

## 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 2013 に準拠して作成

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/100mg 「トローワ」

SUPLATAST TOSILATE CAPSULES 50 mg/ CAPSULES 100 mg “TOWA”  
《スプラタストトシル酸塩カプセル》

製 品 名	スプラタストトシル酸塩 カプセル 50mg 「トローワ」	スプラタストトシル酸塩 カプセル 100mg 「トローワ」
剤 形	硬カプセル剤	
製 剤 の 規 制 区 分	該当しない	
規 格 ・ 含 量	1 カプセル中 スプラタスト トシル酸塩 50mg 含有	1 カプセル中 スプラタスト トシル酸塩 100mg 含有
一 般 名	和 名：スプラタストトシル酸塩(JAN) 洋 名：Suplatast Tosilate(JAN、INN)	
製 造 販 売 承 認 年 月 日	2017年 6月 20日	
薬 価 基 準 収 載 年 月 日	2017年 12月 8日	
発 売 年 月 日	2007年 7月 6日	2006年 7月 7日
開 発 ・ 製 造 販 売 ( 輸 入 ) ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元：東和薬品株式会社	
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	電話番号： FAX：	
問 い 合 わ せ 窓 口	東和薬品株式会社 学術部 DI センター(24時間受付対応)  0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797 <a href="http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff">http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff</a>	

本 IF は 2017 年 12 月改訂(第 6 版、販売名の変更)の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

# IF 利用の手引きの概要 — 日本病院薬剤師会 —

## 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、添付文書と略す)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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IF と略す)の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を保管する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」(以下、「IF記載要領 2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IFの発行]

- ①「IF記載要領 2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### 3. IFの利用にあたって

「IF記載要領 2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月)

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	22
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	22
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	22
II. 名称に関する項目	2	3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	22
1. 販売名	2	4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	22
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	22
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	22
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	22
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	23
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	24
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	24
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	24
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	24
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	24
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	24
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	25
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	25
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	26
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	26
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	2. 毒性試験	26
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	27
5. 調製法及び溶解後の安定性	8	1. 規制区分	27
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	2. 有効期間又は使用期限	27
7. 溶出性	9	3. 貯法・保存条件	27
8. 生物学的試験法	13	4. 薬剤取扱い上の注意点	27
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	13	5. 承認条件等	27
10. 製剤中の有効成分の定量法	13	6. 包装	27
11. 力価	13	7. 容器の材質	28
12. 混入する可能性のある夾雑物	13	8. 同一成分・同効薬	28
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	14	9. 国際誕生年月日	28
14. その他	14	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	28
V. 治療に関する項目	15	11. 薬価基準収載年月日	28
1. 効能・効果	15	12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	28
2. 用法・用量	15	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	28
3. 臨床成績	15	14. 再審査期間	28
VI. 薬効薬理に関する項目	17	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	29
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	17	16. 各種コード	29
2. 薬理作用	17	17. 保険給付上の注意	29
VII. 薬物動態に関する項目	18	XI. 文 献	30
1. 血中濃度の推移・測定法	18	1. 引用文献	30
2. 薬物速度論的パラメータ	19	2. その他の参考文献	30
3. 吸収	19	XII. 参考資料	30
4. 分布	20	1. 主な外国での発売状況	30
5. 代謝	20	2. 海外における臨床支援情報	30
6. 排泄	20	XIII. 備 考	30
7. トランスポーターに関する情報	21	その他の関連資料	30
8. 透析等による除去率	21		

---

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

スプラタストトシル酸塩カプセルはアレルギー性疾患治療剤であり、本邦では 1995 年に上市されている。東和薬品株式会社が後発医薬品として、トシラートカプセル 50mg 及びトシラートカプセル 100mg の開発をそれぞれ企画し、医薬発第 481 号(平成 11 年 4 月 8 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2006 年 3 月(100mg)、2007 年 3 月(50mg)にそれぞれ承認を取得、2006 年 7 月(100mg) 及び 2007 年 7 月(50mg)に発売した。

その後、医療事故防止のため、2017 年 12 月にスプラタストトシル酸塩カプセル 50mg「トーワ」及びスプラタストトシル酸塩カプセル 100mg「トーワ」と販売名の変更を行い、現在に至る。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

**有用性：**スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg「トーワ」及びスプラタストトシル酸塩カプセル 100mg「トーワ」は、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、アレルギー性鼻炎に対して、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ことにより、有用性が認められている。

**安全性：**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。

副作用として、胃部不快感、嘔気、胃痛、下痢、眠気、好酸球増多、発疹、そう痒感、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、LDH 上昇、生理不順、けん怠感・脱力感等が報告されている。〔Ⅷ. 8. (3) その他の副作用の項を参照〕

重大な副作用として、肝機能障害(初期症状：全身けん怠感、食欲不振、発熱、嘔気等)、ネフローゼ症候群があらわれることがある。〔Ⅷ. 8. (2)重大な副作用と初期症状の項を参照〕

---

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和 名

スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg 「トローワ」  
スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トローワ」

#### (2) 洋 名

SUPLATAST TOSILATE CAPSULES 50 mg “TOWA”  
SUPLATAST TOSILATE CAPSULES 100 mg “TOWA”

#### (3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格(含量)＋「トローワ」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

### 2. 一般名

#### (1) 和 名(命名法)

スプラタストトシル酸塩(JAN)

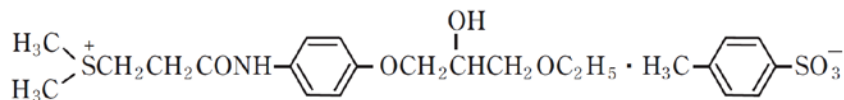
#### (2) 洋 名(命名法)

Suplatast Tosilate(JAN、INN)

#### (3) ステム

-ast : 抗アレルギー薬

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 : C<sub>16</sub>H<sub>26</sub>NO<sub>4</sub>S · C<sub>7</sub>H<sub>7</sub>O<sub>3</sub>S

分子量 : 499.64

### 5. 化学名(命名法)

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

---

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：トシル酸プラタスト

7. CAS登録番号

94055-76-2

---

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

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。

##### (2) 溶解性

溶 媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	溶 解 性
水	1mL 未満	極めて溶けやすい
メタノール	1mL 未満	極めて溶けやすい
酢酸(100)	1mL 未満	極めて溶けやすい
エタノール(99.5)	1mL 以上 10mL 未満	溶けやすい

##### (3) 吸 湿 性

潮解性である。

##### (4) 融点(分解点)・沸点・凝固点

融点：86～90℃

##### (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

pH：4.4～5.8(10%水溶液)

旋光度：本品の水溶液(1→10)は旋光性を示さない。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

水：37℃、6時間で約4%分解する。

液性(pH)：pH6.8、37℃、6時間で約9%分解する。

pH1.2及びpH4.0、37℃、6時間まで安定である。

その他：潮解性がある。



---

### 3. 有効成分の確認試験法

- (1) ペンタシアノニトロシル鉄(III)酸ナトリウム試液及び 2mol/L 塩酸試液による呈色反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

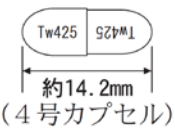

### 4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

製品名	スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg 「トーワ」	スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」
剤形の区別	硬カプセル剤	
性状	頭部が白色、胴部が白色の不透明硬カプセル剤で、内容物にはおはいはないか又は特異なおいのある白色の粉末である。	
識別コード	本体 Tw425	包装 Tw426
外形 全長 号数	 約14.2mm (4号カプセル)	 約15.8mm (3号カプセル)
質量(mg)	約 115	約 199

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

(1) 剤形の区別、外観及び性状の項を参照

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分(活性成分)の含量

スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg 「トーワ」

1 カプセル中 スプラタストトシル酸塩 50mg を含有する。

スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」

1 カプセル中 スプラタストトシル酸塩 100mg を含有する。

#### (2) 添加物

使用目的	添加物
賦形剤	結晶セルロース
滑沢剤	ステアリン酸 Mg

カプセル本体：酸化チタン、ラウリル硫酸 Na、ゼラチン

(3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg 「トーワ」<sup>1)</sup>

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品(乾燥剤入り)

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	頭部が白色、胴部が白色の不透明硬カプセル剤で内容物はわずかに特異なにおいのある白色の粉末	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	93.4~109.7	86.1~103.5
含量(%)	100.6~103.3	96.8~99.1

スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」<sup>2)</sup>

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品(乾燥剤入り)

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	頭部が白色、胴部が白色の不透明硬カプセル剤で内容物はわずかに特異なにおいのある白色の粉末	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	93.8~108.2	94.5~106.7
含量(%)	102.4~104.7	97.7~102.0

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 箇月)の結果、スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg 「トーワ」及びスプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」は通常の市場流通下においてそれぞれ 3 年間安定であることが推測された。

(2) 無包装状態における安定性

スプラタストシル酸塩カプセル 50mg 「トーワ」<sup>3)</sup>

試験項目	開始時	温度		湿度 (25°C、75%RH、1 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
		(40°C、3 箇月)			
外観	問題なし	問題なし		カプセルが溶解、 内容物が潮解	問題なし
含量	問題なし	問題なし		測定不能	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし		測定不能	問題なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成 11 年 8 月 20 日」に準じて試験を実施した。

スプラタストシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」<sup>4)</sup>

試験項目	開始時	温度(40°C)		湿度 (25°C、75%RH、1 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
		1 箇月	3 箇月		
外観	問題なし	内容物が吸湿	粘着性発生、 内容物が吸湿	カプセルが溶解、 内容物が潮解	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	測定不能	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	測定不能	データなし

注)「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成 11 年 8 月 20 日」に準じて試験を実施した。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

---

## 7. 溶出性

### (1) 規格及び試験方法<sup>5) 6)</sup>

スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg「トーワ」及びスプラタストトシル酸塩カプセル 100mg「トーワ」は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたトシル酸スプラタストカプセルの溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：水 900mL

回転数：50rpm

測定法：紫外可視吸光度測定法

規 格：15 分間の溶出率が 80%以上のときは適合とする。

〔出典：日本薬局方外医薬品規格第 3 部〕

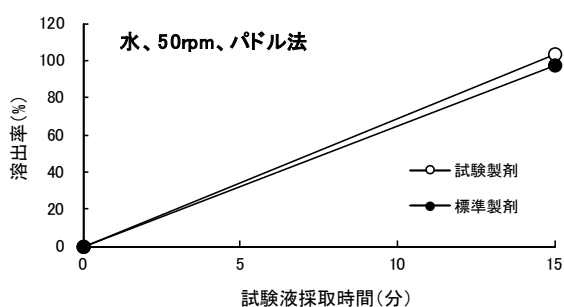
(2) 生物学的同等性試験

スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg 「トーワ」<sup>7)</sup>

「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 12 年 2 月 14 日 医薬審第 64 号)(以下、ガイドライン)に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたスプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」を標準製剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験製剤の処方変更水準は、ガイドラインにより A 水準に該当した。

<測定条件>

試験液	: 水	検体数	: n=12
回転数	: 50rpm	試験法	: パドル法
試験製剤	: スプラタストトシル酸塩カプセル50mg「トーワ」	標準製剤	: スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「トーワ」



時間(分)	0	15
試験剤	0	103.0
標準偏差	0	1.91
標準剤	0	97.7
標準偏差	0	4.32

①試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較 (パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験製剤	標準製剤	
50	水	15	103.0	97.7	適

判定基準

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する。

②最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率(パドル法)

試験条件			(a)	(b)	(a)が(b)を 超えた数	判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	最小値～最大値 (%)	平均溶出率 ±15%の範囲(%)		
50	水	15	100.5～106.3	88.0～118.0	0	適

判定基準

最終比較時点における標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達する場合：試験製剤の個々の溶出率について、平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

①②の結果より、上記の試験条件について、溶出挙動が同等と判定された。

従って、スプラタストトシル酸塩カプセル 50mg「トーワ」と標準製剤(スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg「トーワ」)は、生物学的に同等であるとみなされた。

スプラタストシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」<sup>8)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成13年5月31日 医薬審発第786号)(以下、ガイドライン)に従い、溶出試験を行った。

<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水

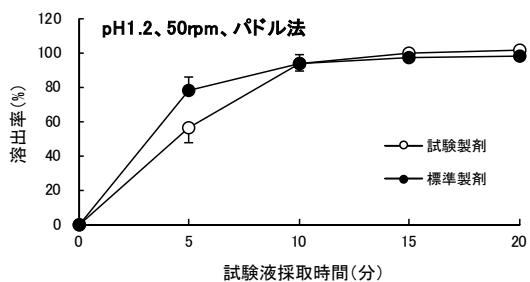
回転数 : 50rpm、100rpm

試験製剤 : スプラタストシル酸塩カプセル100mg「トーワ」

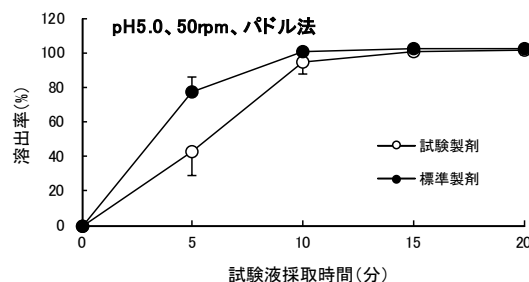
検体数 : n=12

試験法 : バドル法

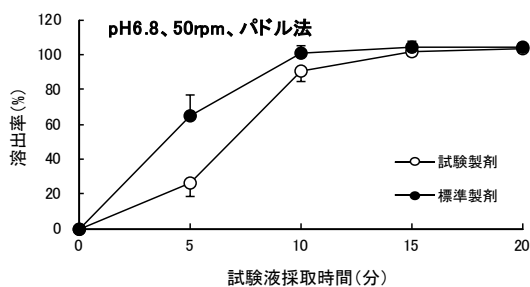
標準製剤 : カプセル剤、100mg



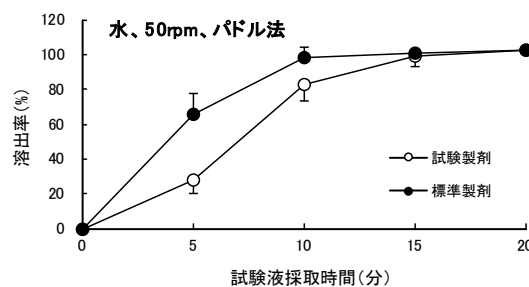
時間(分)	0	5	10	15	20
試験製剤	0	56.2	93.2	99.5	100.9
標準偏差	0	8.90	3.91	2.99	2.49
標準製剤	0	78.0	93.7	97.1	98.2
標準偏差	0	8.02	4.68	3.21	2.93



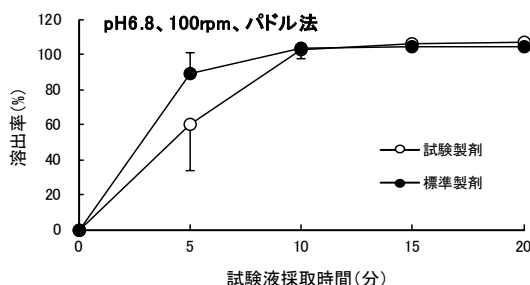
時間(分)	0	5	10	15	20
試験製剤	0	42.7	94.3	100.5	101.4
標準偏差	0	13.50	6.43	2.91	2.62
標準製剤	0	77.4	100.6	101.9	102.3
標準偏差	0	8.72	1.65	1.07	0.97



時間(分)	0	5	10	15	20
試験製剤	0	26.5	90.1	101.6	103.0
標準偏差	0	7.84	5.78	2.59	2.32
標準製剤	0	65.1	101.1	103.9	104.4
標準偏差	0	11.69	3.74	3.30	2.42



時間(分)	0	5	10	15	20
試験製剤	0	28.0	82.4	98.7	102.5
標準偏差	0	7.47	8.82	5.51	2.18
標準製剤	0	66.0	97.8	100.8	102.5
標準偏差	0	11.48	6.03	1.84	1.74



時間(分)	0	5	10	15	20
試験製剤	0	59.8	102.6	106.3	106.7
標準偏差	0	26.12	5.18	2.44	2.49
標準製剤	0	88.9	103.5	104.1	104.4
標準偏差	0	12.32	1.42	1.35	1.27



試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験製剤	標準製剤	
50	pH1.2	15	97.1	99.5	適
	pH5.0		101.9	100.5	適
	pH6.8		103.9	101.6	適
	水		100.8	98.7	適
100	pH6.8		104.1	106.3	適

#### 判定基準

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

従って、スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

#### 8. 生物学的試験法

該当しない

#### 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) ペンタシアノニトロシル鉄(III)酸ナトリウム試液及び 2mol/L 塩酸試液による呈色反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

#### 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

#### 11. 力価

該当しない

#### 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

---

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

---

## V. 治療に関する項目

### 1. 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

### 2. 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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

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試験の概要  
該当しない

---

## 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

アンレキサノクス、イブジラスト、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オザグレル塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オキサトミド、クロモグリク酸ナトリウム、ザフィルルカスト、セラトロダスト、タザノラスト、トラニラスト、エメダスチンフマル酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、プラニルカスト水和物、ベポタスチンベシル酸塩、ペミロラストカリウム、モンテルカストナトリウム、ラマトロバン、レピリナスト、メキタジン等

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

Th2 型サイトカインである IL-4、IL-5 の産生抑制作用及び IgE 抗体産生抑制作用等により、抗アレルギー作用を示す。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

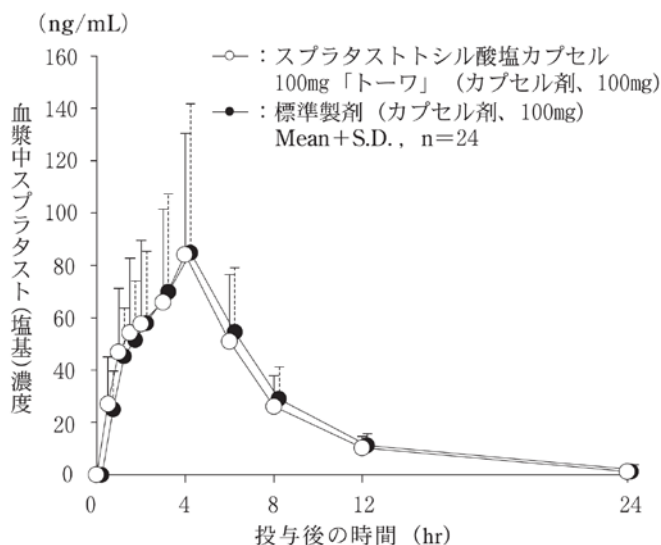
(3) 臨床試験で確認された血中濃度の項を参照

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

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 「トーワ」<sup>9)</sup>

スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル(スプラタストトシル酸塩として100mg)健康成人男子(n=24)に絶食単回経口投与して血漿中スプラタスト(塩基)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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-24</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
スプラタストトシル酸塩 カプセル100mg 「トーワ」 (カプセル剤, 100mg)	571.4 ± 237.6	93.33 ± 46.18	3.15 ± 1.42	3.6823 ± 1.2434
標準製剤 (カプセル剤, 100mg)	600.0 ± 257.1	94.38 ± 52.02	3.27 ± 1.47	4.2986 ± 1.4960

(Mean ± S.D., n=24)

---

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

スプラタストトシル酸塩カプセル 100mg 「トーワ」<sup>9)</sup>

kel : 0.20887±0.06604 hr<sup>-1</sup> (健康成人男子、絶食経口投与)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸 収

該当資料なし

---

#### 4. 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

VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 2)を参照

(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

該当資料なし

#### 5. 代 謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

#### 6. 排 泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし



---

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

**【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

### 3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

**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。]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

**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。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

**重大な副作用（頻度不明）**

(1) 肝機能障害：黄疸、ALT(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、A1-P 上昇、LDH 上昇等の肝機能障害（初期症状：全身けん怠感、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。

(2) 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。

(3) その他の副作用

**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	好酸球増多、白血球減少
過敏症	発疹、そう痒感、蕁麻疹
肝臓	AST(GOT) 上昇、ALT(GPT) 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、LDH 上昇、ビリルビン上昇、A1-P 上昇
泌尿器	蛋白尿、頻尿
その他	生理不順、けん怠感・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) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

添付文書より抜粋

**【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

**その他の副作用**

	頻度不明
過敏症	発疹、そう痒感、蕁麻疹

9. 高齢者への投与

**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 150 mg/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。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

**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女性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。]

11. 小児等への投与

**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）

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

**臨床検査結果に及ぼす影響**

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

13. 過量投与

該当しない

14. 適用上の注意

**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、更には穿孔を起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。]

---

15. その他の注意

**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。

16. その他

該当しない

---

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験

該当資料なし

#### (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### (3) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (4) 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

該当資料なし

#### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

#### (3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (4) 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

有効成分：劇薬

劇薬：1 カプセル中、スプラタストトシル酸塩 100mg 以下を含有するものは除く。

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3 年(外箱に記載)

### 3. 貯法・保存条件

貯法：室温保存(開封後は湿気を避けること)

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて

患者向け医薬品ガイド：有

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

#### (3) 調剤時の留意点について

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

製品名	包装形態	内容量(重量、容量又は個数等)
スプラタストトシル酸塩 カプセル 50mg 「トーワ」	PTP 包装	100 カプセル
スプラタストトシル酸塩 カプセル 100mg 「トーワ」	PTP 包装	100 カプセル、500 カプセル

7. 容器の材質

製品名	包装形態	材質
スプラタストトシル酸塩 カプセル 50mg 「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリプロピレン、アルミ箔
		ピロー(乾燥剤入り) : アルミ・ポリエチレン ラミネート
スプラタストトシル酸塩 カプセル 100mg 「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリ塩化ビニル・ ポリ塩化ビニリデン 複合フィルム、アルミ箔
		ピロー(乾燥剤入り) : アルミ・ポリエチレン ラミネート

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アイピーディカプセル 50/100、アイピーディドライシロップ 5%

同効薬：アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、クロモグリク酸ナトリウム、トラニラスト、ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン等

9. 国際誕生年月日

1995 年 1 月 20 日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号	備考
スプラタストトシル酸塩 カプセル 50mg 「トーワ」	2007 年 3 月 15 日	21900AMX00377000	
	2017 年 6 月 20 日	22900AMX00540	販売名変更による
スプラタストトシル酸塩 カプセル 100mg 「トーワ」	2006 年 3 月 15 日	21800AMZ10335000	
	2017 年 6 月 20 日	22900AMX00541	販売名変更による

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日	備考
スプラタストトシル酸塩 カプセル 50mg 「トーワ」	2007 年 7 月 6 日	
	2017 年 12 月 8 日	販売名変更による
スプラタストトシル酸塩 カプセル 100mg 「トーワ」	2006 年 7 月 7 日	
	2017 年 12 月 8 日	販売名変更による

12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない



---

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

ただし、Ⅷ. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法の項 6)に注意喚起の記載がある。

16. 各種コード

製品名	HOT 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
スプラタストトシル酸塩 カプセル 50mg 「トーワ」	118008401	4490016M1104	621800801
スプラタストトシル酸塩 カプセル 100mg 「トーワ」	117465601	4490016M2100	621746501

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

---

## X I . 文 献

### 1. 引用文献

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(カプセル 50mg)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(カプセル 100mg)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(カプセル 50mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(カプセル 100mg)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(カプセル 50mg)
- 6) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(カプセル 100mg)
- 7) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(カプセル 50mg)
- 8) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(カプセル 100mg)
- 9) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；血漿中スプラタスト(塩基)濃度  
(カプセル 100mg)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II . 参 考 資 料

### 1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## X III . 備 考

### その他の関連資料

東和薬品株式会社 製品情報ホームページ

<http://med.towayakuhin.co.jp/medical/product/index.php>





製造販売元

**東和薬品株式会社**

大阪府門真市新橋町2番11号