

トルバプタン製剤

会社名	トルバプタンOD錠										トルバプタン顆粒1%					
	商品名/屋号	添加物	規格 (mg)	大きさ			包装 (錠)				写真 (7.5mg)	商品名/屋号	添加物	包装 (g)	写真	
				径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (mg)	10	20	60	100						
大塚製薬	サムスカ OD錠	ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール・低置換度ヒドロキシプロピルセルロース・ポリビニルアルコール (完全けん化) 造粒物、クロスボンド、スクラロース、トウモロコシデンプン、青色2号アルミニウムレーキ、ステアリン酸マグネシウム	7.5	7.7 (長径) 4.4 (短径)	2.6	85	-	○	-	○		サムスカ 顆粒1%	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、青色2号アルミニウムレーキ	30		
			15	8 (直径)	3.1	170	-	○	-	○						
			30	7.4 (一辺)	3.1	160	○	-	-	-						
東和薬品	「トーワ」	D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、ジブチルヒドロキシトルエン、青色2号アルミニウムレーキ、軽質無水ケイ酸、クロスカルメロースナトリウム、アスパルテーム (L-フェニルアラニン化合物)、香料、ステアリン酸マグネシウム、その他3成分	7.5	9.5 (長径) 5.4 (短径)	3.0	157	-	○	○	-		「トーワ」	D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、ジブチルヒドロキシトルエン、青色2号アルミニウムレーキ、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸	30		
			15	9.5 (直径)	4.3	314	-	○	○	-						
沢井製薬	「サワイ」	軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、スクラロース、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール、青色2号アルミニウムレーキ	7.5	7.8 (長径) 4.4 (短径)	2.7	90	-	○	-	○		「サワイ」	軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、青色2号アルミニウムレーキ	30		
			15	8.1 (直径)	3.2	180	-	○	-	○						
大塚製薬 工場	「オーツカ」	AG	7.5	7.7 (長径) 4.4 (短径)	2.6	85	-	○	-	○		「オーツカ」	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、スクラロース、青色2号アルミニウムレーキ	30		
			15	8 (直径)	3.1	170	-	○	-	○						
トーア エイヨー	「TE」	共同開発	7.5	7.8 (長径) 4.4 (短径)	3.1	100	-	○	-	○		「TE」	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、スクラロース、青色2号アルミニウムレーキ	30		
			15	8.6 (直径)	3.7	200	-	○	-	○						
ニプロ	「ニプロ」	共同開発	7.5	7.8 (長径) 4.4 (短径)	3.1	100	-	○	-	○		「ニプロ」	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、スクラロース、青色2号アルミニウムレーキ	30		
			15	8.6 (直径)	3.7	200	-	○	-	○						
第一三共 エスファ	「DSEP」	共同開発	7.5	7.8 (長径) 4.4 (短径)	3.1	100	-	○	-	○		「DSEP」	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、スクラロース、青色2号アルミニウムレーキ	30		
			15	8.6 (直径)	3.7	200	-	○	-	○						

☆GE情報☆
 ◇『抗利尿ホルモン不適合分泌症候群 (SIADH) における低ナトリウム血症の改善』と『腎容積が既に増大しており、かつ、腎容積の増大速度が速い常染色体優性多発性のう胞腎の進行抑制』は、希少疾病用医薬品に指定されているサムスカ (先発品) のみの適応。AG (「オツカ」) にも適応はない。よって上記のみに適応のある30mg規格はGEの発売無し。今後の適応追加予定に関しては、AGを含め全メーカー未定。
 ◇OD錠「オツカ」はAG1である (原薬・添加剤・製造工場が先発品と同一)。
 ◇「オツカ」はAGとして顆粒剤型を発売しない。
 ◇「KMP」が共創未来ファーマから、沢井製薬との共同開発として薬価収載もされていたが、発売延期状態が継続していたなか、2024.1に販売中止を決定。

☆サムスカ (先発品) 情報☆

【効能又は効果】

(参考)

	OD錠7.5mg 顆粒1%	OD錠15mg	OD錠30mg
心不全における体液貯留	○	○	-
肝硬変における体液貯留	○	-	-
SIADHにおける低ナトリウム血症	○	○	○
常染色体優性多発性のう胞腎	○	○	○

○：効能あり、-：効能なし

【用法・用量】

(参考)

	投与方法	投与量
心不全における体液貯留	1日1回	15mg
肝硬変における体液貯留	1日1回	7.5mg
SIADHにおける低ナトリウム血症	1日1回	開始用量7.5mg (必要に応じて漸増) → 最高用量60mg
常染色体優性多発性のう胞腎	1日2回	開始用量1日60mg (朝45mg、夕方15mg) ↓ 1日90mg (朝60mg、夕方30mg) (漸増) 1日120mg (朝90mg、夕方30mg)

【開発・販売経緯】

2010年10月：サムスカ錠15mgは「ループ利尿薬等の他の利尿薬で効果不十分な心不全における体液貯留」を効能又は効果として、製造販売承認を取得 (サムスカ錠7.5mgは、2013年2月に製造販売承認を取得)

2013年09月：サムスカ錠7.5mgに「ループ利尿薬等の他の利尿薬で効果不十分な肝硬変における体液貯留」の効能又は効果が追加。

2014年03月：サムスカ錠7.5/15mgに「腎容積が既に増大しており、かつ、腎容積の増大速度が速い常染色体優性多発性のう胞腎の進行抑制」の効能又は効果が追加 (サムスカ錠30mgも2014年3月に製造販売承認を取得)

2017年03月：サムスカ顆粒1%の製造販売承認を取得

2019年08月：サムスカOD錠7.5/15/30mgの製造販売承認を取得

2020年06月：「抗利尿ホルモン不適合分泌症候群 (SIADH) における低ナトリウム血症の改善」の効能又は効果が追加

2021年3月31日：サムスカ錠7.5/15/30mgの経過措置期間終了 (⇒普通錠の販売中止)

【有効成分の特徴】

白色の結晶又は結晶性の粉末で顕著な吸湿性や遮光が必要な注意点などは特になし。

☆評価☆

- ★顆粒剤型に関しては大きな差異はないため比較は見送る。
 - ★OD錠に関しては製剤的な差異が少ない中で、「トーワ」のみペパーミント風味、大きさが一回り大きい点が他社と異なる。
 - ★GS1コードはAGである「オツカ」のみ2錠ずつに対応だが、その他は1錠ずつに対応しており評価できる。
 - ★OD錠・顆粒を販売しているのは「トーワ」「サワイ」の2社、その他はOD錠のみの発売である。
 - ★AGである「オツカ」が顆粒を発売しなかったのは市場的な判断と思われるが、AGだからこそ、ラインナップは先発品に倣うことを期待するところである。
- 剤型のラインナップや錠剤の大きさを評価の重点においた結果、
「沢井製薬 (トルバプタンOD錠・顆粒1%「サワイ」)」
 を推奨メーカーとする。

☆OD錠の比較☆

【錠剤の外観】

<剤形・色調> 全ての製剤が先発品と同じく青系～青系調であり、2.5mgは変形長方形、15mgは円形。

<大きさ> 「トーワ」が一回り大きく、他全ての製剤は先発品と同等で大きな違いはない。

<割線> 「トーワ」の15mgは片面割線で、他全ての製剤は両面に割線あり。

【包装規格】

「トーワ」のみ「20錠・60錠包装」、他全てのメーカーは先発品同様「20錠・100錠包装」。

【PTPデザイン】

<色調> 全ての製剤において先発品に倣い、7.5mgは青地の、15mgは白地のPTPデザインとなっている。

<GS1コード> 「オツカ」のみ2錠ずつに対応。その他は1錠ずつに対応。

【安定性】

全ての製剤において、少なくとも3か月は過酷試験内において安定であり、一包化可。

【味】

「トーワ」は「ペパーミント風味」であり、他全ての製剤は先発品と同様スクラロース由来の「わずかな甘み」がある。

参考資料：各社Web・DI学術、添付文書、IF