

## 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2018（2019年更新版）に準拠して作成

気管支拡張剤  
サルブタモール硫酸塩錠  
サルブタモール錠 2mg 「日医工」  
Salbutamol Tablets

剤形	素錠
製剤の規制区分	なし
規格・含量	1錠中 サルブタモール硫酸塩 2.4mg（サルブタモールとして 2mg）含有
一般名	和名：サルブタモール硫酸塩 洋名：Salbutamol Sulfate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認：2013年 7月 22日 薬価基準収載：2013年 12月 13日 販売開始：1978年 4月 1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>

本IFは2023年8月改訂（第1版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

## 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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

## 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>11</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ....	11
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 薬理作用 .....	11
3. 製品の製剤学的特性.....	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>12</b>
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	1. 血中濃度の推移.....	12
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	2. 薬物速度論的パラメータ.....	12
6. RMP の概要.....	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	12
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	4. 吸収.....	12
1. 販売名.....	2	5. 分布.....	12
2. 一般名.....	2	6. 代謝.....	13
3. 構造式又は示性式.....	2	7. 排泄.....	13
4. 分子式及び分子量.....	2	8. トランスポーターに関する情報.....	13
5. 化学名（命名法）又は本質.....	2	9. 透析等による除去率.....	13
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	2	10. 特定の背景を有する患者.....	13
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	11. その他.....	13
1. 物理化学的性質.....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>14</b>
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3	1. 警告内容とその理由.....	14
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	3	2. 禁忌内容とその理由.....	14
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>4</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由... ..	14
1. 剤形.....	4	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由... ..	14
2. 製剤の組成.....	4	5. 重要な基本的注意とその理由.....	14
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	5	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	15
4. 力価.....	5	7. 相互作用.....	16
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	5	8. 副作用.....	17
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	5	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	18
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	6	10. 過量投与.....	18
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	6	11. 適用上の注意.....	18
9. 溶出性.....	6	12. その他の注意.....	18
10. 容器・包装.....	7	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>19</b>
11. 別途提供される資材類.....	7	1. 薬理試験.....	19
12. その他.....	8	2. 毒性試験.....	19
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>9</b>	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>20</b>
1. 効能又は効果.....	9	1. 規制区分.....	20
2. 効能又は効果に関連する注意.....	9	2. 有効期間.....	20
3. 用法及び用量.....	9	3. 包装状態での貯法.....	20
4. 用法及び用量に関連する注意.....	9	4. 取扱い上の注意点.....	20
5. 臨床成績.....	9	5. 患者向け資材.....	20

## 略語表

6.	同一成分・同効薬.....	20
7.	国際誕生年月日 .....	20
8.	製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日.....	20
9.	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.....	20
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	20
11.	再審査期間 .....	20
12.	投薬期間制限に関する情報.....	21
13.	各種コード .....	21
14.	保険給付上の注意 .....	21
<b>X I .</b>	<b>文献</b> .....	<b>22</b>
1.	引用文献 .....	22
2.	その他の参考文献.....	22
<b>X II .</b>	<b>参考資料</b> .....	<b>23</b>
1.	主な外国での発売状況.....	23
2.	海外における臨床支援情報 .....	23
<b>X III .</b>	<b>備考</b> .....	<b>24</b>
1.	調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たつての参考情報.....	24
2.	その他の関連資料.....	24

略語	略語内容
無	

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、サルブタモール硫酸塩を有効成分とする気管支拡張剤である。

サルブタモール硫酸塩製剤の「アス・タージス錠」は、日医工株式会社が開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験等を実施し、1978年1月28日に承認を取得、1978年4月1日に販売を開始した。

再評価（品質再評価）の結果、2003年2月21日、薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの再評価結果を得た。

医療事故防止のため、以下の販売名変更を行った。

承認年月日	販売名	旧販売名
2007年2月28日	アスタージス錠 2mg	アス・タージス錠
2013年7月22日	サルブタモール錠 2mg「日医工」	アスタージス錠 2mg

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、サルブタモール硫酸塩を有効成分とする気管支拡張剤である。
- (2) 重大な副作用として、重篤な血清カリウム値低下、ショック、アナフィラキシーが報告されている。  
(「Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

- (1) PTPシートはピッチコントロールを行い、1錠ごとに成分名、含量、屋号を表示した。

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### (1) 承認条件

該当しない

#### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

### 6. RMPの概要

該当しない

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

サルブタモール錠 2mg 「日医工」

#### (2) 洋名

Salbutamol Tablets

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

サルブタモール硫酸塩 (JAN)

#### (2) 洋名 (命名法)

Salbutamol Sulfate (JAN)

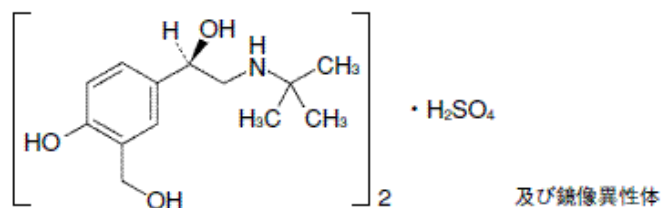
#### (3) ステム (stem)

フェネチルアミン系気管支拡張薬: -terol

(フェネチルアミン系気管支拡張薬であるが、「-terol」が使われていない。)

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式:



### 4. 分子式及び分子量

分子式:  $(C_{13}H_{21}NO_3)_2 \cdot H_2SO_4$

分子量: 576.70

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

化学式: (1*RS*)-2-(1,1-Dimethylethyl)amino-1-(4-hydroxy-3-hydroxymethylphenyl)ethanol  
hemisulfate (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の粉末である。

##### (2) 溶解性

水に溶けやすく、エタノール (95) 又は酢酸 (100) に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

##### (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

水溶液 (1→20) 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

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### (1) 確認試験法

###### 1) 紫外可視吸光度測定法

本品の塩酸試液溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 3) 定性反応

本品の水溶液は硫酸塩の定性反応を呈する。

##### (2) 定量法

###### 滴定法

本品の酢酸溶液を過塩素酸で滴定する。(指示薬：クリスタルバイオレット試液)



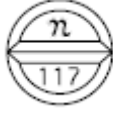


## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

素錠

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	サルブタモール錠 2mg 「日医工」	
剤形	素錠	
色調	白色	
外形	表面	
	裏面	
	側面	
直径 (mm)	6.0	
厚さ (mm)	2.4	
質量 (mg)	90	
本体コード	n 117	
包装コード	Ⓝ117	

#### (3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

#### (4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

#### (5) その他

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量及び添加剤

販売名	サルブタモール錠 2mg 「日医工」
有効成分	1錠中 サルブタモール硫酸塩 2.4mg (サルブタモールとして 2mg)
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、アルファー化デンプン、カルメロースカルシウム、タルク、ステアリン酸マグネシウム

#### (2) 電解質等の濃度

該当資料なし

#### (3) 熱量

該当資料なし

### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 4. 力価

該当しない

### 5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

### 6. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

(1) 長期保存試験

◇長期保存試験 25℃・60%RH [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	12 ヶ月	24 ヶ月	36 ヶ月
性状 <白色の錠剤>	AR2401 LD0801 FT0203	適合	適合 適合 —	適合	適合
確認試験 (※1)	AR2401 LD0801 FT0203	適合	適合 適合 —	適合	適合
溶出性 (%) <15 分、85%以上>	AR2401 LD0801 FT0203	95.8~102.6 96.5~ 99.0 94.0~ 95.6	97.9~100.7 98.8~101.6 —	98.6~103.0 96.1~ 98.5 95.6~ 99.0	93.8~ 97.6 97.5~100.7 91.2~ 94.1
含量 (%) ※2 <90.0~110.0%>	AR2401 LD0801 FT0203	101.9 99.1 104.0	102.7 101.5 —	101.7 102.0 100.6	101.2 98.5 100.2

※1：呈色反応、紫外可視吸光度測定法、薄層クロマトグラフィー

※2：表示量に対する含有率 (%)

—：試験未実施

(2) 無包装状態の安定性

試験実施期間：2009/5/22~2009/9/3

◇無包装 40℃ [遮光、気密容器]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月
性状 n=10 <白色の錠剤>	LU1001	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠
溶出性 (%) n=6 <15 分、85%以上>	LU1001	97.5~100.2	95.0~97.8	95.2~96.9	95.1~96.7
含量 (%) ※ n=3 <90.0~110.0%>	LU1001	102.6~103.3	101.7~101.9	100.5~101.1	100.8~103.9
(参考値) 硬度 (N) n=10	LU1001	78~84	68~75	68~81	67~75

※：表示量に対する含有率 (%)

◇無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月
性状 n=10 ＜白色の錠剤＞	LU1001	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠
溶出性 (%) n=6 ＜15 分、85%以上＞	LU1001	97.5～100.2	97.2～99.3	94.5～98.1	96.8～99.6
含量 (%) ※ n=3 ＜90.0～110.0%＞	LU1001	102.6～103.3	101.8～102.7	101.1～101.6	102.4～107.1
(参考値) 硬度 (N) n=10	LU1001	78～84	35～41	34～38	38～44

※：表示量に対する含有率 (%)

◇無包装 室温・曝光 [D65 光源、気密容器]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10 ＜白色の錠剤＞	LU1001	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠
溶出性 (%) n=6 ＜15 分、85%以上＞	LU1001	97.5～100.2	97.2～99.3	94.5～98.1	96.8～99.6
含量 (%) ※ n=3 ＜90.0～110.0%＞	LU1001	102.6～103.3	101.8～102.7	101.1～101.6	102.4～107.1
(参考値) 硬度 (N) n=10	LU1001	78～84	35～41	34～38	38～44

※：表示量に対する含有率 (%)

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

## 9. 溶出性

### （1）溶出規格

サルブタモール錠 2mg「日医工」は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたサルブタモール硫酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

（試験液に水 900mL を用い、パドル法により、50rpm で試験を行う）

溶出規格

表示量*	規定時間	溶出率
2mg	15 分	85%以上

\*：サルブタモールとして

## (2) 溶出試験<sup>2)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成13年5月31日  
医薬審発第786号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

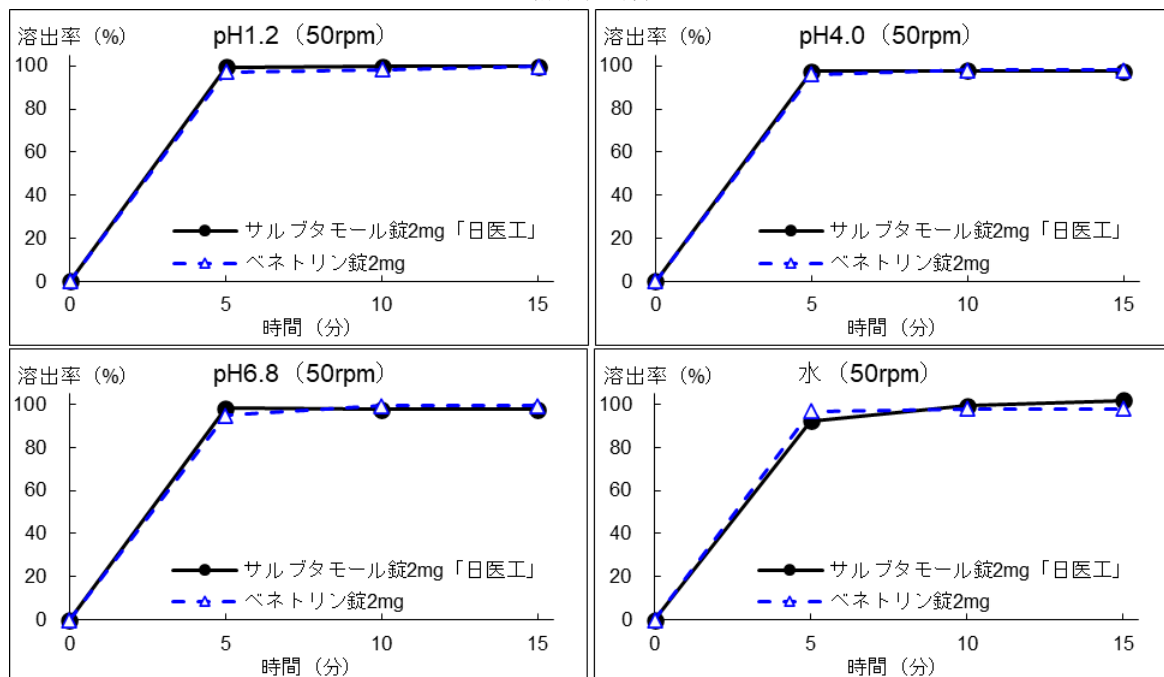
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤および本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤および本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤および本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤および本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（ベネトリン錠2mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

## 10. 容器・包装

### (1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

### (2) 包装

100錠 [10錠×10 ; PTP]

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTP : ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔

ピロー : ポリエチレンテレフタレート・アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

**11. 別途提供される資材類**

該当資料なし

**12. その他**

該当記載事項なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

下記疾患の気道閉塞性障害にもとづく諸症状の緩解

- 気管支喘息
- 小児喘息
- 肺気腫
- 急・慢性気管支炎
- 肺結核
- 珪肺結核

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

通常成人1回2錠を1日3回経口投与し、症状の激しい場合には1回4錠を1日3回経口投与する。  
なお、年齢・症状により適宜増減する。

小児の標準投与量は成人用量の1/4～1/2量であり、通常5才以上15才未満は1回1～2錠を1日3回、5才未満は1回1～1.5錠を1日3回経口投与する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

該当資料なし

##### 2) 安全性試験

該当資料なし

#### (5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

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

カテコールアミン群、 $\beta_2$ アドレナリン受容体刺激剤

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

サルブタモールは短時間作用性 $\beta_2$ 刺激剤であり、アデニル酸シクラーゼを活性化し細胞内の環状アデノシン一リン酸を増加させることで、気管支平滑筋を弛緩させる。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 $\beta_2$ 受容体選択性

モルモットにサルブタモールを経口投与した実験において、サルブタモールは $\beta_2$ 受容体刺激による気管支拡張作用が強く、一方 $\beta_1$ 受容体刺激による心刺激作用は弱いことが明らかにされており、 $\beta_2$ 受容体に選択的に作用する性質を有する<sup>3)</sup>。

##### 18.3 気管支拡張作用

**18.3.1** モルモットにサルブタモールを経口投与し、1時間後に1%ヒスタミン0.5mLを噴霧して気管支収縮を誘発したところ、サルブタモール0.3~10.0mg/kg投与群において喘息指数<sup>注)</sup>の軽減及び窒息性気管支収縮に対する抑制効果が認められた<sup>4)</sup>。

注) 喘息指数：ヒスタミン又はメタコリン噴霧後5分間、1分毎に発現する症状を採点（例；変化なし：0、チアノーゼ・軽度の呼吸不整：1……等）し、5回の和で示す。

**18.3.2** 無麻酔モルモットにアセチルコリン溶液を噴霧して誘発させた気管支収縮に対し、サルブタモールの1mg/kg経口投与群では30分~4時間、5mg/kg経口投与群では4~6時間にわたり抑制効果を示した<sup>3)</sup>。

#### (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

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 16.1.1 単回経口投与

健康成人 2 例に <sup>3</sup>H-サルブタモール 10mg<sup>注)</sup> を単回経口投与した時、血漿中放射活性濃度は投与後 1～2 時間で最高値となり、その後急速な減少を示した。血中濃度半減期は 1.5～2 時間であった<sup>5)・6)</sup> (外国人データ)。

注) 本剤の承認用量は通常成人 1 回 2 錠 1 日 3 回投与である。

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

(「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照)

### 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) 消失速度定数

該当資料なし

#### (4) クリアランス

該当資料なし

#### (5) 分布容積

該当資料なし

#### (6) その他

該当資料なし

### 3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) パラメータ変動要因

該当資料なし

### 4. 吸収

該当資料なし

### 5. 分布

#### (1) 血液-脳関門通過性

(「Ⅶ. 5. (5) その他の組織への移行性」の項参照)

#### (2) 血液-胎盤関門通過性

(「Ⅷ. 6. (5) 妊婦」の項参照)

#### (3) 乳汁への移行性

(「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照)

#### (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

ラットに<sup>3</sup>H 標識サルブタモール 25mg/kg を単回経口投与した結果、投与後 1～2 時間で血中及び各組織内濃度は最高値に達し、肝臓、脂肪、筋肉で高く、次いで腎臓、肺、心臓、脾臓の順であり、脳にはほとんど移行しなかった<sup>5)</sup>。

#### (6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

### 6. 代謝

#### (1) 代謝部位及び代謝経路

ラット、ウサギ経口投与時の排泄物中の主代謝産物はグルクロン酸抱合体であり、ラットにおける胆汁排泄研究では肝臓中でつくられていることが示されている<sup>5)</sup>。

#### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

### 7. 排泄

健康成人 2 例に<sup>3</sup>H-サルブタモール 10mg<sup>注)</sup> を単回経口投与した時、投与後 24 時間以内に投与量の 90%が尿中に排泄された<sup>5) 6)</sup> (外国人データ)。

注) 本剤の承認用量は通常成人 1 回 2 錠 1 日 3 回投与である。

### 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

### 9. 透析等による除去率

該当資料なし

### 10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

### 11. その他

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

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### 2.禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8.重要な基本的注意

**8.1** 用法及び用量どお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、小児に投与する場合には、使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。

**8.2** 過度に使用を続けた場合、不整脈、場合により心停止を起こすおそれがあるので、使用が過度にならないように注意すること。[13.1、13.2 参照]

(解説)

8.1 本剤の使用は、患者が上述のような適正な使用方法について十分理解し、過量投与になるおそれのないことが確認された場合にのみ投与すること。また、小児へ投与する場合は、必要に応じ保護者に適正な使用方法を理解させること。

8.2 本剤は気管支喘息や肺気腫等の気道閉塞性の諸症状を緩解させる対症療法剤である。

従って、本剤の使用回数が増加した場合には、原疾患の進行、悪化が予測される。

この際に他の治療を併用することなく本剤の使用を過度に続けた場合には、不整脈や心停止などの重大な心疾患を起こすおそれがある [9.1.3 参照]。特に気管支喘息の患者においては、発作発現時に使用が過度になりやすくなるため、用法及び用量を正しく指導し、経過観察を十分に行うことが重要である。

## 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

### (1) 合併症・既往歴等のある患者

#### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1.1 甲状腺機能亢進症の患者

甲状腺ホルモンの分泌促進により症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.2 高血圧の患者

$\alpha$  及び  $\beta_1$  作用により血圧を上昇させるおそれがある。

##### 9.1.3 心疾患を有する患者

$\beta_1$  作用により症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.4 糖尿病の患者

グリコーゲン分解作用により症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.5 低酸素血症の患者

血清カリウム値をモニターすることが望ましい。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。[11.1 参照]

(解説)

9.1.1～9.1.4  $\beta$  刺激剤に共通の記載である。

9.1.1 甲状腺は交感神経系の支配をうけており、一方、甲状腺ホルモンは  $\beta$  受容体の数を増加させる。すなわち、甲状腺亢進症では  $\beta$  受容体を介するシステムのトーンが高まっている状態にあり<sup>7)</sup>、 $\beta$  刺激剤に過剰反応する可能性がある。

甲状腺機能亢進症患者には、甲状腺ホルモンの分泌促進により症状を悪化させるおそれがあるの  
で慎重に投与すること。

9.1.2、9.1.3 本剤は  $\beta_2$  受容体に強い親和性を示すが、 $\beta_1$  受容体にも弱い親和性がある<sup>8)</sup>。また、 $\alpha$  受容体刺激作用を示す可能性がある。

$\alpha$  受容体を刺激すると、血管収縮作用により血圧が上昇する。また、 $\beta_1$  受容体を刺激すると、心拍数・心拍出量が増大し収縮期圧が上昇したり、心室性不整脈を起こすことがある。このような作用から高血圧患者や心疾患のある患者には慎重に投与する必要がある。

9.1.4  $\beta_2$  受容体刺激作用により肝臓におけるグリコーゲン分解が促進される結果、血中の糖及び乳酸が増加する可能性がある。糖尿病の患者には、グリコーゲン分解作用により症状を悪化させるおそれがあるの  
で慎重に投与すること。

9.1.5 一般に  $\beta$  刺激剤は細胞内へのカリウム取り込みを上昇させるため、血中のカリウム値を低下させることがある<sup>9)・10)</sup>。また、低酸素血症により低カリウム血症が心リズムに及ぼす作用を増強することがある。

従って、重症喘息患者等の低酸素血症において、本剤を投与する場合には血清カリウム値をモニターすることが推奨される。

### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

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。動物実験（マウス）で催奇形作用が報告されている<sup>8)</sup>。

(解説)

ヒト治療量の数千倍のサルブタモールを、マウスの分裂期及び器官形成期に皮下投与し、胎児の総重量、骨格、内臓の異常について検査した。主として口蓋裂等の奇形が発生し、その発症率はコントロール 1%に対しサルブタモールでは 10%であった<sup>11)</sup>。

(6) 授乳婦

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。

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に、生理機能が低下している。

(解説)

本剤は主として腎臓から排泄されるが、一般的に高齢者では生理機能が低下していることが多いため、本剤の排泄が抑制され、高い血中濃度が持続する恐れがある。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

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
カテコールアミン アドレナリン イソプレナリン塩酸塩等	不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがある。	アドレナリン、イソプレナリン塩酸塩等のカテコールアミン併用により、アドレナリン作動性神経刺激の増大が起きる。 そのため不整脈を起こすことがある。
キサンチン誘導体 ステロイド剤 利尿剤 [11.1 参照]	低カリウム血症による不整脈を起こすおそれがある。 血清カリウム値のモニターを行うこと。	キサンチン誘導体はアドレナリン作動性神経刺激を増大させるため、血清カリウム値の低下を増強することがある。 ステロイド剤及び利尿剤は尿細管でのカリウム排泄促進作用があるため、血清カリウム値の低下が増強することが考えられる。

(解説)

$\beta$  刺激剤に共通の記載である。

カテコールアミン：アドレナリン、イソプレナリン塩酸塩等のカテコールアミンを併用した場合、これら薬剤も  $\beta$  刺激作用をもつため、本剤を過量投与した時と同様な重大な心疾患を引き起こす危険性が予測される [8.2、9.1.3 参照]。これら薬剤との併用による副作用報告に基づく記載ではないが、カテコールアミンとの併用時には総量として過量投与とならないよう注意が必要である。

キサンチン誘導体、ステロイド剤、利尿剤：一般に  $\beta$  刺激薬は細胞内へのカリウム取り込みを上昇させるため、血中のカリウム値を低下させることがある [11.1.1 参照]。

一方、テオフィリン等のキサンチン誘導体はホスホジエステラーゼ活性を抑制することにより、cAMP (サイクリックアデノシン 3',5'モノフォスフェイト) が増加し Na/K ポンプの活性化をきたし、血中のカリウム値を低下させる。また、ステロイド及びチアジド系、ループ系などの利尿剤は腎の尿細管でのカリウム排泄促進作用を有するため、血中のカリウム値を低下させる。従って、本剤とこれら薬剤の併用により、血中のカリウム値の低下が増強される可能性がある。また、重篤な低カリウム血症は不整脈等の心疾患を引き起こすことがあるので、必要に応じ血中のカリウム値のモニターを行うこと。

## 8. 副作用

### 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。

#### (1) 重大な副作用と初期症状

##### 11.1 重大な副作用

###### 11.1.1 重篤な血清カリウム値低下 (頻度不明)

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。[9.1.5、10.2、13.1 参照]

###### 11.1.2 ショック、アナフィラキシー (いずれも頻度不明)

(解説)

11.1.2 国内外において、サルブタモール硫酸塩によるショック、アナフィラキシーの副作用症例が報告されていることから、重大な副作用の項にショック、アナフィラキシーを追記した。

#### (2) その他の副作用

##### 11.2 その他の副作用

	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症		痒痒感、血管性浮腫	発疹、血圧低下、蕁麻疹
循環器	心悸亢進、脈拍増加	不整脈、血圧変動	
精神神経系	頭痛、振戦、睡眠障害	めまい、眠気、興奮、下肢疼痛	落ち着きのなさ
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐、下痢		
その他	口渇、湿疹	口内炎、発汗	潮紅、浮腫、筋痙攣

発現頻度は、新開発医薬品の副作用のまとめ (その 31) <sup>12)</sup>、<sup>13)</sup> に基づく。

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

## 10. 過量投与

### 13. 過量投与

#### 13.1 症状

過量投与時にみられる最も一般的な症状は、一過性の $\beta$ 作用を介する症状である。低カリウム血症が発現するおそれがあるので、血清カリウム値をモニターすること。

海外で吸入剤又は注射剤の高用量投与により、乳酸アシドーシスを含む代謝性アシドーシスが報告されているので、呼吸状態等、患者の状態を十分に観察すること。また、主に小児において経口剤による過量投与時に悪心、嘔吐及び高血糖が報告されている。[8.2、11.1 参照]

#### 13.2 処置

本剤の投与の中止を考慮し、心血管系症状（脈拍増加、心悸亢進等）がみられる患者では心臓選択性 $\beta$ 遮断剤の投与等の適切な処置を検討すること。ただし $\beta$ 遮断剤の使用にあたっては、気管支攣縮の既往のある患者では十分に注意すること。[8.2 参照]

## 11. 適用上の注意

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験

(「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照)

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

#### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

#### (7) 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	サルブタモール錠 2mg 「日医工」	なし
有効成分	サルブタモール硫酸塩	劇薬 <sup>注)</sup>

注) サルブタモールとして、1錠中 4mg 以下を含有するもの、0.5%以下を含有する吸入剤、0.24%以下を含有するシロップ剤は劇薬から除かれる。

### 2. 有効期間

3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

#### 20.取扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は、遮光して保存すること。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：ベネトリンシロップ 0.04%

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

履歴	販売名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
販売 開始	アス・タージス錠	1978年 1月28日	(53AM) 221	1978年 4月1日	1978年 4月1日
販売名 変更	アスタージス錠 2mg	2007年 2月28日	21900AMX00123000	2007年 6月15日	2007年 6月15日
承継	サルブタモール錠 2mg 「日医工」	2013年 7月22日	22500AMX01238000	2013年 12月13日	2013年 12月13日

### 9. 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

### 10. 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（品質再評価）公表年月日：2003年2月21日

結果：薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない

### 11. 再審査期間

該当しない

**12. 投薬期間制限に関する情報**

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

**13. 各種コード**

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
サルブタモール錠 2mg 「日医工」	2254001F1102	2254001F1102	104026501	620402601

**14. 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) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) Cullum VA., et al. : Br. J. Pharmacol. 1969 ; 35 : 141-151 (PMID : 5762037)
- 4) 小林晋作 他 : 医薬品研究. 1971 ; 2 : 120-127
- 5) Martin LE., et al. : Eur. J. Pharmacol. 1971 ; 14 : 183-199 (PMID : 5164253)
- 6) Kennedy MCS., et al. : Br. J. Dis. Chest. 1969 ; 63 : 165-174 (PMID : 4894367)
- 7) 山本蒔子 他 : 薬理と治療. 1983 ; 11 : 9 : 3975-3982
- 8) 岩浪克之 : 日本薬剤師会雑誌. 1997 ; 49 : 3 : 435-440
- 9) 菱田 明 他 : 日本臨床. 1981 ; 39 : 2 : 304-309
- 10) 佐藤辰男 : 医学のあゆみ. 1984 ; 130 : 3 : 188-189
- 11) Szabo KT., et al. : Teratology. 1975 ; 12 : 336-337
- 12) 厚生省薬務局 : 医薬品副作用情報. 1979 ; No.35
- 13) 日本医事新報. 1979 ; No.2863 : 109

### **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

#### 妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

（「VIII. 6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

	Drug Name	Category
オーストラリアの分類	salbutamol	A

(2021年4月検索)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category A：

Drugs which have been taken by a large number of pregnant women and women of childbearing age without any proven increase in the frequency of malformations or other direct or indirect harmful effects on the fetus having been observed.

## XIII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

#### 本項の情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。

試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。

医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### (1) 粉碎

該当資料なし

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

##### サルブタモール錠 2mg 「日医工」

#### 1) 試験方法

[崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

[通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2019/1/30～2019/2/7

ロット番号：D00300

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
サルブタモール錠 2mg 「日医工」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし