

貯 法：気密容器に入れ、室温保存  
使用期限：外箱等に表示(3年)

承認番号	22500AMX01336
薬価収載	2013年12月
販売開始	2006年7月

閉塞性気道疾患用剤

# ツロブテロール塩酸塩DS小児用0.1%「タカタ」

シロップ用ツロブテロール塩酸塩  
TULOBUTEROL HYDROCHLORIDE



## 【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】

### 1. 組成

品 名	ツロブテロール塩酸塩DS小児用0.1%「タカタ」
成分・分量	1g中 ツロブテロール塩酸塩 1mg
添 加 物	ヒドロキシプロピルセルロース、精製白糖

### 2. 製剤の性状

品 名	ツロブテロール塩酸塩DS小児用0.1%「タカタ」
性 状	白色の顆粒状で、においはなく、味は甘い。

## 【効能・効果】

下記疾患の気道閉塞性障害にもとづく呼吸困難など諸症状の緩解

気管支喘息、急性気管支炎、慢性気管支炎、喘息性気管支炎、肺気腫、珪肺症、塵肺症

## 【用法・用量】

通常、小児に対し、ドライシロップとして、1日40mg/kg(ツロブテロール塩酸塩として0.04mg/kg)を2回に分け、用時溶解して経口投与する。

ただし、年齢、症状により適宜増減する。

なお、標準投与量は、通常、下記の用量を1日2回に分け、用時溶解して経口投与する。

年 齢	ドライシロップとして1日量 (ツロブテロール塩酸塩として1日量)
0.5～3歳未満	0.25～0.5g(0.25～0.5mg)
3～9歳未満	0.5～1g(0.5～1mg)
9～15歳	1～2g(1～2mg)

## 【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)

- 甲状腺機能亢進症の患者[症状が増悪するおそれがある。]
- 高血圧症の患者[血圧が上昇することがある。]

- 心疾患のある患者[心悸亢進、不整脈等があらわれることがある。]
- 糖尿病の患者[糖代謝が亢進し、血中グルコースが増加するおそれがある。]
- 高齢者[「5.高齢者への投与」の項参照]

### 2. 重要な基本的注意

- 気管支喘息治療における長期管理の基本は、吸入ステロイド剤等の抗炎症剤の使用であり、吸入ステロイド剤等により症状の改善が得られない場合、あるいは患者の重症度から吸入ステロイド剤等との併用による治療が適切と判断された場合にのみ、本剤と吸入ステロイド剤等を併用して使用すること。

本剤は吸入ステロイド剤等の抗炎症剤の代替薬ではないため、患者が本剤の使用により症状改善を感じた場合であっても、医師の指示なく吸入ステロイド剤等を減量又は中止し、本剤を単独で用いることのないよう、患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

- 気管支喘息、慢性気管支炎又は肺気腫治療の長期管理において、本剤の投与期間中に発現する急性発作に対しては、短時間作動型吸入β<sub>2</sub>刺激薬等の他の適切な薬剤を使用するよう患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

また、その薬剤の使用量が増加したり、効果が十分でなくなってきた場合には、疾患の管理が十分でないことが考えられるので、可及的速やかに医療機関を受診し治療を受けるよう患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

- 気管支喘息治療において、短時間作動型β<sub>2</sub>刺激薬等、急性発作を緩和するための薬剤の使用量が増加したり、効果が十分でなくなってきた場合には、生命を脅かす可能性があるため、吸入ステロイド剤等の増量等の抗炎症療法の強化を行うこと。

- 用法・用量通り正しく使用しても効果が認められない場合は、本剤が適当でないと考えられるので、投与を中止すること。

なお、小児に使用する場合には、使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。

- 過度に使用を続けた場合、不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがあるため、使用が過度にならないように注意すること。

今回改訂 →

今回改訂 →

### 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
カテコールアミン製剤 アドレナリン、イソプロテレノール等	不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがある。	本剤及びカテコールアミン製剤はともに交感神経刺激作用を持つ。
キサンチン誘導体 テオフィリン、アミノフィリン水和物、ジプロフィリン等	低カリウム血症による不整脈を起こすおそれがある。	本剤及びキサンチン誘導体はともに細胞内へのカリウム移行作用を持つ。
ステロイド剤 プレドニゾロン、ベタメタゾン、ヒドロコルチゾン等		ステロイド剤及び利尿剤は尿中へのカリウム排泄を増加させる。
利尿剤 トリクロルメチアジド、フロセミド、アセタゾラミド等		

### 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)

重篤な血清カリウム値の低下  $\beta_2$ 刺激薬により重篤な血清カリウム値の低下が報告されている。また、 $\beta_2$ 刺激薬による血清カリウム値の低下作用は、キサンチン誘導体、ステロイド剤及び利尿剤の併用により増強することがあるので、重症喘息患者では特に注意すること。さらに、低酸素血症は血清カリウム値の低下が心リズムに及ぼす作用を増強することがある。このような場合には、血清カリウム値をモニターすることが望ましい。

#### (2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	痒痒感、発疹等
循環器	心悸亢進、顔面紅潮、不整脈等
精神神経系	振戦、めまい、頭痛、全身倦怠感、熱感、不眠等
消化器	嘔気・悪心、胃不快感、食欲不振、下痢、嘔吐等
その他	口渇、CK(CPK)上昇

注)症状があらわれた場合には、使用を中止すること。(太字)

### 5. 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、低用量から投与を開始するなど慎重に投与すること。

### 6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

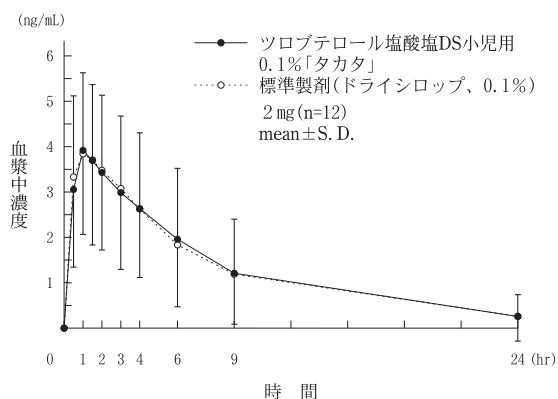
(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳中の婦人には、本剤投与中は授乳を避けさせること。[動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。]

### 【薬物動態】

#### 1. 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

本剤と標準製剤(ドライシロップ、0.1%)をクロスオーバー法により、健康成人男子12名にそれぞれ2g(ツロブテロール塩酸塩として2mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.5、1、1.5、2、3、4、6、9及び24時間に採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したツロブテロール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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt(ng·hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ツロブテロール塩酸塩DS小児用0.1%「タカタ」	32.57 ± 26.13	4.06 ± 1.82	1.1 ± 0.3	4.7 ± 2.8
標準製剤(ドライシロップ、0.1%)	32.32 ± 23.97	4.01 ± 1.83	1.2 ± 0.5	4.9 ± 2.8

(mean ± S.D.)

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<sup>2)</sup>

本剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたツロブテロール塩酸塩ドライシロップの溶出規格に適合していることが確認されている。

### 【薬効薬理】

ツロブテロール塩酸塩は、気管支平滑筋の $\beta_2$ 受容体を刺激し、adenyl cyclaseを活性化し、細胞内のATPをcAMPに変換し、気管支を拡張させる。

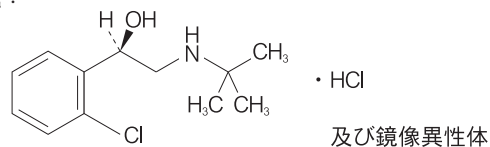
### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ツロブテロール塩酸塩[日局]

Tulobuterol Hydrochloride

化学名：(1RS)-1-(2-Chlorophenyl)-2-(1,1-dimethylethyl)aminoethanol monohydrochloride

構造式：



分子式：C<sub>12</sub>H<sub>18</sub>ClNO · HCl

分子量：264.19

性状：白色の結晶又は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にくい。

水溶液(1→20)は旋光性を示さない。

融点 約163℃

#### 【取扱い上の注意】

#### 安定性試験<sup>3)</sup>

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、36ヵ月)の結果、3年間安定であることが確認された。

#### 【包装】

ソロブテロール塩酸塩DS小児用0.1%「タカタ」

バラ包装：100g(プラスチック瓶)

500g(プラスチック瓶)

#### 【主要文献】

- 1) 高田製薬(株)社内資料(生物学的同等性)
- 2) 高田製薬(株)社内資料(溶出性)
- 3) 高田製薬(株)社内資料(安定性)

#### 【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。

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

前回  
改訂  
⇒

製造販売

**高田製薬株式会社**

さいたま市西区宮前町203番地1

