

**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

**抗てんかん剤**

**ラコサミド錠**

**ラコサミド錠50mg「サワイ」**  
**ラコサミド錠100mg「サワイ」**

ラコサミドドライシロップ

**ラコサミドロス10%「サワイ」**

**LACOSAMIDE Tablets, DS [SAWAI]**

剤 形	錠50mg/錠100mg : 割線入りフィルムコーティング錠 DS10% : ドライシロップ
製 剤 の 規 制 区 分	劇薬、処方箋医薬品 <small>注)</small> <small>注)注意—医師等の処方箋により使用すること</small>
規 格 ・ 含 量	錠50mg : 1錠中ラコサミド50mg含有 錠100mg : 1錠中ラコサミド100mg含有 DS10% : 1g中ラコサミド100mg含有
一 般 名	和名 : ラコサミド(JAN) 洋名 : Lacosamide(JAN)
製 造 販 売 承 認 年 月 日	製造販売承認年月日 : 2025年8月15日
薬 価 基 準 収 載 年 月 日	薬価基準収載年月日 : 2025年12月5日
販 売 開 始 年 月 日	販売開始年月日 : 2025年12月5日
製 造 販 売 (輸 入) ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元 : 沢井製薬株式会社
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	
問 い 合 わ せ 窓 口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL : 0120-381-999、FAX : 06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト : <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2025年12月改訂の電子添文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 ー日本病院薬剤師会ー

## 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(<http://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、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。

(2020年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目 .....	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 .....	37
1. 開発の経緯 .....	1	1. 警告内容とその理由 .....	37
2. 製品の治療学的特性 .....	1	2. 禁忌内容とその理由 .....	37
3. 製品の製剤学的特性 .....	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 .....	37
4. 適正使用に関して周知すべき特性 .....	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 .....	37
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 .....	1	5. 重要な基本的注意とその理由 .....	37
6. RMPの概要 .....	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....	38
7. その他の注意 .....	39	7. 相互作用 .....	39
II. 名称に関する項目 .....	3	8. 副作用 .....	39
1. 販売名 .....	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	40
2. 一般名 .....	3	10. 過量投与 .....	40
3. 構造式又は示性式 .....	3	11. 適用上の注意 .....	40
4. 分子式及び分子量 .....	3	12. その他の注意 .....	41
5. 化学名(命名法)又は本質 .....	3		
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	4		
III. 有効成分に関する項目 .....	5	IX. 非臨床試験に関する項目 .....	42
1. 物理化学的性質 .....	5	1. 薬理試験 .....	42
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	5	2. 毒性試験 .....	42
3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....	5		
IV. 製剤に関する項目 .....	6	X. 管理的事項に関する項目 .....	43
1. 剤形 .....	6	1. 規制区分 .....	43
2. 製剤の組成 .....	7	2. 有効期間 .....	43
3. 添付溶解液の組成及び容量 .....	7	3. 包装状態での貯法 .....	43
4. 力価 .....	7	4. 取扱い上の注意 .....	43
5. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7	5. 患者向け資材 .....	43
6. 製剤の各種条件下における安定性 .....	7	6. 同一成分・同効薬 .....	43
7. 調製法及び溶解後の安定性 .....	15	7. 国際誕生年月日 .....	43
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化) .....	16	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 .....	43
9. 溶出性 .....	16	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 .....	43
10. 容器・包装 .....	19	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容 .....	44
11. 別途提供される資材類 .....	20	11. 再審査期間 .....	44
12. その他 .....	20	12. 投薬期間制限に関する情報 .....	44
13. 各種コード .....	44	13. 保険給付上の注意 .....	44
14. 保険給付上の注意 .....	44		
V. 治療に関する項目 .....	21	XI. 文献 .....	45
1. 効能又は効果 .....	21	1. 引用文献 .....	45
2. 効能又は効果に関連する注意 .....	21	2. その他の参考文献 .....	46
3. 用法及び用量 .....	21		
4. 用法及び用量に関連する注意 .....	22	XII. 参考資料 .....	47
5. 臨床成績 .....	22	1. 主な外国での発売状況 .....	47
VI. 薬効薬理に関する項目 .....	27	2. 海外における臨床支援情報 .....	47
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .....	27		
2. 薬理作用 .....	27	XIII. 備考 .....	48
VII. 薬物動態に関する項目 .....	28	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 .....	48
1. 血中濃度の推移 .....	28	2. その他の関連資料 .....	51
2. 薬物速度論的パラメータ .....	32		
3. 母集団(ポピュレーション)解析 .....	33		
4. 吸収 .....	33		
5. 分布 .....	34		
6. 代謝 .....	34		
7. 排泄 .....	35		
8. トランスポーターに関する情報 .....	35		
9. 透析等による除去率 .....	35		
10. 特定の背景を有する患者 .....	35		
11. その他 .....	36		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ラコサミド錠50mg/錠100mg／DS10%「サワイ」は、ラコサミドを含有する抗てんかん剤である。本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準備した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2025年8月
上市	2025年12月

2025年12月に「他の抗てんかん薬で十分な効果が認められないてんかん患者の強直間代発作に対する抗てんかん薬との併用療法」の効能又は効果が追加承認された。(X. -9. 参照)

### 2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤は、「てんかん患者の部分発作(二次性全般化発作を含む)」の効能又は効果を有する。(V. -1. 参照)
- 2) ラコサミドは電位依存性ナトリウムチャネルの緩徐な不活性化を選択的に促進し、過興奮状態にある神経細胞膜を安定化させることによって抗けいれん作用を示すと考えられている<sup>1)</sup>。(VI. -2. 参照)
- 3) 重大な副作用として、房室ブロック、徐脈、失神、中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、薬剤性過敏症症候群、無顆粒球症が報告されている。(VIII. -8. 参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

「IV. 製剤に関する項目」及び沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」  
<https://med.sawai.co.jp/> 参照

### 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材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	有: I. -6. 参照
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	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

(2025年12月5日時点)

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### 1) 承認条件

21. 承認条件  
 医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

#### 2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

## I. 概要に関する項目

### 6. RMPの概要

#### 医薬品リスク管理計画書(RMP)の概要

1.1. 安全性検討事項		
【重要な特定されたリスク】	【重要な潜在的リスク】	【重要な不足情報】
心電図PR延長関連事象(房室ブロック、徐脈、失神等) 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群) 薬剤性過敏症症候群 無顆粒球症	自殺行動、自殺念慮	なし
1.2. 有効性に関する検討事項		
使用実態下における有効性		
↓上記に基づく安全性監視のための活動		
2. 医薬品安全性監視計画の概要	↓上記に基づくリスク最小化のための活動	
通常の医薬品安全性監視活動	4. リスク最小化計画の概要	
副作用、文献・学会情報及び外国措置報告等の収集・確認・分析に基づく安全対策の検討(及び実行)	通常のリスク最小化活動	
追加の医薬品安全性監視活動	電子添文及び患者向医薬品ガイドによる情報提供	
特定使用成績調査(強直間代発作) [小児]	追加のリスク最小化活動	
3. 有効性に関する調査・試験の計画	なし	
なし		

(2025年12月5日時点)

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名 .....

#### 1) 和名

ラコサミド錠50mg「サワイ」

ラコサミド錠100mg「サワイ」

ラコサミドDS10%「サワイ」

#### 2) 洋名

LACOSAMIDE Tablets [SAWAI]

LACOSAMIDE DS [SAWAI]

#### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

### 2. 一般名 .....

#### 1) 和名(命名法)

ラコサミド(JAN)

#### 2) 洋名(命名法)

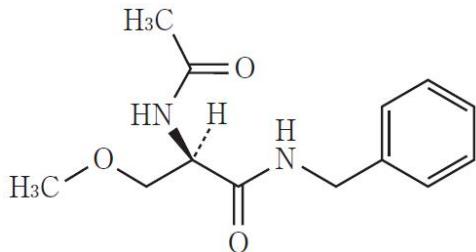
Lacosamide (JAN)

lacosamide (INN)

#### 3) ステム(stem)

不明

### 3. 構造式又は示性式 .....



### 4. 分子式及び分子量 .....

分子式: C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>

分子量: 250.29

### 5. 化学名(命名法)又は本質 .....

(2R)-2-Acetamido-N-benzyl-3-methoxypropanamide

II. 名称に関する項目

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～淡黄色の粉末である。

##### 2) 溶解性

メタノールに溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けやすく、水にやや溶けにくく、ヘプタンにほとんど溶けない。

##### 3) 吸湿性

吸湿性は認められない。

##### 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

該当資料なし

#### 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 ······

##### <確認試験法>

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法

##### <定量法>

液体クロマトグラフィー

## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

## 1) 剤形の区別

ラコサミド錠50mg/錠100mg「サワイ」：割線入りフィルムコーティング錠

ラコサミドDS10%「サワイ」：ドライシロップ

## 2) 製剤の外観及び性状

品名	ラコサミド錠50mg「サワイ」	ラコサミド錠100mg「サワイ」
外 形		
性 状	ピンク色	濃黄色
直径(mm)	9.2×4.3	12.2×5.6
厚さ(mm)	3.0	3.5
重量(mg)	約95	約190

品名	ラコサミドDS10%「サワイ」
性 状	白色～微黄白色の顆粒

オレンジ様芳香、添加剤由来の甘みを有する。

## 3) 識別コード

## ● ラコサミド錠50mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：ラコサミド 50 サワイ

## ● ラコサミド錠100mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：ラコサミド 100 サワイ

## ● ラコサミドDS10%「サワイ」

該当しない

## 4) 製剤の物性

## ● ラコサミド錠50mg/錠100mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## ● ラコサミドDS10%「サワイ」

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## 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

品名	ラコサミド錠50mg「サワイ」	ラコサミド錠100mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	ラコサミド	
	50mg	100mg
添加剤	カルナウバロウ、クロスボビドン、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース	
	酸化鉄、青色2号アルミニウムレーキ	—

品名	ラコサミドDS10%「サワイ」
有効成分 [1g中]	ラコサミド 100mg
添加剤	クロスボビドン、軽質無水ケイ酸、スクラロース、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール、ラウリル硫酸Na、香料

## 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

## ●ラコサミド錠50mg「サワイ」

1) 加速試験<sup>2)</sup>

## 目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を短期間で推定するため、加速試験を実施する。

## 方法

「安定性試験ガイドラインの改定について」(平成15年6月3日 医薬審発第0603001号)に基づいて、本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

#### IV. 製剤に関する項目

##### 試験条件及び検体

保存条件	40±2°C/75±5%RH		
保存期間	6ヶ月		
試験回数	3回/ロット		
保存形態	PTP包装	PTP(ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム/アルミニウム箔)/紙箱	
	バラ包装	バラ(白色ポリエチレン瓶/白色ポリプロピレンキャップ)/紙箱	
ロット番号	PTP包装	①801T1S0883、②801T1S0884、③801T1S0885	
	バラ包装	④801T1S0883、⑤801T1S0884、⑥801T1S0885	

##### 結果

いずれのロットもすべての試験項目において規格に適合した。

試験項目	ロット番号	イニシャル			6ヶ月後		
		①	②	③	①	②	③
性状		ピンク色の割線入りフィルムコートィング錠					
確認試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合
水分		適合	適合	適合	適合	適合	適合
質量偏差試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合
試験項目	ロット番号	イニシャル			6ヶ月後		
		④	⑤	⑥	④	⑤	⑥
性状		ピンク色の割線入りフィルムコートィング錠					
確認試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合
水分		適合	適合	適合	適合	適合	適合
質量偏差試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験		適合	適合	適合	適合	適合	適合

##### 結論

本製剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

##### 2)無包装下の安定性試験<sup>3)</sup>

###### 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

###### 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

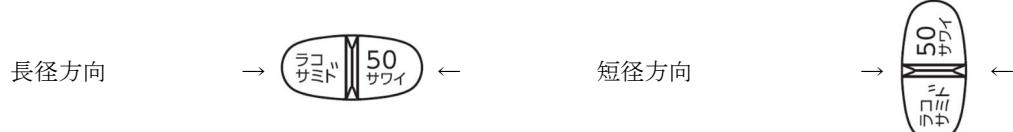
## 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件		
801T1S0884	温度	40°C、遮光気密容器	
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放	
	室温	25°C/60%RH、遮光開放	
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(5000lx)、開放	

## 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・硬度*(5錠の平均値)・水分・溶出試験・定量試験	1回

\* : 本製剤の未設定規格のため参考値(長径及び短径に並行に荷重をかけて測定)



## 結果

保存条件・期間	試験項目	性状	硬度(N)		水分	溶出試験	定量試験*
			長径方向	短径方向			
	イニシャル	(a)	87.8	107.6	適合	適合	100.0
温度	5週	変化なし	変化なし 96.0	変化なし 95.4	—	変化なし	変化なし 101.7
	13週	変化なし	変化なし 87.0	変化なし 105.6	—	変化なし	変化なし 100.3
湿度	5週	変化なし	変化なし 89.2	変化なし 103.0	—	変化なし	変化なし 102.1
	13週	変化なし	変化なし 97.0	変化なし 98.4	変化なし	変化なし	変化なし 100.8
室温	5週	変化なし	変化なし 87.6	変化なし 107.6	—	変化なし	変化なし 101.3
	13週	変化なし	変化なし 91.6	変化なし 104.4	—	変化なし	変化なし 98.7
光	60万lx·h	変化なし	変化なし 87.4	変化なし 107.8	—	変化なし	変化なし 101.0
	120万lx·h	変化なし	変化なし 87.0	変化なし 107.4	—	変化なし	変化なし 99.9

\*: イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a) : ピンク色の割線入りフィルムコーティング錠

— : 実施なし

3) 分割後の安定性試験<sup>4)</sup>

## 目的

本製剤の分割後の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

本製剤を割線に沿って二分割\*し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>5)</sup>に従い評価する。

\* : 分割操作は「Cleyera錠剤カッター CHOPPER TAB-C-1」を使用

#### IV. 製剤に関する項目

##### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
801T1S0884	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(5000lx)、開放

##### 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状 <sup>†</sup> ・定量試験・含量均一性試験	1回

†：分割面は未設定規格のため参考として記載

##### 結果

保存条件・期間	試験項目	性状		定量試験*	含量均一性試験
		表面	分割面		
	イニシャル	ピンク色	白色	100.0	適合
室温	5週	変化なし	変化なし	変化なし 99.2	—
	13週	変化なし	変化なし	変化なし 98.7	—
光	60万lx·h	変化なし	変化なし	変化なし 99.3	—
	120万lx·h	変化なし	変化なし	変化なし 99.4	—

\*：イニシャルを100としたときの含有率(%)

—：実施なし

#### ●ラコサミド錠100mg「サワイ」

##### 1) 加速試験<sup>5)</sup>

##### 目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を短期間で推定するため、加速試験を実施する。

##### 方法

「安定性試験ガイドラインの改定について」(平成15年6月3日 医薬審発第0603001号)に基づいて、本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

##### 試験条件及び検体

保存条件	40±2°C/75±5%RH	
保存期間	6ヶ月	
試験回数	3回/ロット	
保存形態	PTP包装	PTP(ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム/アルミニウム箔)/紙箱
	バラ包装	バラ(白色ポリエチレン瓶/白色ポリプロピレンキャップ)/紙箱
ロット番号	PTP包装	①801T2S0883、②801T2S0884、③801T2S0885
	バラ包装	④801T2S0883、⑤801T2S0884、⑥801T2S0885

**結果**

いずれのロットもすべての試験項目において規格に適合した。

PTP包装		イニシャル			6カ月後		
試験項目	ロット番号	①	②	③	①	②	③
性状	濃黄色の割線入りフィルムコートィング錠			濃黄色の割線入りフィルムコートィング錠			
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
水分	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
質量偏差試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合

バラ包装		イニシャル			6カ月後		
試験項目	ロット番号	④	⑤	⑥	④	⑤	⑥
性状	濃黄色の割線入りフィルムコートィング錠			濃黄色の割線入りフィルムコートィング錠			
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
水分	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
質量偏差試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合

**結論**

本製剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

**2) 無包装下の安定性試験<sup>6)</sup>****目的**

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

**方法**

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

**試験検体及び保存条件**

ロット番号	保存条件		
801T2S0884	温度	40°C、遮光気密容器	
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放	
	室温	25°C/60%RH、遮光開放	
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(5000lx)、開放	

**試験項目及び試験回数**

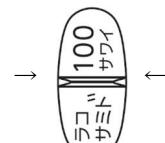
試験項目	試験回数
性状・硬度*(5錠の平均値)・水分・溶出試験・定量試験	1回

\* : 本製剤の未設定規格のため参考値(長径及び短径に並行に荷重をかけて測定)

長径方向



短径方向



#### IV. 製剤に関する項目

##### 結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(N)		水分	溶出試験	定量試験*
		長径方向	短径方向			
イニシャル	(a)	118.4	111.8	適合	適合	100.0
温度	5週	変化なし 122.2	変化なし 114.4	—	変化なし	変化なし 101.0
	13週	変化なし 119.0	変化なし 119.2	—	変化なし	変化なし 100.7
湿度	5週	変化なし 92.8	変化あり (規格内) 146.8	—	変化なし	変化なし 100.5
	13週	変化なし 131.0	変化なし 113.8	変化なし	変化なし	変化なし 100.8
室温	5週	変化なし 111.8	変化なし 115.4	—	変化なし	変化なし 100.7
	13週	変化なし 113.8	変化なし 124.6	—	変化なし	変化なし 99.0
光	60万lx・h	変化なし 112.6	変化なし 118.0	—	変化なし	変化なし 100.0
	120万lx・h	変化なし 113.8	変化なし 116.0	—	変化なし	変化なし 99.1

\*：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：濃黄色の割線入りフィルムコーティング錠

—：実施なし

##### 3) 分割後の安定性試験<sup>7)</sup>

###### 目的

本製剤の分割後の安定性を確認するため試験を実施する。

###### 方法

本製剤を割線に沿って二分割<sup>\*</sup>し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

\*：分割操作は「Cleyera錠剤カッター CHOPPER TAB-C-1」を使用

###### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
801T2S0884	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(5000lx)、開放

###### 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状 <sup>†</sup> ・定量試験・含量均一性試験	1回

†：分割面は未設定規格のため参考として記載

**結果**

試験項目 保存条件・期間	性状		定量試験*	含量均一性 試験
	表面	分割面		
イニシャル	濃黄色	白色	100.0	適合
室温	5週	変化なし	変化なし 100.0	—
	13週	変化なし	変化なし 100.0	—
光	60万lx·h	変化なし	変化なし 100.3	—
	120万lx·h	変化なし	変化なし 99.6	—

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

—：実施なし

**●ラコサミドDS10%「サワイ」****1) 加速試験<sup>8)</sup>****目的**

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を短期間で推定するため、加速試験を実施する。

**方法**

「安定性試験ガイドラインの改定について」(平成15年6月3日 医薬審発第0603001号)に基づいて、本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

**試験条件及び検体**

保存条件	40±2°C/75±5%RH
保存期間	6ヶ月
試験回数	3回/ロット
保存形態	バラ(白色ポリエチレン瓶/白色ポリプロピレンキャップ)/紙箱
ロット番号	①801L3S1513、②801L3S1514、③801L3S1515

**結果**

いずれのロットもすべての試験項目において規格に適合した。

試験項目 ロット番号	イニシャル			6ヶ月後			
	①	②	③	①	②	③	
性状	白色の顆粒			白色の顆粒			
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	

**結論**

本製剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

## IV. 製剤に関する項目

### 2) 無包装下の安定性試験<sup>9)</sup>

#### 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

#### 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

#### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件		
801L3S1514	温度	40°C、遮光気密容器	
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放	
	室温	25°C/60%RH、遮光開放	
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(5000lx)、開放	

#### 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・溶出試験・定量試験	1回

#### 結果

保存条件・期間	試験項目	性状	溶出試験	定量試験*
イニシャル	性状	白色の顆粒	適合	100.0
	溶出試験			
温度	5週	変化なし	変化なし	変化なし 100.9
	13週	変化なし	変化なし	変化なし 100.3
湿度	5週	変化なし	変化なし	変化なし 100.0
	13週	変化なし	変化なし	変化なし 97.9
室温	5週	変化なし	変化なし	変化なし 100.1
	13週	変化なし	変化なし	変化なし 99.1
光	60万lx·h	変化なし	変化なし	変化なし 98.8
	120万lx·h	変化なし	変化なし	変化なし 100.4

\*: イニシャルを100としたときの含有率(%)

#### A) 評価分類基準

##### 【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり(規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合

## 【硬度】

分類	評価基準
変化なし	硬度変化が30%未満の場合
変化あり(規格内)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合
変化あり(規格外)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合

## 【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

## ●ラコサミド錠50mg/錠100mg「サワイ」

該当しない

## ●ラコサミドDS10%「サワイ」

<懸濁後の安定性試験><sup>10)</sup>

## 目的

本製剤の懸濁後の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

本製剤1gを50mLの水に懸濁後、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施する。

## 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
801L3S1514	室温	23.5~23.8°C/50.1~52.9%RH、549~660lx(LEDランプ)、透明のガラス容器

## 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・定量試験	1回

## 結果

試験項目 保存条件・期間	性状	定量試験※
配合直後	わずかに白濁した液	100.0
室温(24h)	わずかに白濁した液	99.6

※：配合直後を100としたときの含有率(%)

#### IV. 製剤に関する項目

##### 8. 他剤との配合変化(物理化学的変化) ······

###### <配合変化試験>

###### ●ラコサミドDS10%「サワイ」<sup>11)</sup>

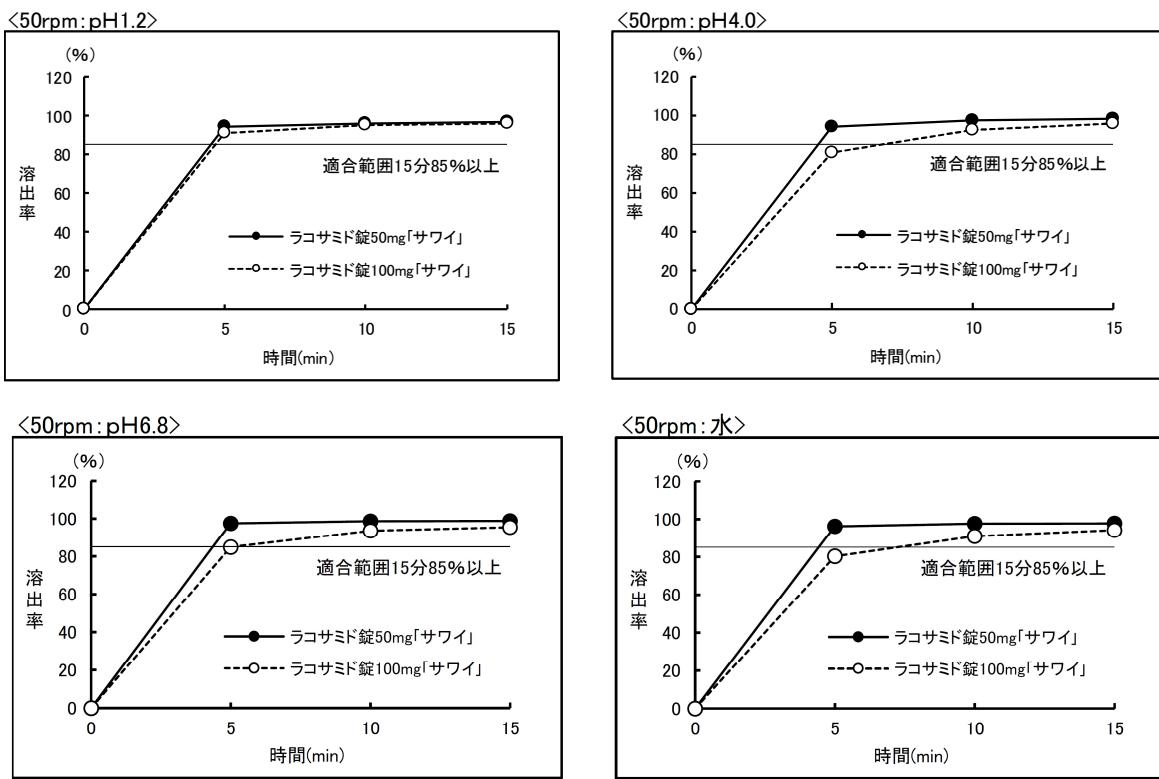
XIII. -2. 参照

##### 9. 溶出性 ······

###### <溶出挙動における同等性及び類似性>

###### ●ラコサミド錠50mg「サワイ」<sup>12)</sup>

目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の同等性の判定及び生物学的同等性の確認を行うため、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。	
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
条件	回転数・試験液	50rpm : pH1.2、50rpm : pH4.0、50rpm : pH6.8、50rpm : 水
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5°C
	試験数	12ベッセル
検体	試験製剤	ラコサミド錠50mg「サワイ」(ロット番号: 801T1S0884)
	標準製剤	ラコサミド錠100mg「サワイ」(ロット番号: 801T2S0884)
結果	<p>＜50rpm : pH1.2＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>＜50rpm : pH4.0＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>＜50rpm : pH6.8＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>＜50rpm : 水＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p>	
結論	以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。 本剤の処方変更水準はC水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。	

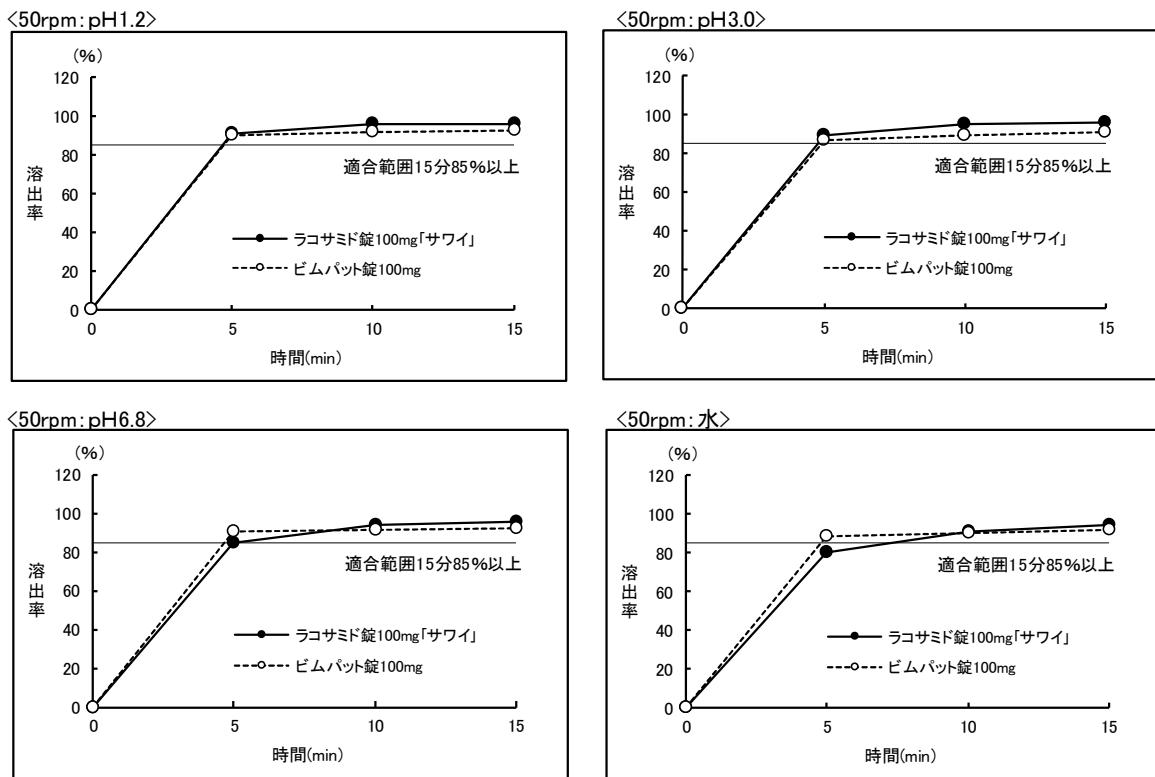


( └ : 判定基準の適合範囲)

● ラコサミド錠100mg「サワイ」<sup>13)</sup>

目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性の判定を行うため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。	
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
条件	回転数・試験液	50rpm : pH1.2、50rpm : pH3.0、50rpm : pH6.8、50rpm : 水
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5°C
	試験数	12ベッセル
検体	試験製剤	ラコサミド錠100mg「サワイ」(ロット番号 : 801T2S0884)
	標準製剤	ビムパット錠100mg(ロット番号 : 358879)
結果	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	<50rpm : pH3.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	<50rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	<50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	
結論		

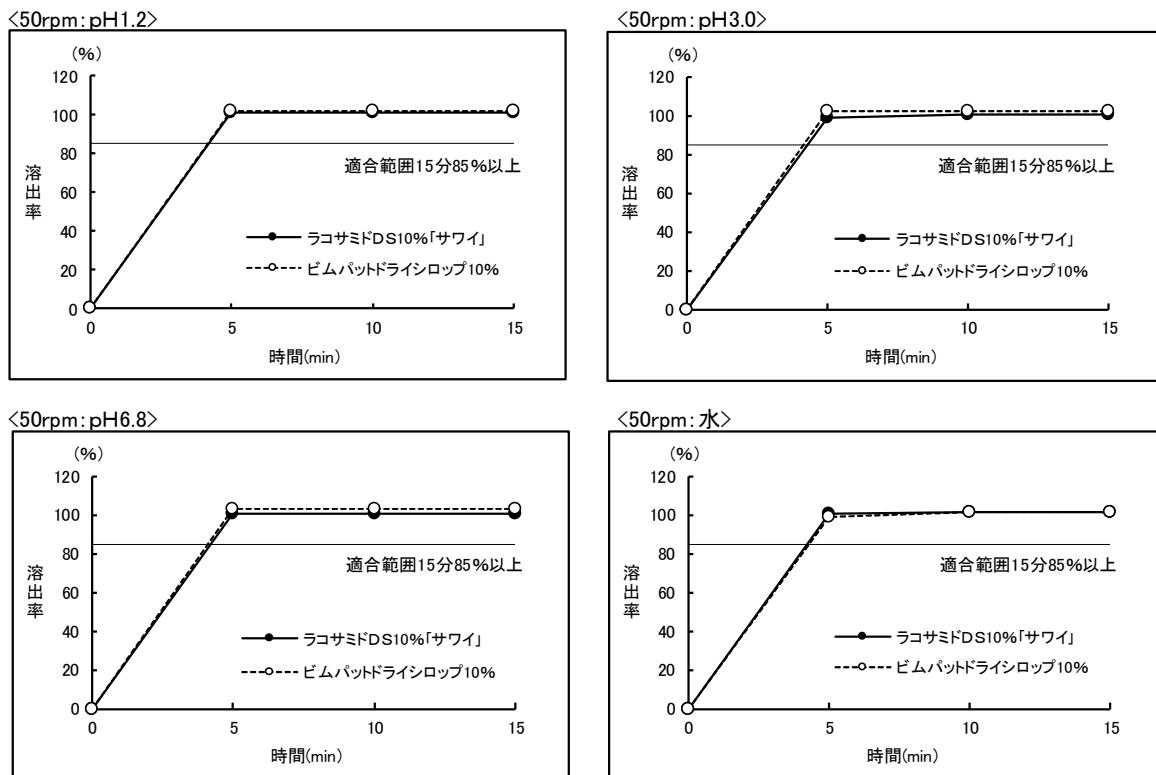
#### IV. 製剤に関する項目



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

#### ● ラコサミドDS10%「サワイ」<sup>14)</sup>

目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性の判定を行うため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。	
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
条件	回転数・試験液	50rpm : pH1.2、50rpm : pH3.0、50rpm : pH6.8、50rpm : 水
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5°C
	試験数	12ベッセル
検体	試験製剤	ラコサミドDS10%「サワイ」(ロット番号: 801L3S1514)
	標準製剤	ビムパットドライシロップ10% (ロット番号: 352813)
結果	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	<50rpm : pH3.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	<50rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	<50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。	
	以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	
結論		



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

## 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

該当資料なし

### 2) 包装

#### ● ラコサミド錠50mg/錠100mg「サワイ」

##### 22. 包装

〈ラコサミド錠50mg「サワイ」〉

PTP : 100錠(10錠×10)

バラ : 200錠

〈ラコサミド錠100mg「サワイ」〉

PTP : 100錠(10錠×10)

バラ : 200錠

#### ● ラコサミドDS10%「サワイ」

##### 22. 包装

〈ラコサミドDS10%「サワイ」〉

バラ : 100g

### 3) 予備容量

該当しない

## IV. 製剤に関する項目

### 4) 容器の材質

#### ●ラコサミド錠50mg/錠100mg「サワイ」

PTP : [PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミニウム箔

バラ : [本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

#### ●ラコサミドDS10%「サワイ」

バラ : [本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

### 11. 別途提供される資材類 .....

該当しない

### 12. その他 .....

#### <付着性確認試験>

#### ●ラコサミドDS10%「サワイ」<sup>15)</sup>

##### 目的

本製剤の包材に対する付着性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

1. 本製剤 1 g をポリエチレン製袋[ユニパックB-4]に入れて 100 回振とうさせた 後、本製剤を袋から取り出す。

2. 袋への付着量を測定し、付着率を算出する。

##### 試験検体及び試験回数

ロット番号	801L3S1514
試験回数	3回

##### 結果

平均付着率(%)	0.6%
----------	------

試験環境 : 24.2°C/50.8%RH

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 4. 効能又は効果

○てんかん患者の部分発作（二次性全般化発作を含む）

○他の抗てんかん薬で十分な効果が認められないてんかん患者の強直間代発作に対する抗てんかん薬との併用療法

### 2. 効能又は効果に関する注意

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

##### ●ラコサミド錠50mg/錠100mg「サワイ」

#### 6. 用法及び用量

成人：通常、成人にはラコサミドとして1日100mgより投与を開始し、その後1週間以上の間隔をあけて增量し、維持用量を1日200mgとするが、いずれも1日2回に分けて経口投与する。なお、症状により1日400mgを超えない範囲で適宜増減するが、增量は1週間以上の間隔をあけて1日用量として100mg以下ずつ行うこと。

小児：通常、4歳以上的小児にはラコサミドとして1日2mg/kgより投与を開始し、その後1週間以上の間隔をあけて1日用量として2mg/kgずつ增量し、維持用量を体重30kg未満の小児には1日6mg/kg、体重30kg以上50kg未満の小児には1日4mg/kgとする。いずれも1日2回に分けて経口投与する。なお、症状により体重30kg未満の小児には1日12mg/kg、体重30kg以上50kg未満の小児には1日8mg/kgを超えない範囲で適宜増減するが、增量は1週間以上の間隔をあけて1日用量として2mg/kg以下ずつ行うこと。ただし、体重50kg以上的小児では、成人と同じ用法・用量を用いること。

##### ●ラコサミドDS10%「サワイ」

#### 6. 用法及び用量

成人：通常、成人にはラコサミドとして1日100mg（ドライシロップとして1g）より投与を開始し、その後1週間以上の間隔をあけて增量し、維持用量を1日200mg（ドライシロップとして2g）とするが、いずれも1日2回に分けて用時懸濁して経口投与する。なお、症状により1日400mg（ドライシロップとして4g）を超えない範囲で適宜増減するが、增量は1週間以上の間隔をあけて1日用量として100mg（ドライシロップとして1g）以下ずつ行うこと。

小児：通常、4歳以上的小児にはラコサミドとして1日2mg/kg（ドライシロップとして20mg/kg）より投与を開始し、その後1週間以上の間隔をあけて1日用量として2mg/kg（ドライシロップとして20mg/kg）ずつ增量し、維持用量を体重30kg未満の小児には1日6mg/kg（ドライシロップとして60mg/kg）、体重30kg以上50kg未満の小児には1日4mg/kg（ドライシロップとして40mg/kg）とする。いずれも1日2回に分けて用時懸濁して経口投与する。なお、症状により体重30kg未満の小児には1日12mg/kg（ドライシロップとして120mg/kg）、体重30kg以上50kg未満の小児には1日8mg/kg（ドライシロップとして80mg/kg）を超えない範囲で適宜増減するが、增量は1週間以上の間隔をあけて1日用量として2mg/kg（ドライシロップとして20mg/kg）以下ずつ行うこと。ただし、体重50kg以上的小児では、成人と同じ用法・用量を用いること。

## V. 治療に関する項目

### 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

##### 7. 用法及び用量に関連する注意

###### 〈効能共通〉

7.1 クレアチニンクリアランスが30mL/min以下の重度及び末期腎機能障害のある患者には、成人は1日最高用量を300mg、小児は1日最高用量を25%減量とするなど慎重に投与すること。また、血液透析を受けている患者では、1日用量に加えて、血液透析後に最大で1回用量の半量の追加投与を考慮すること。[9.2.1、9.2.2、16.1.2、16.6.1、16.6.2参考]

7.2 軽度又は中等度の肝機能障害のある患者(Child-Pugh分類A及びB)には、成人は1日最高用量を300mg、小児は1日最高用量を25%減量とするなど慎重に投与すること。[9.3.2、16.6.3参考]

7.3 本剤の1日最高用量は体重30kg未満の小児では1日12mg/kg、体重30kg以上50kg未満の小児では1日8mg/kgである。本剤を1日8mg/kgを超えて投与している体重30kg未満の小児が、成長に伴い安定的に体重が30kg以上となった場合には、患者の状態を十分に観察し、効果及び副作用の発現を考慮したうえで、適切な用量を検討すること。なお、急激な減量は避けること。

###### 〈強直間代発作〉

7.4 本剤を強直間代発作に対して使用する場合には、他の抗てんかん薬と併用すること。[臨床試験において、強直間代発作に対する本剤単独投与での使用経験はない。]

#### 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

###### 17.3.1 心電図に対する影響

健康成人214例にラコサミド400mg/日、800mg/日<sup>注7)</sup>又はプラセボを1日2回に分けて6日間反復経口投与、又はモキシフロキサシン400mg/日を1日1回3日間反復経口投与したとき、ラコサミドはQTc間隔を延長しなかった。ラコサミド群のPR間隔の平均変化量は第6日目の投与1時間後に最大となり、プラセボ群との差は、400mg/日で7.3ms、800mg/日<sup>注7)</sup>で11.9msであった<sup>16)</sup>(外国人データ)。

注7) 本剤の承認された1日最高用量は400mgである。

##### 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

## 17.1 有効性及び安全性に関する試験

&lt;部分発作(二次性全般化発作を含む)&gt;

## 17.1.1 国際共同第Ⅲ相試験(単剤療法、成人)

新規に又は最近てんかんと診断された部分発作(二次性全般化発作を含む)又は未分類の全般性強直間代発作を有する16歳以上の患者を対象として、ラコサミド錠200～600mg/日<sup>注1)</sup>又はカルバマゼピン徐放錠(CBZ-CR)400～1200mg/日<sup>注2)</sup>を単剤にて経口投与したとき、主要評価項目であるKaplan-Meier法により推定した最終評価用量における6ヵ月間発作消失率は下表のとおりであり、群間差の95%信頼区間の下限値は予め設定された非劣性限界値(-12%)を上回ったこと、CBZ-CR群の6ヵ月間発作消失率に対する群間差の95%信頼区間の下限値の比(相対差)は、予め設定した非劣性限界値(-20%)を上回ったことから、CBZ-CRに対するラコサミド錠の非劣性が確認された<sup>17)</sup>。

解析対象集団	投与群	例数	発作が消失した患者数(割合(%))	発作消失率(%) [95%信頼区間] <sup>a)</sup>	群間差(%) [95%信頼区間] <sup>a),b)</sup>	相対差(%) <sup>c)</sup>
FAS <sup>d)</sup>	ラコサミド錠群	444 <sup>f)</sup>	327 (73.6)	89.8 [86.8, 92.8]	-1.3 [-5.5, 2.8]	-6.0
	CBZ-CR群	442 <sup>g)</sup>	308 (69.7)	91.1 [88.2, 94.0]		
PPS <sup>e)</sup>	ラコサミド錠群	408	307 (75.2)	91.5 [88.6, 94.3]	-1.3 [-5.3, 2.7]	-5.7
	CBZ-CR群	397	285 (71.8)	92.8 [90.0, 95.5]		

a) Kaplan-Meier法による推定値(過去3ヵ月間の発作回数(2回以下、3回以上)を層としてMantel-Haenszel法により調整)

b) ラコサミド錠群の消失率-CBZ-CR群の消失率

c) 消失率の群間差の95%信頼区間の下限値/CBZ-CR群の消失率×100

d) Full Analysis Set

e) Per Protocol Set

f) 日本人症例7例を含む

g) 日本人症例13例を含む

なお、事後解析結果によるラコサミド錠群で400mg/日超への增量が必要となった患者を効果不十分例として扱った場合のFASにおける発作が消失した患者数(割合(%))は308<sup>注3)</sup>/444例(69.4%)であり、Kaplan-Meier法により推定した発作消失率[95%信頼区間]は84.1%[80.5, 87.6]であった。

副作用発現頻度は、ラコサミド錠群で37.2%(165/444例)であった。主な副作用は、浮動性めまい7.9%(35/444例)、疲労5.6%(25/444例)、傾眠4.5%(20/444例)であった。

注1) 本剤の承認された1日最高用量は400mgである。

注2) カルバマゼピン徐放錠は本邦では承認されていない。

注3) 200～400mg/日投与で発作が消失した患者数。

## 17.1.3 国際共同第Ⅲ相試験(併用療法、成人)

既存の抗てんかん薬で十分な発作抑制効果が得られない部分発作を有する16歳以上の日本人及び中国人のてんかん患者547例(日本人患者142例を含む)を対象として、ラコサミド錠200、400mg/日又はプラセボを16週間経口投与(既存の抗てんかん薬1～3剤との併用)したとき、主要評価項目である観察期間に対する維持期間の28日あたりの部分発作回数変化量は下表のとおりであり、プラセボ群とラコサミド錠200mg/日及び400mg/日群との間で統計学的に有意な差が認められた。なお、各群における50%レスポンダーレート(28日あたりの部分発作回数が観察期間と比べて50%以上改善した患者の割合)は、プラセボ群19.7%(36/183例)、ラコサミド錠200mg/日群38.5%(70/182例)及びラコサミド錠400mg/日群49.2%(88/179例)であった<sup>18)</sup>。

## V. 治療に関する項目

	例数 <sup>a)</sup>	28日あたりの部分発作回数の変化量 <sup>b)</sup>	p値 <sup>c)</sup>	プラセボ群に対する減少率 <sup>d)</sup> [95%信頼区間]
プラセボ群	183	-1.22		
200mg/日群	182	-3.33	<0.001	29.4 [18.7, 38.7]
400mg/日群	179	-4.50	<0.001	39.6 [30.5, 47.6]

a)Full Analysis Set

b)中央値

c)対数変換した維持期間の28日あたりの部分発作回数を反応変数、投与群及び国を因子、対数変換した観察期間の28日あたりの部分発作回数を共変量とする共分散分析

d)共分散分析より推定された最小二乗平均値から計算した部分発作回数減少率(%)

副作用発現頻度は、ラコサミド錠群で47.7%(173/363例)であった。主な副作用は、浮動性めまい22.9%(83/363例)、傾眠8.8%(32/363例)、複視4.4%(16/363例)であった。

### 17.1.5 海外第Ⅲ相試験(小児)

既存の抗てんかん薬で十分な発作抑制効果が得られない部分発作を有する4歳以上17歳未満の小児てんかん患者343例を対象として、ラコサミド(体重30kg未満の患者は8～12mg/kg/日、体重30～50kg未満の患者は6～8mg/kg/日、体重50kg以上の患者は300～400mg/日)又はプラセボを16週間経口投与(既存の抗てんかん薬1～3剤との併用)したとき、主要評価項目である観察期間に対する維持期間の28日あたりの部分発作回数変化量は下表のとおりであり、プラセボ群とラコサミド群との間で統計学的に有意な差が認められた<sup>19)</sup>。

	例数 <sup>a)</sup>	28日あたりの部分発作回数の変化量 <sup>b)</sup>	p値 <sup>c)</sup>	プラセボ群に対する減少率 <sup>d)</sup> [95%信頼区間]
プラセボ群	170	-1.55		
ラコサミド群	170	-3.05	0.0003	31.72 [16.342, 44.277]

a)Full Analysis Set

プラセボ群の2例は、維持期間の発作回数データに欠測(発作日誌の項目の10%超)があったため、解析に含めなかった

b)中央値

c) $\ln(X+1)$ (Xは部分発作回数)で対数変換した部分発作回数を用い、投与群、併合した実施医療機関を因子とし、対数変換した観察期間の28日あたりの部分発作回数を共変量とした共分散分析

d)プラセボ群に対する減少率(%)= $100 \times \{1 - \exp(\text{最小二乗平均のラコサミド群とプラセボ群の差})\}$

副作用発現頻度は、ラコサミド群で33.9%(58/171例)であった。主な副作用は、傾眠14.0%(24/171例)、浮動性めまい8.8%(15/171例)であった。

### 〈強直間代発作〉

#### 17.1.7 国際共同第Ⅲ相試験(成人及び小児)

既存の抗てんかん薬で十分な発作抑制効果が得られない強直間代発作を有する4歳以上のてんかん患者242例(日本人患者30例を含む)を対象として、ラコサミド(体重30kg未満の小児患者は8～12mg/kg/日、体重30～50kg未満の小児患者は6～8mg/kg/日、体重50kg以上の小児及び成人患者は300～400mg/日)又はプラセボを最長で24週間経口投与(既存の抗てんかん薬1～3剤との併用)したとき、主要評価項目である24週間の治療期間における2回目の強直間代発作が発現するまでの時間は下表のとおりであり、プラセボとラコサミド群との間で統計学的に有意な差が認められた<sup>20)</sup>。

投与群	例数 <sup>a)</sup>	イベント発現までの日数(日) <sup>b)</sup> [95%信頼区間]	ハザード比 <sup>c)</sup> [95%信頼区間]	P値 <sup>c)</sup>
プラセボ群	121	77.0 [49.0, 128.0]	0.540 [0.377, 0.774]	<0.001
ラコサミド群	118	— [144.0, —]		

a) Full Analysis Set  
 ラコサミド群の1例は125件のイベントが発現した後に無作為化割付けされたため、2例は24週間の治療期間の発作情報が得られなかつたため、解析に含めなかつた  
 b) Kaplan-Meier法による24週間の治療期間における2回目の強直間代発作の発現までの時間の推定値（中央値）  
 「-」：ラコサミド群では24週間の治療期間に2回目の強直間代発作が50%以上の症例に認められなかつたため推定不能  
 c) 観察期間における28日あたりの強直間代発作の回数が2回以下の小児、2回以下の成人、2回超の小児又は成人を層としたCox比例ハザードモデルに基づく。Wald法により算出された  
 副作用発現頻度は、ラコサミド群で46.3% (56/121例) であった。主な副作用は、浮動性めまい17.4% (21/121例)、傾眠13.2% (16/121例)、悪心7.4% (9/121例) であった。

## (2) 安全性試験

### 〈部分発作(二次性全般化発作を含む)〉

#### 17.1.2 国内第Ⅲ相試験(単剤療法、成人)

1剤の既存の抗てんかん薬を投与している16歳以上の部分発作を有するてんかん患者を対象として、ラコサミド錠200～600mg/日<sup>注4)</sup>経口投与による単剤療法へ切り替えたとき、6カ月間発作消失患者の割合は46.2% (6/13例) であった<sup>21)</sup>。

副作用発現頻度は、84.2% (16/19例) であった。主な副作用は、浮動性めまい42.1% (8/19例)、傾眠31.6% (6/19例)、回転性めまい、悪心が各10.5% (2/19例) であった。

注4) 本剤の承認された1日最高用量は400mgである。

#### 17.1.4 国際共同長期継続投与試験(成人)

国際共同第Ⅲ相試験(併用療法)を完了した日本及び中国の患者473例(日本人患者123例を含む)を対象として、ラコサミド錠100～400mg/日を1日2回に分けて経口投与したとき(中間報告、最長767日投与)、先行試験の観察期間からの28日あたりの部分発作回数減少率の中央値は55.23%、50%レスポンダーレートは56.3% (265/471例) であった<sup>22)</sup>。副作用発現頻度は、ラコサミド錠群で42.9% (203/473例) であった。主な副作用は、浮動性めまい17.8% (84/473例)、傾眠5.7% (27/473例)、頭痛3.8% (18/473例) であった。

#### 17.1.6 国際共同第Ⅱ相長期継続投与試験(小児)

4歳から17歳の直接登録された小児てんかん患者136例(日本人46例、外国人90例)を対象として、ラコサミド12mg/kg/日(体重50kg以上の患者は600mg/日<sup>注5)</sup>)までを1日2回に分けて経口投与したとき、観察期間からの全治療期間における部分発作回数変化率の中央値は-52.73%(日本人で-27.63%、外国人で-60.56%)であった<sup>23)</sup>。

副作用発現頻度は、56.2% (77/137例) であった。主な副作用は、浮動性めまい20.4% (28/137例)、傾眠19.7% (27/137例)、振戦8.0% (11/137例) であった。

注5) 本剤の承認された1日最高用量は、成人及び体重50kg以上の小児には400mg、体重30kg以上50kg未満の小児には8mg/kg、体重30kg未満の小児には12mg/kgである。

## V. 治療に関する項目

### 〈強直間代発作〉

#### 17.1.8 國際共同長期継続投与試験(成人及び小児)

国際共同第III相試験(成人及び小児)を完了した患者及び当該試験での適格性基準のうち強直間代発作回数の基準のみを満たさなかった患者239例(日本人患者37例を含む)を対象として、ラコサミド(体重50kg未満の小児患者は4～12mg/kg/日、体重50kg以上の小児患者は200～600mg/日、成人患者は200～800mg/日<sup>注6)</sup>)を1日2回に分けて経口投与したとき(中間報告、最長1416日投与)、先行試験の観察期間からの治療期間における28日あたりの強直間代発作回数変化率の中央値は-88.52%であった<sup>24)</sup>。

副作用発現頻度は、34.7%(83/239例)であった。主な副作用は、浮動性めまい10.9%(26/239例)、傾眠5.9%(14/239例)、回転性めまい及び悪心3.8%(9/239例)であった。

注6)本剤の承認された1日最高用量は、成人及び体重50kg以上の小児には400mg、体重30kg以上50kg未満の小児には8mg/kg、体重30kg未満の小児には12mg/kgである。

#### 5) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### 6) 治療の使用

##### (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

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

電位依存性Naチャンネル抑制作用：

トピラマート、ラモトリギン、ルフィナミド<sup>25)</sup>

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### 1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

ラコサミドは電位依存性ナトリウムチャネルの緩徐な不活性化を選択的に促進し、過興奮状態にある神経細胞膜を安定化させることによって抗けいれん作用を示すと考えられている<sup>1)</sup>。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 てんかん発作に対する作用

ラコサミドは聴原性発作マウス、扁桃核キンドリング発作マウス、海馬キンドリング発作ラット、6 Hzてんかん発作マウス及び最大電気ショック発作(マウス、ラット)の部分発作及び全般発作を反映した動物モデルにおいて発作を抑制した<sup>26)</sup>。

##### 18.3 抗てんかん原性作用

扁桃核電気刺激キンドリングラットにおいて、キンドリング形成を抑制した<sup>27)</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 血中濃度

###### 16.1.1 成人

###### (1) 単回投与

健康成人男性18例にラコサミド100、200、400mgを空腹時に単回経口投与したとき、投与後0.5～4時間でCmaxに達し、t<sub>1/2</sub>は約14時間であった。AUC及びCmaxは投与量に比例して増加した<sup>28)</sup>。

単回投与時の薬物動態パラメータ

投与量	100mg	200mg	400mg
例数	12	11	12
AUC <sub>0-∞</sub> (μg·h/mL)	57.0[20.4]	116.4[18.2]	219.1[16.1]
AUC <sub>0-t</sub> (μg·h/mL)	55.0[18.7]	112.1[17.1]	212.5[15.0]
Cmax (μg/mL)	2.96[15.2]	5.84[25.0]	11.8[15.4]
t <sub>max</sub> (h)	1.00 (0.50-4.00)	1.00 (0.25-1.50)	1.00 (0.50-4.00)
t <sub>1/2</sub> (h)	14.0[20.2]	14.6[13.0]	13.7[15.3]
CL/F (L/h)	1.75[20.4]	1.72[18.2]	1.83[16.1]
Vd/F (L)	35.5[13.4]	36.3[13.0]	36.2[12.8]

幾何平均値[CV(%)]、t<sub>max</sub>は中央値(範囲)

###### (2) 反復投与

健康成人男性5例にラコサミド200mg/回を1日2回7日間反復経口投与したとき、血漿中ラコサミド濃度は投与開始から3日後に定常状態に到達した。AUC<sub>0-12h</sub>の累積係数は2.4であった<sup>29)</sup>(外国人データ)。

#### ●ラコサミドDS10%「サワイ」

##### 16.1.3 生物学的同等性

健康成人男性24例にラコサミド100mg(ドライシロップ10%を1g又は100mg錠を1錠)を空腹時単回投与したとき、ラコサミドの血漿中薬物動態パラメータは以下のとおりであった。ドライシロップ10%と100mg錠の生物学的同等性が確認された<sup>30)</sup>。

単回投与時の薬物動態パラメータ

薬物動態パラメータ	ドライシロップ10% (例数=24)	100mg錠 (例数=24)	幾何平均の比 <sup>a)</sup> (90%信頼区間)
Cmax (μg/mL)	4.46[23.5]	4.24[29.5]	1.05 (0.93-1.19)
AUC <sub>0-t</sub> (μg·h/mL)	56.2[14.7]	56.0[15.7]	1.00 (0.99-1.02)
t <sub>max</sub> (h)	0.25 (0.25-0.75)	0.50 (0.25-3.00)	—

Cmax及びAUC<sub>0-t</sub>は幾何平均値[CV(%)]

t<sub>max</sub>は中央値(範囲)

a) ドライシロップ/錠

## &lt;生物学的同等性試験&gt;

●ラコサミド錠50mg「サワイ」<sup>12)</sup>

## 16.8 その他

## &lt;ラコサミド錠50mg「サワイ」&gt;

ラコサミド錠50mg「サワイ」は溶出挙動に基づき、ラコサミド錠100mg「サワイ」と生物学的に同等とみなされた。

IV. -9. 参照

●ラコサミド錠100mg「サワイ」<sup>31, 32)</sup>

## 目的

ラコサミド錠100mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

## 方法

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、ラコサミド錠100mg「サワイ」とビムパット錠100mgをそれぞれ1錠(ラコサミドとして100mg)健康成人男性\*に絶食下単回経口投与し、血漿中ラコサミド濃度を測定する。

\* 薬物代謝酵素CYP2C19の遺伝子多型解析検査の表現型がPM(Poor Metabolizer)と判定された者を除く

採血時点	0、0.08、0.17、0.33、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12、24、48、72hr
休薬期間	7日間以上
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ラコサミド錠100mg「サワイ」(ロット番号:801T2S0884)
標準製剤	ビムパット錠100mg(ロット番号:358879)

## 評価

ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUC<sub>t</sub>およびC<sub>max</sub>の対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれlog(0.80)～log(1.25)の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

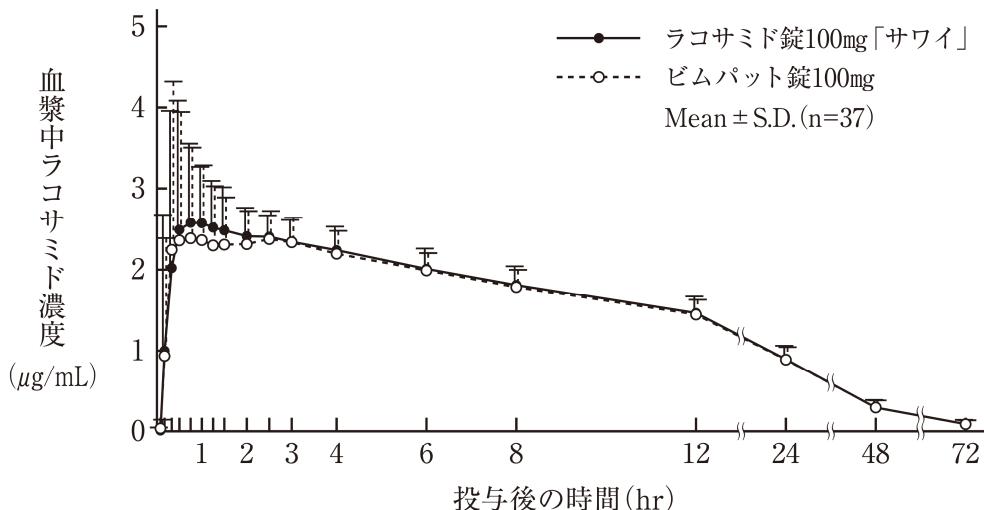
## 結果

## 各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> ( $\mu$ g/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-72hr</sub> ( $\mu$ g·hr/mL)
ラコサミド錠100mg 「サワイ」	3.82±1.13	0.9±0.7	14.6±2.0	56.74±8.52
ビムパット錠100mg	3.91±1.10	1.1±1.0	14.6±2.0	56.04±8.03

(Mean±S.D., n=37)

## VII. 薬物動態に関する項目



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-72hr</sub>	log (1.01)	log (1.00) ~ log (1.02)
Cmax	log (0.98)	log (0.88) ~ log (1.09)

血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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。

### 結論

得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準であるlog(0.80)～log(1.25)の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

### ●ラコサミドDS10%「サワイ」<sup>33, 34)</sup>

#### 目的

ラコサミドDS10%「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

#### 方法

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、ラコサミドDS10%「サワイ」とビムパットドライシロップ10%をそれぞれ1g(ラコサミドとして100mg)健康成人男性\*に絶食下単回経口投与し、血漿中ラコサミド濃度を測定する。

\* 薬物代謝酵素CYP2C19の遺伝子多型解析検査の表現型がPM(Poor Metabolizer)と判定された者を除く

採血時点	0、0.08、0.17、0.33、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12、24、48、72hr
休薬期間	7日間以上
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ラコサミドDS10%「サワイ」(ロット番号:801L3S1514)
標準製剤	ビムパットドライシロップ10%(ロット番号:352813)

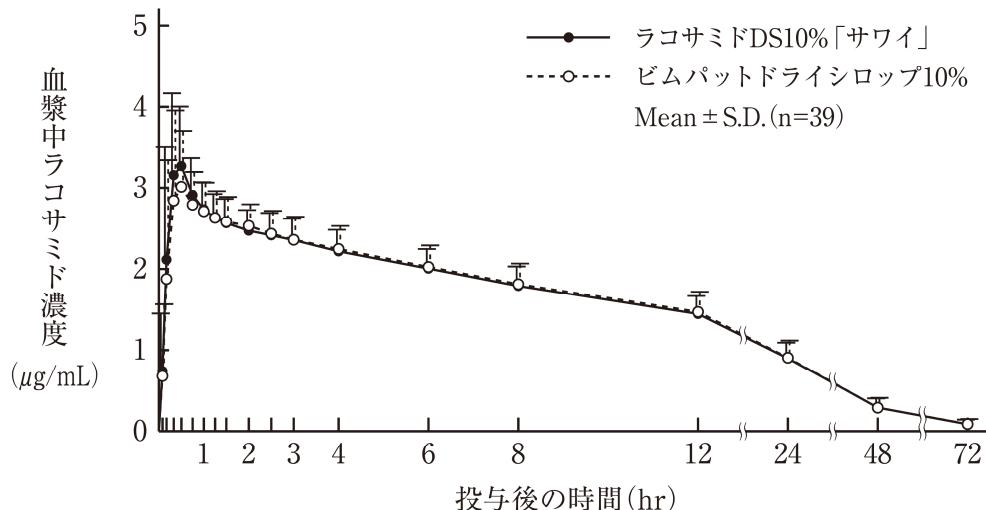
**評価**

ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUCtおよびCmaxの対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれ $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

**結果**

各製剤 1 g投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax ( $\mu\text{g/mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-72hr</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )
ラコサミドDS10% 「サワイ」	$3.66 \pm 0.76$	$0.4 \pm 0.2$	$14.3 \pm 1.9$	$57.18 \pm 10.57$
ビムパットドライシロップ10%	$3.45 \pm 0.76$	$0.7 \pm 0.5$	$14.2 \pm 2.1$	$57.57 \pm 11.54$

(Mean  $\pm$  S.D., n=39)

	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-72hr</sub>	$\log(1.00)$	$\log(0.98) \sim \log(1.01)$
Cmax	$\log(1.07)$	$\log(1.01) \sim \log(1.13)$

血漿中濃度ならびにAUCt、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。

**結論**

得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準である $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

## 3) 中毒域

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 4) 食事・併用薬の影響

#### 16.2.1 食事の影響

健康成人男性24例にラコサミド300mgを空腹時又は食後に単回経口投与したとき、食事はラコサミドのAUC<sub>0-t</sub>及びCmaxに影響を及ぼさなかった<sup>35)</sup>(外国人データ)。

### 16.7 薬物相互作用

#### 16.7.1 薬物相互作用試験

ラコサミドは、治療血漿中濃度域でCYP1A2、2B6、2C9、2C19及び3A4に対して誘導作用を示さず、CYP1A1、1A2、2A6、2B6、2C8、2C9、2D6、2E1、3A4及び3A5に対して阻害作用を示さなかったが、CYP2C19に対する阻害作用が示唆された。

ラコサミドは、P-糖蛋白質の典型的な基質ではなく、P-糖蛋白質に対して阻害作用を示さなかった<sup>36)</sup> (in vitro)。

#### 16.7.2 臨床薬物相互作用試験

##### (1) カルバマゼピン

健康成人男性19例に、ラコサミド(200mg/回、1日2回)の定常状態において、強いCYP3A誘導薬及び中程度のCYP2C9誘導薬であるカルバマゼピン(200mg/回、1日2回)を併用反復経口投与したとき、カルバマゼピンはラコサミドの定常状態のAUC<sub>0-12h</sub>及びCmaxに影響を及ぼさなかった。健康成人男性18例に、カルバマゼピン(200mg/回、1日2回)の定常状態において、ラコサミド(200mg/回、1日2回)を併用反復経口投与したとき、ラコサミドはカルバマゼピンの定常状態のAUC<sub>0-12h</sub>及びCmaxに影響を及ぼさなかった<sup>37)</sup>(外国人データ)。

##### (2) オメプラゾール

健康成人男性34例に、ラコサミド(300mg)の単回経口投与において、弱いCYP2C19阻害薬であるオメプラゾール(40mg/回、1日1回)を併用反復経口投与したとき、オメプラゾールはラコサミドのAUC<sub>0-t</sub>及びCmaxに影響を及ぼさなかった。CYP2C19基質であるオメプラゾール(40mg)の単回経口投与において、ラコサミド(300mg/回、1日2回)を併用反復経口投与したとき、ラコサミドはオメプラゾールのAUC<sub>0-t</sub>及びCmaxに影響を及ぼさなかった<sup>38)</sup>(外国人データ)。

##### (3) ミダゾラム

健康成人男性33例に、CYP3A基質であるミダゾラム(7.5mg)の単回経口投与において、ラコサミド(200mg/回、1日2回)を併用反復経口投与したとき、ラコサミドはミダゾラムのCmaxを30%増加させたがAUC<sub>0-t</sub>に影響を及ぼさなかった<sup>39)</sup>(外国人データ)。

##### (4) ワルファリン

健康成人男性16例に、S-ワルファリンがCYP2C9基質であるワルファリン(25mg)の単回経口投与において、ラコサミド(200mg/回、1日2回)を併用反復経口投与したとき、ラコサミドはS及びR-ワルファリンのAUC<sub>0-t</sub>及びCmaxに影響を及ぼさず、プロトロンビン時間及びプロトロンビン時間の国際標準比(INR)の最大値及びAUC<sub>0-168h</sub>に影響を及ぼさなかった<sup>40)</sup>(外国人データ)。

#### 16.7.3 母集団薬物動態解析

日本人及び外国人の成人及び小児のてんかん患者から得られた血漿中ラコサミド濃度データを用いて、母集団薬物動態解析を行った。その結果、CYP誘導作用を有する抗てんかん薬であるカルバマゼピン、フェニトイン又はフェノバルビタールの併用により、ラコサミドの定常状態のAUCは、成人及び小児で、各々25%及び17%減少した<sup>41, 42)</sup>。

## VIII. - 7. 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

- ラコサミド錠100mg「サワイ」を健康成人男性に1錠(ラコサミドとして100mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>31, 32)</sup>  
 $0.048 \pm 0.006 \text{hr}^{-1}$

- ラコサミドDS10%「サワイ」を健康成人男性に1g(ラコサミドとして100mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>33, 34)</sup>  
 $0.049 \pm 0.006 \text{hr}^{-1}$

## 4) クリアランス

該当資料なし

## 5) 分布容積

VII. - 5. -5) 参照

## 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

## 16.1.2 小児

非盲検3試験及び二重盲検1試験において6ヵ月<sup>注1)</sup>から17歳までの小児てんかん患者414例(日本人46例を含む)から得られた血漿中ラコサミド濃度を用いて母集団薬物動態解析を行い、小児におけるラコサミドの薬物動態パラメータを推定した。本解析におけるラコサミドの投与量は2～12mg/kg/日を1日2回投与(体重50kg以上の小児での最高用量は600mg/日<sup>注2)</sup>)であった。見かけの分布容積(Vd/F)は0.71L/kg、見かけの全身クリアランス(CL/F)は体重及び年齢に依存し、体重15kgの4歳児で0.88L/h(0.058L/h/kg)、体重25kgの8歳児で1.18L/h(0.047L/h/kg)、体重40kgの12歳児で1.60L/h(0.040L/h/kg)、体重50kgの16歳児で1.83L/h(0.037L/h/kg)と推定された<sup>41)</sup>。[7.1参照]

注1) 本剤は4歳以上的小児に対して適用を有している。

注2) 本剤の承認された1日最高用量は、成人及び体重50kg以上の小児には400mg、体重30kg以上50kg未満の小児には8mg/kg、体重30kg未満の小児には12mg/kgである。

## 4. 吸収 .....

## 16.2 吸収

## 16.2.2 バイオアベイラビリティ

健康成人24例にラコサミド200mgを30及び60分間で単回点滴静脈内投与又は単回経口投与したとき、ラコサミドのAUC<sub>0-t</sub>及びCmaxは同程度であり、ラコサミド錠の絶対バイオアベイラビリティはほぼ100%であった<sup>43)</sup>。

## VII. 薬物動態に関する項目

### 5. 分布 ······

#### 1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

#### 2) 血液-胎盤関門通過性

VIII. -6. -5) 参照

#### 3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 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

##### 16.3 分布

健康成人24例にラコサミド200mgを30分間で単回点滴静脈内投与したとき、分布容積(Vd)は31.1Lであり、ラコサミド200mgを単回経口投与したとき、見かけの分布容積(Vd/F)は32.8Lであった。

*in vitro*(ラコサミド1.5~60  $\mu$ g/mL)及び*ex vivo*(ラコサミド0.7~5.5  $\mu$ g/mL)試験の結果、ラコサミドの血漿蛋白結合率は15%未満であった<sup>43, 44)</sup>。

#### 6) 血漿蛋白結合率

VII. -5. -5) 参照

### 6. 代謝 ······

#### 1) 代謝部位及び代謝経路

##### 16.4 代謝

ラコサミドは腎排泄及び代謝により体内から消失した。

*in vitro*試験の結果、薬理学的に不活性な主代謝物であるO-脱メチル体生成に主に寄与するCYP分子種は、CYP3A4、CYP2C9及びCYP2C19であった<sup>45)</sup>。

#### 2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

VII. -6. -1) 参照

#### 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

## 16.5 排泄

16.5.1 健康成人男性各5例に $[^{14}\text{C}]$ -ラコサミド100mg(40  $\mu\text{Ci}$ )を単回経口投与及び1時間で単回点滴静脈内投与したとき、投与後168時間までに、尿中に投与量の94%及び97%が排泄され、糞への排泄は0.5%未満であった。尿中にはラコサミド(約30~40%)、O-脱メチル体(約30%)、極性画分(約20%)及び他の微量な代謝物(0.5~2%)として排泄された<sup>45, 46)</sup>(外国人データ)。

16.5.2 健康成人男性にラコサミド100~400mgを単回経口投与したとき、投与72時間後までの尿中排泄率は、ラコサミド29~33%、O-脱メチル体10~15%であった。血漿中O-脱メチル体のAUC<sub>0-t</sub>は血漿中ラコサミドの約10%であった<sup>27)</sup>。

16.5.3 健康成人にラコサミド200mgを30分間で単回点滴静脈内投与したとき、全身クリアランス(CL)は1.78L/hであり、ラコサミド200mgを単回経口投与したとき、見かけの全身クリアランス(CL/F)は1.84L/hであった<sup>43)</sup>。

## 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

VII. -10. 参照

## 10. 特定の背景を有する患者

## 16.6 特定の背景を有する患者

## 16.6.1 腎機能障害患者

腎機能の異なる成人被験者にラコサミド100mgを単回経口投与したとき、AUC<sub>0-t</sub>は腎機能正常者(CL<sub>CR</sub> :  $\geq 80\text{mL/min}$ )と比較して、軽度低下者(CL<sub>CR</sub> : 50~ $< 80\text{mL/min}$ )では27%、中等度低下者(CL<sub>CR</sub> : 30~ $< 50\text{mL/min}$ )で22%、重度低下者(CL<sub>CR</sub> :  $< 30\text{mL/min}$ )で59%高く、Cmaxは軽度から重度の腎機能低下者で10~14%高かった。軽度から重度の腎機能低下者におけるO-脱メチル体のAUC<sub>0-t</sub>は腎機能正常者の1.5~4.6倍であった<sup>47)</sup>(外国人データ)。[7.1、9.2.1参照]

単回投与時の薬物動態パラメータ

腎機能	正常	軽度低下	中等度低下	重度低下
例数	8	8	8	8
CL <sub>CR</sub> (mL/min)	$\geq 80$	50~ $< 80$	30~ $< 50$	$< 30$
AUC <sub>0-t</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$ )	47.0 [20.8]	59.6 [17.5]	57.6 [19.0]	74.8 [26.9]
Cmax( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	2.69 [35.0]	2.95 [20.7]	3.06 [10.0]	3.02 [23.3]
t <sub>max</sub> (h)	1.0 (0.5~2.0)	0.5 (0.5~1.0)	0.5 (0.5~1.0)	1.0 (0.5~1.5)
t <sub>1/2</sub> (h)	13.2 [17.6]	18.2 [18.7]	15.4 [18.9]	18.3 [27.8]
CL/F(L/h)	2.13 [20.8]	1.68 [17.5]	1.74 [19.0]	1.34 [26.9]
CL <sub>R</sub> (L/h)	0.590 [37.9]	0.354 [51.3]	0.277 <sup>a)</sup> [24.4]	0.143 [31.8]

幾何平均値[CV(%)]、AUC<sub>0-t</sub>は0~96時間値、t<sub>max</sub>は中央値(範囲)CL<sub>R</sub> : 腎クリアランス

a) 7例

## VII. 薬物動態に関する項目

### 16.6.2 血液透析を受けている末期腎機能障害患者

血液透析を受けている末期腎機能障害の成人被験者に、非透析時及び透析開始2.5時間前にラコサミド100mgを単回経口投与したとき、非透析時に比べ4時間の透析実施時ではラコサミドのAUC<sub>0-t</sub>は46%減少し、透析による除去効率はラコサミド57%、O-脱メチル体53%であり、透析クリアランスはラコサミド140mL/min(8.40L/h)、O-脱メチル体149mL/min(8.94L/h)であった<sup>47,48)</sup>(外国人データ)。[7.1、9.2.2、13.2参照]

単回投与時の薬物動態パラメータ

血液透析	非透析時	4時間透析時
例数	8	8
ラコサミド		
AUC <sub>0-t</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$ )	43.2[20.2]	23.2[15.1]
Cmax( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	3.18[22.4]	2.79[22.1]
tmax(h)	0.50(0.5-4.0)	0.75(0.5-2.0)
t <sub>1/2</sub> (h)	19.6[19.4]	19.2[26.8]
O-脱メチル体		
AUC <sub>0-t</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$ )	6.63[74.3]	3.43[68.5]
Cmax( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	0.48[69.5]	0.22[69.1]

幾何平均値[CV(%)]、AUC<sub>0-t</sub>は0~24時間値、tmaxは中央値(範囲)

### 16.6.3 肝機能障害患者

肝機能が中等度に低下した成人(Child-Pugh分類B)にラコサミド100mg/回を1日2回5日間反復経口投与したとき、健康成人に比べてラコサミドの定常状態のAUC<sub>0-12h</sub>及びCmaxはそれぞれ61%及び50%高かった。また、体重で基準化した定常状態のAUC<sub>0-12h</sub>及びCmaxはそれぞれ47%及び37%高かった。重度肝機能障害患者(Child-Pugh分類C)での薬物動態は検討していない<sup>49)</sup>(外国人データ)。[2.2、7.2、9.3.1、9.3.2参照]

定常状態の薬物動態パラメータ

肝機能	正常	Child-Pugh分類B
例数	8	8
AUC <sub>0-12h</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$ )	53.3[17.3]	85.9[21.7]
Cmax( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	5.83[13.3]	8.75[18.7]
tmax(h)	1.5(0.5-2.0)	1.5(0.5-2.0)
t <sub>1/2</sub> (h)	14.8[19.7]	24.1[23.5]

幾何平均値[CV(%)]、tmaxは中央値(範囲)

### 16.6.4 高齢者

65歳以上の高齢男性11例及び高齢女性12例にラコサミド100mg/回を1日2回5日間反復経口投与したとき、45歳以下の成人男性12例と比較して、高齢男性及び女性においてラコサミドの定常状態のAUC<sub>0-12h</sub>はそれぞれ33%及び50%高く、Cmaxはそれぞれ29%及び53%高かった。また、体重で基準化したAUC<sub>0-12h</sub>は高齢男性及び女性においてそれぞれ26%及び23%高かった<sup>50,51)</sup>(外国人データ)。[9.8参照]

### 16.6.5 CYP2C19遺伝子多型

日本人及び中国人健康成人男性各18例を、CYP2C19遺伝子型に基づく代謝能分類により、急速代謝能者(UM)1例、高代謝能者(EM)17例、中間代謝能者(IM)10例、及び低代謝能者(PM)8例に分け、この集団にラコサミド100~400mgを単回経口投与したとき、ラコサミドの投与量及び体重で基準化したAUC<sub>0-∞</sub>は、EMに比べてPMで24%、IMで10%高かった<sup>27)</sup>。

## 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)
  - 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
  - 2.2 重度の肝機能障害のある患者[9.3.1、16.6.3参照]

### 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

V. -4. 参照

### 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 連用中における投与量の急激な減量ないし投与中止により、てんかん発作の増悪又はてんかん重積状態があらわれることがあるので、投与を中止する場合には、少なくとも1週間以上かけて徐々に減量するなど慎重に行うこと。
- 8.2 浮動性めまい、霧視、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注意すること。
- 8.3 PR間隔の延長があらわれがあるので、本剤の投与中は第二度以上の房室ブロック等に関連する症状(頻脈、脈拍数減少、脈拍不整、頭部ふらふら感、失神、動悸、息切れ等)の発現に注意すること。本剤の投与中にそのような症状があらわれた場合には、医師の診察を受けるよう患者及びその家族等に指導すること。心伝導障害や重度の心疾患(心筋梗塞又は心不全等)の既往のある患者、ナトリウムチャネル異常(ブルガダ症候群等)のある患者、PR間隔の延長を起こすおそれのある薬剤を併用している患者等では、本剤投与開始時及び本剤投与中は心電図検査を行うなど、患者の状態及び病態の変化を注意深く観察すること。[9.1.1、10.2、11.1.1参照]
- 8.4 易刺激性、興奮、攻撃性等の精神症状があらわれ、自殺企図に至ることもあるので、本剤投与中は患者の状態及び病態の変化を注意深く観察すること。[8.5、15.1参照]
- 8.5 患者及びその家族等に攻撃性、自殺企図等の精神症状発現の可能性について十分説明を行い、医師と緊密に連絡を取り合うよう指導すること。[8.4、15.1参照]
- 8.6 複視、霧視等の眼障害が生じる可能性があるので、診察時に、眼障害について問診を行う等注意し、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。[15.2.1参照]

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 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 心伝導障害や重度の心疾患(心筋梗塞又は心不全等)の既往のある患者、ナトリウムチャネル異常(ブルガダ症候群等)のある患者

本剤のPR間隔延長作用により房室ブロック等が発現するおそれがある。[8.3、10.2、11.1.1参照]

#### 2) 腎機能障害患者

##### 9.2 腎機能障害患者

##### 9.2.1 重度腎機能障害のある患者

[7.1、16.6.1参照]

##### 9.2.2 血液透析を受けている末期腎機能障害患者

[7.1、16.6.2参照]

#### 3) 肝機能障害患者

##### 9.3 肝機能障害患者

##### 9.3.1 重度の肝機能障害のある患者

投与しないこと。本剤の血中濃度が上昇するおそれがある。[2.2、16.6.3参照]

##### 9.3.2 軽度又は中等度の肝機能障害のある患者(Child-Pugh分類A及びB)

[7.2、16.6.3参照]

#### 4) 生殖能を有する者

設定されていない

#### 5) 妊婦

##### 9.5 妊婦

妊娠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。

ラットにおいて胎児移行性が認められている。

#### 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。

ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。

#### 7) 小児等

##### 9.7 小児等

9.7.1 低出生体重児、新生児、乳児又は4歳未満の幼児に対する臨床試験は実施していない。

9.7.2 小児患者の部分発作に対する単剤療法に関する臨床試験は国内・海外ともに行われていない。

## 8) 高齢者

## 9.8 高齢者

一般に高齢者では生理機能が低下している。[16.6.4参照]

## 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
PR間隔の延長を起こす おそれのある薬剤 [8.3、9.1.1、11.1.1参照]	房室ブロック等が発現する おそれがある。	併用によりPR間隔延長作用 が相加的に増強するおそれ がある。

## 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 房室ブロック、徐脈、失神(いずれも1%未満)

PR間隔の延長を起こすおそれがある。[8.3、9.1.1、10.2参照]

## 11.1.2 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis: TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)(いずれも頻度不明)

発熱、紅斑、水疱・びらん、そう痒、咽頭痛、眼充血、口内炎等の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。

## 11.1.3 薬剤性過敏症症候群(頻度不明)

初期症状として発疹、発熱がみられ、更に肝機能障害、リンパ節腫脹、白血球増加、好酸球增多、異型リンパ球出現等を伴う遅発性の重篤な過敏症状があらわれることがある。なお、ヒトヘルペスウイルス6(HHV-6)等のウイルスの再活性化を伴うことが多く、投与中止後も発疹、発熱、肝機能障害等の症状が再燃あるいは遷延化があるので注意すること<sup>51)</sup>。

## 11.1.4 無顆粒球症(頻度不明)

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 2) その他の副作用

#### 11.2 その他の副作用

種類/頻度	3 %以上	1～3 %未満	1 %未満	頻度不明
精神神経系	浮動性めまい (17.8%)、頭痛、傾眠	記憶障害、振戻、運動失調	うつ病、幻覚、攻撃性、激越、感覚鈍麻、錯覚、認知障害、異常行動、錯乱状態、注意力障害、平衡障害、不眠症、眼振、構語障害、嗜眠、協調運動異常、ミオクローヌス性てんかん	精神病性障害、多幸気分
眼		複視、霧視		
血液		白血球数減少		
消化器	悪心、嘔吐	下痢	消化不良、口内乾燥、鼓腸、便秘	
循環器			心房細動	心房粗動
肝臓		肝機能異常		
代謝及び栄養		食欲減退		
皮膚			発疹、蕁麻疹、そう痒症	血管浮腫
免疫系			薬物過敏症	
筋骨格系			筋痙攣	
感覚器		回転性めまい	耳鳴	
その他	疲労	歩行障害、易刺激性	転倒、挫傷、裂傷、鼻咽頭炎、発熱、無力症、酩酊感	咽頭炎

### 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(最大12000mg)により認められた主な症状は、浮動性めまい、悪心、発作(全般性強直間代発作、てんかん重積状態)、心伝導障害、ショック及び昏睡であった。また、ラコサミド7000mgを一度に服用した例で死亡が報告されている。

##### 13.2 処置

本剤は血液透析により除去可能であり、発現している症状の程度に応じて血液透析の実施を考慮すること。[16.6.2参照]

### 11. 適用上の注意

#### ●ラコサミド錠50mg/錠100mg「サワイ」

##### 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。

#### ●ラコサミドDS10%「サワイ」

設定されていない

## 12. その他の注意·····

## 1) 臨床使用に基づく情報

## 15.1 臨床使用に基づく情報

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。[8.4、8.5参照]

## 2) 非臨床試験に基づく情報

## 15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 非臨床薬物動態試験において、ラコサミドはラットの水晶体に投与後35日目まで分布したが、ラットの26週間及び104週間反復投与毒性試験で眼に異常は認められず、イヌの52週間反復投与毒性試験において水晶体の変化は認められなかった。複視、霧視等の眼に関する副作用の発現率はプラセボ群より高く、16週間投与の日中共同第III相試験のプラセボ群では1.6%に対し、本剤200mg/日群で4.9%、400mg/日群で12.2%、長期投与では5.5%であり、海外第III相試験(併合成績)のプラセボ群では4.4%に対し、本剤200mg/日群で8.9%、400mg/日群で18.0%、600mg/日群で30.5%であった。[8.6参照]

15.2.2 欠神発作モデルであるWAG/Rijラット(3、10及び30mg/kgを腹腔内投与)及びストラスブル遺伝性欠神てんかんラット(15.6及び31.2mg/kgを腹腔内投与)において、欠神発作の増悪が認められた。

---

## 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」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

規制区分	
製剤	劇薬、処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	劇薬

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間

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

該当しない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：ビムパット錠50mg/錠100mg／ドライシロップ10%

同効薬：電位依存性Naチャンネル抑制作用：

トピラマート、ラモトリギン、ルフィナミド<sup>25)</sup>

### 7. 国際誕生年月日

該当しない

### 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

製品名	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
ラコサミド錠50mg 「サワイ」	2025年8月15日	30700AMX00178000	2025年12月5日	2025年12月5日
ラコサミド錠100mg 「サワイ」	2025年8月15日	30700AMX00179000	2025年12月5日	2025年12月5日
ラコサミドDS10% 「サワイ」	2025年8月15日	30700AMX00180000	2025年12月5日	2025年12月5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

承認年月日：2025年12月3日

効能又は効果内容：「他の抗てんかん薬で十分な効果が認められないてんかん患者の強直間代発作に対する抗てんかん薬との併用療法」の効能又は効果を追加した。

X. 管理的事項に関する項目

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 .....

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 .....

該当しない

13. 各種コード .....

製品名	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番号	レセプト電算処理 システム用コード
ラコサミド錠50mg 「サワイ」	1139015F1086	1139015F1086	129974801	622997401
ラコサミド錠100mg 「サワイ」	1139015F2082	1139015F2082	129975501	622997501
ラコサミドDS10% 「サワイ」	1139015R1074	1139015R1074	129976201	622997601

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。

---

## XI . 文獻

---

1. 引用文献 .....
- 1) Errington, A. C. et al. : Mol. Pharmacol., 2008 ; 73 : 157-169
  - 2) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ラコサミド錠50mg「サワイ」
  - 3) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ラコサミド錠50mg「サワイ」
  - 4) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験] ラコサミド錠50mg「サワイ」
  - 5) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ラコサミド錠100mg「サワイ」
  - 6) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ラコサミド錠100mg「サワイ」
  - 7) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験] ラコサミド錠100mg「サワイ」
  - 8) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ラコサミドDS10%「サワイ」
  - 9) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ラコサミドDS10%「サワイ」
  - 10) 沢井製薬(株) 社内資料[懸濁後の安定性試験] ラコサミドDS10%「サワイ」
  - 11) 沢井製薬(株) 社内資料[配合変化試験成績] ラコサミドDS10%「サワイ」
  - 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ラコサミド錠50mg「サワイ」
  - 13) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ラコサミド錠100mg「サワイ」
  - 14) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ラコサミドDS10%「サワイ」
  - 15) 沢井製薬(株) 社内資料[付着性確認試験] ラコサミドDS10%「サワイ」
  - 16) Kropeit, D. et al. : Acta Neurol. Scand., 2015 ; 132 : 346-354
  - 17) 部分発作単剤療法の国際共同実薬対照試験(ビムパット錠：2017年8月25日承認、審査報告書)
  - 18) 日本及び中国における部分発作併用療法のプラセボ対照比較試験(ビムパット錠：2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.7.1)
  - 19) 小児患者を対象とした部分発作併用療法のプラセボ対照比較試験(ビムパットドライシロップ/錠：2019年1月8日承認、申請資料概要2.7.3.2, 2.7.6.3.1)
  - 20) 成人及び小児患者を対象とした強直間代発作併用療法の国際共同プラセボ対照試験(ビムパット錠/ドライシロップ/点滴静注：2020年12月25日承認、申請資料概要2.7.6.1.1)
  - 21) 部分発作併用療法から単剤療法への切り替え試験(ビムパット錠：2017年8月25日承認、審査報告書)
  - 22) 日本及び中国における部分発作併用療法の長期継続投与試験(ビムパット錠：2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.8.1)
  - 23) 小児患者を対象とした部分発作併用療法の長期継続投与試験(ビムパットドライシロップ/錠：2019年1月8日承認、申請資料概要2.7.6.4.1)
  - 24) 成人及び小児患者を対象とした強直間代発作併用療法の長期継続投与試験(ビムパット錠/ドライシロップ/点滴静注：2020年12月25日承認、申請資料概要2.7.6.2.1)
  - 25) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaimeMenu/>> (2025/12/5 アクセス)
  - 26) てんかん発作に対する作用(ビムパット錠：2016年7月4日承認、申請資料概要2.6.2.2)
  - 27) Brandt, C. et al. : Epilepsia, 2006 ; 47 : 1803-1809
  - 28) 岡垣琢也他：薬理と治療, 2015 ; 43 : 1307-1316
  - 29) 外国人健康成人におけるラコサミド反復投与時の薬物動態(ビムパット錠：2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.3.3)
  - 30) 岡垣琢也他：薬理と治療, 2018 ; 46 : 1331-1338
  - 31) 大塚由絵他, 診療と新薬, 62(10), 657(2025)

## X I. 文献

- 32) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ラコサミド錠100mg「サワイ」
- 33) 大塚由絵他, 診療と新薬, 62(10), 667(2025)
- 34) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ラコサミドDS10%「サワイ」
- 35) 外国人健康成人におけるラコサミドの薬物動態に及ぼす食事の影響(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.1.1)
- 36) 薬物相互作用試験(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.6.4.5, 2.6.4.7)
- 37) Cawello, W. et al. : J. Clin. Pharmacol., 2010; 50: 459-471
- 38) Cawello, W. et al. : Clin. Drug Investig., 2014; 34: 317-325
- 39) ミダゾラムとの薬物相互作用(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.5.9)
- 40) Stockis, A. et al. : Epilepsia, 2013; 54: 1161-1166
- 41) 日本人及び外国人小児患者における母集団薬物動態解析(ビムパットドライシロップ/錠: 2019年1月8日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.2.3)
- 42) ラコサミドに関する母集団薬物動態解析(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.2.2.5.2)
- 43) 寺田清人他: 臨床精神薬理, 2018; 21: 1223-1234
- 44) 分布(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.6.4.4)
- 45) 代謝(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.2.3)
- 46) Cawello, W. et al. : Eur. J. Drug Metab. Pharmacokinet., 2012; 37: 241-248
- 47) Cawello, W. et al. : Clin. Pharmacokinet., 2013; 52: 897-906
- 48) 血液透析を受けている末期腎機能障害患者(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.4)
- 49) 外国人肝機能低下者におけるラコサミドの薬物動態(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.4.5)
- 50) Schaefer, C. et al. : Clin. Drug Investig., 2015; 35: 255-265
- 51) 高齢者(ビムパット錠: 2016年7月4日承認、申請資料概要2.7.6.4)
- 52) 厚生労働省: 重篤副作用疾患別対応マニュアル 薬剤性過敏症症候群
- 53) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ラコサミド錠50mg「サワイ」
- 54) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ラコサミド錠100mg「サワイ」
- 55) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ラコサミド錠50mg「サワイ」
- 56) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ラコサミド錠100mg「サワイ」
- 57) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ラコサミドDS10%「サワイ」

## 2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....

2. 海外における臨床支援情報 .....

該当資料なし

### 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ます、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

###### <粉碎後の安定性試験>

###### ●ラコサミド錠50mg「サワイ」<sup>53)</sup>

###### 目的

本製剤の粉碎後の安定性を確認するため試験を実施する。

###### 方法

本製剤を粉碎し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>B)</sup>に従い評価する。

###### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
801T1S0884	室温	25°C/60%RH、遮光、開放シャーレ*
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(5000lx)、開放シャーレ*

\*：通気性を確保し飛散しないようにポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆う

###### 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・定量試験	1回

###### 結果

試験項目 保存条件・期間	性状	定量試験*
イニシャル	白い粉末にうすいピンク色のフィルム片が混じっていた	100.0
室温	5週	変化なし 99.2
	13週	変化なし 99.4
光(60万lx·h)	変化なし	変化なし 98.7

\*：イニシャルを100としたときの含有率(%)

###### ●ラコサミド錠100mg「サワイ」<sup>54)</sup>

###### 目的

本製剤の粉碎後の安定性を確認するため試験を実施する。

###### 方法

本製剤を粉碎し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>B)</sup>に従い評価する。

### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
801T2S0884	室温	25°C/60%RH、遮光、開放シャーレ*
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(5000lx)、開放シャーレ*

\* : 通気性を確保し飛散しないようにポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆う

### 試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・定量試験	1回

### 結果

試験項目 保存条件・期間	性状	定量試験*
イニシャル	白い粉末にうすい黄色のフィルム片が混じっていた	100.0
室温	5週	変化なし 99.4
	13週	変化なし 99.6
光(60万lx·h)	変化なし	変化なし 99.6

\* : イニシャルを100としたときの含有率(%)

### B) 評価分類基準

#### 【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり	形状変化や色調変化が認められる場合

#### 【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

#### 【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

### 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

#### ＜崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験＞

##### ● ラコサミド錠50mg「サワイ」<sup>55)</sup>

##### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、試験を実施する。

##### 方法

1. 本製剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、お湯(約55°C)20mLを吸い取る。
2. 5分間放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を観察する。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返す。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液をチューブに注入し、水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。

### 使用器具

シリング：テルフィードEDシリング 20mL  
チューブ：ジェイフィード栄養カテーテル(DEHPフリー)  
[120cm、8Fr. (外径2.7mm)]

ロット番号	801T1S0883
試験回数	1回

### 結果

崩壊・懸濁状態	5分後	錠剤は崩壊し、往復横転により懸濁液となったが、試料の沈殿が見られた。
チューブ通過性	通過したが、シリング及びチューブに付着が認められた。	
チューブ通過液のpH	約6.9	

### ●ラコサミド錠100mg「サワイ」<sup>56)</sup>

#### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、試験を実施する。

#### 方法

1. 本製剤を1錠、シリングにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、お湯(約55°C)20mLを吸い取る。
2. 5分間放置後シリングを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を観察する。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返す。(最大20分まで)
3. シリング内の液をチューブに注入し、水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。

### 使用器具

シリング：テルフィードEDシリング 20mL  
チューブ：ジェイフィード栄養カテーテル(DEHPフリー)  
[120cm、8Fr. (外径2.7mm)]

ロット番号	801T2S0883
試験回数	1回

### 結果

崩壊・懸濁状態	5分後	錠剤は崩壊し、往復横転により懸濁液となったが、試料の沈殿が見られた。
チューブ通過性	通過したが、シリング及びチューブに付着が認められた。	
チューブ通過液のpH	約7.4	

### ●ラコサミドDS10%「サワイ」<sup>57)</sup>

#### 目的

本製剤の懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、試験を実施する。

#### 方法

1. 本製剤1.0gをビーカーに移した後、お湯(約55°C)20mLを注ぎ、分散するように攪拌して懸濁状態を観察する。
2. 懸濁液をシリングで吸い取った後、チューブに注入し、通過液を別のビーカーに採取する。
3. 同じシリングに水20mLを吸い取り、チューブをフラッシュした後、通過状態を観察する。

### 使用器具

シリング：テルフィードEDシリング 20mL  
チューブ：ジェイフィード栄養カテーテル(DEHPフリー)  
[120cm、8Fr. (外径2.7mm)]

ロット番号	801L3S1513
試験回数	1回

## 結果

懸濁状態	懸濁したが、試料の沈殿が見られた。
チューブ通過性	通過したが、シリンジ及びチューブに付着が認められた。
チューブ通過液のpH	約7.3

## 2. その他の関連資料 .....

### 患者向け資材

- ・ラコサミド錠/DS「サワイ」を服用される患者さんとご家族の方へ
- ・ラコサミド錠「サワイ」を服用されている方へ

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

### ＜配合変化試験成績＞

#### ●ラコサミドDS10%「サワイ」<sup>11)</sup>

##### 目的

ラコサミドDS10%「サワイ」(以下、本製剤と記載)を他剤(以下、配合薬剤)又は食品等と配合した際の物理化学的变化を確認するために試験を実施する。

##### 方法

本製剤と配合薬剤又は食品等を下記条件で配合及び保存した後、下記試験項目について確認する。

##### 保存条件及び配合方法

保存条件	20.1～25.6°C/37～65%RH、散光下(LED電灯)
配合方法	本製剤400mg <sup>※1</sup> と配合薬剤又は食品等を(配合量 <sup>※1</sup> は結果に記載)を混合し、透明ガラス瓶(密栓)にて保存する。

##### 試験検体、試験項目及び試験回数

ロット番号	801L3S1514	
試験項目	I. 配合薬剤	性状(外観・におい)、質量変動率 <sup>※2</sup> 、定量試験 <sup>※3</sup>
	II. 食品等	性状(外観・におい)、pH、再分散性 <sup>※4</sup> 、定量試験 <sup>※3</sup>
試験回数	1回	

※1： ラコサミドDS10%「サワイ」及び配合薬剤は製剤量として

※2： 質量変動率(%)=(本製剤と配合薬剤の混合・保存後の質量／混合前の試験製剤と配合薬剤の合計質量)×100(%)

※3： 配合直後のラコサミド量を100とし、[ ]に表示量に対する含有率を示す(%)

※4： 食品(飲料)と配合する場合のみ実施。配合後の液を入れた保存容器を5秒間倒立させ、次いで5秒間正立する。この操作を1回として配合後の懸濁液が均質に分散するまでの回数が9回までは良好、10回以上は不良と判定する。

## 結果

試験実施：2025年6月

### I. 配合薬剤

分類	配合薬剤名(成分名) ①配合前の外観 ②配合前のにおいて ③配合量(製剤量として)	試験項目	配合結果			
			配合直後	1カ月	2カ月	3カ月
抗 て ん か ん 剤	デパケン細粒40% (バルプロ酸ナトリウム)  ①白色の細粒又は粉末 ②わずかに特異なにおいて ③670mg	外観	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒
		におい	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて
		質量変動率 (%)	100.0	102.2	103.3	104.0
		定量試験 (%)	100.0 [97.49]	101.5	104.2	96.7
	アレビアチン散10% (フェニトイント)  ①白色の散剤 ②わずかに特異なにおいて ③670mg	外観	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末
		におい	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて
		質量変動率 (%)	100.0	100.0	100.0	100.1
		定量試験 (%)	100.0 [97.19]	99.0	102.5	96.2
	エクセグラン散20% (ゾニサミド)  ①白色の散剤 ②わずかに特異なにおいて ③250mg	外観	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末
		におい	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて
		質量変動率 (%)	100.0	100.2	100.3	100.4
		定量試験 (%)	100.0 [95.59]	100.3	104.5	97.3
	マイスタン細粒1% (クロバザム)  ①白色の細粒又は粉末 ②わずかに特異なにおいて ③420mg	外観	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒
		におい	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて
		質量変動率 (%)	100.0	100.4	100.5	100.6
		定量試験 (%)	100.0 [95.26]	102.3	104.2	98.4
	リボトリール細粒0.5% (クロナゼパム)  ①薄橙色の細粒 ②においなし ③260mg	外観	白色の顆粒 と薄橙色の細粒	白色の顆粒 と薄橙色の細粒	白色の顆粒 と薄橙色の細粒	白色の顆粒 と薄橙色の細粒
		におい	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて
		質量変動率 (%)	100.0	100.2	100.3	100.3
		定量試験 (%)	100.0 [95.78]	100.4	104.4	96.9
	エピレオプチマル散50% (エトスクシミド)  ①白色の散剤 ②わずかに特異なにおいて ③250mg	外観	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末
		におい	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて
		質量変動率 (%)	100.0	100.1	100.2	100.3
		定量試験 (%)	100.0 [94.20]	104.6	107.4	98.8
	ブリミドン細粒99.5%「日医工」 (ブリミドン)  ①白色の細粒 ②わずかに特異なにおいて ③0.3g	外観	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒
		におい	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて	わずかに 特異なにおいて
		質量変動率 (%)	100.0	100.2	100.3	100.3
		定量試験 (%)	100.0 [97.80]	98.5	103.4	98.0

分類	配合薬剤名(成分名) ①配合前の外観 ②配合前のにおい ③配合量(製剤量として)	試験項目	配合結果			
			配合直後	1カ月	2カ月	3カ月
抗てんかん剤	クランポール末 (アセチルフェネトライド)  ①白色の結晶性の粉末 ②わずかに特異なにおい ③0.2g	外観	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒
		におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
		質量変動率(%)	100.0	100.1	100.2	100.2
		定量試験(%)	100.0 [95.26]	100.8	104.4	97.0
	イーケプラドライシロップ50%(レベチラセタム)  ①白色の粉末又は粒 ②わずかに特異なにおい ③500mg	外観	白色の顆粒又は粉末	白色の顆粒又は粉末	白色の顆粒又は粉末	白色の顆粒又は粉末
		におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
		質量変動率(%)	100.0	100.1	100.2	100.2
		定量試験(%)	100.0 [95.18]	100.9	104.5	97.1
	レベチラセタムDS50%「サワイ」 (レベチラセタム)  ①白色の粉末又は粒 ②わずかに特異なにおい ③500mg	外観	白色の顆粒又は粉末	白色の顆粒又は粉末	白色の顆粒又は粉末	白色の顆粒又は粉末
		におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
		質量変動率(%)	100.0	100.2	100.3	100.3
		定量試験(%)	100.0 [95.95]	99.5	104.2	96.4
催眠鎮静剤	フィコンパ細粒1% (ペランパネル水和物)  ①黄色の細粒 ②においなし ③1000mg	外観	白色の顆粒と黄色の細粒	白色の顆粒と黄色の細粒	白色の顆粒と黄色の細粒	白色の顆粒と黄色の細粒
		におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
		質量変動率(%)	100.0	100.1	100.1	100.2
		定量試験(%)	100.0 [96.01]	100.8	105.0	97.3
	フェノバール散10% (フェノバルビタール)  ①淡紅色の散剤 ②わずかに特異なにおい ③200mg	外観	白色の顆粒と淡紅色の粉末	白色の顆粒と淡紅色の粉末	白色の顆粒と淡紅色の粉末	白色の顆粒と淡紅色の粉末
		におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
		質量変動率(%)	100.0	100.3	100.4	100.4
		定量試験(%)	100.0 [95.91]	101.6	105.1	98.2
抗不安剤	セルシン散1% (ジアゼパム)  ①白色の細粒を含む粉末 ②わずかに特異なにおい ③200mg	外観	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒
		におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
		質量変動率(%)	100.0	100.4	100.5	100.6
		定量試験(%)	100.0 [96.12]	97.7	104.3	96.6
	ダイアモックス末 (アセタゾラミド)  ①白色の結晶性の粉末 ②わずかに特異なにおい ③80mg	外観	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒	白色の顆粒又は細粒
		におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
		質量変動率(%)	100.0	100.3	100.4	100.4
		定量試験(%)	100.0 [95.98]	99.9	104.3	96.7

分類	配合薬剤名(成分名) ①配合前の外観 ②配合前のにおい ③配合量(製剤量として)	試験項目	配合結果			
			配合直後	1カ月	2カ月	3カ月
精 神 神 経 用 剂	ニューレブチル細粒10% (プロペリシアジン) ①淡黄色の細粒 ②わずかに特異なにおい ③60mg	外観	白色の顆粒 と淡黄色の細粒	白色の顆粒 と淡黄色の細粒	白色の顆粒 と淡黄色の細粒	白色の顆粒 と淡黄色の細粒
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.3	100.4	100.5
		定量試験 (%)	100.0 [96.14]	97.2	103.9	97.0
精 神 神 経 用 剂	リスペダール細粒1% (リスペリドン) ①白色の細粒又は粉末 ②わずかに特異なにおい ③50mg	外観	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.3	100.4	100.4
		定量試験 (%)	100.0 [96.03]	100.7	105.1	95.9
精 神 神 経 用 剂	リスペリドン細粒1%「サワイ」 (リスペリドン) ①白色の細粒又は粉末 ②わずかに特異なにおい ③50mg	外観	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.3	100.3	100.4
		定量試験 (%)	100.0 [97.85]	99.5	101.2	93.9
精 神 神 経 用 剂	エビリファイ散1% (アリピプラゾール) ①白色の散剤 ②わずかに特異なにおい ③800mg	外観	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.2	100.3	100.3
		定量試験 (%)	100.0 [95.44]	100.1	104.7	96.5
消 化 性 潰 瘍 用 剤	マーズレンS配合顆粒 (アズレンスルホン酸ナトリウム水 和物、L-グルタミン) ①青色の顆粒 ②わずかに特異なにおい ③0.3g	外観	白色の顆粒 と青色の顆粒	白色の顆粒 と青色の顆粒	白色の顆粒 と青色の顆粒	白色の顆粒 と青色の顆粒
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.1	100.1	100.2
		定量試験 (%)	100.0 [95.28]	100.5	104.3	96.8
混 合 ビ タ ミ ン 剤	シナール配合顆粒 (アスコルビン酸、パントテン酸カル シウム) ①黄白色の顆粒 ②わずかに特異なにおい ③1g	外観	白色の顆粒 と黄白色の顆粒	白色の顆粒 と黄白色の顆粒	白色の顆粒 と黄白色の顆粒	白色の顆粒 と黄白色の顆粒
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.5	100.6	100.6
		定量試験 (%)	100.0 [96.51]	101.8	103.3	95.0

分類	配合薬剤名(成分名) ①配合前の外観 ②配合前のにおい ③配合量(製剤量として)	試験項目	配合結果			
			配合直後	1カ月	2カ月	3カ月
抗 パ ー キ ン ソ ン 剤	アマンタジン塩酸塩細粒10%「サワイ」 (アマンタジン塩酸塩) ①白色の細粒 ②わずかに特異なにおい ③500mg	外 観	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒	白色の顆粒又 は細粒
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.0	100.1	100.2
		定量試験 (%)	100.0 [96.21]	103.5	104.7	95.4
	ドパストン散98.5% (レボドバ) ①白色の細粒含む粉末 ②わずかに特異なにおい ③0.4g	外 観	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末	白色の顆粒又 は粉末
		におい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい	わずかに 特異なにおい
		質量変動率 (%)	100.0	100.1	100.2	100.2
		定量試験 (%)	100.0 [95.79]	103.4	105.4	98.6
健 胃 消 化 剤	S・M配合散 (タカヂアスターぜ、メタケイ酸アル ミニ酸マグネシウム、炭酸水素ナト リウム、沈降炭酸カルシウム、チョウ ジ末、ウイキョウ末、ケイヒ末、ショ ウキョウ末、サンショウ末、オウレン 末、カンゾウ末) ①薄い茶色の粉末 ②特異な芳香のにおい ③0.6g	外 観	白色の顆粒と 薄い茶色の粉末	白色の顆粒と 薄い茶色の粉末	白色の顆粒と 薄い茶色の粉末	白色の顆粒と 薄い茶色の粉末
		におい	特異な芳香の におい	特異な芳香の におい	特異な芳香の におい	特異な芳香の におい
		質量変動率 (%)	100.0	99.8	99.8	99.8
		定量試験 (%)	100.0 [98.69]	100.3	105.1	93.4

## II. 食品等

配合品名 ①配合前の外観 ②配合前のにおい ③pH ④配合量	試験項目	配合結果		
		配合直後	1時間後	3時間後
プッチンプリン ①黄色のゲル状 ②プリンのにおい ③6.65 ④20g	外 観	黄色のゲル状	黄色のゲル状	黄色のゲル状
	にお い	プリンのにおい	プリンのにおい	プリンのにおい
	pH	6.71	6.76	6.76
	再分散性	—	—	—
	定量試験 (%)	100.0 [96.09]	68.1	82.4
MOW(モウ)バニラ ①微黄白色の液 ②バニラのにおい ③6.47 ④20g	外 観	微黄白色の液	微黄白色の液	微黄白色の液
	にお い	バニラのにおい	バニラのにおい	バニラのにおい
	pH	6.53	6.57	6.56
	再分散性	—	—	—
	定量試験 (%)	100.0 [84.98]	99.6	105.5
明治ブルガリアヨーグルトLB81 プレーン ①白色のゲル状 ②ヨーグルトのにおい ③4.09 ④20g	外 観	白色のゲル状	白色のゲル状	白色のゲル状
	にお い	ヨーグルトのにおい	ヨーグルトのにおい	ヨーグルトのにおい
	pH	4.11	4.20	4.17
	再分散性	—	—	—
	定量試験 (%)	100.0 [90.90]	97.1	98.1
おくすり飲めたね[いちご味] ①淡赤色のゼリー状 ②いちごのにおい ③3.81 ④20g	外 観	淡赤色のゼリー状 と白色の細粒	淡赤色のゼリー状 と白色の細粒	淡赤色のゼリー状 と白色の細粒
	にお い	いちごのにおい	いちごのにおい	いちごのにおい
	pH	3.87	3.93	3.89
	再分散性	—	—	—
	定量試験 (%)	100.0 [100.37]	92.3	97.4
サントリー天然水 ①無色透明の液 ②においなし ③7.53 ④20mL	外 観	微白色の懸濁液	微白色の懸濁液	微白色の懸濁液
	にお い	においなし	においなし	においなし
	pH	6.91	7.01	7.07
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験 (%)	100.0 [96.78]	99.6	100.2
森永ココア ①茶褐色の液 ②ココアのにおい ③6.85 ④20mL	外 観	茶褐色の液	茶褐色の液	茶褐色の液
	にお い	ココアのにおい	ココアのにおい	ココアのにおい
	pH	6.78	6.82	6.86
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験 (%)	100.0 [98.04]	98.4	98.6

— : 実施なし

配合品名 ①配合前の外観 ②配合前におい ③pH ④配合量	試験項目	配合結果		
		配合直後	1時間後	3時間後
ポカリスエット ①微白色の懸濁液 ②ポカリスエットのにおい ③3.60 ④20mL	外観	微白色の懸濁液	微白色の懸濁液	微白色の懸濁液
	におい	ポカリスエットのにおい	ポカリスエットのにおい	ポカリスエットのにおい
	pH	3.49	3.51	3.60
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験(%)	100.0 [96.13]	100.3	100.9
なっちゃん オレンジ ①黄色の液 ②オレンジのにおい ③3.61 ④20mL	外観	黄色の液	黄色の液	黄色の液
	におい	オレンジのにおい	オレンジのにおい	オレンジのにおい
	pH	3.58	3.53	3.56
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験(%)	100.0 [96.18]	99.5	100.0
なっちゃん りんご ①微白色の液 ②りんごのにおい ③3.42 ④20mL	外観	微白色の液	微白色の液	微白色の液
	におい	りんごのにおい	りんごのにおい	りんごのにおい
	pH	3.33	3.36	3.41
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験(%)	100.0 [95.89]	99.7	100.7
明治おいしい牛乳 ①白色の液 ②牛乳のにおい ③6.72 ④20mL	外観	白色の液	白色の液	白色の液
	におい	牛乳のにおい	牛乳のにおい	牛乳のにおい
	pH	6.65	6.75	6.76
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験(%)	100.0 [94.46]	102.9	104.6
カルピスウォーター ①白色の懸濁液 ②カルピスのにおい ③3.52 ④20mL	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液
	におい	カルピスのにおい	カルピスのにおい	カルピスのにおい
	pH	3.48	3.47	3.54
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験(%)	100.0 [96.24]	99.3	100.1
New ヤクルト ①黄白色の懸濁液 ②ヤクルトのにおい ③3.63 ④20mL	外観	黄白色の懸濁液	黄白色の懸濁液	黄白色の懸濁液
	におい	ヤクルトのにおい	ヤクルトのにおい	ヤクルトのにおい
	pH	3.50	3.58	3.59
	再分散性	—	良好	良好
	定量試験(%)	100.0 [95.70]	99.2	99.6

—：実施なし





