2009年６月改訂(第４版、指定医薬品削除)
＊2008年７月改訂

アレルギー性疾患治療剤
スプラタストトシル酸塩カプセル50mg「サワイ」
スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「サワイ」
SUPLATAST TOSILATE
スプラタストトシル酸塩カプセル

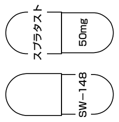
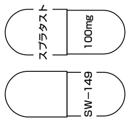
日本標準商品分類番号
87449

	＊50mg	100mg
承認番号	22000AMX00485000	21900AMX00497000
薬価収載	2008年７月	2007年７月
販売開始	**2008年７月**	2007年７月

貯　法	室温保存 開封後は湿気を避けて保存すること
使用期限	外箱に表示

【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

【組成・性状】
・**組成**
＊**スプラタストトシル酸塩カプセル50㎎「サワイ」**：１カプセル中にスプラタストトシル酸塩50mgを含有する。
添加物として、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Naを含有する。
スプラタストトシル酸塩カプセル100㎎「サワイ」：１カプセル中にスプラタストトシル酸塩100mgを含有する。
添加物として、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Naを含有する。
・**製剤の性状**

品　名	剤　形	外　　形 全長(㎜)・重量(㎎)・カプセル号数	性　　状
＊スプラタストトシル酸塩カプセル50㎎「サワイ」	硬カプセル剤	 14.2　約115　4 [識別コード：SW-148]	頭　部：白色不透明 胴　部：白色不透明 内容物：白色の粉末で、においはないか又は特異なにおいがある
スプラタストトシル酸塩カプセル100㎎「サワイ」	硬カプセル剤	 15.8　約216　3 [識別コード：SW-149]	頭　部：白色不透明 胴　部：白色不透明 内容物：白色の粉末で、においはないか又は特異なにおいがある

【効能・効果】
気管支喘息、アトピー性皮膚炎、アレルギー性鼻炎

【用法・用量】
通常、成人にはスプラタストトシル酸塩として１回100mgを１日３回毎食後に経口投与する。
ただし、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)
肝障害のある患者〔肝障害が悪化するおそれがある。〕
２．重要な基本的注意
1)本剤は喘息の悪化時ばかりでなく、喘息が良好にコントロールされている場合でも継続して服用するよう、患者に十分説明しておくこと。
2)本剤は気管支拡張剤、ステロイド剤、抗ヒスタミン剤等と異なり、**既に起こっている発作や症状を速やかに軽減する薬剤ではない**ので、このことは患者に十分説明しておく必要がある。
3)気管支喘息患者に本剤を投与中、**大発作をみた場合**は気管支拡張剤あるいはステロイド剤を投与する必要がある。
4)長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。
5)本剤の使用によりステロイド維持量を減量し得た患者で、本剤の投与を中止する場合は原疾患再発のおそれがあるので注意すること。
6)本剤の使用により効果が認められない場合には漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。
7)本剤を季節性のアレルギー性疾患患者に投与する場合は好発季節を考え、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
３．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)
⑴**肝機能障害：黄疸**、ALT(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、γ-GTP上昇、Al-P上昇、LDH上昇等の**肝機能障害(初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等)**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。
⑵**ネフローゼ症候群：ネフローゼ症候群**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。
2)**その他の副作用**
次の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には減量、休薬等の適切な処置を行うこと。なお、過敏症があらわれた場合には投与を中止すること。

	頻度不明
消化器	胃部不快感、嘔気、胃痛、下痢、口渇、食欲不振、口内炎、腹痛、嘔吐、腹部膨満感、舌のあれ
精神神経系	眠気、頭痛、痙攣、振戦、めまい、しびれ
血液	白血球減少、好酸球増多
過敏症	発疹、瘙痒感、蕁麻疹
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、γ-GTP上昇、LDH上昇、ビリルビン上昇、Al-P上昇
泌尿器	蛋白尿、頻尿
その他	生理不順、倦怠感・脱力感、浮腫、耳鳴、眼瞼乾燥感、発熱、ほてり、鼻出血、味覚異常、口臭、動悸、咳、胸部圧迫感

4.高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、低用量(例えば150mg/日)から投与を開始し、増量する場合は患者の副作用及び臨床症状を十分観察しながら行うこと。

5.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)授乳婦に投与する場合には授乳を中止させること。〔動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。〕

6.小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

7.臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与はアレルゲン皮内反応を抑制し、アレルゲンの確認に支障をきたすので、アレルゲン皮内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。

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)

9.その他の注意

スプラタストトシル酸塩からジメチルスルフィドが生じ、口臭が発現することがある。

【薬物動態】

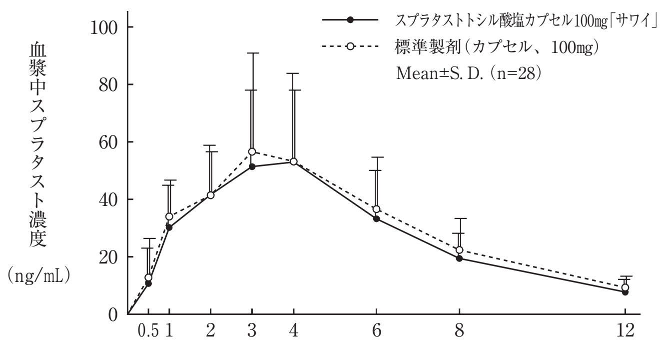
1.生物学的同等性試験

スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1カプセル(スプラタストトシル酸塩として100mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中スプラタスト濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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)]

スプラタストトシル酸塩として100mg投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0\text{-}12hr}$ (ng・hr/mL)
スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「サワイ」	60.3±31.0	3.3±1.2	3.1±0.4	340.4±141.9
標準製剤(カプセル、100mg)	63.6±33.3	3.5±1.1	3.1±0.4	368.4±140.4

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC、C_{max}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

本製剤は、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】

スプラタストトシル酸塩は、ヘルパーT細胞からのインターロイキン4(IL-4)及びインターロイキン5(IL-5)の産生を抑制することにより、IgE抗体産生抑制作用及び好酸球浸潤抑制作用等を示し、抗アレルギー作用を発揮すると考えられている。

【有効成分に関する理化学的知見】

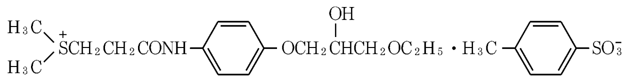
一般名：スプラタストトシル酸塩(Suplatast Tosilate)

化学名：(*RS*)-[2-[4-(3-Ethoxy-2-hydroxypropoxy)phenylcarbamoyl]ethyl]dimethylsulfonium *p*-toluenesulfonate

分子式：$C_{16}H_{26}NO_4S \cdot C_7H_7O_3S$

分子量：499.64

構造式：



性　状：スプラタストトシル酸塩は白色の結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。水、メタノール又は酢酸(100)に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けやすい。水溶液(1→10)は旋光性を示さない。潮解性である。

*【取扱い上の注意】

・安定性試験

PTP包装(PTPシートをアルミピロー包装(乾燥剤入り))したものを用いた加速試験(40℃75%RH、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。[2)、3)]

【包　　装】

*スプラタストトシル酸塩カプセル50mg「サワイ」：

100カプセル(PTP：10Cap×10)

スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「サワイ」：

100カプセル(PTP：10Cap×10)、500カプセル(PTP：10Cap×50)、210カプセル(PTP：21Cap×10)

【主要文献及び文献請求先】

＊・主要文献

1)沢井製薬(株)社内資料［生物学的同等性試験］

2)、3)沢井製薬(株)社内資料［安定性試験］

・文献請求先〔主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい〕

沢井製薬株式会社　医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

0120-381-999　FAX：06-6394-7355

製造販売元

沢井製薬株式会社

大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K04　A090404