

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 2013 に準拠し作成

ロイコトリエン受容体拮抗剤
気管支喘息・アレルギー性鼻炎治療剤

プラナルカストカプセル112.5mg「科研」

PRANLUKASTCap.

剤 形	硬カプセル剤
製 剤 の 規 制 区 分	該当しない
規 格 ・ 含 量	1カプセル中に日本薬局方プラナルカスト水和物 112.5mg を含有する。
一 般 名	和名：プラナルカスト水和物（JAN） 洋名：Pranlukast Hydrate（JAN）、Pranlukast（INN）
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2007年3月15日 薬価基準収載年月日：2007年7月6日 発 売 年 月 日：2007年7月6日
開 発 ・ 製 造 販 売 （ 輸 入 ） ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	発 売 元：科研製薬株式会社 製造販売元：シオノケミカル株式会社
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	
問 合 せ 窓 口	科研製薬株式会社 医薬品情報サービス室 T E L：0120-519-874 受付時間：9:00～17:00（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） ホームページアドレス： http://www.kaken.co.jp/

本 IF は 2017 年 10 月 改 訂 の 添 付 文 書 の 記 載 に 基 づ き 改 訂 し た。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

IF 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、医薬品医療機器総合機構ホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品医療機器総合機構ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載に合わせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い、IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ① 「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
1. 開発の経緯	1	10. 製剤中の有効成分の定量法	7
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	11. 力価	8
II. 名称に関する項目	2	12. 混入する可能性のある夾雑物	8
1. 販売名	2	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8
(1) 和名	2	14. その他	8
(2) 洋名	2	V. 治療に関する項目	9
(3) 名称の由来	2	1. 効能又は効果	9
2. 一般名	2	2. 用法及び用量	9
(1) 和名(命名法)	2	3. 臨床成績	9
(2) 洋名(命名法)	2	(1) 臨床データパッケージ	9
(3) ステム	2	(2) 臨床効果	9
3. 構造式又は示性式	2	(3) 臨床薬理試験	9
4. 分子式及び分子量	2	(4) 探索的試験	9
5. 化学名(命名法)	2	(5) 検証的試験	9
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(6) 治療的使用	9
7. CAS登録番号	3	VI. 薬効薬理に関する項目	10
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	10
1. 物理化学的性質	4	2. 薬理作用	10
(1) 外観・性状	4	(1) 作用部位・作用機序	10
(2) 溶解性	4	(2) 薬効を裏付ける試験成績	10
(3) 吸湿性	4	(3) 作用発現時間・持続時間	10
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	4	VII. 薬物動態に関する項目	11
(5) 酸塩基解離定数	4	1. 血中濃度の推移・測定法	11
(6) 分配係数	4	(1) 治療上有効な血中濃度	11
(7) その他の主な示性値	4	(2) 最高血中濃度到達時間	11
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	11
3. 有効成分の確認試験法	4	(4) 中毒域	11
4. 有効成分の定量法	4	(5) 食事・併用薬の影響	12
IV. 製剤に関する項目	5	(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因	12
1. 剤形	5	2. 薬物速度論的パラメータ	12
(1) 剤形の区別、外観及び性状	5	(1) 解析方法	12
(2) 製剤の物性	5	(2) 吸収速度定数	12
(3) 識別コード	5	(3) バイオアベイラビリティ	12
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	5	(4) 消失速度定数	12
2. 製剤の組成	5	(5) クリアランス	12
(1) 有効成分(活性成分)の含量	5	(6) 分布容積	12
(2) 添加物	5	(7) 血漿蛋白結合率	12
(3) その他	5	3. 吸収	12
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	4. 分布	12
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	(1) 血液-脳関門通過性	12
5. 調製法及び溶解後の安定性	6	(2) 血液-胎盤関門通過性	12
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	(3) 乳汁への移行性	12
7. 溶出性	6	(4) 髄液への移行性	13
8. 生物学的試験法	7		

(5) その他の組織への移行性	13	(1) 単回投与毒性試験	18
5. 代謝	13	(2) 反復投与毒性試験	18
(1) 代謝部位及び代謝経路	13	(3) 生殖発生毒性試験	18
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	13	(4) その他の特殊毒性	18
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	13	X. 管理的事項に関する項目	19
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	13	1. 規制区分	19
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	13	2. 有効期間又は使用期限	19
6. 排泄	13	3. 貯法・保存条件	19
(1) 排泄部位及び経路	13	4. 薬剤取扱い上の注意点	19
(2) 排泄率	13	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	19
(3) 排泄速度	13	(2) 薬剤交付時の取扱いについて (患者等に留意すべき必須事項等)	19
7. トランスポーターに関する情報	13	(3) 調剤時の留意点について	19
8. 透析等による除去率	13	5. 承認条件等	19
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目	14	6. 包装	19
1. 警告内容とその理由	14	7. 容器の材質	19
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	14	8. 同一成分・同効薬	20
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14	9. 国際誕生年月日	20
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	20
5. 慎重投与内容とその理由	14	11. 薬価基準収載年月日	20
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14	12. 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	20
7. 相互作用	14	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
(1) 併用禁忌とその理由	14	14. 再審査期間	20
(2) 併用注意とその理由	15	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	20
8. 副作用	15	16. 各種コード	20
(1) 副作用の概要	15	17. 保険給付上の注意	20
(2) 重大な副作用と初期症状	15	XI. 文献	21
(3) その他の副作用	16	1. 引用文献	21
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	16	2. その他の参考文献	21
(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度	16	XII. 参考資料	22
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	16	1. 主な外国での発売状況	22
9. 高齢者への投与	16	2. 海外における臨床支援情報	22
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16	XIII. 備考	23
11. 小児等への投与	16	1. その他の関連資料	23
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16	(1) GS1 コード	23
13. 過量投与	17		
14. 適用上の注意	17		
15. その他の注意	17		
16. その他	17		
IX. 非臨床試験に関する項目	18		
1. 薬理試験	18		
(1) 薬効薬理試験	18		
(2) 副次的薬理試験	18		
(3) 安全性薬理試験	18		
(4) その他の薬理試験	18		
2. 毒性試験	18		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

プラナルカスト水和物は、本邦において開発されたロイコトリエン（LT）受容体拮抗剤であり、本邦では 1995 年に上市され、広く臨床で使用されている。

プラナルカストカプセル 112.5mg「科研」は、プラナルカスト水和物を主成分とする後発医薬品としてシオノケミカル株式会社が開発を企画し、薬食発第 0331015 号（2005 年 3 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2007 年 3 月に承認を得て、2007 年 7 月に発売に至った。

さらに、2009 年 9 月に「アレルギー性鼻炎」の効能について承認を取得し、現在に至っている。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

برانلکاستカプセル 112.5mg 「科研」

(2) 洋名

PRANLUKAST Cap. 112.5mg 「KAKEN」

(3) 名称の由来

「有効成分名」 + 「剤形」 + 「規格」 + 「屋号」 より命名。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

برانلکاست水和物 (JAN)

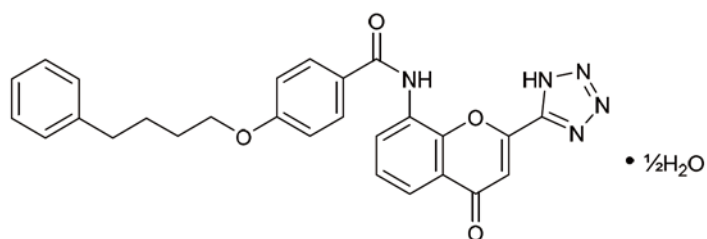
(2) 洋名 (命名法)

Pranlukast Hydrate (JAN)、Pranlukast (INN)

(3) ステム

-lukast (ロイコトリエン拮抗薬)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{27}H_{23}N_5O_4 \cdot \frac{1}{2}H_2O$

分子量 : 490.51

5. 化学名 (命名法)

N-[4-Oxo-2-(1*H*-tetrazol-5-yl)-4*H*-chromen-8-yl]-4-(4-phenylbutyloxy) benzamide hemihydrate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

7. CAS 登録番号

103177-37-3 (Pranlukast)

150821-03-7 (Pranlukast Hydrate)

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～淡黄色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

溶 媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	日本薬局方の 溶解度表記
エタノール (99.5)	1,000mL 以上 10,000mL 未満	極めて溶けにくい
水	10,000mL 以上	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 233℃（分解）

(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

日本薬局方「プラシルカスト水和物」の確認試験法による。

- ・紫外可視吸光度測定法
- ・赤外吸収スペクトル測定法（KBr 錠剤法）

4. 有効成分の定量法


日本薬局方「プラシルカスト水和物」の定量法による。

- ・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、外観及び性状

性状	外形	サイズ・重量
蓋部、胴体部共に白色～帯黄白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は白色～淡黄色の粉末を含む粒である。		3号カプセル 重量：210mg

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

PLK（カプセル表面）

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1カプセル中に日本薬局方ブランルカスト水和物 112.5mg を含有する。

(2) 添加物

内容物：部分アルファー化デンプン、乳糖水和物、軽質無水ケイ酸、プルラン、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム
カプセル：ゼラチン、酸化チタン、ラウリル硫酸ナトリウム、マクロゴール 4000

(3) その他

特になし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

最終包装製品（PTP 包装）を用いた長期保存試験の結果、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが確認された。また、最終包装製品（バラ包装）を用いた加速試験の結果、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。

試験の種類	保存条件	包装形態	保存期間	結果
長期保存試験	室温	PTP 包装	36 ヶ月	適合 ^{※1}
加速試験	40±1℃、75±5%RH	PTP 包装・バラ包装	6 ヶ月	適合 ^{※2}

※1：性状、確認試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量

※2：性状、確認試験、溶出試験、定量

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性²⁾

[公的溶出規格に基づく試験]

ポリソルベート 80 1g に溶出試験第 2 液を加えて 200mL とした液 900mL を試験液とし、日局溶出試験法のパドル法（回転数：100rpm）により試験を行うとき、برانلカストカプセル 112.5mg 「科研」は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたبرانلカストカプセルの溶出規格に適合していることが確認されている（溶出規格：90 分間の溶出率は 80%以上）。

[後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日改正 医薬審発第 787 号別紙）に基づく試験]

①試験法：日本薬局方一般試験法溶出試験法 パドル法

②試験条件：

試験液量：900mL 測定方法：紫外可視吸光度測定法

各種条件：

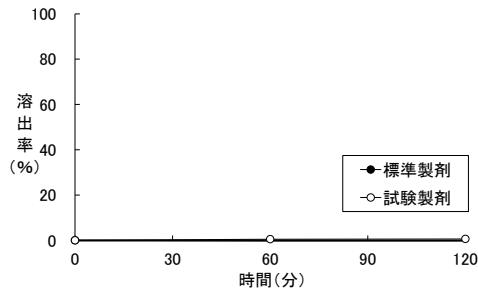
試験液	サンプリング時間（分）	回転数
pH1.2	60, 120	50rpm
pH4.0	180, 360	
pH6.8	180, 360	
水	180, 360	
pH1.2 ^{**}	60, 120	
pH4.0 ^{**}	180, 360	
pH6.8 ^{**}	5, 10, 15, 30, 45, 60, 90, 120	
pH6.8 ^{**}	5, 10, 15, 30, 45, 60, 90, 120	
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

※1.0 w/v%ポリソルベート 80 添加

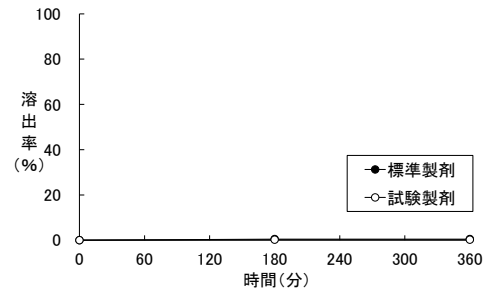
③試験結果：「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従って溶出試験を実施した結果、試験製剤（برانلカストカプセル 112.5mg 「科研」）と標準製剤の溶出挙動は、8 溶出試験条件中 2 条件において基準に適合せず、両製剤の溶出挙動は同等ではないと判断された。なお、本ガイドラインでは「本試験による同等性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものでない」とされている。そこで、試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験を実施したところ、両製剤は生物学的に同等である結果が得られた。このことから溶出率の違いは、血中濃度に反映されず問題ないものであると考えられた。

[試験製剤 (プラシルカストカプセル 112.5mg 「科研」) と標準製剤の各種条件下における溶出挙動]

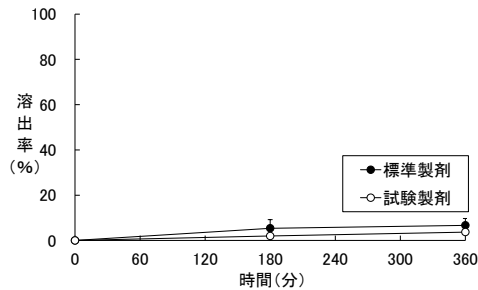
pH1.2, 50rpm



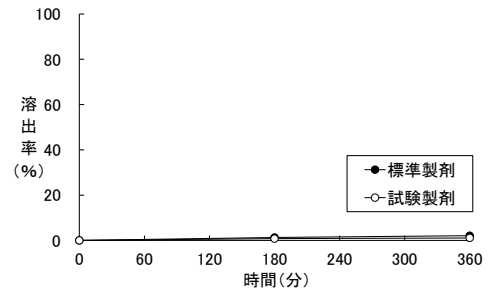
pH4.0, 50rpm



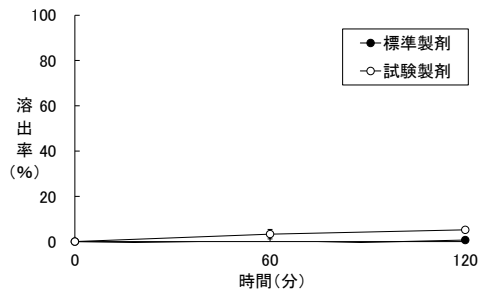
pH6.8, 50rpm



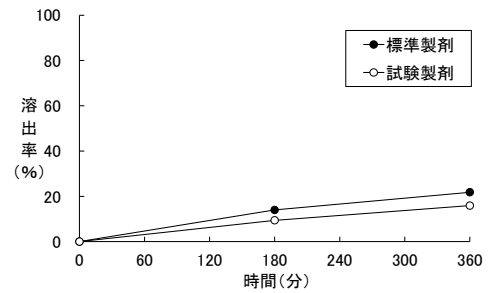
水, 50rpm



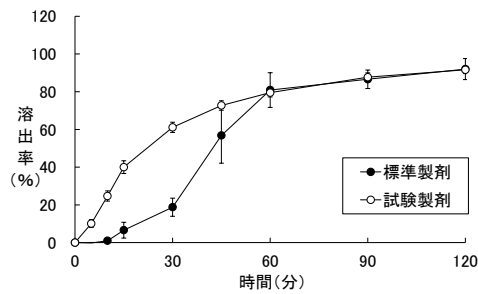
pH1.2, 50rpm (1.0w/v% ポリソルベート 80 添加)



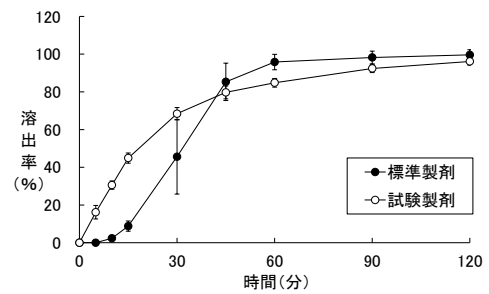
pH4.0, 50rpm (1.0w/v% ポリソルベート 80 添加)



pH6.8, 50rpm (1.0w/v% ポリソルベート 80 添加)



pH6.8, 100rpm (1.0w/v% ポリソルベート 80 添加)



8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- ・ 呈色反応
- ・ 紫外可視吸光度測定法
- ・ 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

気管支喘息、アレルギー性鼻炎

2. 用法及び用量

通常、成人にはプラシルカスト水和物として1日量450mg（本剤4カプセル）を朝食後及び夕食後の2回に分けて経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ザフィルルカスト、モンテルカストナトリウム

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序³⁾

プラナルカスト水和物は、システイニルロイコトリエン (LTC₄、D₄、E₄) に対する選択的 CysLT₁ 受容体拮抗薬である。プラナルカスト水和物は *in vitro* において LTD₄ による気道平滑筋細胞の増殖抑制作用が報告されており、また気道リモデリングに対する抑制効果も示唆されている。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

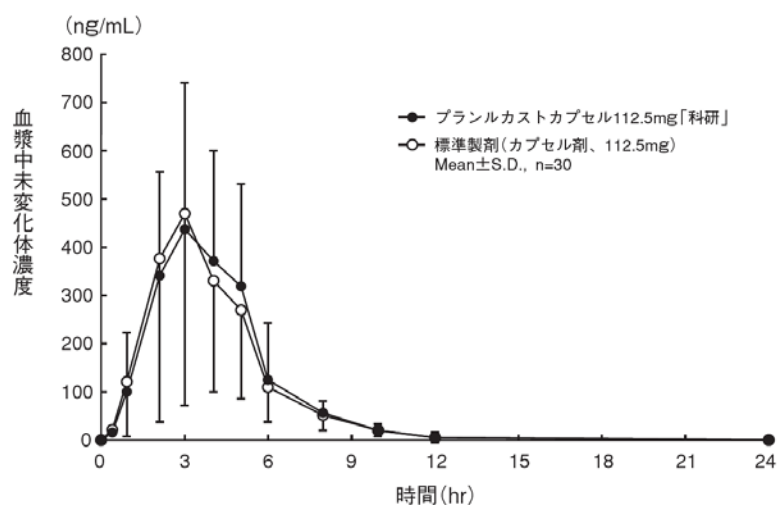
(2) 最高血中濃度到達時間

「(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁴⁾

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成13年5月31日改正 医薬審発第786号 別紙)に準拠し実施)

ブランルカストカプセル 112.5mg「科研」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル(ブランルカスト水和物として112.5mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=30)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ブランルカストカプセル 112.5mg「科研」	1998.4±924.3	567.1±253.3	3.1±1.1	3.3±1.9
標準製剤 (カプセル剤、112.5mg)	1956.8±1227.7	588.5±405.8	3.1±1.1	4.3±3.7

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「ⅧⅢ-7. 相互作用」の項参照

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

0.273±0.126 (hr⁻¹) (試験製剤単回投与時、平均±標準偏差、n=30)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸 収

該当資料なし

4. 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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

該当資料なし

5. 代 謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

本剤は主として CYP3A4 で代謝される（「VIII-7. 相互作用」の項参照）。

(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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排 泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (1) 本剤は気管支拡張剤、ステロイド剤等と異なり、すでに起こっている喘息発作を緩解する薬剤ではないので、このことは患者に十分説明しておく必要がある。
- (2) 気管支喘息患者に本剤を投与中、大発作をみた場合は、気管支拡張剤あるいはステロイド剤を投与する必要がある。
- (3) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。
- (4) 本剤投与によりステロイド維持量を減量し得た患者で、本剤の投与を中止する場合は、原疾患再発のおそれがあるので注意すること。
- (5) 本剤を含めロイコトリエン拮抗剤使用時に **Churg-Strauss** 症候群様の血管炎を生じたとの報告がある。これらの症状は、おおむね経口ステロイド剤の減量・中止時に生じている。本剤使用時は、特に好酸球数の推移及びしびれ、四肢脱力、発熱、関節痛、肺の浸潤影等の血管炎症状に注意すること。
- (6) 他のロイコトリエン拮抗剤を投与した患者で、因果関係は明らかではないがうつ病、自殺念慮、自殺及び攻撃的行動を含む精神症状が報告されているので、本剤の投与にあたっては患者の状態を十分に観察すること。
- (7) 本剤投与により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

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
主に CYP3A4 によって代謝される薬剤	本剤及びこれらの薬剤の血中濃度が上昇する可能性がある。	本剤は <i>in vitro</i> 試験で CYP3A4 により代謝され、これらの薬剤の代謝を競合的に阻害するとの報告がある。
CYP3A4 を阻害する薬剤 (イトラコナゾール、エリスロマイシン等)	本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。	<i>in vitro</i> 、 <i>in vivo</i> 試験でこれらの薬剤により本剤の代謝が阻害されるとの報告がある。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

1) ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、意識障害、呼吸困難、発疹等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。

2) 白血球減少

白血球減少（初期症状：発熱、咽頭痛、全身倦怠感等）があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

3) 血小板減少

血小板減少（初期症状：紫斑、鼻出血、歯肉出血等の出血傾向）があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

4) 肝機能障害

黄疸、AST (GOT)・ALT (GPT) の著しい上昇等を伴う肝機能障害があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には投与を中止し適切な処置を行うこと。

5) 間質性肺炎、好酸球性肺炎

発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常、好酸球増加等を伴う間質性肺炎、好酸球性肺炎があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

6) 横紋筋融解症

横紋筋融解症があらわれることがあるので、筋肉痛、脱力感、CK (CPK) 上昇、血中ミオグロビン上昇等の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。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

(3) その他の副作用

その他の副作用	
頻度 分類	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹、そう痒、蕁麻疹、多形滲出性紅斑等
精神神経系	頭痛、眠気、めまい、不眠、しびれ、味覚異常、ふるえ、けいれん、興奮、不安
消化器	嘔気、腹痛、胃部不快感、下痢、嘔吐、胸やけ、食欲不振、便秘、腹部膨満感、口内炎、舌炎、舌しびれ
循環器	不整脈(頻脈・心房細動・期外収縮等)、動悸、潮紅
肝臓	ビリルビン上昇、AST (GOT)・ALT (GPT) の上昇、アルカリホスファターゼ上昇等
筋骨格系	関節痛、筋肉痛、四肢痛、こわばり、CK (CPK) 上昇
泌尿器	蛋白尿、尿潜血、頻尿、尿量減少、排尿障害、BUN 上昇
その他	胸部絞扼感、発熱、浮腫、倦怠感、トリグリセリド上昇、出血、好酸球増多、咽喉頭異常感、口渇、耳鳴、尿沈渣陽性、脱毛、生理不順、乳房腫脹・硬結、乳房痛、女性化乳房

注) 発現した場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)」、「(2) 重大な副作用と初期症状」及び「(3) その他の副作用」の項参照

9. 高齢者への投与

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(例えば、1回1カプセルを1日2回)など注意すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

11. 小児等への投与

小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

該当しない

14. 適用上の注意

適用上の注意

薬剤交付時

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報告されている。)

15. その他の注意

該当しない

16. その他

特になし

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) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII-6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」及び「VIII-14. 適用上の注意」の項参照

くすりのしおり：あり

患者向医薬品ガイド：あり

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

なし

6. 包 装

P T P：140 カプセル（14 カプセル×10）、420 カプセル（14 カプセル×30）、
1400 カプセル（14 カプセル×100）

バ ラ：100 カプセル

7. 容器の材質

[PTP 包装製品]

P T P：ポリ塩化ビニル、アルミニウム

ピ ロ ー：アルミニウム、ポリエチレン

個 装 箱：紙

[バラ包装製品]

袋：アルミニウム、ポリエチレン

個 装 箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：オノンカプセル等

同 効 薬：ザフィルルカスト、モンテルカストナトリウム

9. 国際誕生年月日

1995年3月31日（国内開発）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2007年3月15日

承認番号：21900AMX00394000

11. 薬価基準収載年月日

2007年7月6日

12. 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

○承認時（2007年3月15日承認）

【効能・効果】気管支喘息

【用法・用量】通常、成人にはبرانルカスト水和物として1日量450mg（本剤4カプセル）を朝食後及び夕食後の2回に分けて経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

○追加された効能・効果及び用法・用量（下線部、2009年9月4日承認）

【効能・効果】気管支喘息、アレルギー性鼻炎

【用法・用量】変更なし

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

HOT（9桁）番号	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
117931601	4490017M1052	620005530

17. 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. 文献

1. 引用文献

- 1) シオノケミカル株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) シオノケミカル株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 3) 國分 二三男：医薬ジャーナル，38 (S-1)，173，2002
- 4) シオノケミカル株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)

2. その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

1. その他の関連資料

(1) GS1 コード

製品名	包装	GS1 コード	
		販売包装単位	調剤包装単位
プラシルカストカプセル 112.5mg 「科研」	140 カプセルPTP	(01)14987042 377020	
	420 カプセルPTP	(01)14987042 377044	(01)04987042 377511
	1400 カプセルPTP	(01)14987042 377082	
	100 カプセルバラ	(01)14987042 377013	(01)04987042 377528

