

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DS10%「サワイ」 プラナルカストカプセル112.5mg「サワイ」

PRANLUKAST

プラナルカスト製剤

剤形	DS10% : ドライシロップ カプセル112.5mg : 硬カプセル剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	DS10% : 1g中日局プラナルカスト水和物100mg含有 カプセル112.5mg : 1カプセル中日局プラナルカスト水和物112.5mg含有
一般名	和名 : プラナルカスト水和物 洋名 : Pranlukast Hydrate
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 (DS10%) 2009年1月8日 (カプセル112.5mg) 薬価基準収載年月日 : 2007年7月6日 (DS10%) 2009年5月15日 (カプセル112.5mg) 発売年月日 : 2007年7月6日 (DS10%) 2009年5月15日 (カプセル112.5mg)
開発・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 : 06-6394-7355 医療関係者向けホームページ : http://med.sawai.co.jp

本IFは2016年4月改訂(DS10%)、2012年1月改訂(カプセル112.5mg)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、独立行政法人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 —日本病院薬剤師会—

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、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.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を掲載する医薬品情報提供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、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供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情報提供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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	21
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	21
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	21
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	21
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	21
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	21
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	22
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	22
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	24
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	24
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	24
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	24
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	24
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	24
4. 有効成分の定量法	4	15. その他の注意	24
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他	24
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	25
2. 製剤の組成	5	1. 薬理試験	25
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	25
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	X. 管理的事項に関する項目	26
5. 調製法及び溶解後の安定性	8	1. 規制区分	26
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	2. 有効期間又は使用期限	26
7. 溶出性	9	3. 貯法・保存条件	26
8. 生物学的試験法	12	4. 薬剤取扱い上の注意点	26
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12	5. 承認条件等	26
10. 製剤中の有効成分の定量法	13	6. 包装	26
11. 力価	13	7. 容器の材質	27
12. 混入する可能性のある夾雑物	13	8. 同一成分・同効薬	27
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	13	9. 国際誕生年月日	27
14. その他	13	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	27
V. 治療に関する項目	14	11. 薬価基準収載年月日	27
1. 効能又は効果	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	27
2. 用法及び用量	14	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	28
3. 臨床成績	14	14. 再審査期間	28
VI. 薬効薬理に関する項目	16	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	28
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	16	16. 各種コード	28
2. 薬理作用	16	17. 保険給付上の注意	28
VII. 薬物動態に関する項目	17	XI. 文献	29
1. 血中濃度の推移・測定法	17	1. 引用文献	29
2. 薬物速度論的パラメータ	19	2. その他の参考文献	29
3. 吸収	19	XII. 参考資料	30
4. 分布	19	1. 主な外国での発売状況	30
5. 代謝	20	2. 海外における臨床支援情報	30
6. 排泄	20	XIII. 備考	30
7. トランスポーターに関する情報	20	その他の関連資料	30
8. 透析等による除去率	20		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

プラナルカストDS10%/カプセル112.5mg「サワイ」は、日局プラナルカスト水和物を含有する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である。

プラナルカストは、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。¹⁾

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。

	プラナルカストDS10% 「サワイ」	プラナルカストカプセル 112.5mg「サワイ」
承認申請に際し準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号	
承認	2007年3月	2009年1月
上市	2007年7月	2009年5月

2009年9月に「アレルギー性鼻炎」の効能・効果が追加承認された。[カプセル112.5mg] (X. -12. 参照)

2016年4月に「アレルギー性鼻炎」の効能・効果が追加承認された。[DS10%] (X. -12. 参照)

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 識別性を考慮し、カプセル本体に成分名、含量及び識別コードを表示している。[カプセル112.5mg]
- 2) においはなく、味は甘い。[DS10%]
- 3) システイニルロイコトリエン(Cys-LTs : LTC₄、LTD₄、LTE₄)の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により喘息症状の改善に寄与しているものと考えられる。²⁾
- 4) Cys-LTsによる毛細血管透過性亢進、粘液分泌亢進、気道への好酸球及び好塩基球の浸潤を抑制するとされている。²⁾
- 5) 重大な副作用として、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(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

برانلکاستDS10%「サワイ」

برانلکاستカプセル112.5mg「サワイ」

2) 洋名

PRANLUKAST

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)

برانلکاست水和物(JAN)

2) 洋名(命名法)

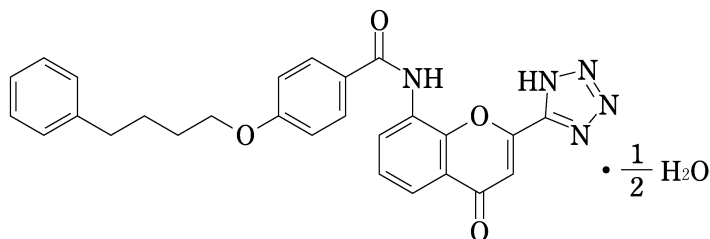
Pranlukast Hydrate(JAN)

Pranlukast(INN)

3) ステム

-lukast : ロイコトリエン受容体拮抗薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

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

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

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³⁾ : pH1.2 : 0.1 μ g/mL、pH4.0 : 0.1 μ g/mL、pH6.8 : 0.8 μ g/mL、水 : 0.3 μ g/mL、
pH8.0 : 0.1 μ g/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

水分 : 1.5～2.2% (50mg、電量滴定法)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点 : 約233°C(分解)

5) 酸塩基解離定数

pKa=3.42(滴定法)³⁾

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

比吸光度 $E_{1\text{cm}}^{1\%}$ (257nm) : 約855 [本品のエタノール(99.5)溶液(1→100000)]¹⁾

2. 有効成分の各種条件下における安定性

保存条件 : 気密容器

3. 有効成分の確認試験法

日局「プランルカスト水和物」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法

4. 有効成分の定量法

日局「プランルカスト水和物」の定量法に準ずる。(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

品名	剤形	外形			性状
		全長(mm)	重量(mg)	カプセル号数	
プラシルカスト DS10%「サワイ」	ドライ シロップ	_____			白色～微黄色の細粒状 で、においはなく、味は 甘い
プラシルカスト カプセル112.5mg 「サワイ」	硬カプセル 剤	15.8	約251	3	頭部：白色～帯黄白色 不透明 胴部：白色～帯黄白色 不透明 内容物：白色～淡黄色の 粒を含む粉末

2) 製剤の物性

● プラシルカストDS10%「サワイ」

製剤均一性(分包品)：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行う
とき、規格に適合する。

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

安息角：31.4° (実測値)

● プラシルカストカプセル112.5mg「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：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

3) 識別コード

● プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

SW-481

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

● プラシルカストDS10%「サワイ」

1g中に日局プラシルカスト水和物100mgを含有する。

● プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

1カプセル中に日局プラシルカスト水和物112.5mgを含有する。

IV. 製剤に関する項目

2) 添加物

● プランルカストDS10%「サワイ」

添加物として、軽質無水ケイ酸、白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、部分アルファー化デンプン含有する。

● プランルカストカプセル112.5mg「サワイ」

添加物として、グリセリン脂肪酸エステル、ステアリン酸Mg、ゼラチン、タルク、マクロゴール4000、モノラウリン酸ソルビタン、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、マクロゴール4000、ラウリル硫酸Na含有する。

3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

● プランルカストDS10%「サワイ」

用時懸濁して経口投与する。

4. 製剤の各種条件下における安定性

● プランルカストDS10%「サワイ」⁴⁾

1) 分包装品の安定性(加速試験)

プランルカストDS10%「サワイ」を分包装(ポリエチレンセロハン)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	帯黄白色の細粒状で、においはなく、味は甘かった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.3	98.6

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)

プランルカストDS10%「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	帯黄白色の細粒状で、においはなく、味は甘かった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.3	99.1

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性

プラシルカストDS10%「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3 ヶ月)
性 状	帯黄白色の細粒状で、においはなく、味は甘かった	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.2	100.4	100.1	100.4

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」⁵⁾

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヶ月
性 状	頭部白色～帯黄白色不透明、胴部白色～帯黄白色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～淡黄色の粒を含む粉末であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
質量偏差試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.4	99.2

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)

プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヶ月
性 状	頭部白色～帯黄白色不透明、胴部白色～帯黄白色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～淡黄色の粒を含む粉末であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
質量偏差試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.4	99.4

※：表示量に対する含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

3) 無包装下の安定性

プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

保存条件		イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C 75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C 60%RH 3ヵ月)
性状	外観	頭部帯黄白色不透明、胴部帯黄白色不透明の硬カプセル剤	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	内容物	帯黄白色の粒を含む粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験		問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※		100.0	99.3	98.9	99.7	98.8

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

5. 調製法及び溶解後の安定性

●プラシルカストDS10%「サワイ」

懸濁後の安定性

プラシルカストDS10%「サワイ」を水道水又は純水に懸濁(本剤0.5gを精密に量り、水2.5mLを加え懸濁)したものについて、30°Cの保存条件下で14日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、懸濁後、14日間は安定であると判断した。⁴⁾

溶解液	試験項目	結果		
		イニシャル	7日後	14日後
水道水	性状	帯黄白色の懸濁液で、においはなかった	変化なし	変化なし
	定量試験※	97.9	97.2	97.9
純水	性状	帯黄白色の懸濁液で、においはなかった	変化なし	変化なし
	定量試験※	98.1	97.7	98.6

※：表示量に対する含有率(%)

XIII. 備考「配合変化試験成績」参照⁶⁾

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

●プラシルカストDS10%「サワイ」

XIII. 備考「配合変化試験成績」参照⁶⁾

<pH変動試験結果>⁶⁾

含量/容量	試料pH	外観	(A)0.1mol/L HCl (B)0.1mol/L NaOH	最終pH 又は変化点pH	移動指数	変化所見
100mg/1g	5.42 (2.5g/精製水5mL)	白色の懸濁液	(A)5.0mL	1.30	4.12	変化なし
			(B)5.0mL	7.28	1.86	変化なし (やや粘性あり)

7. 溶出性

＜溶出挙動における同等性及び類似性＞

● プランルカストDS10%「サワイ」^{7,8)}

通知等	「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 医薬審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水) 50rpm(ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加：pH1.2、pH4.0、pH6.8) 100rpm(pH6.8 ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加)
試験回数	12 ベッセル	

【結果及び考察】

＜50rpm：pH1.2＞

測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。

＜50rpm：pH4.0＞

測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。

＜50rpm：pH6.8＞

測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。

＜50rpm：水＞

測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。

＜50rpm：pH1.2ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加＞

測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。

＜50rpm：pH4.0ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加＞

測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。

＜50rpm：pH6.8ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加＞

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

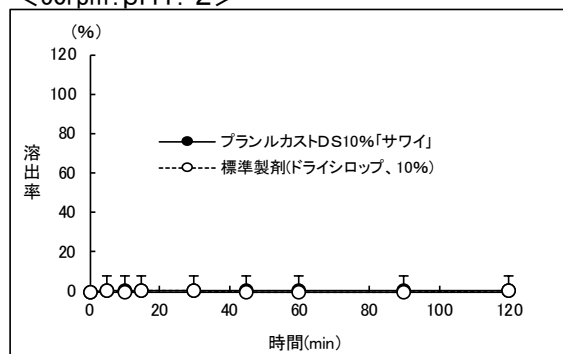
＜100rpm：pH6.8ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加＞

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

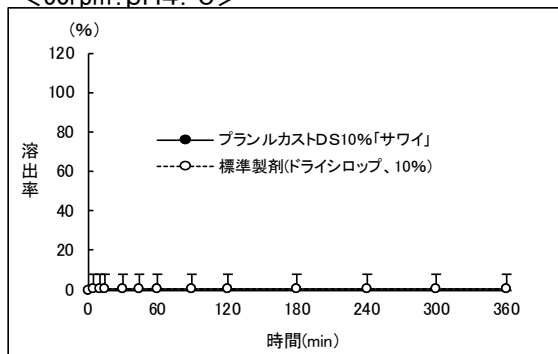
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

(溶出曲線)

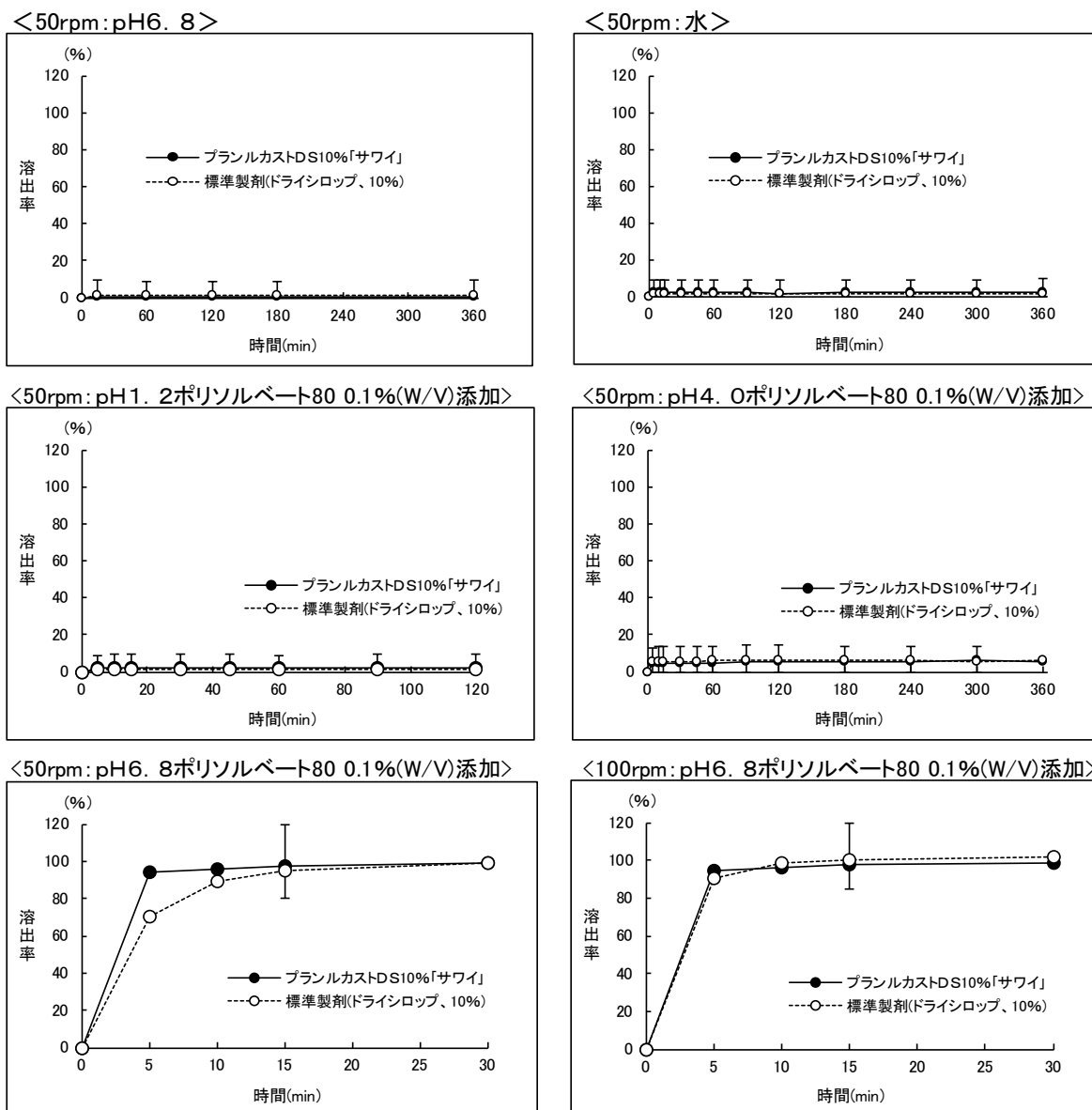
＜50rpm：pH1.2＞



＜50rpm：pH4.0＞



IV. 製剤に関する項目



([] : 判定基準の適合範囲)

● プララルカストカプセル112.5mg「サワイ」^{9, 10)}

本剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2, 4.0, 6.8, 水) 50rpm (ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加: pH1.2, pH4.0, pH6.8) 100rpm (pH6.8 ポリソルベート80 0.1% (W/V) 添加)
試験回数	12 ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm: pH1.2>

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(30分)及び規定された試験時間(120分)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±9%の範囲にあった。

<50rpm : pH4. 0>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(60分)及び規定された試験時間(360分)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±9%の範囲にあった。

<50rpm : pH6. 8>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(180分)及び規定された試験時間(360分)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±9%の範囲にあった。

<50rpm : 水>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(180分)及び規定された試験時間(360分)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±9%の範囲にあった。

<50rpm : pH1. 2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分分)及び規定された試験時間(120分)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±9%の範囲にあった。

<50rpm : pH4. 0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(90分)及び規定された試験時間(360分)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±9%の範囲にあった。

<50rpm : pH6. 8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>

標準製剤の平均溶出率が40%(45分)及び85%(90分)付近の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%の範囲にあった。

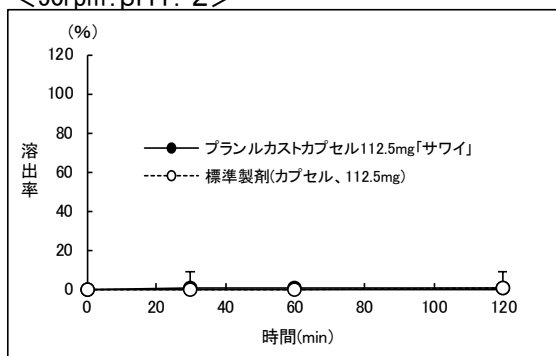
<100rpm : pH6. 8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>

標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(60分)付近の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%の範囲にあった。

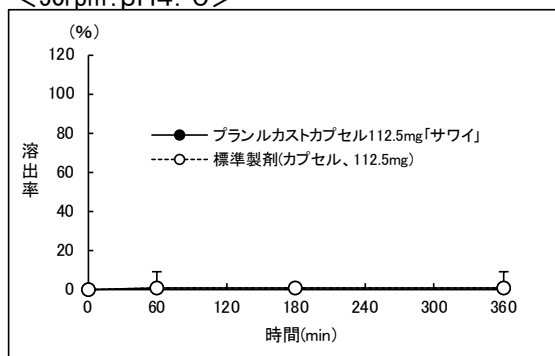
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

<50rpm : pH1. 2>

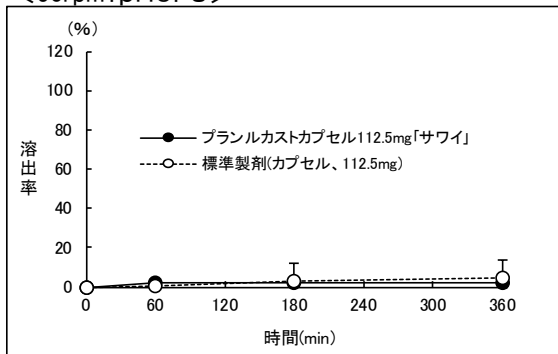


<50rpm : pH4. 0>

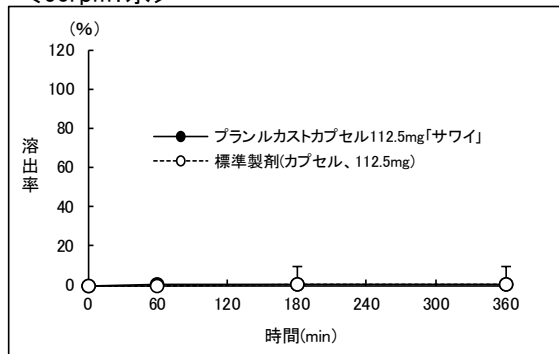


IV. 製剤に関する項目

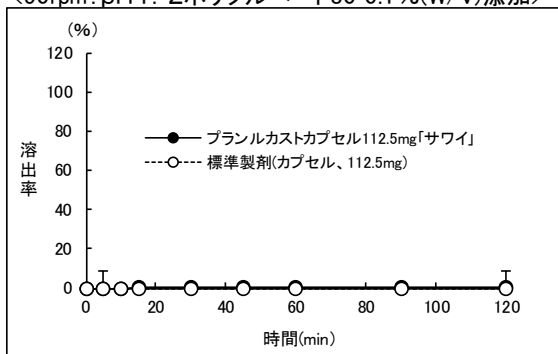
<50rpm: pH6. 8>



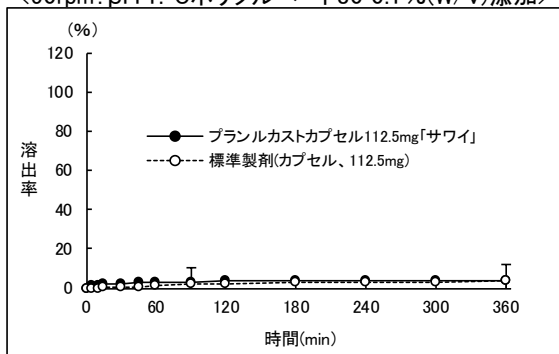
<50rpm: 水>



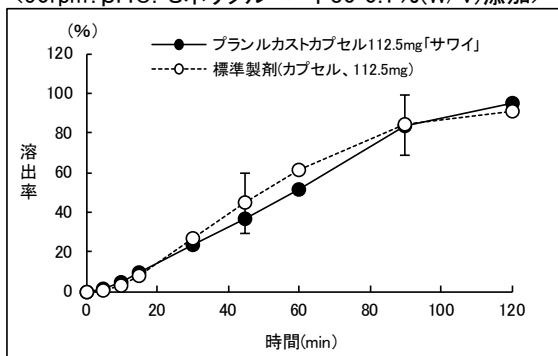
<50rpm: pH1. 2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



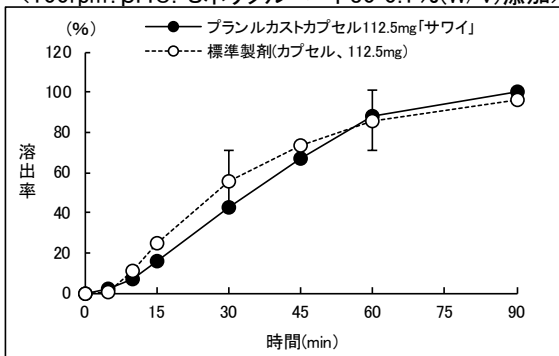
<50rpm: pH4. 0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



<50rpm: pH6. 8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



<100rpm: pH6. 8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



([] : 判定基準の適合範囲)

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

●ブランドカストDS10%「サワイ」

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 薄層クロマトグラフィー

●ブランドカストカプセル112.5mg「サワイ」

- 1) 1-ナフトールのエタノール溶液による呈色反応
- 2) 紫外可視吸光度測定法
- 3) 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
該当資料なし

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

● プランルカストDS10%「サワイ」

通常、小児にはプラン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日最高用量はプラン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、プランルカスト水和物として成人の通常用量である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(プランルカスト水和物として50mg)
18kg以上25kg未満	0.7g(プランルカスト水和物として70mg)
25kg以上35kg未満	1.0g(プランルカスト水和物として100mg)
35kg以上45kg未満	1.4g(プランルカスト水和物として140mg)

● プランルカストカプセル112.5mg「サワイ」

通常、成人にはプラン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

(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……………

ロイコトリエン受容体拮抗薬：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……………

プラシルカストの薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

システイニルロイコトリエン(Cys-LTs：LTC₄、LTD₄、LTE₄)の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により喘息症状の改善に寄与しているものと考えられる。また、プラシルカストはCys-LTsによる毛細血管透過性亢進、粘液分泌亢進、気道への好酸球及び好塩基球の浸潤を抑制するとされている。²⁾

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

軽症から中等症の気管支喘息に対するプラシルカストの効果発現は一般的に数週間以内である。¹⁾

VII. 薬物動態に関する項目

プラシルカスト製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

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

VII. -1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

● プラシルカストDS10%「サワイ」^{8, 12)}

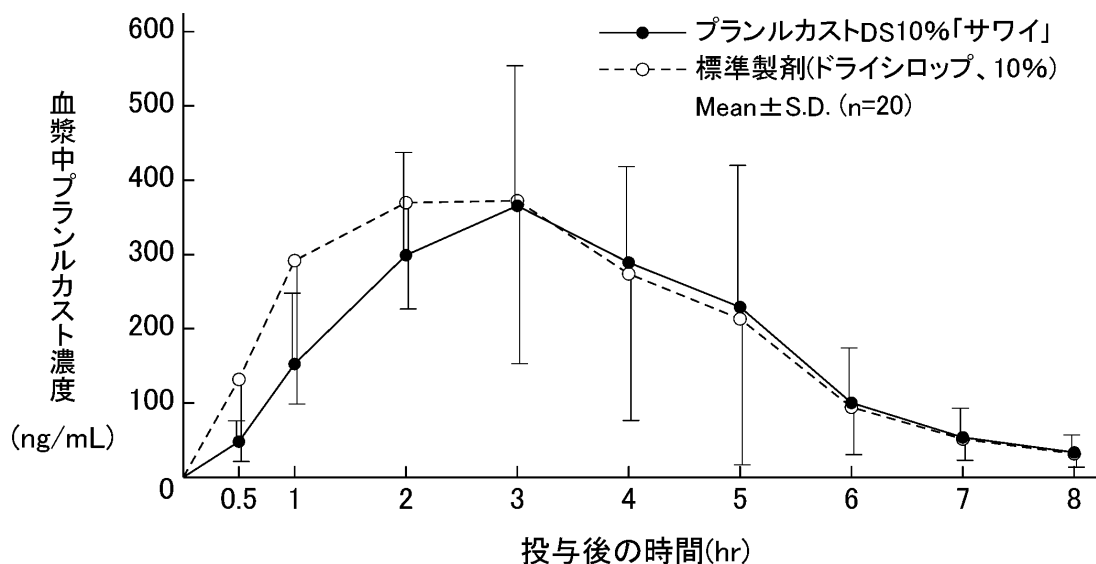
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、0.5、1、2、3、4、5、6、7、8 hr
休薬期間	2日間
測定方法	HPLC法

プラシルカストDS10%「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1g(プラシルカスト水和物として100mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中プラシルカスト濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1g投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (ng・hr/mL)
プラシルカストDS10% 「サワイ」	450±196	3.0±1.0	1.3±0.2	1492±524
標準製剤 (ドライシロップ、10%)	509±238	2.5±1.1	1.3±0.3	1676±662

(Mean±S.D.)



VII. 薬物動態に関する項目

● プランルカストカプセル112.5mg「サワイ」^{10, 13)}

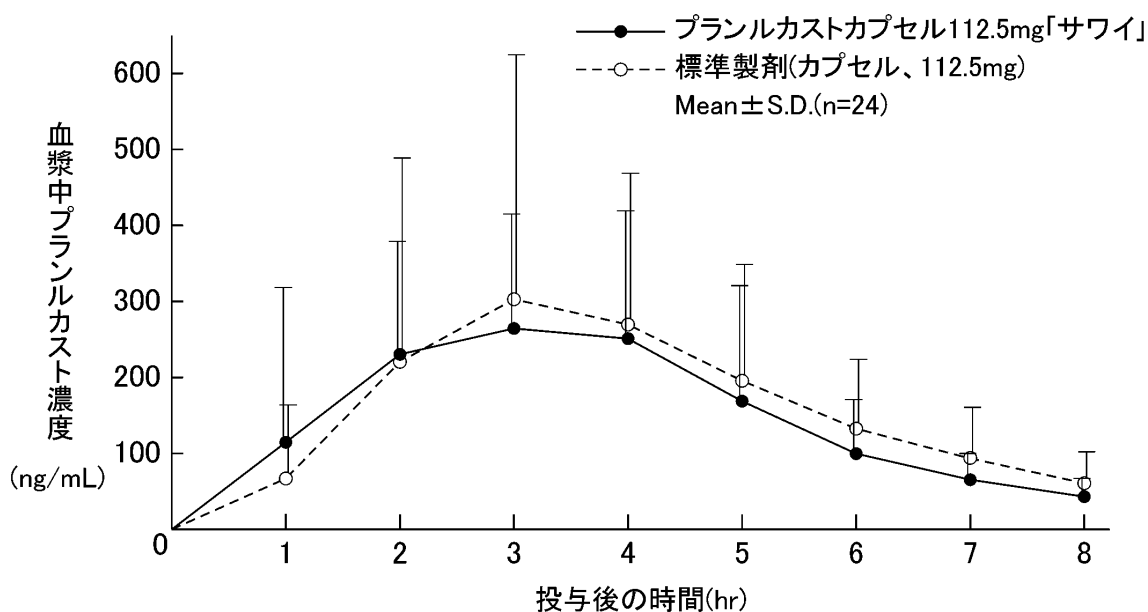
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、1、2、3、4、5、6、7、8 hr
休薬期間	2日間
測定方法	LC/MS法

プランルカストカプセル112.5mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1カプセル（プランルカスト水和物として112.5mg）空腹時単回経口投与（クロスオーバー法）し、血漿中プランルカスト濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1カプセル投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (ng・hr/mL)
プランルカストカプセル 112.5mg「サワイ」	366±230	2.9±0.9	1.8±0.5	1216± 649
標準製剤 (カプセル、112.5mg)	372±309	3.4±1.1	1.8±0.5	1313±1054

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびに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。

4) 中毒域

該当資料なし

5) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 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

● プランルカストDS10%「サワイ」を健康成人男子に1g(プランルカスト水和物として100mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{8,12)}

 $0.556 \pm 0.090 \text{hr}^{-1}$

● プランルカストカプセル112.5mg「サワイ」を健康成人男子に1カプセル(プランルカスト水和物として112.5mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{10,13)}

 $0.424 \pm 0.118 \text{hr}^{-1}$

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

VII. 薬物動態に関する項目

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

in vitro 試験でCYP3A4により代謝される。

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

尿中0.24%、糞中98.9%(72時間後)(225mg、単回経口)¹⁴⁾

2) 排泄率

VII. -6. -1) 参照

3) 排泄速度

VII. -6. -1) 参照

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。[DS10%、カプセル112.5mg]
特に、小児の通年性アレルギー性鼻炎については、他社の臨床試験において、プラシボ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。[DS10%]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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。[DS10%]

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

1) 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

2) その他の副作用	
	頻度不明
過 敏 症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、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、ビリルビン上昇、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	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

プラシルカスト製剤の副作用が以下のとおり報告されている。

ドライシロップ剤の副作用発現率は2.9%(52/1,764)であり、主な副作用は発疹・痒痒0.5%、嘔気0.5%、AST(GOT)・ALT(GPT)上昇等の肝機能異常0.3%等であった。¹⁴⁾

カプセル剤の気管支喘息に対する副作用発現率は3.5%(174/4,963)であり、主な副作用は発疹・痒痒0.6%、腹痛・胃部不快感0.6%、下痢0.4%、嘔気0.3%、AST(GOT)・ALT(GPT)上昇等の肝機能異常0.3%、ビリルビン上昇0.1%等であり、アレルギー性鼻炎に対する副作用発現率は3.2%(119/3,728)であり、主な副作用は腹痛・胃部不快感0.6%、下痢0.5%、発疹・痒痒0.4%、眠気0.3%等であった。¹⁴⁾

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

【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

副作用	
1) 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) その他の副作用	
	頻度不明
過 敏 症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、多形滲出性紅斑、痒痒等

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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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(例えば、1回1カプセルを1日2回[カプセル112.5mg])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

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。][DS10%]
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)。[カプセル112.5mg]

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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)[カプセル112.5mg]

15. その他の注意

該当しない

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

プラシラカストの非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

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
LD₅₀(マウス、♂、静脈内) : >1,000mg/kg¹⁵⁾

 - 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

	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

3. 貯法・保存条件

●プラシルカストDS10%「サワイ」

室温保存

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

室温保存

開封後は湿気を避けて保存すること

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)

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

●プラシルカストDS10%「サワイ」

VIII. -6. 参照

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

VIII. -6. 及びVIII. -14. 参照

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

●プラシルカストDS10%「サワイ」

200包(1包0.7g・4連包)、100g(バラ)、500g(バラ)

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

PTP：140カプセル(14Cap×10)、700カプセル(14Cap×50)

バラ：200カプセル

7. 容器の材質

●プラシルカストDS10%「サワイ」

分包：[本体]ポリエチレンセロハン、[ピロー]アルミラミネートフィルム

バラ：[本体]ポリエチレン瓶、[内蓋]ポリエチレン

[キャップ]ポリプロピレン、ポリエチレン

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

バラ：[本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：オノンドライシロップ10%/カプセル112.5mg

同効薬：ロイコトリエン受容体拮抗剤：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

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

●プラシルカストDS10%「サワイ」

製造販売承認年月日：2007年3月15日、承認番号：21900AMX00409000

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2009年1月8日、承認番号：22100AMX00027000

11. 薬価基準収載年月日

●プラシルカストDS10%「サワイ」：2007年7月6日

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」：2009年5月15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

●プラシルカストカプセル112.5mg「サワイ」

承認年月日：2009年9月14日

効能・効果内容：「アレルギー性鼻炎」の効能・効果を追加した。

X. 管理的事項に関する項目

● プランルカストDS10%「サワイ」

承認年月日：2016年4月20日

効能・効果内容：「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

品名	HOT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
プランルカストDS10% 「サワイ」	118021301	4490017R1130	620005539
プランルカストカプセル 112.5mg「サワイ」	119181301	4490017M1109	620009427

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) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十七改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016, C-4585 - C-4589.
- 2) 高折修二他監訳, グッドマン・ギルマン薬理書, 第11版, 廣川書店, 2007, p. 903-906.
- 3) 日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集, No. 29, 薬事日報社, 2008, p. 207.
- 4) ~ 5) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[配合変化試験成績]
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
- 8) 陶易王他, 新薬と臨牀, **56**(6), 777(2007).
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
- 10) 高野和彦他, 新薬と臨牀, **58**(3), 508(2009).
- 11) 田中千賀子他編, NEW 薬理学, 改訂第5版, 南江堂, 2007, p. 392.
- 12) ~ 13) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]
- 14) JAPAN DRUGS編集委員会編, JAPAN DRUGS 日本医薬品総覧, 2008~2009年版, メディカルレビュー社, 2008, p. 1611-1612.
- 15) The Merck Index 14th edition, 2006, p. 1324.

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

その他の関連資料

配合変化試験成績⁶⁾

● プランルカストDS10%「サワイ」

<配合方法>

プランルカストDS10%「サワイ」(以下、当社製剤)と他剤を配合し、性状(外観、におい、湿潤性、流動性、再分散性、pH)を観察し、含量を測定した。

含量は配合直後のプランルカスト水和物量を100%とし、()に表示量に対する含有率を%で示した。

A : 当社製剤を配合薬剤(粉末製剤)と混合した。

B : 当社製剤を精製水で懸濁し、配合薬剤(シロップ剤)と混合した。

C : 当社製剤を食品・飲料と混合した。

(保存条件)温度 : 1~30°C(室温) 期間 : 7日間(A, B)又は24時間(C)

貯法 : シャーレ開放(ただしゴミが入らないようにする)・散光下(A)

ガラス容器・密栓・散光下(B, C)

流動性 : 「良好」、「少し悪化」、「悪化」、「固化」の4段階で評価した。

再分散性 : 試験液を入れた試験管を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、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回以上は不良とした。

※2012年5月作成の配合変化試験成績を掲載した。

プラシルカストDS10%「サワイ」 配合変化試験成績

【粉末製剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前性状、におい)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
総合感冒剤	幼児用PL顆粒 外 観：うすい橙色 におい：なし	サリチルアミド他	4 g	1 g	A	外観	白色とうすい橙色の混合物	白色とうすい橙色の混合物	白色とうすい橙色の混合物	白色とうすい橙色の混合物
						におい	なし	なし	なし	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
						含量(%)	100.0(100.2)	-	-	101.4
去たん剤	ムコダイン細粒 外 観：白色 におい：-	L-カルボシステイン	1.8g	1 g	A	外観	白色	-	-	白色
						におい	-	-	-	-
						湿潤性	-	-	-	-
						流動性	-	-	-	-
						含量(%)	100.0(98.8)	-	-	102.4
鎮咳去たん剤	アスペリンドライシロップ2% 外 観：橙色 におい：特異なにおい	チペピジンヒベンズ酸塩	2 g	1 g	A	外観	白色とうすい橙色の混合物	白色とうすい橙色の混合物	白色とうすい橙色の混合物	白色とうすい橙色の混合物
						におい	特異なにおい	特異なにおい	わずかに特異なにおい	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
						含量(%)	100.0(104.6)	-	-	96.9*
気管支拡張剤	テオドールドライシロップ20% 外 観：白色 におい：特異なにおい	テオフィリン	1 g	1 g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
						含量(%)	100.0(105.5)	-	-	92.3*
気管支拡張剤	アーデフィリンDS20% 外 観：白色 におい：ピーチのにおい	テオフィリン	1 g	1 g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						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	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
						含量(%)	100.0(103.2)	-	-	95.4*
気管支拡張剤	ホクナリンドライシロップ0.1%小児用 外 観：白色 におい：なし	ツロブテロール塩酸塩	1 g	1 g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	なし	なし	なし	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
						含量(%)	100.0(100.9)	-	-	97.3*
止しゃ剤、整腸剤	メプチン顆粒0.01% 外 観：白色 におい：なし	プロカテロール塩酸塩水和物	0.5g	1 g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	なし	なし	なし	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
						含量(%)	100.0(102.1)	-	-	96.9*
止しゃ剤、整腸剤	ビオフェルミンR 外 観：白色 におい：わずかに特異なにおい	耐性乳酸菌	1.5g	1 g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	なし	なし	なし	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	悪化(一部塊を生じた)	悪化(一部塊を生じた)	悪化(一部塊を生じた)
						含量(%)	100.0(101.2)	-	-	98.0*
混合ビタミン剤	シナール 外 観：淡黄色 におい：なし	アスコルビン酸・パントテン酸カルシウム	4.5g	1 g	A	外観	白色と淡黄色の混合物	白色と淡黄色の混合物	白色と淡黄色の混合物	白色と淡黄色の混合物
						におい	なし	なし	なし	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
						含量(%)	100.0(106.3)	-	-	96.0*

※ 10日後のデータ

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前性状、におい)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
ア ル ギ ー 用 剤	アレジオンドライシロップ1% 外 観：うすい橙色 におい：特異なにおい	エピナスチ ン塩酸塩	1g	1g	A	外観	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物
						におい	なし	なし	なし	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(105.5)	-	-	94.7*					
	セルテクトドライシロップ 外 観：白色 におい：なし	オキサトミ ド	1g	1g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	なし	なし	なし	なし
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(103.7)	-	-	96.7*					
	オキロットDS小児用2% 外 観：白色 におい：なし	オキサトミ ド	1g	1g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	なし	なし	なし	なし
湿潤性						なし	なし	なし	なし	
流動性						良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(104.6)	-	-	94.9*						
ザジテンドライシロップ 外 観：白色 におい：特異なにおい	ケトチフェ ンフマル酸 塩	1.2g	1g	A	外観	白色	白色	白色	白色	
					におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(102.1)	-	-	97.4*						
ケトテンDS0.1% 外 観：白色 におい：いちごのにおい	ケトチフェ ンフマル酸 塩	1.2g	1g	A	外観	白色	白色	白色	白色	
					におい	いちごのにおい	いちごのにおい	いちごのにおい	いちごのにおい	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(103.7)	-	-	95.9*						
抗 生 物 質 製 剤	フロモックス小児用細粒100mg 外 観：赤白色 におい：特異な芳香	セフカペン ピボキシル 塩酸塩水和 物	1.8g	1g	A	外観	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物
						におい	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(99.1)	-	-	100.5					
	ケフラーール細粒小児用100mg 外 観：うすい黄色 におい：わずかにオレンジ様のにおい	セファクロ ル	4g	1g	A	外観	白色とうすい黄色 の混合物	白色とうすい黄色 の混合物	白色とうすい黄色 の混合物	白色とうすい黄色 の混合物
						におい	わずかにオレンジ様 のにおい	わずかにオレンジ様 のにおい	わずかにオレンジ様 のにおい	わずかにオレンジ様 のにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(99.5)	-	-	101.2					
	ケフボリン細粒10% 外 観：うすい橙色 におい：わずかにオレンジ様のにおい	セファクロ ル	4g	1g	A	外観	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物
						におい	わずかにオレンジ様 のにおい	わずかにオレンジ様 のにおい	わずかにオレンジ様 のにおい	わずかにオレンジ様 のにおい
湿潤性						なし	なし	なし	なし	
流動性						良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(100.8)	-	-	100.5						
メイアクトMS小児用細粒 外 観：橙色 におい：特異な芳香	セフジトレ ンピボキシ ル	1.8g	1g	A	外観	白色と橙色の混合物	白色と橙色の混合物	白色と橙色の混合物	白色と橙色の混合物	
					におい	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(98.5)	-	-	102.0						

※ 10日後のデータ

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前性状、におい)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
抗 生 物 質 製 剤	セフゾン細粒小児用10% 外 観：淡赤白色 におい：特異な芳香	セフジニル	1.8g	1g	A	外観	白色と淡赤白色 の混合物	白色と淡赤白色 の混合物	白色と淡赤白色 の混合物	白色と淡赤白色 の混合物
						におい	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(99.5)	-	-	99.9					
	トミロン細粒小児用10% 外 観：淡橙色 におい：特異な芳香	セフテラム ピボキシル	1.8g	1g	A	外観	白色と淡橙色の混合物	白色と淡橙色の混合物	白色と淡橙色の混合物	白色と淡橙色の混合物
						におい	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(99.2)	-	-	100.7					
	バナンドライシロップ 外 観：赤みの橙色 におい：なし	セフボドキシム プロキセチル	3.6g	1g	A	外観	白色と赤みの橙色 の混合物	白色と赤みの橙色 の混合物	白色と赤みの橙色 の混合物	白色と赤みの橙色 の混合物
						におい	なし	なし	なし	なし
湿潤性						なし	なし	なし	なし	
流動性						良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(100.3)	-	-	100.3						
バナセファンDS5% 外 観：赤みの橙色 におい：わずかにオレンジ様の芳香	セフボドキシム プロキセチル	3.6g	1g	A	外観	白色と赤みの橙色 の混合物	白色と赤みの橙色 の混合物	白色と赤みの橙色 の混合物	白色と赤みの橙色 の混合物	
					におい	わずかにオレンジ様の芳香	わずかにオレンジ様の芳香	わずかにオレンジ様の芳香	わずかにオレンジ様の芳香	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(100.5)	-	-	100.2						
ジスロマック細粒小児用 外 観：うすい橙色 におい：特異なにおい	アジスロマイシン水和物	2g	1g	A	外観	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物	白色とうすい橙色 の混合物	
					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	なし	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(105.8)	-	-	93.5*						
クラリスドライシロップ10% 小児用 外 観：微赤白色 におい：わずかに特異なにおい	クラリスロマイシン	2g	1g	A	外観	白色と微赤白色 の混合物	白色と微赤白色 の混合物	白色と微赤白色 の混合物	白色と微赤白色 の混合物	
					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	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(100.2)	-	-	104.9						
クラリスロマイシンDS10% 小児用「サワイ」 外 観：白色 におい：いちごのにおい	クラリスロマイシン	2g	1g	A	外観	白色	白色	白色	白色	
					におい	いちごのにおい	いちごのにおい	いちごのにおい	いちごのにおい	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(107.0)	-	-	93.0*						

※ 10日後のデータ

【シロップ剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前性状、におい、pH)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
鎮 咳 剤	フスコデシロップ 外 観：淡黄赤色澄明 におい：特異なにおい pH：4.71	ジヒドロコデイン リン酸塩・dl-メ チルエフェドリン 塩酸塩・クロル フェニラミンマ レイン酸塩	2 mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	微橙白色懸濁	微橙白色懸濁 (白色の沈殿あり)	微橙白色懸濁 (白色の沈殿あり)	微橙白色懸濁 (白色の沈殿あり)
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	4.88	4.90	4.87	3.52
含量(%)	100.0(97.5)	-	-	100.5						
去 た ん	ムコダインシロップ5% 外 観：褐色澄明 におい：特異なにおい pH：6.19	L-カルボシ ステイン	12mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	淡橙白色懸濁	淡褐色懸濁 (白色の沈殿あり)	淡褐色懸濁 (白色の沈殿あり)	淡褐色澄明 (白色の沈殿、多数の微 細な白色の浮遊物あり)
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	6.19	6.25	6.16	6.20
含量(%)	100.0(99.6)	-	-	104.1						
ん 剤	ムコソルバンシロップ 外 観：無色澄明 におい：特異なにおい pH：2.60	アムプロキ ソール塩酸 塩	6 mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	白色懸濁	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	無色澄明 (白色の沈殿、多数の微 細な白色の浮遊物あり)
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	2.77	2.79	2.76	2.72
含量(%)	100.0(97.4)	-	-	101.5						
気 管 支 拡 張 剤	メブチンシロップ5 μ g/mL 外 観：無色澄明 におい：オレンジのにおい pH：3.94	プロカテ ロール塩酸 塩水和物	15mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	白色懸濁	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)
						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	オレンジのにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	3.93	3.93	3.93	3.93
含量(%)	100.0(100.7)	-	-	104.7						
酵 素 製 剤	レフトーゼシロップ0.5% 外 観：無色澄明 におい：なし pH：3.44	リゾチーム 塩酸塩	8 mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	白色懸濁	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	無色澄明 (白色の沈殿、微細な 白色の浮遊物あり)
						におい	なし	なし	なし	なし
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	3.71	3.71	3.70	3.71
含量(%)	100.0(96.0)	-	-	102.5						

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前性状、におい、pH)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
抗 ヒ ス タ ミ ン 剤	ゼスランシロップ 外 観：無色澄明 におい：特異なにおい pH：5.88	メキタジン	12mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	白色懸濁	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	無色澄明 (白色の沈殿、多数の微 細な白色の浮遊物あり)
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	5.99	5.99	6.00	5.98
含量(%)	100.0(100.2)	—	—	105.1						
タ ミ ン 剤	ペリアクチンシロップ0.04% 外 観：無色澄明 におい：特異なにおい pH：3.67	シプロヘブ タジン塩酸 塩水和物	12mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	白色懸濁	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	3.68	3.68	3.67	3.66
含量(%)	100.0(96.0)	—	—	102.0						
ン 剤	ポララミンシロップ 外 観：橙色澄明 におい：特異なにおい pH：6.16	d-クロルフェ ニラミンマレ イン酸塩	20mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	橙色懸濁	橙色懸濁 (微橙白色の沈殿あり)	橙色懸濁 (微橙白色の沈殿あり)	橙色懸濁 (微橙白色の沈殿あり)
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	6.20	6.19	6.18	6.16
含量(%)	100.0(99.3)	—	—	104.4						
ア レ ル ギ ー 用 剤	ザジテンシロップ 外 観：無色澄明 におい：特異なにおい pH：5.19	ケトチフェ ンフマル酸 塩	6 mL	1 g/ 精製水 5 mL	B	外観	白色懸濁	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	白色懸濁 (白色の沈殿あり)	無色澄明 (白色の沈殿、微細な 白色の浮遊物あり)
						におい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい	特異なにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	5.19	5.19	5.19	5.19
含量(%)	100.0(99.7)	—	—	105.8						

