に伴う自覚症状を緩解するものであり、漫然と長期投与すべきでない。

### 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

設定されていない

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

## Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### (5) 妊婦

#### 9.5 妊婦

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。

(解説)

妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。

### (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。

### (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

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

## 7. 相互作用

### (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

設定されていない

## 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

設定されていない

### (2) その他の副作用

#### 11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	頻度不明
過 敏 症		発疹
消 化 器	便秘、食欲不振、口渇、悪心、下痢	
精神神経系	頭痛、眩暈	眠気、脱力感

## Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### ◆副作用頻度一覧表等

[副作用及び臨床検査値の変動]

副作用は総症例 951 例中 34 例 (3.58%) に認められ、症状別には便秘 23 件 (2.42%)、食欲不振 3 件 (0.32%)、口渇 3 件 (0.32%)、頭痛 2 件 (0.21%) 等であった。

また、本剤に起因すると考えられる臨床検査値の変動は報告されていない。

副作用発現頻度一覧表

	症例数 (%)
総 症 例 数	951
副作用発現症例数	34 (3.58)

副作用の種類	発現件数 (%)
[消化器]	34 (3.58)
便秘	23 (2.42)
口内異味感	1 (0.11)
口渇	3 (0.32)
悪心 (嘔気)	2 (0.21)
食欲不振	3 (0.32)
胸やけ	1 (0.11)
下痢	1 (0.11)
[全身・その他]	4 (0.42)
頭痛	2 (0.21)
めまい	1 (0.11)
悪寒	1 (0.11)

(1974 年 7 月集計)

### 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

設定されていない

### 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 口内にしびれ等を残さないため噛み砕いたりせずに、速やかに飲みくださいよう注意させること。

14.1.2 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に刺入し、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。

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

---

### 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

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」参照)

#### (2) 安全性薬理試験

##### 1) 中枢神経系に対する影響

マウスにおいて、本薬 80mg/kg 以上の腹腔内投与で自発運動の抑制や歩行障害がみられている。また、ウサギの体温は、本薬 80~160mg/kg の経口投与で約 0.5℃ 低下し、2~3 時間で回復した。ウサギの大脳皮質および海馬の自発脳波は本薬 40~60mg/kg の腹腔内投与で高電位の徐波成分が増加した。

##### 2) 循環系に対する影響

麻酔イヌに本薬 1mg/kg を静注した結果、著明な血圧低下と心電図 PR 間隔の延長が認められた。無麻酔イヌに本薬 10~20mg/kg を経口投与した結果、血圧や心電図 PR 間隔は変化しなかったが、心拍数が若干増加した。

##### 3) 消化器系に対する影響

クロラロス麻酔下のネコに本薬の 0.01~0.1% 溶液を十二指腸注入及び静注した場合にも、膵液分泌促進作用が認められた。この作用は迷走神経や内臓神経の切断後、あるいはアトロピンやヘキサメトニウム処置後でも有効であることから、神経系を介さないものであると考えられる。

#### (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

LD<sub>50</sub> mg/kg

動物種 投与経路	マウス		ラット	
	雄	雌	雄	雌
経口	1231	1000~2000	1000~2000	1071

○マウス・ラット・ウサギ

〈中毒症状〉

協調性運動失調、振戦、強直性痙攣、間代性痙攣、呼吸促迫、呼吸困難

〈死因〉

心臓の収縮力の抑制、伝導障害

〈最大無作用量等〉

該当資料なし

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

### (2) 反復投与毒性試験

#### 1) 亜急性毒性

Wistar系ラット雌雄に本薬 25、100、400mg/kg/日を1カ月間経口投与した。その結果、高用量の400mg/kg投与群で軽度の腎障害及び胃障害が認められた。100mg/kg以下では、血液検査、尿検査、生化学検査、組織学的検査において異常所見は認められなかった。

#### 2) 慢性毒性

ラット雌雄を本薬 0.1%、0.2%及び 0.4%含有餌で 28 週間飼育した、あるいはイヌに 400mg、800mg/頭/日を 28 週間経口投与した結果、いずれも臓器重量、血液検査、組織学的検索において異常所見は認められなかった<sup>8)</sup>。

### (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

ラットの妊娠前・初期、器官形成期及び周産・授乳期に本薬 20、40mg/kg/日を、また、ウサギの器官形成期に本薬 10、20mg/kg/日を経口投与した。その結果、生殖能への影響、発育抑制、催奇形性は認められなかった。

### (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：該当しない（処方箋医薬品以外の医薬品である）

有効成分：オキセサゼイン 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

アルミ袋開封後、湿気を避けて保存すること（湿気により含量が低下する）。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無し

くすりのしおり：有り

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：無し

同 効 薬：無し

### 7. 国際誕生年月日

該当しない

### 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

	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
旧販売名 ストロカイン錠	1962年2月27日	13700AZZ00743000	1963年1月1日	1962年3月1日
販売名変更 ストロカイン錠 5mg	2007年8月31日 (販売名変更による)	21900AMX01227000	2007年12月21日 (販売名変更による)	2007年12月21日
製造販売承認承継	〃	〃	〃	2023年4月1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

## X. 管理的事項に関する項目

### 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1979年2月2日

効能・効果：「急性・慢性胃炎に伴う次の諸症状に局所麻酔として使用する。ただし、低酸性胃炎及び無酸性胃炎を除く。胃痛、嘔気、吞酸、嘔吐、胃部不快感」を「下記疾患に伴う疼痛・酸症状・嘔気・悪心・嘔吐・胃部不快感・便意逼迫 食道炎、胃炎、胃・十二指腸潰瘍、過敏性大腸症（イリタブルコロン）」に変更。

用法・用量：「1回1～2錠、1日3回症状に応じて適宜増減する。」を「通常成人1日3～8錠（オキサゼインとして1日15～40mg）を3～4回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」に変更。

### 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 (YJコード)	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理 システム用コード
ストロカイン錠 5mg	1219 002F 1065	1219002F1065	1016871 01	620005991

### 14. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

文献請求番号

- 1) 白壁彦夫ら : 臨牀と研究. 1975 ; 52 (10) : 3065-3074 SR-0001
- 2) Farrar G. E. Jr. et al. : Pa. Med. J.. 1962 ; 65 : 1369-1372 SR-0003
- 3) Seifter J. et al. : Proc. Soc. Exp. Bio. Med.. 1962 ; 109 : 664-668 (PMID : 13910333) SR-0004
- 4) Posey E. L. Jr. et al. : Am. J. Gastroenterol.. 1971 ; 55 (1) : 54-57 (PMID : 5550745) SR-0006
- 5) Posey E. L. Jr. et al. : Am. J. Dig. Dis.. 1969 ; 14 (11) : 797-800 (PMID : 5358881) SR-0005
- 6) 山形徹一ら : 診療. 1968 ; 21 (6) : 1035-1041 SR-0008
- 7) 難波良司ら : 日本消化器病学会雑誌. 1966 ; 63 (3) : 271 - 274-C SR-0007
- 8) Glassman J. M. et al. : Toxicol Appl. Pharmacol.. 1963 ; 5 : 184-200 (PMID : 13948386) SR-0043

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

### 1. 主な外国での発売状況

オキセサゼインは、Strocain の販売名で香港、シンガポール等で販売されている。(2020年時点)

### 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

#### (1) 粉碎

表紙に記載の「問い合わせ窓口」に個別に照会すること。

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

表紙に記載の「問い合わせ窓口」に個別に照会すること。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし



CODE DI-I-SR113  
2024 年 3 月作成