

抗てんかん剤

規制区分：  
処方箋医薬品<sup>注1)</sup>  
貯法：  
室温保存  
使用期限：  
包装箱、ラベルに表示。  
使用期限を過ぎた製品  
は使用しないこと。

オスポロット<sup>®</sup>錠50mg  
オスポロット<sup>®</sup>錠200mg

OSPOLOT<sup>®</sup>

〈スルチアム製剤〉

	錠50mg	錠200mg
承認番号	21300AMZ00757	21300AMZ00756
薬価収載	2001年9月	2001年9月
販売開始	2001年12月	2001年12月

【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。〕

【組成・性状】

1. 組成

販売名	オスポロット錠50mg	オスポロット錠200mg
有効成分	1錠中、日局スルチアム50mgを含有する。	1錠中、日局スルチアム200mgを含有する。
添加物	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	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

2. 製剤の性状

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		KW002
			直径：約 6.1mm 厚さ：約 2.95mm 質量：約 97mg	
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		KW003
			直径：約 10.1mm 厚さ：約 4.95mm 質量：約 385mg	

【効能・効果】

精神運動発作

【用法・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。

【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)

薬物過敏症の患者

2. 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に注意すること。

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
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。

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)

(1) 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。

(2) 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 <sup>注2)</sup>		猩紅熱様・麻疹様・中毒疹様発疹
血液 <sup>注3)</sup>	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、呼吸促進

注2)発現した場合には、投与を中止すること。

注3)発現した場合には、減量するなど適切な処置を行うこと。

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減量するなど注意すること。

## 6. 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。〕

## 7. 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。

## \* 8. 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。

## 【薬物動態】

### 〈血中濃度〉

健康成人に1回5mg/kgを経口投与した場合、投与後2～4時間で最高血中濃度(3～8 μg/mL)に達する。<sup>1)</sup>

### 〈参 考〉

#### 排 泄

ラットに10mg/kgを経口投与した実験では、48時間以内に投与量の80～90%が尿中に、10～20%が糞便中に排泄される。<sup>2)</sup>

## 【臨床成績】

総計123例について実施された臨床試験の概要は次のとおりである。<sup>3)</sup> 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。

## 【薬効薬理】

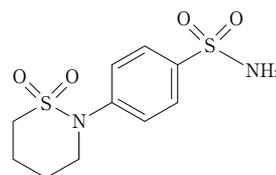
1. スルチアムは電撃痙攣及びペンテトラゾール痙攣試験において抗痙攣作用を示す。治療指数(LD<sub>50</sub>/ED<sub>50</sub>)を指標とした場合、電撃痙攣に対してはフェノバルビタールナトリウムの10倍以上、フェニトインの4～5倍である。ペンテトラゾール痙攣に対してはフェニトインと同程度である。なお、ストリキニーネ及びメチオニン・スルフォキシミン痙攣に対しては抗痙攣作用を示さない(マウス)。<sup>4)</sup>
2. スルチアムは炭酸脱水酵素阻害作用を示す(マウス)。<sup>5)</sup>

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：スルチアム(Sultiam)

化学式：C<sub>10</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub>=290.36

構造式：



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

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。

N, N-ジメチルホルムアミドに極めて溶けやすく、n-ブチルアミンに溶けやすく、メタノール又はエタノール(95)に溶けにくく、水に極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

水酸化ナトリウム試液に溶ける。

融 点：185～188℃

## 【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)

## 【主要文献及び文献請求先】

### 〈主要文献〉

- 1) 乾 正他：精神薬療基金研究年報, **10**, 153(1978)
- 2) Duhm, B. et al. : Z. Naturforschg., **18b**, 475(1963)
- 3) 共和薬品工業株式会社 社内資料：臨床試験
- 4) Wirth, W. et al. : Dtsch. med. Wschr., **85**(50), 2195(1960)
- 5) 西村 健：医学のあゆみ, **40**(3), 121(1962)

### \* \* 〈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。

共和薬品工業株式会社 学術情報課

〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858