

※※印：2011年2月改訂(第8版)  
 ※印：2009年6月改訂

日本標準商品分類番号
87259

貯法：しゃ光・室温保存  
 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。  
 取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照

	錠2	錠3
承認番号	(08AM)0006	(08AM)0007
薬価収載	1996年7月	1996年7月
販売開始	1996年7月	1996年7月
再評価結果 (品質再評価)	2005年5月	2005年5月







尿失禁・尿意切迫感・頻尿治療剤

# ネルオス錠2 ネルオス錠3

NELUOS  
 オキシブチニン塩酸塩錠

- 【禁忌(次の患者には投与しないこと)】**
- 明らかな下部尿路閉塞症状である排尿困難・尿閉等を有する患者〔排尿困難・尿閉等が更に悪化するおそれがある〕
  - 緑内障の患者〔眼圧の上昇を招き、症状を悪化させるおそれがある〕
  - 重篤な心疾患のある患者〔抗コリン作用により頻脈、心悸亢進を起こし心臓の仕事量が増加するおそれがある〕
  - 麻痺性イレウスのある患者〔抗コリン作用により胃腸管の緊張、運動性は抑制され、胃腸管内容物の移動は遅延するため、麻痺性イレウスの患者では、胃腸管内容物の停滞により閉塞状態が強められるおそれがある〕
  - 衰弱患者又は高齢者の腸アトニー、重症筋無力症の患者〔抗コリン作用により、症状を悪化させるおそれがある〕
  - 授乳婦（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）

**【組成・性状】**

	ネルオス錠2	ネルオス錠3	
組成	1錠中： オキシブチニン塩酸塩 ……………2mg	1錠中： オキシブチニン塩酸塩 ……………3mg	
	〈添加物〉 カルメロースカルシウム、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース		
性状	苦味を有する白色の片面1/2割線入り素錠		
識別コード (PTP)	OX 2mg	OX 3mg	
外形 サイズ	表 (直径mm)	 8.0	 8.0
	裏 (重量mg)	 190	 190
	断面 (厚さmm)	 3.6	 3.6

**【効能・効果】**

下記疾患又は状態における頻尿、尿意切迫感、尿失禁  
 神経因性膀胱  
 不安定膀胱(無抑制収縮を伴う過緊張性膀胱状態)

**【用法・用量】**

通常成人1回1錠(オキシブチニン塩酸塩として2又は3mg)を1日3回経口投与する。  
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

**【使用上の注意】**

- 1 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**
- 排尿困難のおそれのある前立腺肥大患者〔前立腺肥大患者では、排尿障害を来していない場合でも、抗コリン剤の投与により排尿障害を起こすおそれがある〕
  - 甲状腺機能亢進症の患者〔心拍数の増加等の症状の悪化を招くおそれがある〕
  - うつ血性心不全の患者〔代償性交感神経系の亢進を更に亢進させるおそれがある〕
  - 不整脈のある患者〔頻脈性の不整脈を有している患者では、副交感神経遮断作用により交感神経が優位にたち、心拍数の増加等が起こるおそれがある〕

- 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〕
- 高温環境にある患者〔抗コリン作用により発汗抑制が起こり、外部の温度上昇に対する不耐性が生じて、急激に体温が上昇するおそれがある〕
- 重篤な肝又は腎疾患のある患者
- ※※(8) パーキンソン症候群又は認知症・認知機能障害のある高齢者〔抗コリン作用により、症状を悪化させるおそれがある〕

**2 重要な基本的注意**

視調節障害、眠気を起こすことがあるので、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。

**3 相互作用**

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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	口渇、便秘、排尿困難、目のかすみ等の副作用が増強されるおそれがある。	抗コリン作用が増強されるおそれがある。

**4 副作用**

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

**(1) 重大な副作用(頻度不明)**

- 血小板減少 血小板減少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。
- 麻痺性イレウス 麻痺性イレウスがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、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。
- ※※3) 尿閉 尿閉があらわれることがあるので、観察を十分に行い、症状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) その他の副作用**

	頻度不明
精神神経系	めまい、眠気、頭痛、しびれ、振戦等
消化器系	口渇、下痢、胃腸障害、胃部不快感、嘔気、食欲不振、胸やけ、便秘、腹部膨満感、口内炎、嘔吐、舌炎等
過敏症	発疹等
※※ 泌尿器系	排尿困難、残尿等
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇
その他	浮腫、倦怠感、口が苦い、発熱、熱感、目のかすみ、眼瞼結膜充血、汗が出なくなる、咽頭部痛、胸痛、手の乾燥感、嘔声等

**5 高齢者への投与**

高齢者に投与する場合には少量から投与し、観察を十分行うとともに、過量投与にならぬよう注意すること。

**6 妊婦、産婦、授乳婦等への投与**

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。  
 動物実験で乳汁への移行が報告されているので授乳中の婦人には投与しないこと。

**7 小児等への投与**

小児に対する安全性は確立していない。



## 8 適用上の注意

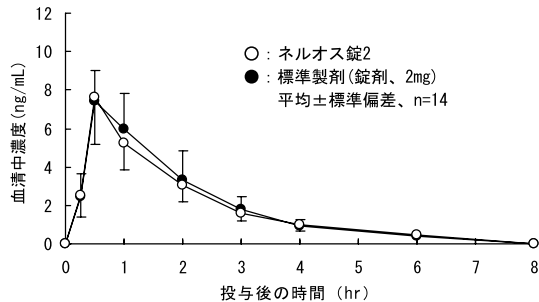
薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

### 【薬物動態】

#### 1 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

##### ●ネルオス錠2

ネルオス錠2と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ4錠(オキシブチニン塩酸塩として8mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清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)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。(1回投与量：承認外用量)



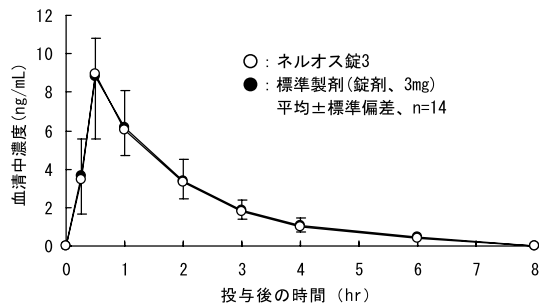
#### 薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-8</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ネルオス錠2	8	14.4±2.7	7.9±1.0	0.5±0.1	1.7±0.4
標準製剤 (錠剤, 2mg)	8	15.1±3.8	8.2±1.7	0.6±0.2	1.4±0.3

血清中濃度並びに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。

##### ●ネルオス錠3

ネルオス錠3と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ3錠(オキシブチニン塩酸塩として9mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清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)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。(1回投与量：承認外用量)



#### 薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-8</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ネルオス錠3	9	16.2±2.7	9.3±1.5	0.5±0.1	1.4±0.3
標準製剤 (錠剤, 3mg)	9	16.7±4.0	9.6±2.5	0.6±0.2	1.4±0.2

血清中濃度並びに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 溶出性<sup>2)</sup>

本剤の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

### 【薬効薬理】<sup>3)</sup>

オキシブチニン塩酸塩は、抗コリン作用による膀胱平滑筋(排尿筋)収縮抑制と弱いカルシウム拮抗作用による平滑筋直接弛緩を示し、膀胱の過緊張状態を緩解させる。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オキシブチニン塩酸塩(塩酸オキシブチニン)  
(Oxybutynin hydrochloride)

化学名：4-diethylamino-2-butynyl(±)-α-cyclohexyl-α-phenylglycolate hydrochloride

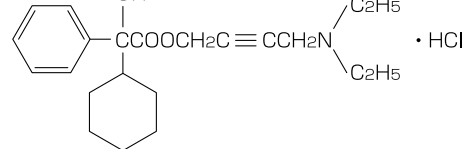
分子式：C<sub>22</sub>H<sub>31</sub>NO<sub>3</sub>·HCl

分子量：393.95

融点：124~129℃

性状：オキシブチニン塩酸塩は白色の結晶性の粉末である。メタノールに極めて溶けやすく、水、エタノール(95)又は酢酸(100)に溶けやすく、無水酢酸にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。水溶液(1→50)は旋光性を示さない。

構造式：



### 【取扱い上の注意】<sup>4)</sup>

安定性試験結果の概要

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ネルオス錠2及びネルオス錠3は通常の市場流通下において安定であることが推測された。

### 【包装】

#### ●ネルオス錠2

PTP包装：100錠(10錠×10)、1,200錠(10錠×120)

#### ※●ネルオス錠3

PTP包装：100錠(10錠×10)

### 【主要文献】

- 1) 大洋薬品工業株式会社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 大洋薬品工業株式会社内資料(溶出試験)
- 3) 河邊等：医学と薬学, 24(6), 1463, 1990
- 4) 大洋薬品工業株式会社内資料(安定性試験)

### 【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。  
大洋薬品工業株式会社 タイヨーDIセンター  
〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号  
TEL 0120-080-601 FAX 052-459-2853

製造販売元

 大洋薬品工業株式会社  
名古屋市中村区太閤一丁目24番11号