



貯法：遮光した気密容器、室温保存

使用期限：外箱等に表示(3年)

注意：取扱上の注意の項参照

承認番号	30100AMX00327
薬価収載	2020年6月
販売開始	1994年7月

気管支拡張剤

劇薬 ** フェノテロール臭化水素酸塩DS小児用0.5%「タカタ」

シロップ用フェノテロール臭化水素酸塩

FENOTEROL HYDROBROMIDE



【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

1. カテコールアミン(アドレナリン、イソプレナリン等)を投与中の患者(「3. 相互作用」の項参照)
2. 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

1. 組成

品名	フェノテロール臭化水素酸塩DS小児用0.5%「タカタ」
成分・分量	1g中 フェノテロール臭化水素酸塩 5mg
添加物	精製白糖、D-マンニトール、ヒプロメロース、クエン酸水和物、ステアリン酸ポリオキシシル40、ジメチルポリシロキサン・二酸化ケイ素混合物、グリセリン脂肪酸エステル、含水二酸化ケイ素、ショ糖脂肪酸エステル、香料、カラメル

2. 製剤の性状

品名	フェノテロール臭化水素酸塩DS小児用0.5%「タカタ」
性状	微黄白色の粉末又は微粒で、芳香があり、味は甘い。

【効能・効果】

下記疾患の気道閉塞性障害に基づく呼吸困難など諸症状の緩解

気管支喘息、喘息性気管支炎、急性気管支炎

【用法・用量】

通常、幼小児に対し、1日0.075g/kg(フェノテロール臭化水素酸塩として0.375mg/kg)を3回に分け、用時溶解して経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、標準投与量は、通常、

- 0.5～1歳未満 0.3～0.6g(フェノテロール臭化水素酸塩として1.5～3.0mg)
- 1～3歳未満 0.6～0.9g(フェノテロール臭化水素酸塩として3.0～4.5mg)
- 3～5歳未満 0.9～1.5g(フェノテロール臭化水素酸塩として4.5～7.5mg)

を1日量とし、1日3回に分け、用時溶解して経口投与する。

【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)
 - (1) 甲状腺機能亢進症の患者[症状を悪化させるおそれがある。]
 - (2) 高血圧症の患者[血圧が上昇することがある。]
 - (3) 心疾患のある患者[動悸、不整脈等があらわれることがある。]
 - (4) 糖尿病の患者[症状を悪化させるおそれがある。]
 - (5) 高齢者(「5. 高齢者への投与」の項参照)
2. 重要な基本的注意
 - (1) 用法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。また、経過の観察を十分に行うこと。
 - (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。
3. 相互作用
 - (1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アドレナリン製剤 アドレナリン、 ボスミン注、 ノルアドレナリン イソプレナリン製剤 アスプールの液、 メジヘラー・イソ	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考えられる。

(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
キサンチン誘導体 テオフィリン、 アミノフィリン 水和物 ステロイド剤 ベタメタゾン、 プレドニゾン、 ヒドロコルチゾン コハク酸エステル ナトリウム 利尿剤 フロセミド	血清カリウム値の 低下作用を増強す ることがある。 血清カリウム値の モニターを行う。	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 が考えられる。 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。

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)

β₂刺激剤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、β₂刺激剤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

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
循環器	動悸、顔のほてり、頻脈、胸痛
精神神経系	頭痛、振戦
消化器	口渇、嘔気、嘔吐、腹痛、食欲不振、胃部不快感、便秘
過敏症 ^{注)}	発疹、痒疹、蕁麻疹
その他	倦怠感、手指腫脹感

注)症状があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。(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

(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。[動物実験でラットに胎児骨格異常の出現頻度の増加が報告されている。]

(2) 授乳中の婦人には、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。[授乳中の投与に関する安全性は確立していない。動物実験(ウサギ)で母乳中へ移行することが報告されている。]

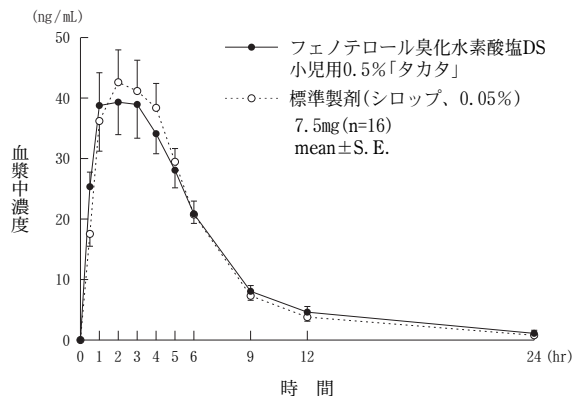
7. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤はアレルゲンによる皮膚反応に抑制的に作用する場合があるので、注意すること。

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験¹⁾

本剤と標準製剤(シロップ、0.05%)をクロスオーバー法により、健康成人男子16名にそれぞれフェノテロール臭化水素酸塩として7.5mgを空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.5、1、2、3、4、5、6、9、12及び24時間に前腕静脈から採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したフェノテロール臭化水素酸塩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C_{max}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)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
フェノテロール臭化水素酸塩DS小児用0.5%「タカタ」	289.23±30.01	44.88±5.63	2.2±0.4	4.4±1.0
標準製剤(シロップ、0.05%)	284.11±24.99	49.32±5.72	2.7±0.3	3.8±0.8

(mean±S.E.)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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²⁾

本剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたフェノテロール臭化水素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。

【臨床成績】

臨床成績^{3~8)}

6施設で実施された一般臨床試験において、解析対象症例176例について評価された全般改善度は、次表のとおりであった。

疾患名	例数	著明改善	改善
気管支喘息(喘息性気管支炎を含む)	90例	31例	45例
		84.4%	
急性気管支炎	86例	22例	52例
		86.0%	

【薬効薬理】

フェノテロール臭化水素酸塩は、アドレナリン作動性β₂-受容体を刺激し、気管支拡張作用を示す。

一方、気管支平滑筋への選択性が高く、心血管系に対する影響が少ない。

また、抗アレルギー作用を示すことが認められている。

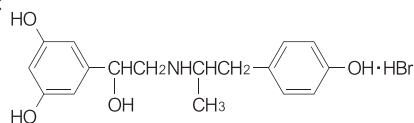
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：フェノテロール臭化水素酸塩

(Fenoterol Hydrobromide)

化学名：(R*, R*)-1-(3, 5-Dihydroxyphenyl)-2-[1-(4-hydroxybenzyl) ethylamino] ethanol hydrobromide

構造式：



分子式：C₁₇H₂₁NO₄ · HBr

分子量：384.26

性状：白色の結晶性の粉末である。

メタノールに溶けやすく、水又はエタノール(95)にやや溶けやすく、ギ酸にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

水溶液(1→25)は旋光性を示さない。

融点 約230℃(分解)

pH : 1.0gを水25mLに溶かした液のpHは4.2~5.2である。

【取扱い上の注意】

1. 開封後はしゃ光し、湿気を避けて保存すること。

2. 溶解後はできるだけ速やかに使用すること。

3. 安定性試験⁹⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、3年間安定であることが推測された。

【包装】

フェノテロール臭化水素酸塩DS小児用0.5%「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) 島崎至弘：新薬と臨牀, 41(2)：207, 1992.
- 4) 鳥越克己他：新薬と臨牀, 41(4)：791, 1992.
- 5) 土屋喬義他：基礎と臨牀, 27(5)：1651, 1993.
- 6) 若林恒郎他：新薬と臨牀, 42(6)：1159, 1993.
- 7) 大塚武司：新薬と臨牀, 42(7)：1412, 1993.
- 8) 五味崇行：医学と薬学, 30(2)：387, 1993.
- 9) 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

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

