＊＊2023年10月改訂（第８版）
＊2020年５月改訂

日本標準商品分類番号
８７２２５９

貯　　法	室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

	0.5mg	1 mg	2 mg
承認番号	22100AMX01005	22100AMX01007	22100AMX01006
薬価収載	2009年11月	2009年11月	2009年11月
販売開始	2009年11月	2009年11月	2009年11月

経皮吸収型・気管支拡張剤

処方箋医薬品※

日本薬局方 ツロブテロール経皮吸収型テープ

ツロブテロールテープ0.5mg「NP」
ツロブテロールテープ1mg「NP」
ツロブテロールテープ2mg「NP」

TULOBUTEROL TAPE「NP」

※注意－医師等の処方箋により使用すること

【禁忌】（次の患者には使用しないこと）
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組　成　・　性　状】

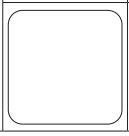
1．組成

１枚中にそれぞれ次の成分を含有

販　売　名	有効成分	添　加　物
ツロブテロールテープ0.5mg「NP」	ツロブテロール（日局）0.5mg	ミリスチン酸イソプロピル、アクリル酸2-エチルヘキシル・ジアセトンアクリルアミド・メタクリル酸アセトアセトキシエチル・メタクリル酸メチル共重合体溶液
ツロブテロールテープ１mg「NP」	ツロブテロール（日局）１mg	
ツロブテロールテープ２mg「NP」	ツロブテロール（日局）２mg	

2．製剤の性状

膏体を支持体に展延した四隅が丸い四角形の粘着テープ剤で、膏体面は無色透明のライナーで覆われている。

販　売　名	色	外　形	大きさ	識　別コード
ツロブテロールテープ0.5mg「NP」	無色～微黄色透明（膏体）		16mm×16mm（2.5cm²）	NP-531
ツロブテロールテープ１mg「NP」			22.5mm×22.5mm（5cm²）	NP-532
ツロブテロールテープ２mg「NP」			32mm×32mm（10cm²）	NP-533

【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、急性気管支炎、慢性気管支炎、肺気腫

【用　法　・　用　量】

通常、成人にはツロブテロールとして２mg、小児にはツロブテロールとして0.5～３歳未満には0.5mg、３～９歳未満には１mg、９歳以上には２mgを１日１回、胸部、背部又は上腕部のいずれかに貼付する。

【使　用　上　の　注　意】

1．慎重投与（次の患者には慎重に使用すること）

（１）甲状腺機能亢進症の患者［症状が増悪するおそれがある。］
（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［心悸亢進、不整脈等があらわれることがある。］
（４）糖尿病の患者［糖代謝が亢進し、血中グルコースが増加するおそれがある。］
（５）アトピー性皮膚炎の患者［貼付部位にそう痒感、発赤等があらわれやすい。］
（６）高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

2．重要な基本的注意

（１）気管支喘息治療における長期管理の基本は、吸入ステロイド剤等の抗炎症剤の使用であり、吸入ステロイド剤等により症状の改善が得られない場合、あるいは患者の重症度から吸入ステロイド剤等との併用による治療が適切と判断された場合にのみ、本剤と吸入ステロイド剤等を併用して使用すること。
本剤は吸入ステロイド剤等の抗炎症剤の代替薬ではないため、患者が本剤の使用により症状改善を感じた場合であっても、医師の指示なく吸入ステロイド剤等を減量又は中止し、本剤を単独で用いることのないよう、患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

＊（２）気管支喘息、慢性気管支炎又は肺気腫治療の長期管理において、本剤の投与期間中に発現する急性発作に対しては、短時間作動型吸入β_2刺激薬等の他の適切な薬剤を使用するよう患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。
また、その薬剤の使用量が増加したり、効果が十分でなくなってきた場合には、疾患の管理が十分でないことが考えられるので、可及的速やかに医療機関を受診し治療を受けるよう患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

＊（３）気管支喘息治療において、短時間作動型β_2刺激薬等、急性発作を緩和するための薬剤の使用量が増加したり、効果が十分でなくなってきた場合には、生命を脅かす可能性があるので、吸入ステロイド剤等の増量等の抗炎症療法の強化を行うこと。

（４）用法・用量通り正しく使用しても効果が認められない場合（目安は１～２週間程度）は、本剤が適当でないと考えられるので、使用を中止すること。なお、小児に使用する場合には、使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。

（５）用法・用量を超えて使用を続けた場合、不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがあるので、用法・用量を超えて使用し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
カテコールアミン製剤 アドレナリン イソプロテレノール 等	不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがある。	本剤及びカテコールアミン製剤はともに交感神経刺激作用を持つ。

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 ジプロフィリン 等	低カリウム血症による不整脈を起こすおそれがある。	本剤及びキサンチン誘導体はともに細胞内へのカリウム移行作用を持つ。
ステロイド剤 プレドニゾロン ベタメタゾン ヒドロコルチゾン 等 利尿剤 トリクロルメチアジド フロセミド アセタゾラミド 等	低カリウム血症による不整脈を起こすおそれがある。	これらの薬剤は尿中へのカリウム排泄を増加させる。

4.副作用

本剤は、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)

1)アナフィラキシー

アナフィラキシーを起こすことがあるので、観察を十分に行い、呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等の症状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)重篤な血清カリウム値の低下

β_2刺激薬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、β_2刺激薬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。更に、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

	頻度不明
過敏症注)	発疹、そう痒症、蕁麻疹
循環器	心悸亢進、顔面紅潮、不整脈、頻脈
精神神経系	振戦、頭痛、不眠、全身倦怠感、めまい、興奮、しびれ感、筋痙縮、熱感、こわばり感
消化器	悪心・嘔吐、食欲不振、下痢、胃部不快感
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇
血液	好酸球数増加
皮膚	適用部位そう痒感、適用部位紅斑、接触性皮膚炎、適用部位疼痛、適用部位変色
その他	CK(CPK)上昇、血清カリウム値の低下、胸痛、浮腫、口渇、筋肉痛

注)症状が認められた場合には使用を中止すること。

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、低用量から使用を開始するなど慎重に使用すること。

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使用すること。[妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。]

(2)授乳中の婦人には本剤使用中は授乳を避けさせること。[動物試験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。]

7.小児等への投与

(1)6カ月未満の乳児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

(2)小児等における長期投与時の安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

8.適用上の注意

貼付部位

(1)貼付部位の皮膚を拭い、清潔にしてから本剤を貼付すること。

(2)皮膚刺激を避けるため、毎回貼付部位を変えることが望ましい。

(3)本剤をはがす可能性がある小児には、手の届かない部位に貼付することが望ましい。

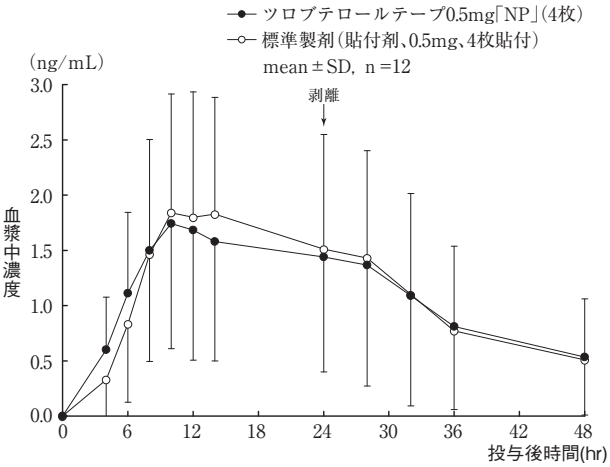
(4)動物試験(ラット)で損傷皮膚に貼付した場合、血中濃度の上昇が認められたので、創傷面に使用しないこと。

【薬物動態】

生物学的同等性試験

(1)ツロブテロールテープ0.5mg「NP」

ツロブテロールテープ0.5mg「NP」と標準製剤のそれぞれ4枚(ツロブテロールとして2mg)を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に胸部単回貼付(24時間)して血漿中ツロブテロール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ($AUC_{0\to48hr}$、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。[1)]



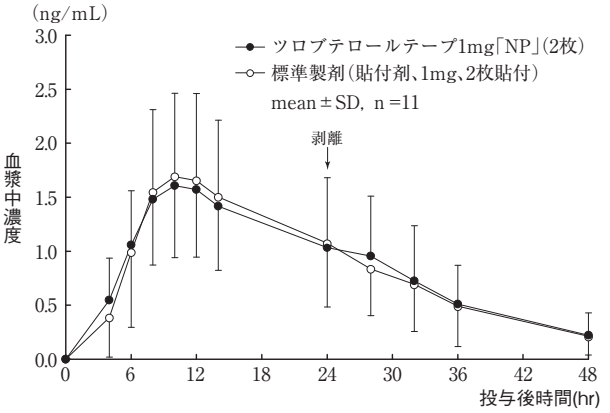
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48hr}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ツロブテロールテープ0.5mg「NP」(4枚貼付)	52.96 ±38.96	1.88 ±1.12	12.50 ±6.72	15.95 ±8.19
標準製剤(貼付剤、0.5mg、4枚貼付)	53.72 ±36.74	1.99 ±1.11	13.50 ±6.16	16.05 ±13.50

(mean±SD,n=12)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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)ツロブテロールテープ1mg「NP」

ツロブテロールテープ1mg「NP」と標準製剤のそれぞれ2枚(ツロブテロールとして2mg)を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に胸部単回貼付(24時間)して血漿中ツロブテロール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ($AUC_{0\to48hr}$、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。[2)]



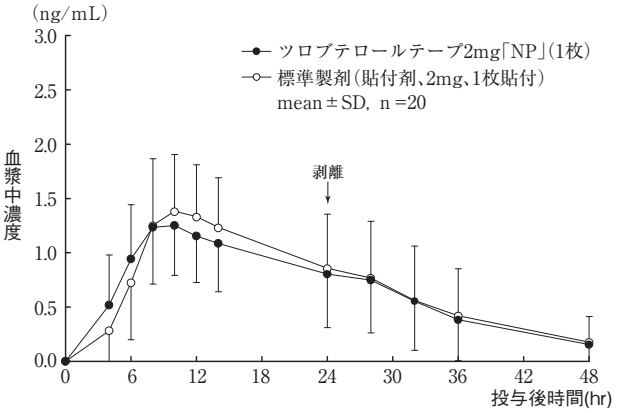
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48hr}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ツロブテロールテープ1㎎「NP」（2枚貼付）	40.95 ±19.32	1.70 ±0.69	10.18 ±1.40	9.73 ±2.61
標準製剤（貼付剤、1mg、2枚貼付）	40.78 ±19.99	1.86 ±0.79	10.73 ±2.57	9.86 ±2.34

（mean±SD,n=11）

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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。

（3）ツロブテロールテープ2mg「NP」

ツロブテロールテープ2㎎「NP」と標準製剤のそれぞれ1枚（ツロブテロールとして2㎎）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に胸部単回貼付（24時間）して血漿中ツロブテロール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（$AUC_{0\to48hr}$、Cmax）について90％信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。[3]



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48hr}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ツロブテロールテープ2mg「NP」（1枚貼付）	32.09 ±15.56	1.39 ±0.52	11.30 ±5.63	8.22 ±3.12
標準製剤（貼付剤、2mg、1枚貼付）	33.40 ±15.82	1.53 ±0.58	11.70 ±4.41	9.02 ±2.76

（mean±SD,n=20）

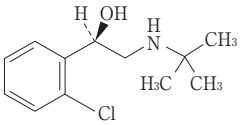
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬　効　薬　理】

選択的アドレナリンβ2受容体作動薬。β2受容体刺激により多くの平滑筋を弛緩させるが、β1受容体刺激による心臓促進作用は弱い。臨床的には、気管支平滑筋弛緩作用を利用して気管支拡張薬として用いられる。β受容体に対する選択性は完全ではないので、心臓興奮に由来する副作用（不整脈など）が全く起こらないわけではない。[4]

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ツロブテロール（Tulobuterol）
化学名：(1*RS*)-1-(2-Chlorophenyl)-2-(1,1-dimethylethyl) aminoethanol
分子式：$C_{12}H_{18}ClNO$
分子量：227.73
構造式：



及び鏡像異性体

性　状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。メタノールに極めて溶けやすく、エタノール(99.5)又は酢酸(100)に溶けやすく、水にほとんど溶けない。0.1mol/L塩酸試液に溶ける。40℃で徐々に昇華する。メタノール溶液(1→20)は旋光性を示さない。
融　点：90～93℃

【取 扱 い 上 の 注 意】

1．使用時及び保管についての注意

患者には本剤を内袋のまま渡し、本剤を使用するときに内袋から取り出すように指示すること。

2．安定性試験

（1）ツロブテロールテープ0.5mg「NP」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度60％、2年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ツロブテロールテープ0.5mg「NP」は通常の市場流通下において、2年間安定であることが確認された。[5]

（2）ツロブテロールテープ1mg「NP」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度60％、2年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ツロブテロールテープ1mg「NP」は通常の市場流通下において、2年間安定であることが確認された。[6]

（3）ツロブテロールテープ2mg「NP」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度60％、2年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ツロブテロールテープ2mg「NP」は通常の市場流通下において、2年間安定であることが確認された。[7]

【　包　　装　】

ツロブテロールテープ0.5mg「NP」：70枚（1枚×70）
ツロブテロールテープ1mg「NP」：70枚（1枚×70）
ツロブテロールテープ2mg「NP」：70枚（1枚×70）

【主　要　文　献】

1）ニプロ㈱社内資料：ツロブテロールテープ0.5mg「NP」の生物学的同等性試験
2）ニプロ㈱社内資料：ツロブテロールテープ1mg「NP」の生物学的同等性試験
3）ニプロ㈱社内資料：ツロブテロールテープ2mg「NP」の生物学的同等性試験
4）第十七改正日本薬局方解説書　廣川書店　2016：C3141-3144
5）ニプロ㈱社内資料：ツロブテロールテープ0.5mg「NP」の安定性試験
6）ニプロ㈱社内資料：ツロブテロールテープ1mg「NP」の安定性試験
7）ニプロ㈱社内資料：ツロブテロールテープ2mg「NP」の安定性試験

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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ください。

第一三共エスファ株式会社　お客様相談室
〒103－8426　東京都中央区日本橋本町3－5－1
TEL：0120－100－601

** NIPRO
製造販売　ニプロ株式会社
大阪府摂津市千里丘新町3番26号
販売元
第一三共エスファ株式会社
東京都中央区日本橋本町3-5-1
販売提携
Daiichi-Sankyo
第一三共株式会社
東京都中央区日本橋本町3-5-1