2024 年 11 月改訂（第 11 版）

日本標準商品分類番号：872259

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

気管支拡張剤
プロカテロール塩酸塩水和物シロップ
プロカテロール塩酸塩シロップ 5μg/mL「日医工」
Procaterol Hydrochloride Syrup

剤形	シロップ用剤（液状）
製剤の規制区分	なし
規格・含量	1mL 中プロカテロール塩酸塩水和物 0.005mg（5μg）含有
一般名	和　名：プロカテロール塩酸塩水和物 洋　名：Procaterol Hydrochloride Hydrate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認：2013 年 2 月 15 日 薬価基準収載：2013 年 6 月 21 日 販 売 開 始：1996 年 7 月　5 日
開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社　お客様サポートセンター TEL：0120-517-215　　FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ　https://www.nichiiko.co.jp/

本 IF は 2023 年 11 月改訂（第 1 版）の添付文書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　―日本病院薬剤師会―

（2020 年 4 月改訂）

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（https://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。

目　　次

Ⅰ．概要に関する項目……1

1．開発の経緯……1
2．製品の治療学的特性……1
3．製品の製剤学的特性……1
4．適正使用に関して周知すべき特性……1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項……1
6．RMP の概要……1

Ⅱ．名称に関する項目……2

1．販売名……2
2．一般名……2
3．構造式又は示性式……2
4．分子式及び分子量……2
5．化学名（命名法）又は本質……2
6．慣用名、別名、略号、記号番号……2

Ⅲ．有効成分に関する項目……3

1．物理化学的性質……3
2．有効成分の各種条件下における安定性……3
3．有効成分の確認試験法、定量法……3

Ⅳ．製剤に関する項目……4

1．剤形……4
2．製剤の組成……4
3．添付溶解液の組成及び容量……4
4．力価……4
5．混入する可能性のある夾雑物……4
6．製剤の各種条件下における安定性……5
7．調製法及び溶解後の安定性……5
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）……5
9．溶出性……5
10．容器・包装……5
11．別途提供される資材類……5
12．その他……5

Ⅴ．治療に関する項目……6

1．効能又は効果……6
2．効能又は効果に関連する注意……6
3．用法及び用量……6
4．用法及び用量に関連する注意……6
5．臨床成績……7

Ⅵ．薬効薬理に関する項目……8

1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群……8
2．薬理作用……8

Ⅶ．薬物動態に関する項目……10

1．血中濃度の推移……10
2．薬物速度論的パラメータ……10
3．母集団（ポピュレーション）解析……10
4．吸収……10
5．分布……11
6．代謝……11
7．排泄……11
8．トランスポーターに関する情報……11
9．透析等による除去率……11
10．特定の背景を有する患者……11
11．その他……11

Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目……12

1．警告内容とその理由……12
2．禁忌内容とその理由……12
3．効能又は効果に関連する注意とその理由……12
4．用法及び用量に関連する注意とその理由……12
5．重要な基本的注意とその理由……12
6．特定の背景を有する患者に関する注意……13
7．相互作用……14
8．副作用……15
9．臨床検査結果に及ぼす影響……16
10．過量投与……16
11．適用上の注意……16
12．その他の注意……16

Ⅸ．非臨床試験に関する項目……17

1．薬理試験……17
2．毒性試験……17

Ⅹ．管理的事項に関する項目……18

1．規制区分……18
2．有効期間……18
3．包装状態での貯法……18
4．取扱い上の注意点……18
5．患者向け資材……18

６．同一成分・同効薬 18
７．国際誕生年月日 18
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 18
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 18
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 18
11．再審査期間 18
12．投薬期間制限に関する情報 19
13．各種コード 19
14．保険給付上の注意 19

ＸＩ．文献 20

１．引用文献 20
２．その他の参考文献 20

ＸⅡ．参考資料 21

１．主な外国での発売状況 21
２．海外における臨床支援情報 21

ＸⅢ．備考 22

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 22
２．その他の関連資料 22

略 語 表

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
tmax	最高血中濃度到達時間
$t_{1/2}$	消失半減期

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

本剤は、プロカテロール塩酸塩水和物を有効成分とする気管支拡張剤である。

「カプテレノールシロップ（5μg/mL）」は、マルコ製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験を実施し、1989 年 8 月 30 日に承認を取得、1996 年 7 月 5 日に販売を開始した。（薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき承認申請）

2002 年 2 月 15 日、用法及び用量の変更が承認された。
2004 年 12 月 1 日、日医工株式会社が販売を開始した。
2009 年 6 月 1 日、マルコ製薬株式会社は、社名を日医工ファーマ株式会社に変更した。
2012 年 6 月 1 日、日医工ファーマ株式会社は日医工株式会社に合併され、製造販売元が日医工株式会社に承継された。

医療事故防止のため、以下の販売名変更を行った。

承認年月日	販売名	旧販売名
2008 年 8 月 11 日	カプテレノールシロップ 5μg/mL	カプテレノールシロップ
2013 年 2 月 15 日	プロカテロール塩酸塩シロップ 5μg/mL「日医工」	カプテレノールシロップ 5μg/mL

２．製品の治療学的特性

（１）本剤は、プロカテロール塩酸塩水和物を有効成分とする気管支拡張剤である。
（２）重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、重篤な血清カリウム値の低下が報告されている。（「Ⅷ．8.（1）重大な副作用と初期症状」の項参照）

３．製品の製剤学的特性

（１）香料として、オレンジフレーバーを使用している。

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、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
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	

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

（１）承認条件

該当しない

（２）流通・使用上の制限事項

該当しない

６．RMP の概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

１．販売名

（１）和名

プロカテロール塩酸塩シロップ５μg/mL「日医工」

（２）洋名

Procaterol Hydrochloride Syrup

（３）名称の由来

一般名より

２．一般名

（１）和名（命名法）

プロカテロール塩酸塩水和物（JAN）

（２）洋名（命名法）

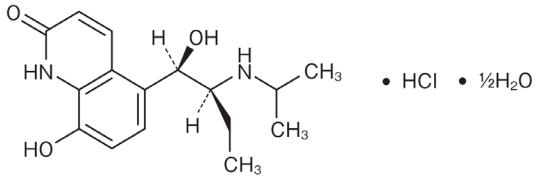
Procaterol Hydrochloride Hydrate（JAN）

（３）ステム（stem）

フェネチルアミン誘導体の気管支拡張薬：-terol

３．構造式又は示性式

化学構造式：



及び鏡像異性体

４．分子式及び分子量

分子式：$C_{16}H_{22}N_2O_3$・HCl・$^1/_2H_2O$

分子量：335.83

５．化学名（命名法）又は本質

8-Hydroxy-5-{(1*RS*,2*SR*)-1-hydroxy-2-[(1-methylethyl)amino]butyl}quinolin-2(1*H*)-one monohydrochloride hemihydrate（IUPAC）

６．慣用名、別名、略号、記号番号

別名：塩酸プロカテロール

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～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

光によって徐々に着色する。

（２）溶解性

水、ギ酸又はメタノールにやや溶けやすく、エタノール（95）に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

（３）吸湿性

該当資料なし

（４）融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 195℃（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

1.0g を水 100mL に溶かした液の pH は 4.0～5.0 である。

水溶液（1→20）は旋光性を示さない。

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

（１）確認試験法

１）紫外可視吸光度測定法

本品の水溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

２）赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

３）塩化物の定性反応

本品の水溶液は塩化物の定性反応を呈する。

（２）定量法

電位差滴定法

本品にギ酸を加えて溶かし、過塩素酸及び無水酢酸を加えた後、加熱する。冷後、無水酢酸を加え、過量の過塩素酸を酢酸ナトリウム液で滴定する。

Ⅳ．製剤に関する項目

１．剤形

（１）剤形の区別

シロップ用剤（液状）

（２）製剤の外観及び性状

販売名	プロカテロール塩酸塩シロップ５μg/mL「日医工」
剤形・性状	シロップ用剤（液状） 無色澄明なやや粘稠な液で、芳香と甘味を有する。
pH	3.5～4.5

（３）識別コード

該当しない

（４）製剤の物性

（「Ⅳ．6．製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

（５）その他

比重（20℃、20℃）：約 1.15

２．製剤の組成

（１）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	プロカテロール塩酸塩シロップ５μg/mL「日医工」
有効成分	1mL 中 プロカテロール塩酸塩水和物 0.005mg（5μg）
添加剤	精製白糖、パラオキシ安息香酸エチル、パラオキシ安息香酸ブチル、クエン酸水和物、水酸化ナトリウム、香料、エタノール

（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[1)]

（１）長期保存試験

◇長期保存試験　25℃・60%RH［最終包装形態］

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	12 ヵ月	24 ヵ月	36 ヵ月
性状 ＜無色澄明なやや粘稠な液で、芳香を有する＞	AR060 JI020	適合	適合	適合	適合
確認試験 （呈色反応、HPLC）	AR060 JI020	適合	―	―	適合
比重 d_{20}^{20} ＜約 1.15＞	AR060 JI020	1.1541 1.1545	1.1566 1.1572	1.1582 1.1588	1.1594 1.1598
pH ＜3.5～4.5＞	AR060 JI020	3.89 3.98	3.93 3.94	3.94 3.93	3.90 3.90
含量（%）※ ＜90.0～110.0%＞	AR060 JI020	106.0 107.5	103.3 102.5	100.8 100.1	99.7 98.7

※：表示量に対する含有率（%）　　―：試験未実施

７．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

９．溶出性

該当しない

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

該当しない

（２）包装

500mL［ガラス瓶］

（３）予備容量

該当しない

（４）容器の材質

瓶：ガラス（褐色）

キャップ：ポリプロピレン

11．別途提供される資材類

該当資料なし

12．その他

該当記載事項なし

Ⅴ．治療に関する項目

１．効能又は効果

下記疾患の気道閉塞性障害に基づく呼吸困難など諸症状の緩解
気管支喘息、慢性気管支炎、肺気腫、急性気管支炎、喘息様気管支炎

２．効能又は効果に関連する注意

5.効能又は効果に関連する注意

〈気管支喘息〉

気管支喘息治療における長期管理の基本は、吸入ステロイド剤等の抗炎症剤の使用であり、吸入ステロイド剤等により症状の改善が得られない場合、あるいは患者の重症度から吸入ステロイド剤等との併用による治療が適切と判断された場合にのみ、本剤と吸入ステロイド剤等を併用して使用すること。

（解説）

米国で実施された喘息患者を対象とした他の長時間作用性β2刺激薬（吸入剤）の多施設共同喘息調査試験（SMART 試験）において、喘息に関連する死亡数の増加が示唆されたことから、2005 年 11 月米国食品医薬品局（FDA）より、長時間作用性吸入β2刺激薬に対し抗炎症剤との併用に関する更なる注意喚起が求められた。

また、国内では「喘息予防・管理ガイドライン 2003」において、吸入ステロイド剤等の抗炎症剤が気管支喘息治療の長期管理の基本治療薬とされ、メプチン経口剤を含む長時間作用性β2刺激薬は追加治療薬又は併用薬として位置づけられている。

これら国内外の状況を踏まえたメプチン経口剤を含む長時間作用性β2刺激薬（経口剤及びテープ剤）に対する厚生労働省医薬食品局安全対策課事務連絡（平成 18 年 4 月 28 日付）に基づき、「気管支喘息治療の長期管理における抗炎症剤との併用に関する注意」を記載した。

３．用法及び用量

（１）用法及び用量の解説

通常、成人にはプロカテロール塩酸塩水和物として 1 回 50μg（シロップとして 10mL）を 1 日 1 回就寝前ないしは 1 日 2 回、朝及び就寝前に経口投与する。

6 才以上の小児にはプロカテロール塩酸塩水和物として 1 回 25μg（シロップとして 5mL）を 1 日 1 回就寝前ないしは 1 日 2 回、朝及び就寝前に経口投与する。

6 才未満の乳幼児にはプロカテロール塩酸塩水和物として 1 回 1.25μg/kg（シロップとして 0.25mL/kg）を 1 日 2 回、朝及び就寝前ないしは 1 日 3 回、朝、昼及び就寝前に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

（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

6 歳未満の乳幼児における体重当たりの 1 回投与量は以下のとおりである。

体重	1 回投与量	体重	1 回投与量	体重	1 回投与量
4kg	1.0mL	10kg	2.5mL	16kg	4.0mL
6kg	1.5mL	12kg	3.0mL	18kg	4.5mL
8kg	2.0mL	14kg	3.5mL	20kg	5.0mL

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

該当資料なし

（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

該当資料なし

２）安全性試験

該当資料なし

（５）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（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

17.1.1 国内臨床試験

小児気管支喘息を対象とした頓用試験（25μg、1.0μg/kg[注)]）における有効率は 82.9%（34/41 例）、小児気管支喘息、喘息様気管支炎を対象とした連用試験（1.0～1.5μg/kg[注)]、1 日 2～3 回）における有効率は 50.7%（116/229 例）であった[2)-4)]。

注）本剤の承認された 6 才以上の小児及び 6 才未満の乳幼児の用法及び用量は、それぞれ 1 回 25μg を 1 日 1 回又は 2 回、並びに 1 回 1.25μg/kg を 1 日 2 回又は 3 回である。

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

選択的アドレナリンβ$_2$受容体作動薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

２．薬理作用

（１）作用部位・作用機序

プロカテロール塩酸塩水和物は気管支平滑筋のβ$_2$受容体を選択的に刺激し、気管支拡張作用を発現する[5)]。

（２）薬効を裏付ける試験成績

18.2 気管支拡張作用

イヌ、ネコ及びモルモットでのヒスタミン等による気道抵抗増大に対する抑制効果でみると、プロカテロール塩酸塩水和物の気管支拡張作用はイソプレナリンと同等かそれ以上の強さで、サルブタモール硫酸塩及びオルシプレナリン硫酸塩より強いことが確認された[6)-9)]。

18.3 気管支拡張作用持続時間

イヌ、ネコ及びモルモットで検討したプロカテロール塩酸塩水和物の気管支拡張作用持続時間は、イソプレナリン、トリメトキノール、オルシプレナリン硫酸塩及びサルブタモール硫酸塩より長いことが確認された[6)-9)]。

18.4 β$_2$受容体への選択性

心循環器系のβ受容体と気道系のβ受容体への臓器選択性をイヌ、ネコ及びモルモットで検討したところ、プロカテロール塩酸塩水和物はイソプレナリン、トリメトキノール、オルシプレナリン硫酸塩及びサルブタモール硫酸塩よりも優れた臓器選択性を示した[6)-9)]。

18.5 抗アレルギー作用

モルモットあるいはラットでの PCA 反応及び肺からのヒスタミン遊離、成人気管支喘息患者での皮膚反応を指標としたプロカテロール塩酸塩水和物の抗アレルギー作用はイソプレナリン、オルシプレナリン硫酸塩及びサルブタモール硫酸塩より強いことが確認された。また、プロカテロール塩酸塩水和物はアレルゲン吸入による気管支反応に対しては即時型のみならず、遅発型にも抑制作用を有することが確認された[10)-13)]。

18.6 気道分泌系に対する作用

プロカテロール塩酸塩水和物はハトの気道繊毛運動を亢進した[14)]。

18.7 運動誘発喘息発作抑制作用

プロカテロール塩酸塩水和物はトレッドミル負荷により誘発された気管支喘息患児の喘息発作を抑制した[15)]。

18.8 気道過敏性亢進に対する作用

プロカテロール塩酸塩水和物はウイルス接種によるイヌの気道過敏性亢進を抑制した[16)]。

18.9 血管透過性亢進に対する作用

各種起炎物質によるラット背部皮下の空気嚢内の血管透過性亢進及び浮腫の形成に対するプロカテロール塩酸塩水和物の抑制作用は、イソプレナリンとほぼ同等であることが確認された。また、ヒスタミン吸入によるモルモット肺水腫の形成に対し、プロカテロール塩酸塩水和物は抑制作用を有し、その作用はサルブタモール硫酸塩より強いことが確認された[17)、18)]。

18.10 咳に対する作用

プロカテロール塩酸塩水和物はサブスタンス P 吸入による急性気管支炎患者の咳の誘発を抑制した[19)]。

（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

健康成人男性44例にプロカテロール塩酸塩シロップ5μg/mLをプロカテロール塩酸塩水和物として100μg[注)]の用量で絶食下経口投与した時の薬物動態パラメータを以下に示す[20)]。

薬物動態パラメータ

t_{max} (hr)	C_{max} (pg/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	AUC_{13hr} (pg・hr/mL)
1.3±0.7	263±104	4.1±1.8	1,151±288

（平均値±標準偏差、n=44）

注）本剤の承認された成人の用量は1回50μgである。

（３）中毒域

該当資料なし

（４）食事・併用薬の影響

（「Ⅷ．7．相互作用」の項参照）

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

該当資料なし

（４）クリアランス

該当資料なし

（５）分布容積

該当資料なし

（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

該当資料なし

４．吸収

該当資料なし

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）妊婦」の項参照）

（３）乳汁への移行性

（「Ⅷ．6.（6）授乳婦」の項参照）

（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

該当資料なし

（６）血漿蛋白結合率

該当資料なし

６．代謝

（１）代謝部位及び代謝経路

ヒトにおける主要な代謝経路はグルクロン酸抱合体への抱合反応と考えられた[21)]。

（２）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

７．排泄

プロカテロール塩酸塩錠 50μg（プロカテロール塩酸塩水和物として 50μg）を経口投与した時の投与後 24 時間までの累積尿中プロカテロール排泄率は 15.7%であった。また、グルクロン酸抱合体の排泄率は 23.6%であった。尿中にはその他の代謝物としてデスイソプロピルプロカテロールが 0.48%排泄された[21)]。

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

該当資料なし

10．特定の背景を有する患者

該当資料なし

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）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

一般的注意として記載した。本剤の成分に対する過敏症の既往歴がある患者に、本剤を再投与した場合、再び過敏症状が発現する可能性が高いと考えられるため、本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には、本剤の投与を避けること。

３．効能又は効果に関連する注意とその理由

（「Ⅴ．2．効能又は効果に関連する注意」を参照すること。）

４．用法及び用量に関連する注意とその理由

（「Ⅴ．4．用法及び用量に関連する注意」を参照すること。）

５．重要な基本的注意とその理由

8.重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 用法及び用量どおり正しく使用しても効果が認められない場合には、本剤が適当でないと考えられるので投与を中止すること。

8.2 過度に使用を続けた場合、不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがあるので、使用が過度にならないように注意すること。［13.1 参照］

〈気管支喘息、慢性気管支炎、肺気腫〉

8.3 本剤の投与期間中に発現する急性の発作に対しては、短時間作動型吸入β_2刺激剤等の他の適切な薬剤を使用するよう患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

また、その薬剤の使用量が増加したり、あるいは効果が十分でなくなってきた場合には、疾患の管理が十分でないことが考えられるので、可及的速やかに医療機関を受診し治療を受けるよう患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

〈気管支喘息〉

8.4 本剤は吸入ステロイド剤等の抗炎症剤の代替薬ではないため、患者が本剤の使用により症状改善を感じた場合であっても、医師の指示なく吸入ステロイド剤等を減量又は中止し、本剤を単独で用いることのないよう、患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に注意を与えること。

8.5 本剤の投与期間中に発現する急性の発作に対して、短時間作動型吸入β_2刺激剤等の薬剤の使用量が増加したり、あるいは効果が十分でなくなってきた場合には、患者の生命が脅かされる可能性があるので、患者の症状に応じて吸入ステロイド剤等の増量等の抗炎症療法の強化を行うこと。

（解説）

8.1 β刺激剤共通の記載である。

8.2 β刺激剤共通の記載である。原疾患が進行、悪化すると本剤の使用回数が増加することも予測されるが、他の治療を併用することなく本剤の使用を過度に続けた場合には、不整脈や心停止などの重大な心疾患を起こすおそれがある。特に気管支喘息の患者においては、発作発現時に使用が過度になりやすくなるため、十分に経過観察しながら使用することが重要である。

8.3 （「Ⅴ．治療に関する項目」の項参照）

8.4、8.5 （「Ⅷ．3．効能又は効果に関連する注意とその理由」の項参照）

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 甲状腺機能亢進症の患者

甲状腺機能亢進症が増悪することがある。

9.1.2 高血圧の患者

血圧が上昇することがある。

9.1.3 心疾患の患者

動悸、不整脈、症状の増悪等があらわれることがある。

9.1.4 糖尿病の患者

糖尿病が増悪することがある。

9.1.5 低酸素血症の患者

血清カリウム値をモニターすることが望ましい。低酸素血症は血清カリウム値の低下が心リズムに及ぼす作用を増強することがある。［11.1.2 参照］

（解説）

9.1.1 甲状腺機能亢進症の患者は、過剰な甲状腺ホルモンが交感神経系の緊張を高めているため、過敏反応を示すおそれがある。

9.1.2 β刺激剤は、血圧を上昇させる作用がある。

9.1.3 β刺激剤は、心拍出量、心拍数を上昇させる傾向がある。

9.1.4 β刺激剤は、肝臓のグリコーゲン分解を増加させ、血中のグルコースレベルを上昇させる傾向がある。また、インスリン分泌を促進する傾向がある。

（２）腎機能障害患者

設定されていない

（３）肝機能障害患者

設定されていない

（４）生殖能を有する者

設定されていない

（５）妊婦

9.5 妊婦

妊婦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。動物実験（ラット）で胎児への移行が報告されている。

（解説）

9.5 妊婦に対する臨床試験成績はなく、安全性は確立していない。

（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。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。

（解説）

9.6 授乳婦に対する臨床試験成績はなく、安全性は確立していない。

（7）小児等

9.7 小児等

低出生体重児又は新生児を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

（8）高齢者

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

（解説）

9.8 一般に生理機能の低下している高齢者では本剤のクリアランスが低下する可能性がある。高齢者では減量するなど、患者の状態を観察しながら注意して投与すること。

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
カテコールアミン製剤 アドレナリン イソプレナリン等	不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがある。	アドレナリン、イソプレナリン等のカテコールアミン製剤の併用によりアドレナリン作動性神経刺激の増大が起こる。そのため不整脈を起こすことが考えられる。
キサンチン誘導体 テオフィリン アミノフィリン水和物 ジプロフィリン等 ［11.1.2 参照］	低カリウム血症、心・血管症状（頻脈、不整脈等）等のβ刺激剤の副作用症状を増強させることがある。副作用の発現に注意し、異常が認められた場合には減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。	キサンチン誘導体はアドレナリン作動性神経刺激を増大させるため、血清カリウム値の低下、心・血管症状等を増強することが考えられる。低カリウム血症の増強についての機序は不明である。
ステロイド剤 ベタメタゾン プレドニゾロン ヒドロコルチゾンコハク酸エステルナトリウム等 利尿剤 フロセミド等 ［11.1.2 参照］	血清カリウム値が低下し、低カリウム血症による不整脈を起こすおそれがある。副作用の発現に注意し、異常が認められた場合には減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。	ステロイド剤及び利尿剤は尿細管でのカリウム排泄促進作用があるため、血清カリウム値の低下を増強することが考えられる。

（解説）

・カテコールアミン製剤

β刺激剤の共通の記載である。アドレナリン、イソプレナリン等のカテコールアミン製剤はβ刺激作用をもつため、本剤とカテコールアミン製剤を併用した場合、不整脈や場合によっては心停止などの重大な心疾患を引き起こすおそれがある。（「Ⅷ．8．(1)重大な副作用と初期症状」の項参照）

・キサンチン誘導体

β刺激剤の共通の記載である。β刺激剤の血清カリウム値の低下、収縮期血圧上昇等の作用が併用により増強されることが報告されている[22)]。本剤とこれら薬剤の併用により、血中のカリウム値の低下が増強される可能性がある。また、重篤な低カリウム血症は不整脈等の心疾患を引き起こすことがあるので、必要に応じ血清カリウム値のモニターを行うこと。

・ステロイド剤

β刺激剤の共通の記載である。β刺激剤の血清カリウム値の低下作用がステロイド剤及び利尿剤により増強されるおそれがある。本剤とこれら薬剤の併用により、血中のカリウム値の低下が増強される可能性がある。また、重篤な低カリウム血症は不整脈等の心疾患を引き起こすことがあるので、必要に応じ血中のカリウム値のモニターを行うこと。

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 ショック、アナフィラキシー（頻度不明）

11.1.2 重篤な血清カリウム値の低下（頻度不明）

キサンチン誘導体、ステロイド剤及び利尿剤の併用により増強することがあるので、重症喘息患者では特に注意すること。［9.1.5、10.2 参照］

（解説）

11.1.1 本剤の投与症例で、ショック、アナフィラキシーの発現が報告されたため。

11.1.2 重篤な低カリウム血症は不整脈等の心疾患を引き起こすことがあるので、必要に応じ血中のカリウム値のモニターを行うこと。

（２）その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
循環器	動悸、頻脈	ほてり等	上室性期外収縮・上室性頻拍・心室性期外収縮・心房細動等
精神神経系	振戦、頭痛、めまい	不眠、手足のしびれ感等	手指の痙縮、筋痙直、筋痙攣、神経過敏
消化器	嘔気、胃部不快感等	嘔吐、口渇	
過敏症	発疹等		そう痒感
肝臓			AST、ALT、LDH の上昇等の肝機能障害
その他		脱力感、鼻閉、耳鳴	全身倦怠感、血清カリウム値の低下、血糖上昇

９．臨床検査結果に及ぼす影響

12.臨床検査結果に及ぼす影響

本剤はアレルゲンによる皮膚反応に抑制的に作用するので、皮膚テストを実施する場合には、12時間前より本剤の投与を中止することが望ましい。

（解説）

プロカテロール塩酸塩水和物には、皮膚反応に対する抑制効果がある[13)]。プロカテロール塩酸塩製剤１錠を抗原注射１又は２時間前に投与したところ、発赤部面積が対照値に比べ有意に消退した。

10. 過量投与

13.過量投与

13.1 症状

過量投与により、頻脈、頻脈性不整脈、血圧低下、神経過敏、振戦、低カリウム血症、高血糖、乳酸アシドーシス等があらわれることがある。［8.2 参照］

13.2 処置

重篤な頻脈性不整脈発現時にはβ遮断剤（プロプラノロール塩酸塩等）が有効な場合があるが、気道抵抗を上昇させるおそれがあるので、喘息患者等への投与には十分注意すること。

（解説）

13.2 誤飲等の場合は必要に応じ胃洗浄等により薬剤の除去を行うとともに、症状に応じて救急処置や一般的維持療法を行うこと。

11. 適用上の注意

14.適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

誤飲を避けるため、小児の手の届かないところに保管すること。

12. その他の注意

（１）臨床使用に基づく情報

設定されていない

（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 ラットを用いた 14 週間反復投与毒性試験で 30mg/kg、26 週間反復投与毒性試験で 10mg/kg 以上の用量で心筋障害が認められた[23)、24)]。この心筋障害はイヌにおいても認められたが、他のβ刺激薬でもラット及びイヌにおいて認められた。

15.2.2 ラットを用いた 104 週間混餌投与試験において、薬物投与により、卵巣間膜腫が出現した。この腫瘍はラットに特異的なものであると考えられており、また、各種β刺激薬を長期間反復投与することにより発現することが報告されている[25)]。

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」の項参照）

（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

製　剤	プロカテロール塩酸塩シロップ 5μg/mL「日医工」	なし
有効成分	プロカテロール塩酸塩水和物	劇薬※

※：1 個中プロカテロールとして 0.05mg 以下を含有するもの、0.01%以下を含有する内用剤、0.4%以下を含有する吸入剤は除かれる。

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．取扱い上の注意点

20.取扱い上の注意

小分け後は遮光して保存すること。

５．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

６．同一成分・同効薬

同一成分：メプチンシロップ 5μg/mL

７．国際誕生年月日

不明

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

履歴	販売名	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
販売開始	カプテレノールシロップ（5μg/mL）	1989 年 8 月 30 日	20100AMZ00455000	1996 年 7 月 5 日	1996 年 7 月 5 日
販売名変更	カプテレノールシロップ 5μg/mL	2008 年 8 月 11 日	22000AMX01831000	2008 年 12 月 19 日	2008 年 12 月 19 日
承継	プロカテロール塩酸塩シロップ 5μg/mL「日医工」	2013 年 2 月 15 日	22500AMX00673000	2013 年 6 月 21 日	2013 年 6 月 21 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

＜用法及び用量の追加＞

販売名　　：カプテレノールシロップ

承認年月日：2002 年 2 月 15 日

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

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	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（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
プロカテロール塩酸塩シロップ 5μg/mL「日医工」	2259004Q1014	2259004Q1197	113698213	621369813

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．文献

１．引用文献

１）社内資料：安定性試験
２）佐々木聖　他：薬理と治療. 1980；8（12）：4735-4743
３）三島健　他：小児科臨床. 1981；34（3）：677-689
４）飯倉洋治　他：小児科臨床. 1981；34（3）：691-697
５）第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021；C4984-C4988
６）Yabuuchi Y., et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther. 1977；202（2）：326-336（PMID：18598）
７）Himori N., et al.：Br. J. Pharmac. 1977；61（1）：9-17
８）Yamashita S., et al.：J. Pharm. Pharmac. 1978；30（5）：273-279
９）Tei S., et al.：Pharmacometrics. 1979；17（3）：335-343
10）江田昭英　他：アレルギー. 1979；28（5）：417-422
11）伊藤和彦　他：新薬と臨牀. 1978；27（12）：2127-2133
12）中沢次夫　他：現代の診療. 1979；21（1）：35-39
13）伊藤和彦：基礎と臨床. 1980；14（11）：3549-3555
14）加瀬佳年　他：応用薬理. 1978；15（4）：705-720
15）赤坂徹　他：小児科診療. 1981；44（2）：239-247
16）Kimura K., et al.：Am. Rev. Respir. Dis. 1990；141：A387
17）Ohuchi K., et al.：Immunopharmacology. 1990；20（2）：81-88
18）河村公太郎　他：基礎と臨床. 1990；24（4）：1981-1983
19）Katsumata U., et al.：Tohoku J. Exp. Med. 1989；158（1）：105-106（PMID：2476867）
20）長谷川節雄　他：臨床医薬. 2004；20（8）：857-866
21）Kobayashi H., et al.：Int. J. Clin. Pharm. Ther. 2010；48（11）：744-750
22）Smith, S. R., et al.：Brit J Clin Pharmac. 1986；21（4）：451-453（PMID：3707814）
23）黒住正雄　他：応用薬理. 1979；17（5）：691-712
24）河野一弥　他：応用薬理. 1979；17（5）：713-732
25）Jack D., et al.：Toxicology. 1983；27：315-320（PMID：6137882）

２．その他の参考文献

該当資料なし

ＸⅡ．参考資料

１．主な外国での発売状況

なし

２．海外における臨床支援情報

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、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）粉砕

該当しない

（２）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

１）試験方法

［通過性試験］

ディスペンサーに試験製剤 10mL を入れてピストンを戻し、8Fr.の経管チューブに接続して約 2～3mL/秒の速度で注入したときの通過性及び残存物を観察した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。注入後、適量の常水を注入してチューブ内を濯いだときの残存物を確認した。

試験実施期間：2017/1/18～2017/1/19

ロット番号：B05400

２）試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
プロカテロール塩酸塩シロップ 5μg/mL「日医工」		8Fr.チューブでは全量押し出せたが、通過抵抗があった。12Fr.では問題なく通過し、残存物もなかった。

２．その他の関連資料

該当資料なし