

# 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に準拠して作成

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

## プラナルカストドライシロップ10%「JG」

Pranlukast Dry Syrup

剤形	ドライシロップ剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1g中 日局 プランルカスト水和物 100mg 含有
一般名	和名：プランルカスト水和物（JAN） 洋名：Pranlukast Hydrate（JAN）
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：2011年4月1日 発売年月日：2011年11月28日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本ジェネリック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 受付時間：9時～18時（土、日、祝日を除く） TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172 医療関係者向けホームページ： <a href="http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html">http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html</a>

本IFは2018年8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、(独)医薬品医療機器総合機構(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>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、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。この変更に合わせて、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、(独)医薬品医療機器総合機構(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) 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 PMDA ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて 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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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 PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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	11. 力価	8
1. 開発の経緯	1	12. 混入する可能性のある夾雑物	8
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	9
II. 名称に関する項目	2	14. その他	9
1. 販売名	2	V. 治療に関する項目	10
(1)和名	2	1. 効能又は効果	10
(2)洋名	2	2. 用法及び用量	10
(3)名称の由来	2	3. 臨床成績	10
2. 一般名	2	(1)臨床データパッケージ	10
(1)和名(命名法)	2	(2)臨床効果	10
(2)洋名(命名法)	2	(3)臨床薬理試験	10
(3)ステム	2	(4)探索的試験	10
3. 構造式又は示性式	2	(5)検証的試験	10
4. 分子式及び分子量	2	1)無作為化並行用量反応試験	10
5. 化学名(命名法)	2	2)比較試験	10
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	3)安全性試験	10
7. CAS登録番号	2	4)患者・病態別試験	10
III. 有効成分に関する項目	3	(6)治療の使用	11
1. 物理化学的性質	3	1)使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	11
(1)外観・性状	3	2)承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要	11
(2)溶解性	3	VI. 薬効薬理に関する項目	12
(3)吸湿性	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	12
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	3	2. 薬理作用	12
(5)酸塩基解離定数	3	(1)作用部位・作用機序	12
(6)分配係数	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	12
(7)その他の主な示性値	3	(3)作用発現時間・持続時間	12
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	VII. 薬物動態に関する項目	13
3. 有効成分の確認試験法	3	1. 血中濃度の推移・測定法	13
4. 有効成分の定量法	3	(1)治療上有効な血中濃度	13
IV. 製剤に関する項目	4	(2)最高血中濃度到達時間	13
1. 剤形	4	(3)臨床試験で確認された血中濃度	13
(1)剤形の区別、外観及び性状	4	(4)中毒域	14
(2)製剤の物性	4	(5)食事・併用薬の影響	14
(3)識別コード	4	(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	14
(4)pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	4	2. 薬物速度論的パラメータ	14
2. 製剤の組成	4	(1)解析方法	14
(1)有効成分(活性成分)の含量	4	(2)吸収速度定数	14
(2)添加物	4	(3)バイオアベイラビリティ	14
(3)その他	4	(4)消失速度定数	14
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	(5)クリアランス	14
4. 製剤の各種条件下における安定性	4	(6)分布容積	14
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	(7)血漿蛋白結合率	15
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	5	3. 吸収	15
7. 溶出性	6		
8. 生物学的試験法	8		
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8		
10. 製剤中の有効成分の定量法	8		



4. 分布	15	IX. 非臨床試験に関する項目	21
(1)血液－脳関門通過性	15	1. 薬理試験	21
(2)血液－胎盤関門通過性	15	(1)薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）	21
(3)乳汁への移行性	15	(2)副次的薬理試験	21
(4)髄液への移行性	15	(3)安全性薬理試験	21
(5)その他の組織への移行性	15	(4)その他の薬理試験	21
5. 代謝	15	2. 毒性試験	21
(1)代謝部位及び代謝経路	15	(1)単回投与毒性試験	21
(2)代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種	15	(2)反復投与毒性試験	21
(3)初回通過効果の有無及びその割合	15	(3)生殖発生毒性試験	21
(4)代謝物の活性の有無及び比率	15	(4)その他の特殊毒性	21
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	15	X. 管理的事項に関する項目	22
6. 排泄	15	1. 規制区分	22
(1)排泄部位及び経路	15	2. 有効期間又は使用期限	22
(2)排泄率	15	3. 貯法・保存条件	22
(3)排泄速度	15	4. 薬剤取扱い上の注意点	22
7. トランスポーターに関する情報	15	(1)薬局での取扱い上の留意点について	22
8. 透析等による除去率	16	(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）	22
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17	(3)調剤時の留意点について	22
1. 警告内容とその理由	17	5. 承認条件等	22
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17	6. 包装	22
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	17	7. 容器の材質	22
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17	8. 同一成分・同効薬	22
5. 慎重投与内容とその理由	17	9. 国際誕生年月日	22
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
7. 相互作用	18	11. 薬価基準収載年月日	23
(1)併用禁忌とその理由	18	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	23
(2)併用注意とその理由	18	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	23
8. 副作用	18	14. 再審査期間	23
(1)副作用の概要	18	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
(2)重大な副作用と初期症状	18	16. 各種コード	23
(3)その他の副作用	19	17. 保険給付上の注意	23
(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	19	XI. 文献	24
(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	19	1. 引用文献	24
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法	19	2. その他の参考文献	24
9. 高齢者への投与	19	XII. 参考資料	25
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19	1. 主な外国での発売状況	25
11. 小児等への投与	19	2. 海外における臨床支援情報	25
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	20	XIII. 備考	26
13. 過量投与	20	その他の関連資料	26
14. 適用上の注意	20		
15. その他の注意	20		
16. その他	20		

# I. 概要に関する項目

---

## 1. 開発の経緯

プラナルカストドライシロップ10%「JG」は、プラナルカスト水和物を含有する気管支喘息・アレルギー性鼻炎治療剤である。

プラナルカストはロイコトリエン（LT）受容体拮抗薬であり、ロイコトリエン受容体に働いて、気管支喘息やアレルギー性鼻炎の鼻閉の発生に関与するペプチドロイコトリエンC<sub>4</sub>、D<sub>4</sub>、E<sub>4</sub>の作用を抑える。<sup>1)</sup>

本邦では、カプセル剤が1995年、ドライシロップ剤が1999年上市されている。

本剤は、「医薬品の承認申請について」（平成17年3月31日 厚生労働省医薬食品局長通知 薬食発第0331015号）に基づき2007年3月に製造販売承認を取得し、日本ジェネリック株式会社が2011年11月に販売を開始した。

2016年5月に「アレルギー性鼻炎」の適応が追加承認された

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 本剤は、小児が服用しやすいドライシロップ製剤である。

(2) 重大な副作用としては、ショック、アナフィラキシー、白血球減少、血小板減少、肝機能障害、間質性肺炎、好酸球性肺炎、横紋筋融解症が報告されている（全て頻度不明）。

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

#### (1) 和名

プラナルカストドライシロップ 10% 「JG」

#### (2) 洋名

Pranlukast Dry Syrup 10% “JG”

#### (3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」 より命名

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

プラナルカスト水和物 (JAN)

#### (2) 洋名 (命名法)

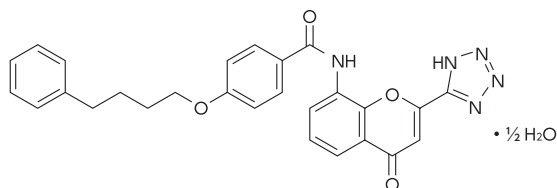
Pranlukast Hydrate (JAN)

Pranlukast (INN)

#### (3) ステム

ロイコトリエン受容体拮抗薬: -lukast

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式:  $\text{C}_{27}\text{H}_{23}\text{N}_5\text{O}_4 \cdot \frac{1}{2}\text{H}_2\text{O}$

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

特になし

### 7. CAS 登録番号

150821-03-7 (Pranlukast Hydrate)

103177-37-3 (Pranlukast)

### 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

エタノール（99.5）に極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

溶解度 <sup>2)</sup>	pH1.2	: 0.1 μg/mL
	pH4.0	: 0.1 μg/mL
	pH6.8	: 0.8 μg/mL
	水	: 0.3 μg/mL
	pH8.0	: 0.1 μg/mL
	pH6.8 + 0.5%ポリソルベート 80	: 1.3mg/mL
pH6.8 + 1.0%ポリソルベート 80	: 1.8mg/mL	

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：233°C（分解）

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa：3.42(滴定法)<sup>2)</sup>

##### (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

日局「プラニルカスト水和物」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法（257nm 付近に吸収の極大を示す。257nm における  $E_{1\%}^{1\text{cm}}$  は約 855 である。）

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

#### 4. 有効成分の定量法

日局「プラニルカスト水和物」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

白色～微黄色の粒状または粉末で、味は甘い。

#### (2) 製剤の物性

該当しない

#### (3) 識別コード

該当しない

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1g 中 日局 プランルカスト水和物 100mg 含有

#### (2) 添加物

精製白糖、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース

#### (3) その他

該当しない

### 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

#### ◎ 加速試験<sup>3)</sup>

包装形態：バラ包装（乾燥剤入り）

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験		溶出試験 (%)	定量試験 (%)
		(2)	(3)		
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)
試験開始時	適合（微黄色の粒状）	適合	適合	81～93	100.5
1 ヶ月後	適合（微黄色の粒状）	適合	適合	83～92	100.3
3 ヶ月後	適合（微黄色の粒状）	適合	適合	85～91	100.5
6 ヶ月後	適合（微黄色の粒状）	適合	適合	84～94	99.9

(1) 白色～微黄色の粒状または粉末である。

(2) 紫外可視吸光度測定法：256～260nm に吸収の極大を示し、310nm～318nm に吸収の肩を示す。

(3) 薄層クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得たスポットの  $R_f$  値は等しい。

- (4) 60 分間 70%以上 (pH7.2 のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液、パドル法、50rpm)
- (5) 表示量の 95.0~105.0%

最終包装製品を用いた加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月) 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。

◎ 無包装状態での安定性試験<sup>4)</sup>

試験条件：

- ①温度に対する安定性試験：40℃、6 ヶ月 (遮光・気密容器)
- ②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、6 ヶ月 (遮光・開放)
- ③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lux・hr (気密容器)

試験項目：性状、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	溶出試験 (%)	定量試験 (%)
規格	(1)	(2)	(3)
試験開始時	適合 (微黄色の粒状)	82~87	100.4
①温度	変化なし	変化なし	変化なし
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし
③光	変化なし	変化なし	変化なし

- (1) 白色~微黄色の粒状または粉末である。
- (2) 60 分間 70%以上 (pH7.2 のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液、パドル法、50rpm)
- (3) 表示量の 95.0~105.0%

安定性の評価は「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」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

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

### 【溶出挙動の同等性】<sup>5)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインの一部改正について（平成13年5月31日 医薬審発第786号）」に従う。

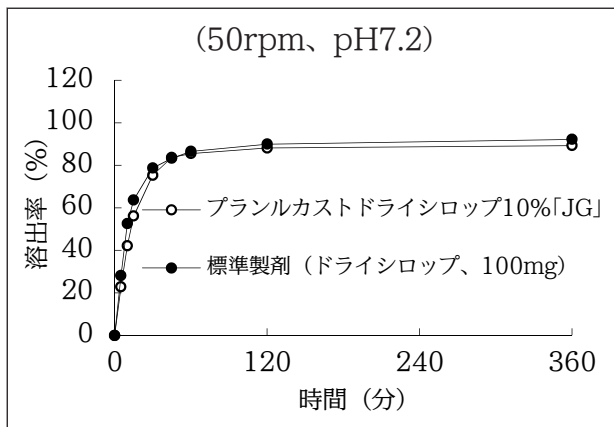
試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 崩壊試験第1液
			pH6.5	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH7.2	薄めた McIlvaine の緩衝液
			水	日本薬局方 精製水
	100rpm	pH7.2	薄めた McIlvaine の緩衝液	
試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

### ・判定基準

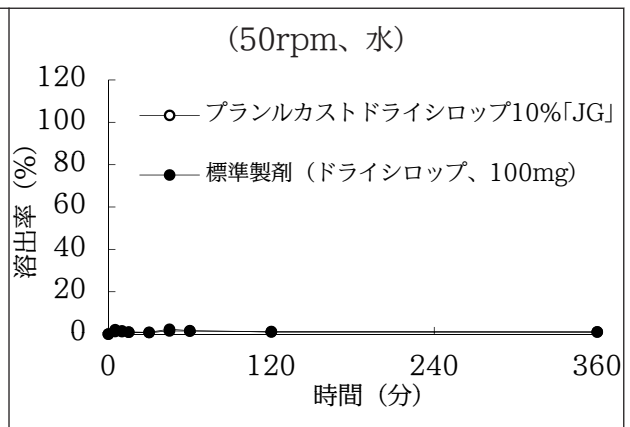
回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。
	pH6.5	
	pH7.2	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	水	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。
100	pH7.2	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

### ・試験結果

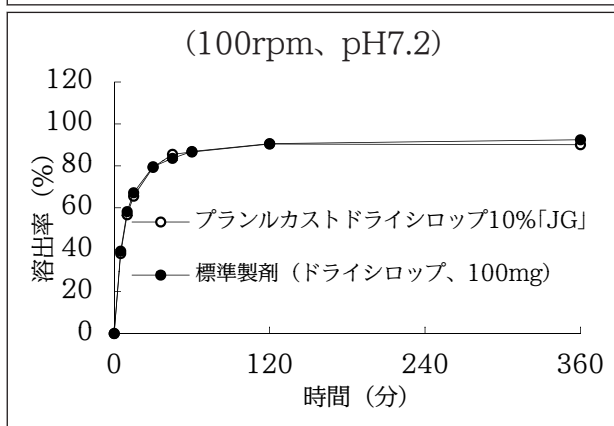
試験条件	試験結果
<p>(50rpm、pH1.2)</p>	<p>(50rpm、pH6.5)</p>
<p>判定時点である 5 分及び 120 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である 5 分及び 360 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>



判定時点である5分及び60分において、試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である5分及び360分において、試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である5分及び45分において、試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。

溶出挙動の同等性の判定（平均溶出率）

回転数 (rpm)	試験液	判定 時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤 (ドライシロップ、100mg)	試験製剤 (プラシルカストドライシ ロップ 10% 「JG」)	
50	pH1.2	5	0.00	0.00	適合
		120	0.00	0.00	
	pH6.5	5	5.72	3.93	適合
		360	9.15	6.79	
	pH7.2	5	28.15	22.77	適合
		60	86.53	85.49	
水	5	2.08	1.20	適合	
	360	0.99	1.03		
100	pH7.2	5	39.32	38.16	適合
		45	83.58	85.52	

結論

試験製剤と標準製剤の溶出挙動の同等性を判定したところ、いずれの試験条件においても「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインの一部改正について（平成13年5月31日 医薬審発第786号）」の判定基準に適合していた。

以上より、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等と確認された。

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

(1) 紫外可視吸光度測定法：256～260nm に吸収の極大を示し、310nm～318nm に吸収の肩を示す。

(2) 薄層クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液から得たスポットの  $R_f$  値は等しい。

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

該当しない

14. その他

該当しない



## 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、小児にはプラナルカスト水和物として1日量7mg/kg（ドライシロップとして70mg/kg）を朝食後および夕食後の2回に分け、用時懸濁して経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。1日最高用量はプラナルカスト水和物として10mg/kg（ドライシロップとして100mg/kg）とする。ただし、プラナルカスト水和物として成人の通常の用量である450mg/日（ドライシロップとして4.5g/日）を超えないこと。

体重別の標準投与量は、通常、下記の用量を1回量とし、1日2回、朝食後および夕食後に経口投与する。

体 重	ドライシロップ 1 回量
12kg 以上 18kg 未満	0.5g（プラナルカスト水和物として50mg）
18kg 以上 25kg 未満	0.7g（プラナルカスト水和物として70mg）
25kg 以上 35kg 未満	1.0g（プラナルカスト水和物として100mg）
35kg 以上 45kg 未満	1.4g（プラナルカスト水和物として140mg）

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (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

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない

## 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

ロイコトリエン (LT) 受容体拮抗剤 (モンテルカストナトリウム、ザフィルルカスト 等)

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

- 1) アレルギーの発症にはヒスタミンやロイコトリエンが関与するが、プランルカストはロイコトリエン受容体に拮抗し、抗炎症作用、気管支収縮抑制作用を示し、気道過敏症を抑制、また鼻粘膜での抗炎症作用、過敏性抑制作用を示す。<sup>6)</sup>
- 2) システイニルロイコトリエン (cys-LTs) は LTC<sub>4</sub>、LTD<sub>4</sub>、LTE<sub>4</sub> から成り、気管平滑筋を強力に収縮させる。cys-LTs の気管支収縮作用は cys-LT<sub>1</sub> 受容体を介している。プランルカストは cys-LT<sub>1</sub> 受容体拮抗薬であり、cys-LTs による気管支平滑筋の収縮を抑制することが喘息症状の改善に寄与しているものと考えられる。<sup>7)</sup>
- 3) アレルギー性鼻炎において重要な役割を果たしている LT による好酸球浸潤を伴う鼻粘膜浮腫および鼻粘膜過敏症等を抑制することにより、臨床症状を改善する。<sup>8)</sup>

#### (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

健康成人男子

薬剤名	投与量	投与方法	Tmax (hr)
プラシルカスト ドライシロップ 10% 「JG」	2.25g (プラシルカスト水和物として 225mg)	絶食単回 経口投与	2.3±0.9

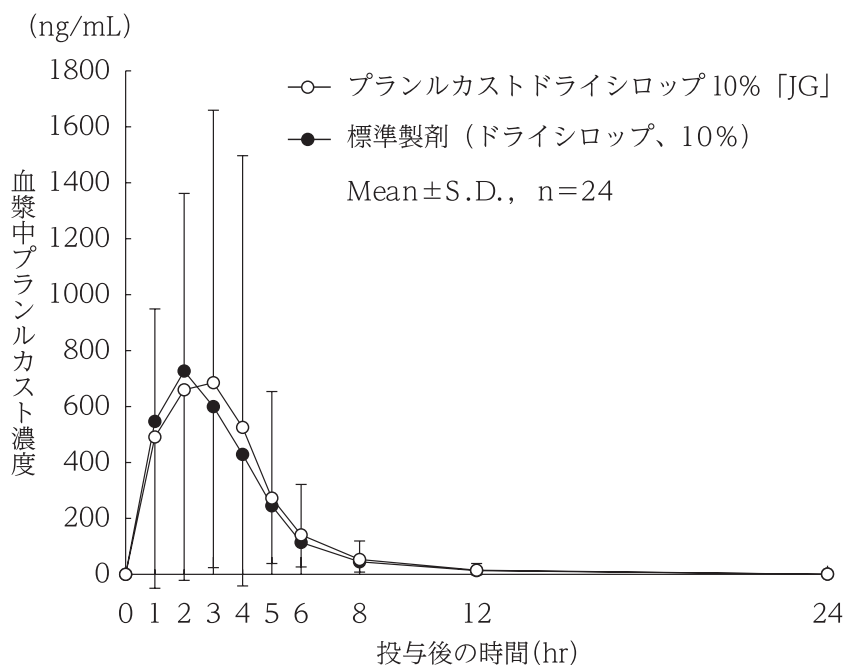
(Mean±S.D.,n=24)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

【生物学的同等性試験】<sup>9)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成13年5月31日医薬審発第786号）」に従う。

プラシルカストドライシロップ 10% 「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2.25g（プラシルカスト水和物として 225mg）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、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  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>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-24</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
برانلکاست ドライシロップ 10% 「JG」	3130.0±4100.9	855.7±952.5	2.3±0.9	1.9±0.7
標準製剤 (ドライシロップ、10%)	2964.4±2491.4	815.3±628.0	2.2±0.8	2.1±0.9

(Mean±S.D.,n=24)

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。

<同等性の判定結果>

	AUC <sub>0-24</sub>	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.066)	log(1.021)
90%信頼区間	log(0.969)~log(1.172)	log(0.915)~log(1.139)

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 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

健康成人男子

薬剤名	投与量	投与方法	kel (hr <sup>-1</sup> )
برانلکاست ドライシロップ 10% 「JG」	2.25g (برانلکاست水和物として 225mg)	絶食単回 経口投与	0.416±0.136

(Mean±S.D.,n=24)

(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

該当資料なし

(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好酸球性多発血管炎性肉芽腫症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。特に、小児の通年性アレルギー性鼻炎については、臨床試験において、本剤群のプラセボ群に対する優越性は示されなかったため、患者の状態を観察し、有益性が認められない場合には漫然と投与しないこと。

(8) 小児では一般に自覚症状を訴える能力が劣るので、本剤の投与に際しては、保護者等に対し、患者の状態を十分に観察し、異常が認められた場合には速やかに主治医に連絡する等の適切な処置をするように注意を与えること。

## 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（以下、全て頻度不明）

#### 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

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

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

「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 -2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)、-8. 副作用(2)重大な副作用と初期症状、-(3)その他の副作用「過敏症」」の項参照

#### 9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

#### 10. 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まわ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

低出生体重児、新生児、乳児に対する安全性は確立していない（低出生体重児、新生児に対しては使用経験がなく、乳児に対しては使用経験が少ない）。

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

該当しない

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

# 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	プラシルカストドライシロップ 10% 「JG」	該当しない (処方箋医薬品以外の医薬品)
有 効 成 分	プラシルカスト水和物	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

室温保存、気密容器

### 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. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 -6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照

- ・患者向医薬品ガイド：有り
- ・くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

バラ：100g

### 7. 容器の材質

バラ包装：ポリエチレン（ボトル）、ポリプロピレン（キャップ）、乾燥剤（シリカゲル）

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：オノン®ドライシロップ 10%（小野薬品工業）他  
同 効 薬：モンテルカストナトリウム、ザフィルルカスト 等

### 9. 国際誕生年月日

該当しない

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	承認番号
2007年3月15日	21900AMX00339000

11. 薬価基準収載年月日

2011年4月1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

承認年月日：2016年5月11日

効能・効果の内容：「アレルギー性鼻炎」の効能・効果を追加した。

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（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	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
プラナルカストドライ シロップ10%「JG」	117834003	4490017R1203	621783403

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。

# X I . 文献

---

## 1. 引用文献

- 1) 田中千賀子、加藤隆一、成宮周編集；NEW 薬理学（改訂第7版）、453（2017）、南江堂
- 2) オレンジブック総合ホームページ <http://www.jp-orangebook.gr.jp/>  
（アクセス 2018.7.26）
- 3) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
　　プランルカストドライシロップ 10%「JG」の安定性試験（2011）
- 4) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
　　プランルカストドライシロップ 10%「JG」の無包装状態での安定性試験（2011）
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
　　プランルカストドライシロップ 10%「JG」の溶出試験（2011）
- 6) 第十七改正日本薬局方解説書、C - 4585（2016）、廣川書店
- 7) 高折修二 他監訳；グッドマン・ギルマン薬理書（上）（第10版）、946（2003）、廣川書店
- 8) Allergol Int.2011 Dec;60（4）：483-9
- 9) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
　　プランルカストドライシロップ 10%「JG」の生物学的同等性試験（2011）

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 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

該当資料なし

## X III. 備考

---

その他の関連資料

該当資料なし



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目9番1号