＊＊2023年７月改訂（第15版）Z
＊2019年９月改訂

日本標準商品分類番号	８７　２３１９

承認番号	22500AMX01274000
薬価収載	2014年６月
販売開始	1990年７月

止　瀉　剤

ロペラミド塩酸塩カプセル1mg「JG」

（ロペラミド塩酸塩カプセル）

〔貯法〕
室温保存
〔使用期限〕
外箱に表示の
期限内に使用すること。

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
(1)出血性大腸炎の患者［腸管出血性大腸菌（O157等）や赤痢菌等の重篤な感染性下痢患者では、症状の悪化、治療期間の延長を来すおそれがある。］
(2)抗生物質の投与に伴う偽膜性大腸炎の患者［症状の悪化、治療期間の延長を来すおそれがある。］
(3)低出生体重児、新生児及び６カ月未満の乳児［外国で、過量投与により、呼吸抑制、全身性痙攣、昏睡等の重篤な副作用の報告がある。］
(4)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）】
(1)感染性下痢患者［治療期間の延長を来すおそれがある。］
(2)潰瘍性大腸炎の患者［中毒性巨大結腸を起こすおそれがある。］
(3)６カ月以上２歳未満の乳幼児（**「７.小児等への投与」**の項参照）

【組成・性状】

販　売　名	ロペラミド塩酸塩カプセル１mg「JG」
成分・含量（１カプセル中）	ロペラミド塩酸塩　１mg
添　加　物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク、ゼラチン、酸化チタン、ラウリル硫酸ナトリウム
剤形・性状	頭部、胴部共に白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は白色の顆粒である。
外　　形	
カプセル号数	４号
重　量(mg)	140
識別コード	CH-TA

【効能・効果】
下痢症

【用法・用量】
ロペラミド塩酸塩として、通常、成人に１日１～２mgを１～２回に分割経口投与する。
なお、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）
重篤な肝障害のある患者［本剤の代謝及び排泄が遅延するおそれがある。］
２.重要な基本的注意
(1)止瀉剤による治療は下痢の対症療法であるので、脱水症状がみられる場合、輸液等適切な水・電解質の補給に留意すること。
(2)本薬の薬理作用上、**便秘**が発現することがあるので、用量に留意し、便秘が発現した場合は投与を中止すること。また、特に便秘を避けねばならない肛門疾患等の患者には注意して投与すること。
(3)眠気、めまいが起こることがあるので、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従事させない**よう注意すること。

３.相互作用
本剤は主として肝代謝酵素CYP3A4及びCYP2C8で代謝されることから、CYP3A4又はCYP2C8を阻害する薬剤と併用した際、本剤の代謝が阻害され血中濃度が上昇する可能性がある。また、本剤はP-糖蛋白の基質である。
併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ケイ酸アルミニウム タンニン酸アルブミン	本剤の効果が減弱するおそれがあるので、投与間隔をあけるなど注意すること。	これらの薬剤により、本剤が吸着されることが考えられる。
リトナビル キニジン	本剤の血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤のP-糖蛋白に対する阻害作用により、本剤の排出が阻害されると考えられる。
イトラコナゾール	本剤の血中濃度が上昇することがある。	イトラコナゾールのCYP3A4及びP-糖蛋白に対する阻害作用により、本剤の代謝及び排出が阻害されると考えられる。
デスモプレシン（経口）	デスモプレシンの血中濃度が上昇することがある。	本剤の消化管運動抑制作用により、デスモプレシンの消化管吸収が増加すると考えられる。

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）
1)**イレウス、巨大結腸**：消化器症状（**「４.副作用(2)その他の副作用：消化器」**の項参照）とともにイレウス、巨大結腸があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止すること。
2)**ショック、アナフィラキシー**：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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)**中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）**：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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
過　敏　症(注)	血管浮腫
中枢神経系	頭痛、傾眠傾向、鎮静、筋緊張低下、意識レベルの低下、筋緊張亢進、意識消失、昏迷、協調運動異常
肝　　臓	AST（GOT）、ALT（GPT）、γ-GTPの上昇
消　化　器	腹部膨満、腹部不快感、悪心、腹痛、嘔吐、食欲不振、消化不良、口内不快感、味覚の変調、便秘、鼓腸
皮　　膚	発疹、蕁麻疹、そう痒感、多形紅斑、水疱性皮膚炎
泌　尿　器	尿閉
そ　の　他	口渇、眠気、めまい、発汗、倦怠感、疲労、体温低下、発熱、散瞳、縮瞳

注）このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

用量に留意するなど、注意して投与すること。[一般に高齢者では生理機能が低下している。]

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2)授乳中の婦人には本剤投与中の授乳は避けさせること。[ヒトで母乳中に移行することが報告されている。]

7. 小児等への投与

(1)小児等に対する安全性は確立していないので、投与しないことが望ましい。

(2)外国で、乳幼児（特に２歳未満）に過量投与した場合、中枢神経系障害、呼吸抑制、腸管壊死に至る麻痺性イレウスを起こしたとの報告がある。

＊8. 過量投与

徴候、症状：外国で、過量投与により昏睡、呼吸抑制、縮瞳、協調異常、筋緊張低下、傾眠、尿閉等の中毒症状が報告されている。また、腸管壊死に至る麻痺性イレウスにより死亡に至った例、QT延長、Torsade de Pointesを含む重篤な心室性不整脈、Brugada症候群の顕在化が報告されている。

処置：中毒症状がみられた場合にはナロキソン塩酸塩を投与する。本剤の作用持続性に比べ、ナロキソン塩酸塩の作用は短時間しか持続しないので、必要な場合にはナロキソン塩酸塩を反復投与する。また、QT延長のリスクがあるため、心電図異常に注意すること。

9. 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。)

＊＊10. その他の注意

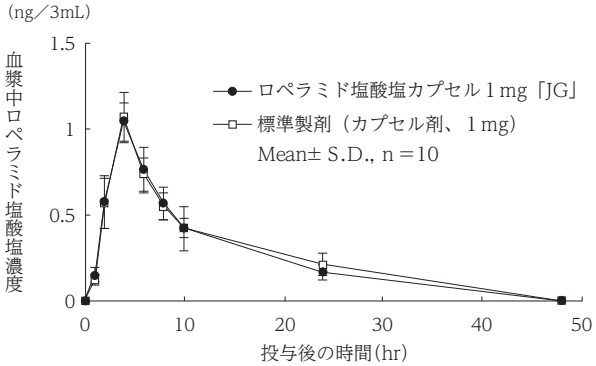
(1)乱用、誤用、又は故意により過量投与した患者において、休薬後に薬物離脱症候群の症例が認められたとの報告があるので、観察を十分に行い、用量に注意すること。

(2)動物実験において、大量投与で薬物依存性が認められているので、観察を十分に行い、用量及び使用期間に注意すること。

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

ロペラミド塩酸塩カプセル１mg「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ２カプセル（ロペラミド塩酸塩として２mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中ロペラミド塩酸塩濃度を測定し、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。[1)]



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}48}$ (ng・hr/3mL)	Cmax (ng/3mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ロペラミド塩酸塩カプセル１mg「JG」	12.48±0.83	1.05±0.11	4.00±0.00	9.31±2.31
標準製剤（カプセル剤、１mg）	13.31±1.41	1.07±0.15	4.00±0.00	13.15±4.96

(Mean±S.D., n=10)

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. 溶出挙動

ロペラミド塩酸塩カプセル１mg「JG」は、日本薬局方外医薬品規格第３部に定められた塩酸ロペラミド１mgカプセルの溶出規格に適合していることが確認されている。[2)]

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ロペラミド塩酸塩（Loperamide Hydrochloride）

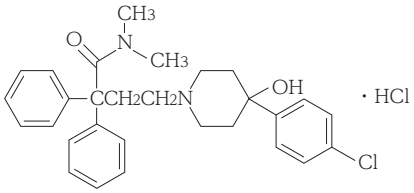
化学名：4-[4-(*p*-Chlorophenyl)-4-hydroxy-1-piperidyl]-*N*,*N*-dimethyl-2,2-diphenylbutyramide hydrochloride

分子式：$C_{29}H_{33}ClN_2O_2$・HCl

分子量：513.50

融　点：約225℃（分解）

構造式：



性　状：ロペラミド塩酸塩は、白色～微黄色の結晶性の粉末である。酢酸（100）又はクロロホルムに溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすく、水、無水酢酸又は2-プロパノールに溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、３年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ロペラミド塩酸塩カプセル１mg「JG」の室温保存における３年間の安定性が確認された。[3)]

【包装】

ロペラミド塩酸塩カプセル１mg「JG」

PTP：100カプセル（10カプセル×10）、
500カプセル（10カプセル×50）

【主要文献】

1)長生堂製薬株式会社　社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）

2)長生堂製薬株式会社　社内資料（溶出試験に関する資料）

3)長生堂製薬株式会社　社内資料（安定性試験に関する資料）

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

日本ジェネリック株式会社　お客さま相談室
〒100-6739　東京都千代田区丸の内一丁目９番１号
TEL　0120-893-170　FAX　0120-893-172

販売元
日本ジェネリック株式会社
東京都千代田区丸の内一丁目９番１号

製造販売元
長生堂製薬株式会社
徳島市国府町府中92番地