

貯 法：室温保存

有効期間：3年

	10mg	30mg
承認番号	23000AMX00128	23000AMX00129
販売開始	2000年7月	2000年7月

消化管運動改善剤

ドンペリドン坐剤

# ドンペリドン坐剤10mg「タカタ」

# ドンペリドン坐剤30mg「タカタ」

Domperidone Suppositories “TAKATA”



## 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 妊婦又は妊娠している可能性のある女性[9.5 参照]
- 2.3 消化管出血、機械的イレウス、消化管穿孔の患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
- 2.4 プロラクチン分泌性の下垂体腫瘍（プロラクチノーマ）の患者〔抗ドパミン作用によりプロラクチン分泌を促す。〕

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

販売名	有効成分	添加剤
ドンペリドン坐剤 10mg「タカタ」	1 個中 日局 ドンペリドン 10mg	酒石酸 ジブチルヒドロキシトルエン マクロゴール 400 マクロゴール 1540 マクロゴール 4000 マクロゴール 6000
ドンペリドン坐剤 30mg「タカタ」	1 個中 日局 ドンペリドン 30mg	酒石酸 ジブチルヒドロキシトルエン マクロゴール 400 マクロゴール 1540 マクロゴール 4000 マクロゴール 6000

### 3.2 製剤の性状

販売名	性状	外形
ドンペリドン坐剤 10mg「タカタ」	白色～帯黄白色の紡錘形の坐剤	 重さ 1.1g 長さ 24mm 直径 8mm
ドンペリドン坐剤 30mg「タカタ」	白色～帯黄白色の紡錘形の坐剤	 重さ 1.1g 長さ 24mm 直径 8mm

## 4. 効能又は効果

- 小児：下記疾患および薬剤投与時の消化器症状（悪心、嘔吐、食欲不振、腹部膨満、腹痛）
- 周期性嘔吐症、乳幼児下痢症、上気道感染症
  - 抗悪性腫瘍剤投与時

## 6. 用法及び用量

- 小児：3才未満の場合、通常ドンペリドンとして1回10mgを1日2～3回直腸内に投与する。  
3才以上の場合、通常ドンペリドンとして1回30mgを1日2～3回直腸内に投与する。  
なお、年齢、体重、症状により適宜増減する。

## 8. 重要な基本的注意

- 8.1 ショックを起こすことがある。[11.1.1 参照]

- 8.2 間脳の内分泌機能調節異常、錐体外路症状等があらわれることがあるので、本剤の投与に際しては、有効性と安全性を十分考慮のうえ使用すること。[9.7、11.1.2 参照]

- 8.3 眠気、めまい・ふらつき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操作に注意させること。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

#### 9.1.1 心疾患のある患者

QT延長があらわれるおそれがある。

### 9.2 腎機能障害患者

副作用が強くあらわれるおそれがある。

### 9.3 肝機能障害患者

副作用が強くあらわれるおそれがある。

### 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。動物実験（ラット）で骨格、内臓異常等の催奇形作用が報告されている。[2.2 参照]

### 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。投与する場合は大量投与を避けること。動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。[16.3.1 参照]

### 9.7 小児等

特に1才以下の乳児には用量に注意し、3才以下の乳幼児には7日以上での連用を避けること。また、脱水状態、発熱時等では特に投与後の患者の状態に注意すること。小児において錐体外路症状、意識障害、痙攣が発現することがある。[8.2、11.1.2、11.1.3 参照]

### 9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に高齢者では生理機能が低下している。[15.1 参照]

## 10. 相互作用

本剤は主にCYP3A4で代謝される。

### 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
フェノチアジン系精神神経用剤 プロクロルペラジン クロロプロマジン チエチルペラジン等 ブチロフェノン系製剤 ハロペリドール等 ラウオルフィアルカロイド製剤 レセルピン等	内分泌機能調節異常又は錐体外路症状が発現しやすくなる。	フェノチアジン系精神神経用剤、ブチロフェノン系製剤は中枢性の抗ドパミン作用を有し、ラウオルフィアルカロイド製剤は中枢でカテコールアミンを枯渇させる。一方、本剤は血液-脳関門を通過しにくい強い抗ドパミン作用を有する。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジギタリス製剤 ジゴキシン等	ジギタリス製剤飽和時の指標となる悪心、嘔吐、食欲不振症状を不顕化することがある。ジギタリス製剤の血中濃度のモニターを行う。	本剤は制吐作用を有する。
抗コリン剤 ブチルスコポラミン臭化物 チキジウム臭化物 チメビジウム臭化物水和物等	本剤の胃排出作用が減弱することがある。症状により一方を減量、中止する。又は必要に応じて間隔をあけて投与する。	抗コリン剤の消化管運動抑制作用が本剤の消化管運動亢進作用と拮抗する。
CYP3A4 阻害剤 イトラコゾール エリスロマイシン等 [16.7.1 参照]	本剤の血中濃度が上昇する。また、エリスロマイシンとの併用においては、QT 延長が報告されている。	強力又は中程度のCYP3A4 阻害作用により本剤の代謝が阻害される。

## 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。

### 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）

ショック、アナフィラキシー（発疹、発赤、呼吸困難、顔面浮腫、口唇浮腫等）を起こすことがある。[8.1 参照]

#### 11.1.2 錐体外路症状（0.1%未満）

後屈頸、眼球側方発作、上肢の伸展、振戦、筋硬直等の錐体外路症状があらわれることがあるので、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。なお、これらの症状が強い場合には、抗パーキンソン剤を投与するなど適切な処置を行うこと。[8.2、9.7 参照]

#### 11.1.3 意識障害、痙攣（いずれも頻度不明）

[9.7 参照]

### 11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
肝臓	肝機能障害（AST、ALT、 $\gamma$ -GTP、ビリルビン、Al-P、LDH 上昇等）		
内分泌			女性化乳房、プロラクチン上昇、乳汁分泌、乳房膨満感、月経異常
消化器	下痢、腹痛、肛門部不快感、悪心	腹部不快感、しぶり腹、腹鳴	便秘、腹部圧迫感、口渇、胸やけ、嘔吐、腹部膨満感、腸痙攣
循環器		心悸亢進	QT 延長
皮膚		発疹	じん麻疹、そう痒
その他			発汗、眠気、動揺感、めまい・ふらつき、口内のあれ

注）発現頻度は使用成績調査を含む。

## 15. その他の注意

### 15.1 臨床使用に基づく情報

外国において本剤による重篤な心室性不整脈及び突然死が報告されている。特に高用量を投与している患者又は高齢の患者で、これらのリスクが増加したとの報告がある。[9.8 参照]

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

#### 16.1.1 生物学的同等性試験

##### (1) ドンベリドン坐剤 10mg 「タカタ」

ドンベリドン坐剤 10mg 「タカタ」とナウゼリン坐剤 10 をクロスオーバー法により、健康成人男子 16 名にそれぞれ 1 個（ドンベリドンとして 10mg）を絶食時単回直腸内投与し、投与前、投与後 0.5、1、2、3、4、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したドンベリドンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、AUC 及び Cmax について統計的評価を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>1)</sup>。

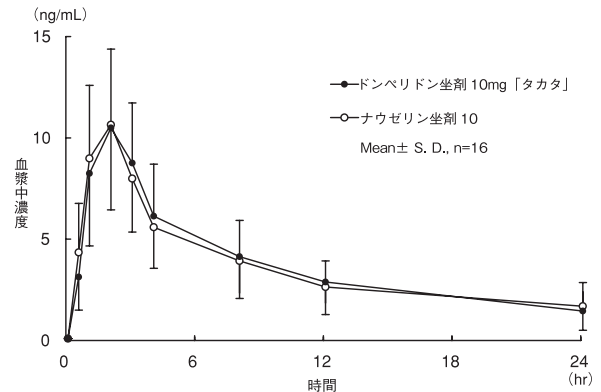


図 16-1 血漿中濃度（坐剤 10mg）

表 16-1 薬物動態パラメータ（坐剤 10mg）

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ドンベリドン坐剤 10mg 「タカタ」	88.61 ± 27.02	11.82 ± 3.42	1.9 ± 0.7	8.1 ± 2.5
ナウゼリン坐剤 10	86.25 ± 30.58	11.86 ± 3.25	1.8 ± 0.5	9.2 ± 4.5

(Mean ± S. D., n=16)

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) ドンベリドン坐剤 30mg 「タカタ」

ドンベリドン坐剤 30mg 「タカタ」とナウゼリン坐剤 30 をクロスオーバー法により、健康成人男子 16 名にそれぞれ 1 個（ドンベリドンとして 30mg）を絶食時単回直腸内投与し、投与前、投与後 0.5、1、2、3、4、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したドンベリドンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、AUC 及び Cmax について統計的評価を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>2)</sup>。

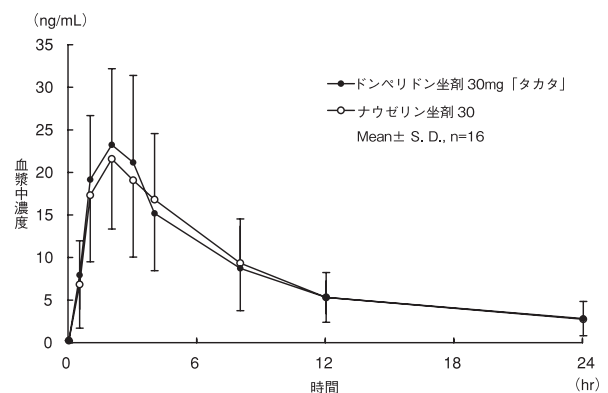


図 16-2 血漿中濃度（坐剤 30mg）

表 16-2 薬物動態パラメータ (坐剤 30mg)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng・ hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ドンペリドン坐剤 30mg「タカタ」	189.43±67.32	24.89±8.75	2.1±1.1	7.4±3.5
ナウゼリン坐剤 30	189.78±83.31	24.19±7.70	2.3±1.0	6.9±3.1

(Mean ± S. D., n=16)

血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 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。

### 16.3 分布

#### 16.3.1 母乳中への移行性

授乳ラットに<sup>14</sup>C-ドンペリドン 2.5mg/kg を静脈内又は経口投与したとき、乳汁中放射能濃度は静脈内投与後 30 分、経口投与後 1~2 時間で最高に達した<sup>3)</sup>。[9.6 参照]

### 16.7 薬物相互作用

#### 16.7.1 イトラコナゾール

外国人健康成人 15 例にドンペリドン (経口剤、20mg<sup>2b)</sup>、単回投与) とイトラコナゾール (200mg/日、5 日間反復投与) を併用投与したとき、ドンペリドンの C<sub>max</sub> 及び AUC<sub>0-∞</sub> はそれぞれ 2.7 倍及び 3.2 倍増加した<sup>4)</sup>。[10.2 参照]

注) ドンペリドン (経口剤) の成人における承認された用法・用量は 1 回 10mg、1 日 3 回である。

### 18. 薬効薬理

#### 18.1 作用機序

上部消化管並びに CTZ (化学受容器引き金帯) に作用し、抗ドパミン作用により薬効を発現する<sup>5)</sup>。

### 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ドンペリドン

(Domperidone)

化学名：5-Chloro-1-[1-[3-(2-oxo-2, 3-dihydro-1H-benzimidazol-1-yl) propyl] piperidin-4-yl]-1, 3-dihydro-2H-benzimidazol-2-one

分子式：C<sub>22</sub>H<sub>24</sub>ClN<sub>5</sub>O<sub>2</sub>

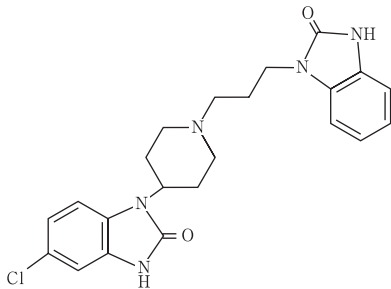
分子量：425.91

性状：白色～微黄色の結晶性の粉末又は粉末である。

酢酸 (100) に溶けやすく、メタノール又はエタノール (99.5) に溶けにくく、2-プロパノールに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点 約 243℃ (分解)

化学構造式：



### 22. 包装

〈ドンペリドン坐剤 10mg「タカタ」〉

50 個 [5 個×10]

〈ドンペリドン坐剤 30mg「タカタ」〉

50 個 [5 個×10]

### 23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験 (ドンペリドン坐剤 10mg「タカタ」)
- 社内資料：生物学的同等性試験 (ドンペリドン坐剤 30mg「タカタ」)
- Michiels M, et al. : Eur J Drug Metab Pharmacokinet. 1981 ; 6 : 37-48
- Yoshizato T, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 2012 ; 68 : 1287-1294
- 日本薬局方解説書編集委員会編：第十八改正 日本薬局方解説書 2021 : C3776-3781

### 24. 文献請求先及び問い合わせ先

高田製薬株式会社 文献請求窓口  
〒336-8666 さいたま市南区沼影 1 丁目 11 番 1 号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

**高田製薬株式会社**

さいたま市西区宮前町203番地1