

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

抗てんかん剤

オスポロット[®]錠50mg オスポロット[®]錠200mg

OSPOLOT[®] Tab.50mg・Tab.200mg

剤形	オスポロット錠 50mg：光沢のあるフィルムコーティング錠 オスポロット錠 200mg：光沢のあるフィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方せん医薬品（注意－医師等の処方せんにより使用すること）
規格・含量	オスポロット錠 50mg：1錠中、日局スルチアム 50mg を含有する。 オスポロット錠 200mg：1錠中、日局スルチアム 200mg を含有する。
一般名	和名：スルチアム 洋名：Sultiame
製造販売承認年月日・ 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日： オスポロット錠 50mg：2001年9月28日 オスポロット錠 200mg：2001年9月28日 薬価基準収載年月日： オスポロット錠 50mg：2001年9月26日 オスポロット錠 200mg：2001年9月26日 発売年月日 オスポロット錠 50mg：2001年12月1日 オスポロット錠 200mg：2001年12月1日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：共和薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	共和薬品工業株式会社 営業本部 営業推進部 学術情報課 TEL.0120-041189(フリーダイヤル) FAX.06-6121-2858 医療関係者向けホームページ http://www.kyowayakuhin.co.jp/amel-di/

本IFは2009年7月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。
最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ
<http://www.pmda.go.jp/>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。この変更に合わせて、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 が添付文書を補完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があり，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，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 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目		V. 治療に関する項目	
1. 開発の経緯	1	1. 効能又は効果	16
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 用法及び用量	16
		3. 臨床成績	16
II. 名称に関する項目		VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	2	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	18
2. 一般名	2	2. 薬理作用	18
3. 構造式又は示性式	2	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	2	1. 血中濃度の推移・測定法	19
5. 化学名（命名法）	2	2. 薬物速度論的パラメータ	21
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3	3. 吸収	22
7. CAS 登録番号	3	4. 分布	22
		5. 代謝	23
III. 有効成分に関する項目		6. 排泄	23
1. 物理化学的性質	4	7. トランスポーターに関する情報	23
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	8. 透析等による除去率	24
3. 有効成分の確認試験法	5	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
4. 有効成分の定量法	5	1. 警告内容とその理由	25
		2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	25
IV. 製剤に関する項目		3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	25
1. 剤形	6	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	25
2. 製剤の組成	6	5. 慎重投与内容とその理由	25
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	7	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	25
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	7. 相互作用	25
5. 調製法及び溶解後の安定性	11	8. 副作用	26
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	11	9. 高齢者への投与	28
7. 溶出性	12	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	28
8. 生物学的試験法	15	11. 小児等への投与	28
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	15	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	28
10. 製剤中の有効成分の定量法	15	13. 過量投与	28
11. 力価	15	14. 適用上の注意	28
12. 混入する可能性のある夾雑物	15		
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	15		
14. その他	15		

15. その他の注意	28
16. その他	29

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	30
2. 毒性試験	30

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	31
2. 有効期間又は使用期限	31
3. 貯法・保存条件	31
4. 薬剤取扱い上の注意点	31
5. 承認条件等	31
6. 包装	31
7. 容器の材質	31
8. 同一成分・同効薬	31
9. 国際誕生年月日	32
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	32
11. 薬価基準収載年月日	32
12. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	32
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	32
14. 再審査期間	32
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	32
16. 各種コード	33
17. 保険給付上の注意	33

X I. 文献

1. 引用文献	34
2. その他の参考文献	34

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	35
2. 海外における臨床支援情報	35

X III. 備考

その他の関連資料	36
----------	----

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1912年ドイツ・バイエル社により Luminal (別名 phenobarbital) が創製され、てんかん治療に導入されて以来、その後の抗てんかん剤はいずれもその構造中に、 $-\text{CO}-\text{NH}-\text{CO}-\text{CR}_1\text{R}_2-$ を有する類縁化合物であった。

1950年代後半、ドイツ・ボンの Helferich らは、さらに優れた抗てんかん作用を持つ全く新しい化合物 N-aryl-butanesultam を合成した。¹⁾

この興味ある化合物群の研究成績に基づき、ドイツ・バイエル社中央医薬研究所の Wirth らはボン大学と協同研究を重ねた結果、N-(4'-sulfamylphenyl)-1,4-butansultam すなわち sultiamе(スルチアム)に特に優れた抗てんかん作用を発見した。²⁾

その後、世界各国の研究者により本剤の臨床効果が検討され、本邦においては昭和 38 年にオスポロットの商品名で発売され、昭和 50 年 6 月に再評価結果が公示された。

共和薬品工業株式会社は、ウエルファイド株式会社(現 田辺三菱製薬)が輸入承認を受けてバイエル薬品株式会社が販売していた販売名「オスポロット錠(50mg、200mg)」の承認を承継し、国内での製造承認に切り換え、平成 13 年 12 月より「オスポロット錠(50mg、200mg)」から「オスポロット錠 50mg、錠 200mg」に名称を変更して販売することとなった。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) オスポロットは多剤と併用して、特に有効率の高い精神運動発作に用いることができる。³⁾
- (2) 鎮静・催眠作用がわずかで、精神状態や行動能力への影響が少ない。⁴⁾
- (3) 2 剤形があり、用量調節が容易である。
- (4) 主な副作用は、知覚異常、呼吸促迫、眠気、悪心・嘔吐、運動失調、頭痛、体重減少等である。
- (5) 重大な副作用として、腎不全があらわれることがある。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名：

オスポロット[®]錠 50mg
オスポロット[®]錠 200mg

(2) 洋名：

OSPOLOT[®] Tab.50mg
OSPOLOT[®] Tab.200mg

(3) 名称の由来：

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)：

スルチアム(JAN)

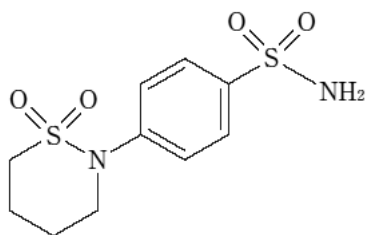
(2) 洋名(命名法)：

Sultiame(JAN,INN)

(3) ステム：

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₀H₁₄N₂O₄S₂

分子量：290.36

5. 化学名(命名法)

4-(3,4,5,6-Tetrahydro-2H-1,2-thiazin-2-yl) benzenesulfonamide S, S-dioxide (IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

略号 : ST

7. CAS 登録番号

61-56-3

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状：

白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。

(2) 溶解性：

溶 媒	日局表現
<i>N, N</i> -ジメチルホルムアミド	極めて溶けやすい
<i>n</i> -ブチルアミン	溶けやすい
メタノール エタノール(95)	溶けにくい
水	極めて溶けにくい
ジエチルエーテル	ほとんど溶けない

本品は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

(3) 吸湿性：

該当資料なし

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点：

融点：185～188℃

(5) 酸塩基解離定数：

pKa：9.7 (スルホンアミド基、滴定法)

(6) 分配係数：

該当資料なし

(7) その他の主な示性値：

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

(1) 各種条件下における安定性

1) 原末での安定性

苛酷試験	試験条件	定量試験 (%)	性状・TLC*
熱	100℃ 5時間加熱	100.1	外観・においに変化はみられず、分解物に基づくスポットは認められなかった。
光	直射日光 7日間	99.7	外観・においに変化はみられず、分解物に基づくスポットは認められなかった。
	キセノンランプ 100時間	99.9	外観・においに変化はみられず、分解物に基づくスポットは認められなかった。

*TLC：薄層クロマトグラフィー

2) 液体状態での安定性

試験条件		定量試験 (%)	TLC* ¹
酸性溶液* ² [pH 約 0.4]	1時間還流加熱	99.8	分解物に基づくスポットは認められなかった。
アルカリ性溶液* ² [pH 約 13.4]		99.6	

*1. TLC：薄層クロマトグラフィー

*2. スルチウムは水に難溶であるため、希塩酸・メタノール溶液および水酸化ナトリウム・メタノール溶液を用いた。

(2) 強制分解による生成物

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「スルチウム」による

- (1) クロロホルムによる呈色反応(スルファニルアミド基の確認)
- (2) 塩酸及び塩化バリウム試液による沈殿反応(イオウ原子の確認)
- (3) 紫外可視吸光度測定法

4. 有効成分の定量法



日本薬局方「スルチウム」による

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 :

販売名	剤形	色	外形・大きさ等	識別コード
オスポロット錠50mg	光沢のあるフィルムコーティング錠	白色	 直径：約 6.1mm 厚さ：約 2.95mm 質量：約 97mg	KW002
オスポロット錠200mg	光沢のあるフィルムコーティング錠	白色	 直径：約 10.1mm 厚さ：約 4.95mm 質量：約 385mg	KW003

(2) 製剤の物性 :

オスポロット錠 50mg、錠 200mg

硬度：58.8N(6.0kg)以上

(3) 識別コード :

IV-1-(1) 参照

錠剤本体に表示。

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

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量 :

オスポロット錠 50mg

1 錠中、日局スルチアム 50mg を含有する。

オスポロット錠 200mg

1 錠中、日局スルチアム 200mg を含有する。

(2) 添加物 :

オスポロット錠 50mg、錠 200mg

トウモロコシデンプン、乳糖、タルク、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、酸化チタン、マクロゴール 4000

(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) 長期保存試験での安定性⁵⁾：

オスポロット錠 50mg、錠 200mg で実施した長期保存試験での安定性試験方法及び結果は次のとおりである。

試験区分	長期保存試験
試験期間	36 ヶ月
試験条件	温度：成り行き、湿度：成り行き
包装形態	バラ包装

オスポロット錠 50mg

バラ包装品*(n=1)

試験項目	規 格	開始時	36 ヶ月
性 状	白色の光沢のあるフィルムコーティング錠	白色の光沢のあるフィルムコーティング錠	変化なし
溶出試験	45 分間 70%以上	87%	89%
定量試験	95.0 ~ 105.0%	101.7%	102.8%

*バラ包装品：未包装バルク製剤を褐色ガラス瓶に入れ、密栓したもの。

オスポロット錠 200mg

バラ包装品*(n=1)

試験項目	規 格	開始時	36 ヶ月
性 状	白色の光沢のあるフィルムコーティング錠	白色の光沢のあるフィルムコーティング錠	変化なし
溶出試験	45 分間 70%以上	76%	85%
定量試験	95.0 ~ 105.0%	102.7%	102.7%

*バラ包装品：未包装バルク製剤を褐色ガラス瓶に入れ、密栓したもの。

(2) 無包装下での安定性⁶⁾ :

オスポロット錠 200mg

オスポロット錠 200mg で実施した苛酷試験での安定性試験方法及び結果は次のとおりである。

試験区分	苛酷試験(湿度)
試験期間	30 日間
試験条件	25±1℃、75±5%RH
包装形態	グラシンラミネート紙

湿度(グラシンラミネート紙)

試験項目	規 格	開始時	30 日目
性 状	白色の光沢のあるフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	変化なし
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.0%	100.8%

(3) その他の安定性⁷⁾ :

オスポロット錠 50mg、錠 200mg で実施した苛酷試験(温度、湿度、光)での安定性試験方法及び結果は次のとおりである。

試験区分	苛酷試験(温度、湿度、光)
試験条件及び試験期間	温度 ①40℃ : 3 ヶ月 ②60℃ : 2 ヶ月 湿度 40℃、75%RH : 3 ヶ月 光 ①フェードテスト : 100 時間 ②直射日光 : 10 日間
包装形態	温度 ①、② : 無色透明気密容器 湿度 ① : 無色透明開封容器 ② : 無色透明気密容器 光 ①、② : 無色透明気密容器

オスポロット錠 50mg

1) 温度

①40℃(n=9)

試験項目	規 格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性 状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.0 分	3.1 分	2.9 分	2.8 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	8.6kg	8.9kg	8.5kg	8.7kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.9%	99.9%	99.8%	99.7%

* 現行規格は溶出試験(75 分間 70%以上)

②60°C(n=9)

試験項目	規 格	開始時	20 日	40 日	60 日
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.0 分	3.2 分	3.1 分	2.9 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	8.6kg	9.1kg	8.5kg	8.8kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.9%	99.8%	99.6%	99.9%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

2)湿度

①40°C、75%RH[無色透明開封容器](n=9)

試験項目	規 格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.0 分	3.1 分	3.1 分	2.9 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	8.6kg	8.9kg	9.0kg	8.6kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.9%	99.5%	99.4%	100.0%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

②40°C、75%RH[無色透明気密容器](n=9)

試験項目	規 格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.0 分	2.9 分	3.1 分	2.9 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	8.6kg	8.8kg	8.9kg	8.7kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.9%	99.4%	99.5%	99.8%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

2)光

①フェードテスト(n=9)

試験項目	規 格	開始時	25 時間	50 時間	75 時間	100 時間
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.0 分	2.9 分	3.0 分	2.8 分	2.9 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	8.6kg	8.0kg	8.8kg	8.9kg	8.0kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.9%	100.1%	99.5%	99.7%	99.7%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

②直射日光(n=9)

試験項目	規 格	開始時	2 日	5 日	10 日
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.0 分	3.0 分	2.8 分	2.9 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	8.6kg	8.4kg	8.4kg	8.0kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.9%	99.8%	99.9%	99.6%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

オスロット錠 200mg

1)温度

①40℃(n=9)

試験項目	規 格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.2 分	3.2 分	3.2 分	3.1 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	11.4kg	11.6kg	12.1kg	11.4kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.3%	99.4%	99.4%	99.6%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

②60℃(n=9)

試験項目	規 格	開始時	20 日	40 日	60 日
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.2 分	3.1 分	3.2 分	3.1 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	11.4kg	11.5kg	12.2kg	11.5kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.3%	99.3%	99.5%	99.3%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

2)湿度

①40℃、75%RH[無色透明開封容器](n=9)

試験項目	規 格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.2 分	3.4 分	3.2 分	3.1 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	11.4kg	11.2kg	10.9kg	11.9kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.3%	99.4%	99.3%	99.4%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

②40℃、75%RH[無色透明気密容器](n=9)

試験項目	規 格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.2 分	3.0 分	3.1 分	3.3 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	11.4kg	11.2kg	11.3kg	11.4kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.3%	99.5%	99.1%	99.2%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

2)光

①フェードテスト(n=9)

試験項目	規 格	開始時	25 時間	50 時間	75 時間	100 時間
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.2 分	3.2 分	3.1 分	3.3 分	3.1 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	11.4kg	11.1kg	10.8kg	11.6kg	11.0kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.3%	99.4%	99.4%	99.3%	99.2%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

②直射日光(n=9)

試験項目	規 格	開始時	2 日	5 日	10 日
性 状	白色の フィルムコーティング錠	白色の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
崩壊試験*	日局 崩壊試験	3.2 分	3.1 分	3.2 分	3.2 分
硬 度	エルウェーカー硬度計	11.4kg	10.8kg	11.1kg	11.1kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.3%	99.3%	99.2%	99.4%

* 現行規格は溶出試験 (75 分間 70%以上)

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⁸⁾

(1) 溶出挙動

オスポロット錠 50mg 「アメル」

医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について(平成10年7月15日付 医薬発審第634号)」に基づき、スルチアム製剤であるオスポロット錠 50mg の溶出挙動を評価した。なお、オスポロット錠 50mg は標準製剤であるため、溶出挙動の同等性は評価していない。

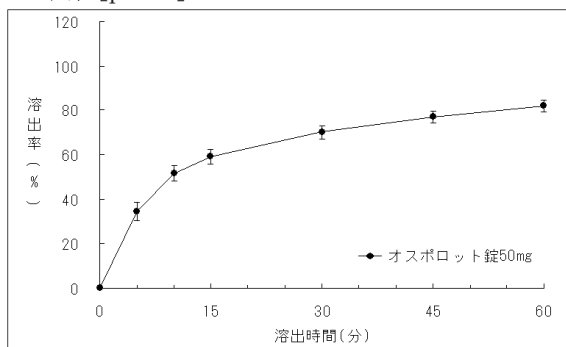
試験方法	日本薬局方(JP13) 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
試験条件	試験液量：900mL、温度：37±0.5℃	
回転数	50回転	
試験液	pH1.2	日本薬局方(JP13) 崩壊試験第1液
	pH4.0	酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L)
	pH6.8	日本薬局方 試薬・試液のリン酸塩緩衝液(1→2)
	水	日本薬局方 精製水

品質再評価の実施基準に基づき、スルチアム製剤であるオスポロット錠 50mg の溶出挙動を評価した結果、以下に示すとおりであった。

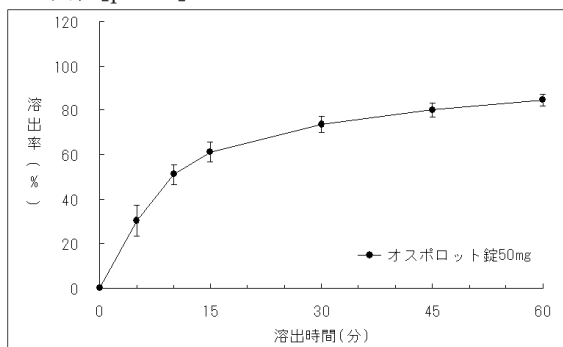
各試験液における溶出挙動は下図の通りである。

図. 溶出曲線(n=6；mean±S.D.)

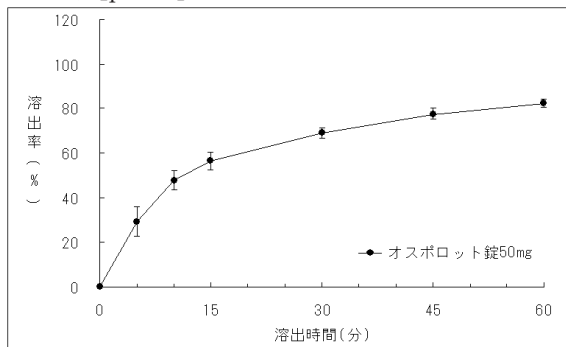
50回転[pH1.2]



50回転[pH4.0]



50回転[pH6.8]



50回転[水]

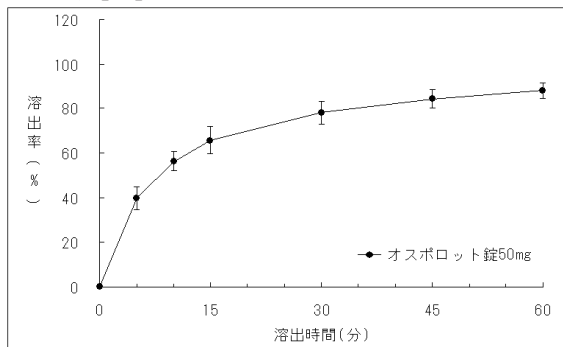


表. 溶出率

試験液	時間毎の平均溶出率(%)						
	0	5分	10分	15分	30分	45分	60分
pH1.2	0	34.6	51.7	59.1	70.1	77.2	82.0
pH4.0	0	30.4	51.1	61.2	73.8	80.0	84.7
pH6.8	0	29.4	47.9	56.5	69.1	77.6	82.4
水	0	39.8	56.3	65.8	78.2	84.2	88.2

(n=6)

オスポロット錠 200mg 「アメル」

「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について(平成10年7月15日付 医薬発審第634号)」に基づき、スルチアム製剤であるオスポロット錠 200mg の溶出挙動を評価した。なお、オスポロット錠 200mg は標準製剤であるため、溶出挙動の同等性は評価していない。

試験方法	日本薬局方(JP13) 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
試験条件	試験液量：900mL、温度：37±0.5℃	
回転数	50回転	
試験液	pH1.2	日本薬局方(JP13) 崩壊試験第1液
	pH4.0	酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L)
	pH6.8	日本薬局方 試薬・試液のリン酸塩緩衝液(1→2)
	水	日本薬局方 精製水

品質再評価の実施基準に基づき、スルチアム製剤であるオスポロット錠 200mg の溶出挙動を評価した結果、以下に示すとおりであった。

各試験液における溶出挙動は下図の通りである。

図. 溶出曲線 (n=6 ; mean±S.D.)

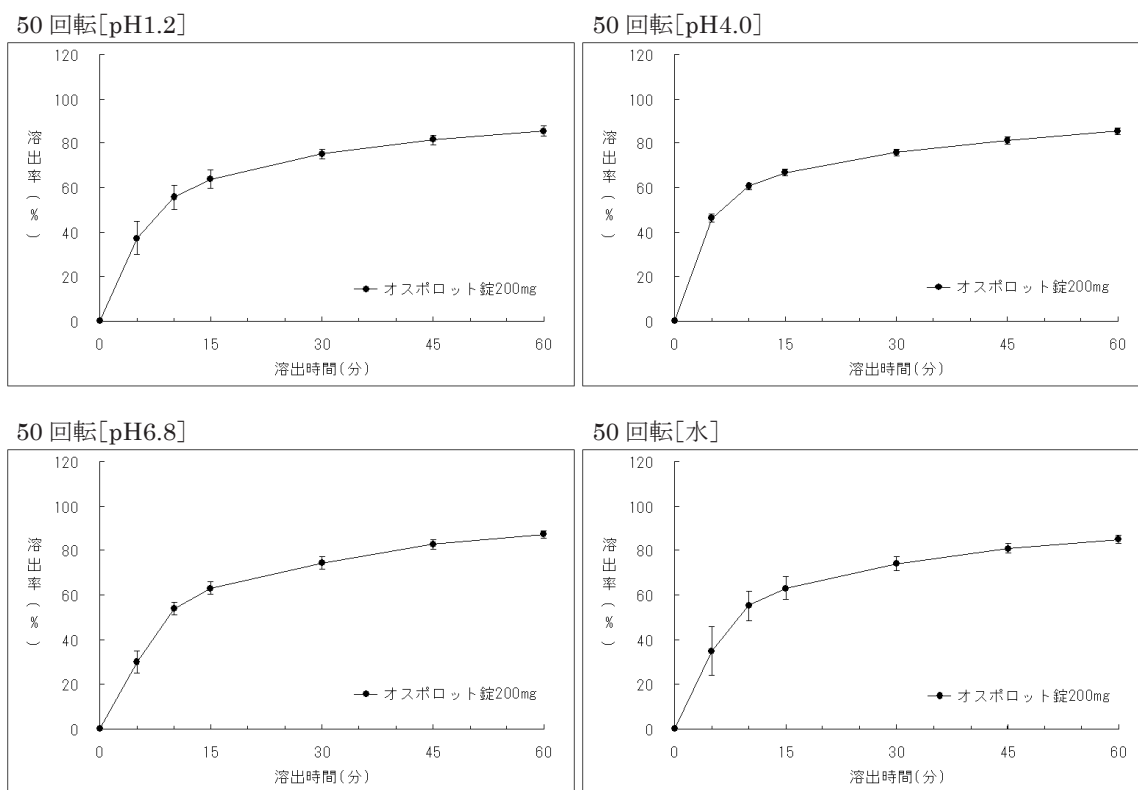


表. 溶出率

試験液	時間毎の平均溶出率(%)						
	0	5分	10分	15分	30分	45分	60分
pH1.2	0	37.4	55.7	63.8	75.2	81.6	85.6
pH4.0	0	46.3	60.6	66.8	75.9	81.3	85.4
pH6.8	0	30.1	54.1	63.1	74.6	82.7	87.2
水	0	35.0	55.3	63.2	74.2	81.0	85.1

(n=6)

(2) 溶出規格

オスポロット錠 50mg 「アメル」

日本薬局方外医薬品規格第三部に定められたスルチアム 50mg 錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

表示量	回転数	試験液	規定時間	溶出率
50mg	50rpm	水	45分	70%以上

オスロット錠 50mg 「アメル」

日本薬局方外医薬品規格第三部に定められたスルチアム 200mg 錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

表示量	回転数	試験液	規定時間	溶出率
200mg	50rpm	水	45分	70%以上

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) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 薄層クロマトグラフ法

10. 製剤中の有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法

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

該当資料なし

14. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

精神運動発作

2. 用法及び用量

スルチアムとして、通常成人 1 日 200 ～ 600mg を 2 ～ 3 回に分けて食後に経口投与する。
なお、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：

該当しない

(2) 臨床効果⁹⁾：

総計 123 例について実施された臨床成績の概要は次のとおりである。

精神運動発作 66 例及び精神運動発作を併発する 57 例、合計 123 例で単独又は追加投与により 89 例 72.3%の有効率を示している。また、このうち難治性の 67 例では 45 例 67.1%の有効率を示している。

(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：

該当資料なし

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

Sultam 化合物、アセタゾラミド

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序^{10)、11)}：

作用部位：中枢神経系

作用機序：本剤は脳組織内で炭酸脱水酵素を阻害し、神経細胞の過興奮性を抑制する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績：

1) スルチアムは電撃痙攣及びペンテトラゾール痙攣試験において抗痙攣作用を示す。治療指数(LD₅₀/ED₅₀)を指標とした場合、電撃痙攣に対してはフェノバルビタールナトリウムの10倍以上、フェニトインの4～5倍である。ペンテトラゾール痙攣に対してはフェニトインと同程度である。なお、ストリキニーネ及びメチオニン・スルフォキシミン痙攣に対しては抗痙攣作用を示さない(マウス)。²⁾

2) スルチアムは炭酸脱水酵素阻害作用を示す(マウス)。¹¹⁾

(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¹⁰⁾ :

8 ~ 15 μ g/mL (血漿中濃度が 1 μ g/mL の患者では発作を抑制できなかった。)

(2) 最高血中濃度到達時間¹⁰⁾ :

2 ~ 4 時間後 (健康成人男子にスルチアム原末 5mg/kg を単回投与した場合)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度 :

1) 単回投与試験

健康成人男子 5 名にスルチアム原末 5mg/kg を経口投与した場合、投与後 2 ~ 4 時間後に血漿中スルチアム濃度は 3 ~ 8 μ g/mL の最高値に達した。

12 時間後にはほとんど血漿中に存在しないことから、半減期は大体 6 ~ 8 時間程度と推測された。¹⁰⁾

(参考 : 中型雄性雑犬)¹²⁾

中型雄性雑犬 20 頭にオスポロット錠 50mg 又は錠 200mg を経口投与したときの血漿中の未変化体濃度及び各種パラメータは以下のとおりであった。

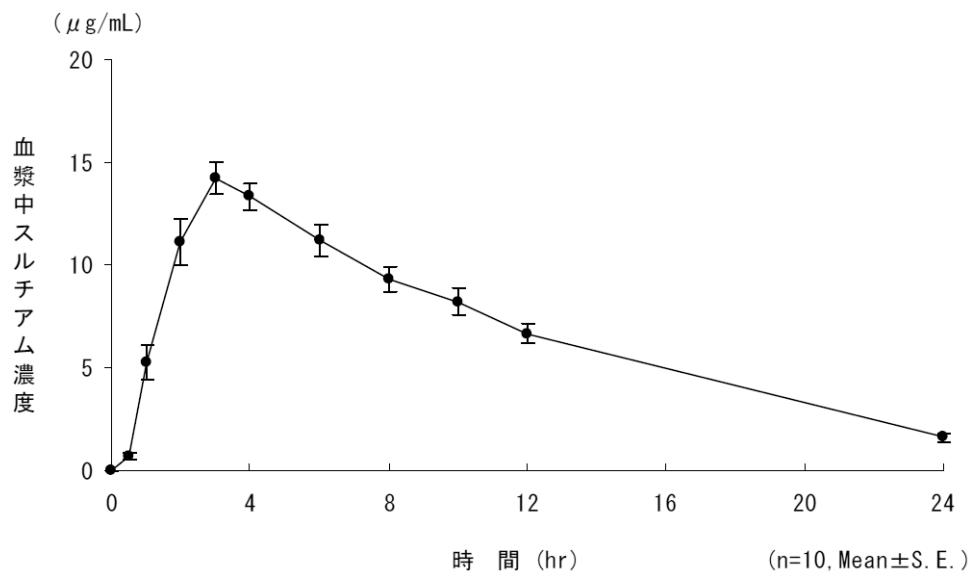
投与条件	<p>オスポロット錠 50mg 中型雄性雑犬に対して 12 時間以上の絶食下において、オスポロット錠 50mg を 4 錠 (スルチアムとして 200mg)、50mL の水とともに単回強制経口投与した。</p> <p>オスポロット錠 200mg 中型雄性雑犬に対して 12 時間以上の絶食下において、オスポロット錠 200mg を 1 錠 (スルチアムとして 200mg)、50mL の水とともに単回強制経口投与した。</p>
採血時点	<p>採血は、治験薬の投与後 0.5、1、2、3、4、6、8、10、12 及び 24 時間後の 10 時点とした。</p> <p>採血量は 1 回につき 4mL とした。</p>
分析法	液体クロマトグラフ法

オスポロット錠 50mg

<薬物動態パラメータ>

	AUC ₍₀₋₂₄₎ (μ g · hr/mL)	Cmax (μ g/mL)	Tmax (hr.)	T _{1/2} (hr.)
オスポロット錠 50mg	165.1 \pm 12.6	14.54 \pm 0.80	2.9 \pm 0.2	5.79 \pm 0.39

(Mean \pm S.E.,n=10)

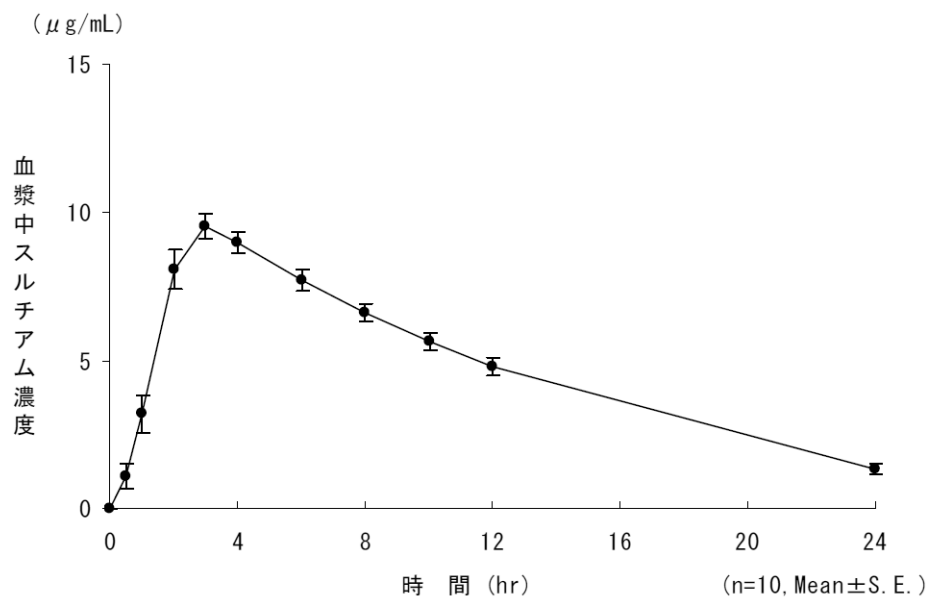


オスポロット錠 200mg

<薬物動態パラメータ>

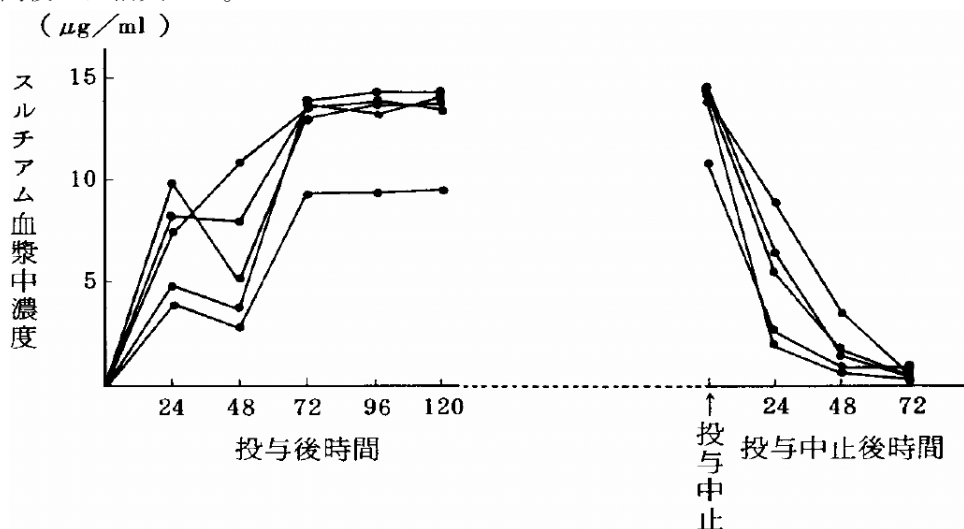
	AUC _(0→24) (μg・hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr.)	T _{1/2} (hr.)
オスポロット錠 200mg	113.7±6.6	9.67±0.49	2.9±0.2	6.95±0.81

(Mean±S.E.,n=10)



2) 連続投与期間(2 週間)

てんかん患者 5 名にオスポロット錠 500mg/日を 1 日 2 回分割経口投与した場合、血漿中未変化体濃度は投与後 72 時間で 8 ~ 15 $\mu\text{g}/\text{mL}$ の一定濃度を維持するようになった。2 週間継続投与して投与を中止したところ、血漿中濃度は速やかに低下し、72 時間後には消失した。¹⁰⁾



(参考：外国人データ)¹³⁾

オスポロットによる長期治療患者 36 例 (3 ~ 14.5mg/kg、6 ヶ月以上経口投与) の血清中濃度は 0.5 ~ 12.5 $\mu\text{g}/\text{mL}$ で、最高血中濃度は投与後 1 ~ 5 時間にみられた。

(4) 中毒域¹⁰⁾ :

45 $\mu\text{g}/\text{mL}$ (赤血球内濃度) : この時、動悸、呼吸促進、四肢しびれ感、知覚異常がみられた。

(5) 食事・併用薬の影響 :

「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 7.相互作用」参照

(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 :

該当資料なし

(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¹⁴⁾ :

44.6%

3. 吸 収

ヒトでの該当資料なし

〈参考：ラット〉

S³⁵ 放射性標識をしたオスポロット 10mg/kg 経口投与では完全に吸収され、8 時間後に胃と小腸には投与量の 10% 以下が残留しているにすぎなかった。

血中には、器官中と比べて有意の差で高濃度の放射能がみられた。

4. 分 布

(1) 血液—脳関門通過性 :

通過する。

(2) 血液—胎盤関門通過性 :

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性 :

該当資料なし

(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 :

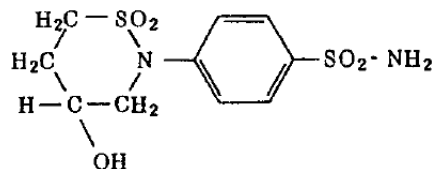
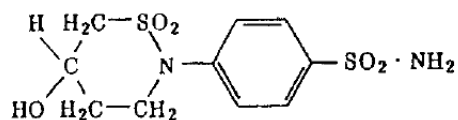
該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路¹⁵⁾ :

代謝部位：肝臓

代謝経路：患者の尿中から代謝物として以下の2種類が認められた。



(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¹⁶⁾ :

腎、胆汁

(2) 排泄率¹³⁾ :

長期治療患者では24時間後に投与量の32%が尿中に排泄された。

〈参考：ラット〉

腎排泄が大部分で、8時間後にすでに50%、48時間後に80%以上が排泄された。

糞便中には、投与後48時間以内に約10%が排泄された。この時期には動物体内には投与量の5%以下しか検出されなかった。

(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)】

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 腎障害のある患者〔腎不全を起こすおそれがある。〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び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)
薬物過敏症の患者

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) 連用中は定期的に肝・腎機能、血液検査を行うことが望ましい。
- (2) 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下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。

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：

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
抗てんかん剤 フェニトイン	フェニトインの血中濃度が上昇することがある。 投与量に注意すること。	発現機序の詳細は不明であるが、フェニトインの代謝を抑制することによると考えられる。

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ため、発現頻度については文献を参考に集計した。(再評価結果)

(2) 重大な副作用と初期症状：

重大な副作用(0.1%未満)

腎不全：腎不全があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、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

以下のような副作用が認められた場合には、投与を中止するなど症状に応じて適切な処置を行うこと。

	5%以上又は頻度不明	0.1～5%未満
過敏症 ^{注1)}		猩紅熱様・麻疹様・中毒疹様発疹
血液 ^{注2)}	白血球減少	貧血
精神神経系	眠気、眩暈、知覚異常、多発神経炎	運動失調、頭痛、倦怠感、不眠
消化器		食欲不振、悪心・嘔吐、便秘、下痢
その他		舌のもつれ、体重減少、呼吸促迫

注1) 発現した場合には、投与を中止すること。

注2) 発現した場合には、減量するなど適切な処置を行うこと。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧：

本邦において集積された 328 例中、副作用が報告された症例は 105 例(32.01%)で発現件数は 127 件であった。このうち自他覚症状の副作用は 125 件(38.10%)で臨床検査値の変動は 2 件(0.60%)であった。内訳は発疹等の過敏症(0.60%)、眠気、知覚異常、運動失調等の精神神経系症状(25.9%)、悪心・嘔吐等の消化器症状(2.13%)、貧血等の血液像異常(0.60%)等であった。

日本と海外における各項目の副作用発現率を下表に示す。

症 状	日本 (328 例中)		外国 (1,703 例中)		合計 (2,031 例中)	
	件数	%	件数	%	件数	%
知 覚 異 常	26	7.9	303	17.8	329	16.2
呼吸 促 迫 ・ 過 呼 吸	2	0.6	240	14.1	242	11.9
心 臓 及 び 循 環 症 状	1	0.3	27	1.6	28	1.4
胃 腸 症 状	6	1.8	96	5.6	102	5.0
食 欲 不 振	4	1.2	26	1.5	30	1.5
精 神 症 状	4	1.2	106	6.2	110	5.4
自 律 神 経 症 状	—	—	11	0.6	11	0.5
不 眠	4	1.2	20	1.2	24	1.2
傾 眠	13	4.0	96	5.6	109	0.4
活 動 障 害	7	2.1	13	0.8	20	1.0
運 動 失 調	16	4.9	49	2.7	65	3.2
言 語 障 害	6	1.8	13	0.8	19	0.9
眩 暈	7	2.1	32	1.9	39	1.9
発 汗	1	0.3	3	0.2	4	0.2
頭 痛 ・ 頭 重 感	16	4.9	40	2.3	56	2.8
顔 面 浮 腫	1	0.3	2	0.1	3	0.1
流 涎	—	—	2	0.1	2	0.1
発 疹	2	0.6	10	0.6	12	0.6
排 尿 障 害	—	—	4	0.2	4	0.2
白 血 球 減 少 症	—	—	3	0.2	3	0.1
貧 血	2	0.6	—	—	2	0.1
発作の増大・重積状態	—	—	4	0.2	4	0.2
視 力 障 害	—	—	7	0.4	7	0.3
硬 縮	—	—	2	0.1	2	0.1
嚥 下 困 難	—	—	1	0.1	1	0.0
甲 状 腺 肥 大	—	—	3	0.2	3	0.1
月 経 困 難	—	—	1	0.1	1	0.0
疲 労	—	—	7	0.4	7	0.3
倦 怠 ・ 脱 力 感	3	0.9	—	—	3	0.1
菌 肉 炎	1	0.3	—	—	1	0.0
難 聴	0	0.0	2	0.1	2	0.1
体 重 減 少	0	0.0	46	2.7	46	2.3
そ の 他	5	1.5	56	3.3	61	3.0

(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：

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 薬物過敏症の患者には慎重に投与すること。
- 3) 過敏症(猩紅熱様・麻疹様・中毒疹様発疹)があらわれた場合には、投与を中止すること。

9. 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減量するなど注意すること。

10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与

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。〔本剤と他の抗てんかん剤を併用投与された母親から、奇形を有する児(右側脳室拡大、特異な顔貌、爪および末節骨の低形成)が生まれ、その新生児に禁断症状(痙攣、興奮症状、易刺激性)があらわれたとの報告がある。〕

11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

徴候、症状：

過量投与に関する情報は少ないが、臨床症状として嘔吐、頭痛、めまい、一過性の痴呆症状等の報告がある。また、強いアシドーシスを伴う高カリウム血症による急性心停止で死亡に至った報告もある。

処置：

胃洗浄、下剤・活性炭投与を行い、一般的な支持・対症療法を行う。本剤はアルカリ可溶であることから、中毒の際は重曹等の投与が一層回復を早めるとの報告がある。

14. 適用上の注意

該当資料なし

15. その他の注意

海外で実施された複数の抗てんかん薬における、てんかん、精神疾患等を対象とした 199 のプラセボ対照臨床試験の検討結果において、自殺念慮及び自殺企図の発現のリスクが、抗てんかん薬の服用群でプラセボ群と比較して約 2 倍高く (抗てんかん薬服用群： 0.43%、プラセボ群： 0.24%)、抗てんかん薬の服用群では、プラセボ群と比べ 1000 人あたり 1.9 人多いと計算された (95%信頼区間： 0.6-3.9)。

また、てんかん患者のサブグループでは、プラセボ群と比べ 1000 人あたり 2.4 人多いと計算されている。

16. その他

該当資料なし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験(「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照) :

(2) 副次的薬理試験²⁾ :

- 1) ラットに 30mg/kg を経口投与した実験では極めて弱い利尿作用が認められる。
- 2) ゴールドハムスターにおいて、半数に驚愕反応を抑制するスルチアムの量は経口投与で 80mg/kg であり、若干の精神安定作用が認められる。

(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²⁾ :

急性毒性

LD₅₀(mg/kg)

動物・性	投与経路	経口
マウス		> 5000
家兔		1000

(2) 反復投与毒性試験¹⁷⁾ :

イヌに 1 日 20 ~ 300mg/kg を 1 年間経口投与した実験では、20 ~ 60mg/kg 投与群で対照群に比し特に有意な変化は認められないが、300mg/kg 投与群で尿中にスルチアム結晶の排泄、血液検査による軽度の貧血、トランスアミナーゼの上昇等が認められている。

(3) 生殖発生毒性試験¹⁸⁾ :

ラットに 1 日 30、100、300mg/kg を妊娠 6 日目から 11 日間経口投与した実験において、胎児の体重減少は対照に比し、100mg/kg と 300mg/kg で有意な差が認められ、かつ用量依存性であった。300mg/kg 投与群では胎盤重量が減少し、発育不全児が増加し、軽度の骨変化を示す例が増加したのが認められたが、奇形は認められなかった。

(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：処方せん医薬品(注意－医師等の処方せんにより使用すること)

有効成分：スルチアム 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

室温保存

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：

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)：

くすりのしおり：有り

「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 14.適用上の注意」参照

(3) 調剤時の留意点について：

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

オスポロット錠 50mg : 50錠(バラ包装)、500錠(バラ包装)

オスポロット錠 200mg : 50錠(バラ包装)、250錠(バラ包装)

7. 容器の材質

褐色ガラス瓶

8. 同一成分・同効薬

同一成分：なし

同効薬 : プリミドン、フェニトイン、トリメタジオン、クロナゼパム、クロバザム、カルバマゼピン、バルプロ酸ナトリウム、ゾニサミド、ガバペンチン

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日

オスポロット錠 50mg : 2001年9月28日

オスポロット錠 200mg : 2001年9月28日

承認番号

オスポロット錠 50mg : 21300AMZ00757

オスポロット錠 200mg : 21300AMZ00756

11. 薬価基準収載年月日

オスポロット錠 50mg : 2001年9月26日

オスポロット錠 200mg : 2001年9月26日

12. 効能又は効果追加, 用法及び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

再評価結果公表年月日 : 1975年6月26日

各適応(効能又は効果)に対する評価判定

(1) 有効であることが推定できるもの

精神運動発作

(2) 有効と判定する根拠がないもの

大発作、小発作

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、投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁)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
オスロット錠 50mg	113901301	1137001F1039	610451024
オスロット錠 200mg	113902001	1137001F2035	610451025

17. 保険給付上の注意

特になし

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) Friebel,von H. et al. : Dtsch.Med.Wschr., 85(50), 2192 (1960)
- 2) Wirth,W. et al. : Dtsch.Med.Wschr., 85(50), 2195 (1960)
- 3) Dreyer,R. : Symp.Akt.Therap.Probl., 4(36), 162 (1963)
- 4) 田縁修治 他 : Medizin Von Heute(「今日の医学」), 45 卷, 1 号, 69 (1971)
- 5) 共和薬品工業株式会社 社内資料 : 安定性試験(長期保存試験)
- 6) 共和薬品工業株式会社 社内資料 : 安定性試験(無包装)
- 7) 共和薬品工業株式会社 社内資料 : 安定性試験
- 8) 共和薬品工業株式会社 社内資料 : 溶出試験
- 9) 共和薬品工業株式会社 社内資料 : 臨床試験
- 10) 乾正 他 : 精神薬療基金研究年報, 10 卷, 153 (1978)
- 11) 西村 健 : 医学のあゆみ, 40 卷, 3 号, 121 (1962)
- 12) 共和薬品工業株式会社 社内資料 : 薬物動態
- 13) Olesen,O.V. : Acta Pharmaco.et Toxicol., 26, 22 (1968)
- 14) Matsumoto,K. et al. : Arzneimittel Forsch Drug Res., 33(II), Nr.7, 961 (1983)
- 15) Livingston,S. et al. : Dis.Nerv.Syst., 28(4), 259 (1967)
- 16) Duhm,von B. et al. : Z.Naturforschg, 18b, 475 (1963)
- 17) Lorke,D.et al.:未発表(1965)
- 18) Lorke,D.:未発表(1971)

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

XⅢ. 備考

その他の関連資料

該当資料なし