

## 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

### 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 －

プラナルカスト水和物錠、プラナルカスト水和物カプセル  
**プラナルカスト錠 112.5mg 「NIG」**  
**プラナルカスト錠 225mg 「NIG」**  
**プラナルカストカプセル 112.5mg 「NIG」**  
**Pranlukast Tablets、Pranlukast Capsules**

剤形	錠：素錠 カプセル：カプセル剤			
製剤の規制区分	なし			
規格・含量	錠 112.5mg：1錠中プラナルカスト水和物 112.5mg 含有 錠 225mg：1錠中プラナルカスト水和物 225.0mg 含有 カプセル：1カプセル中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・販売開始年月日		錠 112.5mg	錠 225mg	カプセル
	製造販売承認	2009年 1月 8日	2011年 1月 14日	2007年 3月 15日
	薬価基準収載	2022年 12月 9日	2022年 12月 9日	2023年 5月 24日
	販売開始	2009年 5月 15日	2011年 9月 1日	2007年 7月 6日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工岐阜工場株式会社 発売元：日医工株式会社 販売：武田薬品工業株式会社			
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 <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>			

本IFは2023年12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て、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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>20</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ...	20
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 薬理作用.....	20
3. 製品の製剤学的特性.....	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>21</b>
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	2	1. 血中濃度の推移.....	21
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	2	2. 薬物速度論的パラメータ.....	22
6. RMP の概要.....	2	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	23
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>3</b>	4. 吸収.....	23
1. 販売名.....	3	5. 分布.....	23
2. 一般名.....	3	6. 代謝.....	23
3. 構造式又は示性式.....	3	7. 排泄.....	24
4. 分子式及び分子量.....	3	8. トランスポーターに関する情報.....	24
5. 化学名（命名法）又は本質.....	3	9. 透析等による除去率.....	24
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	10. 特定の背景を有する患者.....	24
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	11. その他.....	24
1. 物理化学的性質.....	4	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>25</b>
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	4	1. 警告内容とその理由.....	25
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	4	2. 禁忌内容とその理由.....	25
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	25
1. 剤形.....	5	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	25
2. 製剤の組成.....	6	5. 重要な基本的注意とその理由.....	25
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	6	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	26
4. 力価.....	6	7. 相互作用.....	27
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	6	8. 副作用.....	27
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	7	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	29
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	8	10. 過量投与.....	29
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	12	11. 適用上の注意.....	29
9. 溶出性.....	12	12. その他の注意.....	29
10. 容器・包装.....	16	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>30</b>
11. 別途提供される資材類.....	16	1. 薬理試験.....	30
12. その他.....	17	2. 毒性試験.....	30
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>18</b>	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>31</b>
1. 効能又は効果.....	18	1. 規制区分.....	31
2. 効能又は効果に関連する注意.....	18	2. 有効期間.....	31
3. 用法及び用量.....	18	3. 包装状態での貯法.....	31
4. 用法及び用量に関連する注意.....	18	4. 取扱い上の注意点.....	31
5. 臨床成績.....	18	5. 患者向け資材.....	31

## 略語表

6.	同一成分・同効薬.....	31
7.	国際誕生年月日 .....	31
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.....	31
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.....	31
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	32
11.	再審査期間 .....	32
12.	投薬期間制限に関する情報.....	32
13.	各種コード .....	32
14.	保険給付上の注意 .....	33
<b>X I.</b>	<b>文献</b> .....	<b>34</b>
1.	引用文献 .....	34
2.	その他の参考文献.....	34
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b> .....	<b>35</b>
1.	主な外国での発売状況.....	35
2.	海外における臨床支援情報 .....	35
<b>X III.</b>	<b>備考</b> .....	<b>36</b>
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.....	36
2.	その他の関連資料.....	39

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 <sub>1/2</sub>	消失半減期
TLC	薄層クロマトグラフィー
S.D.	標準偏差

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、プラナルカスト水和物を有効成分と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。

「プラナルカストカプセル 112.5mg 「タイヨー」」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）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、生物学的同等性試験を実施し、2007年3月15日に承認を取得、2007年7月6日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

「プラナルカスト錠 112.5mg 「TYK」」は、武田テバ薬品株式会社（旧大正薬品工業株式会社）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、生物学的同等性試験を実施し、2009年1月8日に承認を取得、2009年5月15日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

「プラナルカストカプセル 112.5mg 「タイヨー」」は2009年9月4日に、「プラナルカスト錠 112.5mg 「TYK」」は2009年9月14日に「アレルギー性鼻炎」の効能・効果追加が承認された。

「プラナルカスト錠 225mg 「TYK」」は、武田テバ薬品株式会社（旧大正薬品工業株式会社）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、生物学的同等性試験を実施し、2011年1月14日に承認を取得、2011年6月24日に薬価収載し、2011年9月1日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

2022年12月1日、「プラナルカスト錠 112.5mg 「TYK」」及び「プラナルカスト錠 225mg 「TYK」」は武田テバ薬品株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「TYK」から「NIG」に変更した。

2022年12月9日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

2023年5月1日、「プラナルカストカプセル 112.5mg 「タイヨー」」は武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「タイヨー」から「NIG」に変更した。

2023年5月24日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、プラナルカスト水和物を有効成分と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。
- (2) 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。（「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) PTPシートは、ピッチコントロールを行い、1錠または1カプセルごとに成分名、含量を表示した。
- (2) PTPシートは、調剤時の利便性向上の為、ウィークリーシートにした。

#### 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

プラナルカスト錠 112.5mg 「NIG」

プラナルカスト錠 225mg 「NIG」

プラナルカストカプセル 112.5mg 「NIG」

#### (2) 洋名

Pranlukast Tablets

Pranlukast Capsules

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 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)

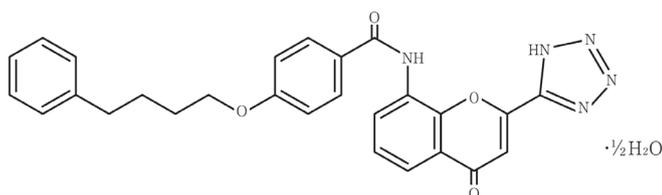
#### (3) ステム (stem)

抗ヒスタミン作用とは異なる作用機序の抗喘息薬又は抗アレルギー薬: -ast

ロイコトリエン受容体拮抗薬: -lukast

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式:



### 4. 分子式及び分子量

分子式: C<sub>27</sub>H<sub>23</sub>N<sub>5</sub>O<sub>4</sub> · 1/2H<sub>2</sub>O

分子量: 490.51

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

*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

### 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。

##### (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、定量法

##### (1) 確認試験法

###### 1) 紫外可視吸光度測定法

本品のエタノール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又はプランルカスト標準品の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又はプランルカスト標準品の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。

##### (2) 定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸二水素カリウム試液、アセトニトリル、メタノール混液

#### IV. 製剤に関する項目

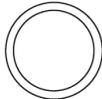
##### 1. 剤形

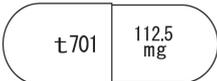
###### (1) 剤形の区別

錠：素錠

カプセル：カプセル剤

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」	プラシルカスト錠 225mg 「NIG」
色・剤形	白色～淡黄色の素錠	白色～淡黄色の割線入り素錠
外形	  	  
直径	7.5mm	9.5mm
厚さ	2.7mm	3.4mm
質量	約 150mg	約 300mg
識別コード (PTP)	TYK404	TYK407

販売名	プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」
色・剤形	蓋部・胴体部とも白色～帯黄白色不透明、 内容物が白色～淡黄色の粉末を含む粒のカプセル剤
外形	 3号カプセル
質量	210mg
識別コード (PTP)	t 701

###### (3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

###### (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

該当しない

## 2. 製剤の組成

### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	プランルカスト錠 112.5mg 「NIG」	プランルカスト錠 225mg 「NIG」
有効成分	1 錠中 プランルカスト水和物 112.5mg	1 錠中 プランルカスト水和物 225.0mg
添加剤	乳糖水和物、デキストリン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、タルク、ステアリン酸マグネシウム	

販売名	プランルカストカプセル 112.5mg 「NIG」	
有効成分	1 カプセル中 プランルカスト水和物 112.5mg	
添加剤	含水二酸化ケイ素、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、プルラン (カプセル本体) 酸化チタン、ゼラチン、マクロゴール 4000、ラウリル硫酸ナトリウム	

### (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<sup>1)</sup>

### (1) 加速試験

◇プラナルカスト錠 112.5mg 「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [PTP包装]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	1				
	2	適合	適合	適合	適合
	3				
確認試験 (呈色反応、紫外可視吸収スペクトル、TLC)	1				
	2	適合	適合	適合	適合
	3				
製剤均一性 (%) ＜15.0%以下＞	1	1.45			1.21
	2	1.29	—	—	1.67
	3	0.79			1.49
溶出性 (%) ＜90 分、80%以上＞	1	98.53～100.29	96.59～101.68	95.99～99.10	97.75～101.10
	2	97.01～99.15	96.14～99.42	96.22～99.27	97.71～100.21
	3	95.38～100.33	95.79～99.30	97.48～99.72	97.69～101.83
含量* (%) ＜95～105%＞	1	100.5	99.7	100.5	100.0
	2	100.1	99.1	99.3	99.3
	3	100.2	99.8	99.5	99.4

※：表示量に対する含有率 (%)

—：未実施

◇プラナルカスト錠 225mg 「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [PTP包装]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の割線入り 素錠＞	1				
	2	適合	適合	適合	適合
	3				
確認試験 (呈色反応、紫外可視吸収スペクトル、TLC)	1				
	2	適合	適合	適合	適合
	3				
製剤均一性 (%) ＜15.0%以下＞	1	0.79～1.32			0.85～1.12
	2	0.57～1.04	—	—	0.71～1.18
	3	0.97～1.23			0.80～1.65
溶出性 (%) n=3 ＜90 分、80%以上＞	1	96.2～100.7	96.1～98.2	99.4～102.1	98.9～102.2
	2	98.4～101.0	95.3～97.8	99.5～102.6	97.5～101.2
	3	96.7～101.1	95.5～99.2	97.5～101.5	97.1～101.3
含量* (%) n=3 ＜95～105%＞	1	100.58～100.94	100.58～100.99	100.87～101.36	100.72～101.86
	2	100.51～101.38	100.69～101.46	100.62～101.52	100.83～101.78
	3	100.16～100.80	100.36～101.99	100.79～101.18	101.30～102.03

※：表示量に対する含有率 (%)

—：未実施

◇プラナルカストカプセル 112.5mg 「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [PTP包装+アルミ袋+紙箱]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	6 ヶ月
性状 ＜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＞	適合	適合
確認試験 (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)	適合	適合
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) ＜15.0%以下＞	適合	適合
溶出性 (%) ＜90 分、80%以上＞	92～101	85～91
含量 (%) *1 ＜95.0～105.0%＞	97.7±0.6**2	100.6±0.6**2

※1：表示量に対する含有率 (%)

※2：平均値±S.D.

(2) 無包装状態の安定性

◇プラナルカスト錠 112.5mg 「NIG」 無包装 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	1 2 3	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠
確認試験 (TLC)	1 2 3	適合	適合	適合	適合
崩壊性 (分秒) ＜60 分以内＞	1 2 3	29'08"～32'16" 29'03"～30'17" 28'11"～30'48"	28'41"～30'01" 29'02"～30'55" 28'05"～30'18"	28'16"～30'31" 28'28"～30'43" 26'56"～30'10"	27'28"～31'15" 27'33"～32'01" 26'47"～31'44"
溶出性 (%) n=6 ＜90 分、80%以上＞	1 2 3	100～102 97～98 99～100	98～99 98～100 98～101	100～103 100～102 97～99	97～98 95～97 98
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	1 2 3	100.2 99.5 99.7	99.5 98.3 98.5	97.9 98.9 97.8	99.1 99.9 100.3
(参考値) 硬度 (kg) n=20	1 2 3	8.95～10.89 9.36～10.98 9.31～11.11	8.28～10.75 7.86～10.32 7.59～10.26	8.32～9.65 7.73～9.15 8.00～9.16	8.60～10.23 7.94～9.88 8.05～9.74

※：表示量に対する含有率 (%)

◇プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」 無包装 30℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	1	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠
	2				
	3				
確認試験 (TLC)	1	適合	適合	適合	適合
	2				
	3				
崩壊性 (分'秒") ＜60 分以内＞	1	29'08"～32'16"	35'44"～38'31"	38'09"～41'39"	38'50"～41'57"
	2	29'03"～30'17"	33'41"～36'50"	36'08"～39'59"	38'01"～44'13"
	3	28'11"～30'48"	35'01"～37'14"	37'44"～41'56"	37'18"～42'22"
溶出性 (%) n=6 ＜90 分、80%以上＞	1	100～102	98～100	98～99	98～99
	2	97～98	98～100	97～99	94～98
	3	99～100	99～101	97～98	94～96
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	1	100.2	99.9	100.1	101.4
	2	99.5	100.7	99.6	101.5
	3	99.7	99.0	99.1	100.7
(参考値) 硬度 (kg) n=20	1	8.95～10.89	7.47～10.15	6.88～8.51	6.95～9.78
	2	9.36～10.98	7.64～10.07	7.52～8.75	7.66～9.58
	3	9.31～11.11	7.53～9.25	7.26～8.67	7.24～9.78

※：表示量に対する含有率 (%)

◇プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」 無包装 曝光量 120 万 Lx・hr [2000Lx、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット番 号	総曝光量				
		開始時	30 万 Lx・hr	60 万 Lx・hr	90 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	1	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠	淡黄色の素錠
	2					
	3					
確認試験 (TLC)	1	適合	適合	適合	適合	適合
	2					
	3					
崩壊性 (分'秒") ＜60 分以内＞	1	29'08"～32'16"	29'11"～32'23"	29'08"～32'11"	28'44"～31'56"	28'52"～32'06"
	2	29'03"～30'17"	29'33"～31'34"	29'18"～31'16"	28'56"～32'08"	28'52"～31'32"
	3	28'11"～30'48"	29'53"～32'35"	29'31"～32'36"	28'59"～33'08"	30'08"～33'09"
溶出性 (%) n=6 ＜90 分、80%以上＞	1	100～102	99～101	99～101	99～101	99～102
	2	97～98	97～100	100～102	95～99	99～100
	3	99～100	98～100	102～104	96～99	98～99
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	1	100.2	98.3	97.6	98.0	97.8
	2	99.5	101.0	98.7	98.8	99.3
	3	99.7	99.2	98.8	98.4	99.2
(参考値) 硬度 (kg) n=20	1	8.95～10.89	8.27～10.51	8.30～9.99	8.17～10.45	7.98～9.95
	2	9.36～10.98	7.89～10.07	7.29～9.28	7.44～9.62	7.75～9.15
	3	9.31～11.11	8.03～10.26	8.25～9.81	8.24～9.89	7.49～7.51

※：表示量に対する含有率 (%)

◇プラシルカスト錠 225mg 「NIG」 無包装 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	1 2 3	白色の割線入り素錠	白色の割線入り素錠	白色の割線入り素錠	白色の割線入り素錠
確認試験 (TLC)	1 2 3	適合	適合	適合	適合
崩壊性 (分秒) ＜60 分以内＞	1 2 3	31'27"～34'20"	31'37"～34'51"	31'40"～34'22"	31'33"～35'56"
溶出性 (%) n=6 ＜90 分、80%以上＞	1 2 3	98～99	96～99	99～100	97～100
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	1 2 3	99.8	101.1	100.6	100.4
(参考値) 硬度 (kg) n=20	1 2 3	15.8～17.5	14.4～17.3	15.3～17.5	12.8～16.9
		12.5～17.0	13.6～16.6	13.2～16.7	15.7～17.5
		13.4～15.9	13.7～15.6	13.9～15.8	13.7～16.7

※：表示量に対する含有率 (%)

◇プラシルカスト錠 225mg 「NIG」 無包装 30℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	1 2 3	白色の割線入り素錠	白色の割線入り素錠	白色の割線入り素錠	白色の割線入り素錠
確認試験 (TLC)	1 2 3	適合	適合	適合	適合
崩壊性 (分秒) ＜60 分以内＞	1 2 3	31'27"～34'20"	37'33"～41'44"	41'47"～43'42"	44'01"～48'44"
溶出性 (%) n=6 ＜90 分、80%以上＞	1 2 3	98～99	96～99	97～98	97～102
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	1 2 3	99.8	101.3	101.0	101.2
(参考値) 硬度 (kg) n=20	1 2 3	15.8～17.5	11.1～15.4	12.6～16.0	12.9～17.1
		12.5～17.0	10.5～15.7	13.3～15.9	13.8～17.5
		13.4～15.9	10.7～15.1	11.5～15.2	11.9～16.6

※：表示量に対する含有率 (%)

◇プラシルカスト錠 225mg 「NIG」 無包装 曝光量 120 万 Lx・hr [2000Lx、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット番 号	総曝光量				
		開始時	30 万 Lx・hr	60 万 Lx・hr	90 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 ＜白色～淡黄色の素錠＞	1 2 3	白色の割線入り 素錠	白色の割線入り 素錠	白色の割線入り 素錠	白色の割線入り 素錠	白色の割線入り 素錠
確認試験 (TLC)	1 2 3	適合	適合	適合	適合	適合
崩壊性 (分秒) ＜60 分以内＞	1 2 3	31'27"～34'20"	32'35"～35'28"	31'11"～33'48"	31'55"～33'30"	32'41"～34'20"
溶出性 (%) n=6 ＜90 分、80%以上＞	1 2 3	98～99	98	97～103	91～95	99～102
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	1 2 3	99.8	99.3	99.6	99.6	100.0
(参考値) 硬度 (kg) n=20	1 2 3	15.8～17.5	15.6～17.9	14.7～16.9	13.7～17.1	14.5～17.4
		12.5～17.0	15.2～17.1	14.5～16.9	13.4～16.9	13.7～16.8
		13.4～15.9	13.9～15.6	12.9～16.0	12.8～15.3	13.9～15.7

※：表示量に対する含有率 (%)

◇プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」 無包装 40℃ [遮光・気密容器]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜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＞	帯黄白色不透明の硬カプセル剤で、 内容物は帯黄白色の粉末を含む粒	帯黄白色不透明の硬カプセル剤で、 内容物は帯黄白色の粉末を含む粒
溶出性 (%) ＜90 分、80%以上＞	95～100	86～90
残存率 (%)	100	102

◇プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」 無包装 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜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＞	帯黄白色不透明の硬カプセル剤で、 内容物は帯黄白色の粉末を含む粒	帯黄白色不透明の硬カプセル剤で、 内容物は帯黄白色の粉末を含む粒
溶出性 (%) ＜90 分、80%以上＞	95～100	90～93
残存率 (%)	100	104

◇プランルカストカプセル 112.5mg「NIG」 無包装 25℃・曝光量 60万 Lx・hr [気密容器]

試験項目 ＜規格＞	総曝光量	
	開始時	60万 Lx・hr
性状 ＜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＞	帯黄白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は帯黄白色の粉末を含む粒	帯黄白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は帯黄白色の粉末を含む粒
溶出性 (%) ＜90分、80%以上＞	95～100	94～95
残存率 (%)	100	103

#### 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（物理化学的变化）

該当しない

#### 9. 溶出性

##### （1）溶出規格

プランルカストカプセル 112.5mg「NIG」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたプランル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。

（試験液として、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を用い、パドル法により、100rpmで試験を行う。）

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
112.5 mg	90分	80%以上

## (2) 溶出試験

< プランルカスト錠 112.5mg 「NIG」 ><sup>2)</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 18 年 11 月 24 日薬食審査発第 1124004 号）

### 試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

回転数及び試験液：

50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)

50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8：各試験液にポリソルベート 80 0.5%添加)

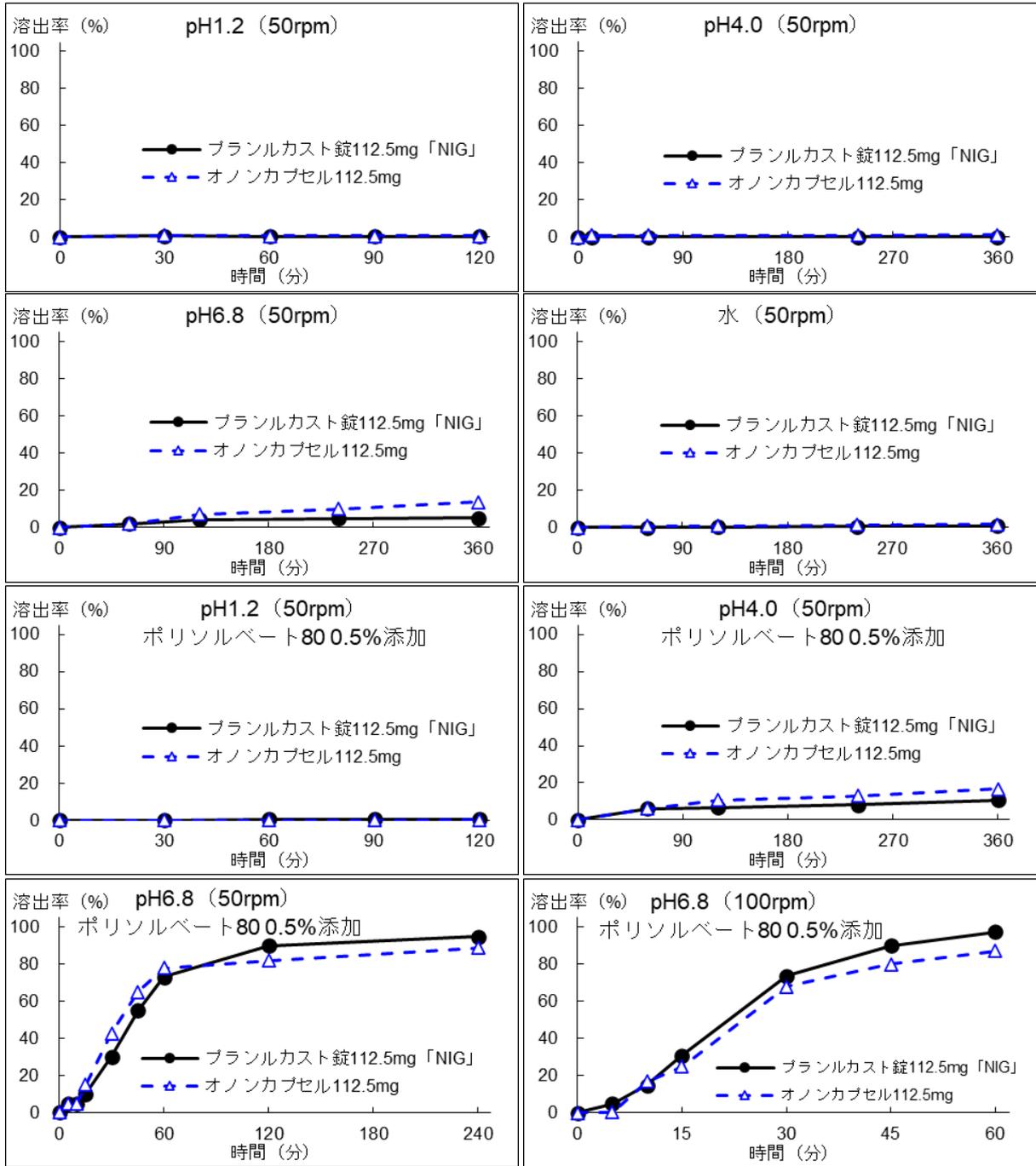
100rpm (pH6.8：0.5% ポリソルベート 80 0.5%添加)

### [判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、120 分における本品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。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、360 分における本品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。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、360 分における本品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。
- ・ 水 (50rpm) では、360 分における本品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。
- ・ pH1.2 (50rpm、ポリソルベート 80 0.5%添加) では、120 分における本品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。
- ・ pH4.0 (50rpm、ポリソルベート 80 0.5%添加) では、標準製剤が 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及び 360 分において、本品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。
- ・ pH6.8 (50rpm、ポリソルベート 80 0.5%添加) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- ・ pH6.8 (100rpm、ポリソルベート 80 0.5%添加) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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、本品の溶出挙動を標準製剤（オノンカプセル112.5mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

< プランルカストカプセル 112.5mg 「NIG」 ><sup>3)</sup>

「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について」（平成 10 年 7 月 15 日 医薬発第 634 号）（その 60）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

回転数及び試験液：

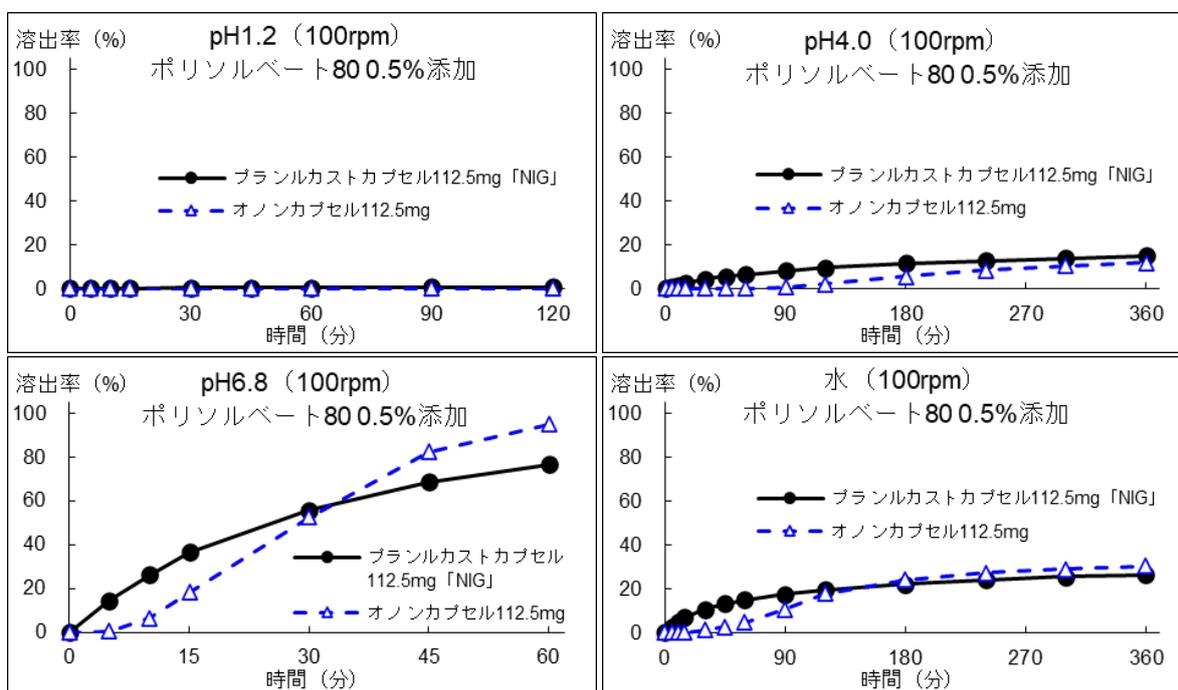
100rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水：各試験液にポリソルベート80 0.5%添加)

[判定]

- ・ pH1.2 (100rpm) では、標準製剤及び本品はほとんど溶出せず、両製剤の類似性が認められた。
- ・ pH4.0 (100rpm) では、標準製剤が 360 分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 360 分において、本品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。
- ・ pH6.8 (100rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- ・ 水 (100rpm) では、標準製剤が 360 分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 360 分において、本品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。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（オノンカプセル112.5mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=6)

### (3) 含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験<sup>4)</sup>

#### < プランルカスト錠 225mg 「NIG」 >

プランルカスト錠 225mg 「NIG」は、「含量が異なる経口固形剤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）」に基づき、プランルカスト錠 112.5mg 「NIG」を標準剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

#### 試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

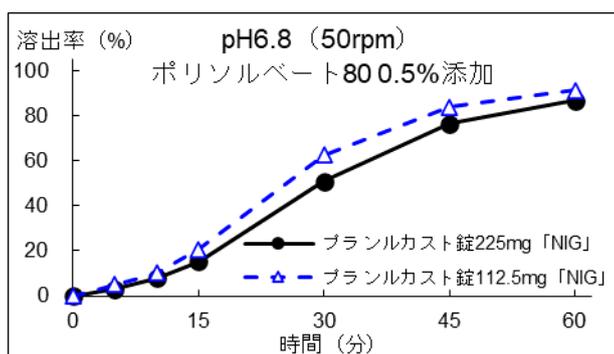
回転数及び試験液：100rpm（pH6.8：ポリソルベート80 0.5%添加）

#### [判定]

- ・pH6.8（100rpm、ポリソルベート 80 0.5%添加）では、 $f_2$  関数の値は 50 以上であった。また、最終比較時点（60 分付近）における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

以上、プランルカスト錠225mg 「NIG」の溶出挙動を標準剤（プランルカスト錠112.5mg「NIG」）と比較した結果、上記の試験液において「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合したことから、生物学的に同等とみなされた。

(溶出曲線)



(n=12)

## 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

#### < プランルカスト錠 112.5mg 「NIG」 >

140 錠 [14 錠 (PTP)  $\times$  10]、700 錠 [14 錠 (PTP)  $\times$  50]

#### < プランルカスト錠 225mg 「NIG」 >

140 錠 [14 錠 (PTP)  $\times$  10]

#### < プランルカストカプセル 112.5mg 「NIG」 >

140 カプセル [14 カプセル (PTP)  $\times$  10]、420 カプセル [14 カプセル (PTP)  $\times$  30]

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTP : ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー : アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

**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

- 気管支喘息
- アレルギー性鼻炎

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

通常、成人にはプラナルカスト水和物として1日量450mg(112.5mg錠:4錠、225mg錠:2錠、112.5mgカプセル: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。

#### (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

高齢者では減量する（例えば、112.5mg錠：1回1錠を1日2回、112.5mgカプセル：1回1カプセルを1日2回）など注意すること。[9.8 参照]

(解説)

高齢者に投薬される可能性があることから設定した。

### 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

###### 〈気管支喘息〉

###### 17.1.1 国内二重盲検比較試験

成人気管支喘息に対する二重盲検比較試験において、プラナルカスト水和物カプセルの有用性が認められている。また、喘息症状の軽減、併用治療薬剤の減量、肺機能の改善効果が認められている<sup>5)</sup>。

###### 〈アレルギー性鼻炎〉

###### 17.1.3 国内二重盲検比較試験

プラナルカスト水和物カプセルの通年性アレルギー性鼻炎に対する二重盲検比較試験において、病型別の改善率は鼻閉を含む病型では61.2% (79/129例)、鼻閉を含まない病型では54.5% (12/22例)である。また、症状別の改善率は鼻閉では71.8% (94/131例)、鼻汁では60.3% (76/126例)、くしゃみでは54.4% (68/125例)である<sup>12)</sup>。

## 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

### 〈気管支喘息〉

#### 17.1.2 国内臨床試験

プラナルカスト水和物カプセルの二重盲検比較試験を含む臨床試験において、改善以上と判定された症例は 334 例中 217 例（65.0%）である<sup>5)・11)</sup>。

### 〈アレルギー性鼻炎〉

#### 17.1.4 国内臨床試験

プラナルカスト水和物カプセルの二重盲検比較試験を含む臨床試験において、改善以上と判定された症例は 358 例中 235 例（65.6%）である<sup>13)</sup>。

### 〈アレルギー性鼻炎〉

#### 17.1.5 国内第Ⅲ相一般臨床試験

プラナルカスト水和物カプセル単独群とプラナルカスト水和物カプセルに他の抗アレルギー剤を併用した群との直接比較は行っていない。一方、プラナルカスト水和物カプセルに他の抗アレルギー剤を併用した群とプラナルカスト水和物カプセル以外の抗アレルギー剤単独群との封筒法による群間比較試験において、改善以上と判定された症例は併用群で 26 例中 19 例（73.1%）、単独群で 20 例中 6 例（30.0%）である<sup>14)</sup>。

## 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剤

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

プラナルカストは気管支喘息の基本的病態形成に深く関与しているロイコトリエンの受容体を選択的に結合してその作用に拮抗し、気道収縮反応、気道の血管透過性亢進、気道粘膜の浮腫及び気道過敏性の亢進を抑制し、気管支喘息患者の臨床症状及び肺機能を改善させる。

また、プラナルカストは鼻閉、鼻汁、くしゃみを三大主徴とするアレルギー性鼻炎の特徴的病態の成立に重要な役割を演じていることが示唆されているロイコトリエンの受容体を選択的に結合してその作用に拮抗し、鼻腔通気抵抗上昇、好酸球浸潤を伴う鼻粘膜浮腫、鼻粘膜過敏性を抑制し、さらに鼻粘膜過敏性抑制作用を介して間接的に、ヒスタミン、アセチルコリン及びその他の非特異的な刺激によるくしゃみや鼻汁等の臨床症状を改善する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 薬理作用

###### 18.2.1 ロイコトリエン (LT) 受容体拮抗作用

モルモット肺膜分画及びモルモット鼻粘膜膜分画において、LTC<sub>4</sub>、LTD<sub>4</sub>、LTE<sub>4</sub>の受容体を選択的に結合してその作用に拮抗する。また、ヒスタミン、アセチルコリン及びセロトニン等には拮抗作用を示さず、アラキドン酸代謝酵素にもほとんど影響を与えない<sup>15)・16)</sup> (*in vitro*)。

###### 18.2.2 気道収縮抑制作用

- 1) 気管支攣縮型喘息患者の気道収縮反応を抑制する<sup>17)</sup>。
- 2) 感作モルモットの抗原誘発気道収縮を経口投与で抑制する<sup>18)</sup>。
- 3) モルモット及びヒトの摘出気道平滑筋のLTC<sub>4</sub>、LTD<sub>4</sub>による収縮を抑制する<sup>15)・19)</sup> (*in vitro*)。

###### 18.2.3 気道過敏性抑制作用

- 1) 気管支喘息患者に経口投与すると、メサコリンに対する気道過敏性を改善する<sup>20)</sup>。
- 2) モルモットの抗原吸入によるアセチルコリン又はヒスタミンの気道過敏性の亢進を経口投与で、またLTによるヒスタミンの気道過敏性の亢進を静脈内投与で抑制する<sup>18)・21)・22)</sup>。

###### 18.2.4 気道の血管透過性及び粘膜浮腫の抑制作用 (抗炎症作用)

- 1) モルモットの抗原誘発による気道の血管透過性の亢進を経口投与で抑制する<sup>23)</sup>。
- 2) モルモットのLTC<sub>4</sub>、LTD<sub>4</sub>による気道粘膜の浮腫形成を静脈内投与で抑制す<sup>22)</sup>。

###### 18.2.5 肺機能の改善作用

気管支喘息患者に経口投与すると、努力性呼気1秒量及び最大呼気流量を改善する<sup>5)・7)</sup>。

###### 18.2.6 鼻腔通気抵抗上昇抑制作用

- 1) 通年性アレルギー性鼻炎患者に経口投与すると、抗原鼻誘発による鼻腔通気抵抗の上昇を抑制する<sup>24)</sup>。
- 2) 感作モルモットの抗原誘発による鼻腔通気抵抗上昇を経口投与で抑制する<sup>25)</sup>。

###### 18.2.7 好酸球浸潤を伴う鼻粘膜浮腫の抑制作用

感作モルモットの抗原誘発による好酸球浸潤を伴う鼻粘膜の浮腫を経口投与で抑制する<sup>25)</sup>。

###### 18.2.8 鼻粘膜過敏性抑制作用

感作モルモットの抗原誘発によるヒスタミンに対するくしゃみ反応の増強を経口投与で抑制する<sup>26)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 16.1.1 単回投与

健康成人 5 例にプラシルカスト水和物カプセル 225mg を食後に単回経口投与すると、血漿中濃度は約 5 時間で最高に達し、その濃度は 642ng/mL で、血漿中半減期は約 1.2 時間である<sup>27)</sup>。

Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	AUC <sub>0-∞</sub> (ng・hr/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)
5.2±1.1	642.3±151.0	2348.7±471.3	1.15±0.13

平均値±標準偏差

##### 16.1.2 生物学的同等性試験

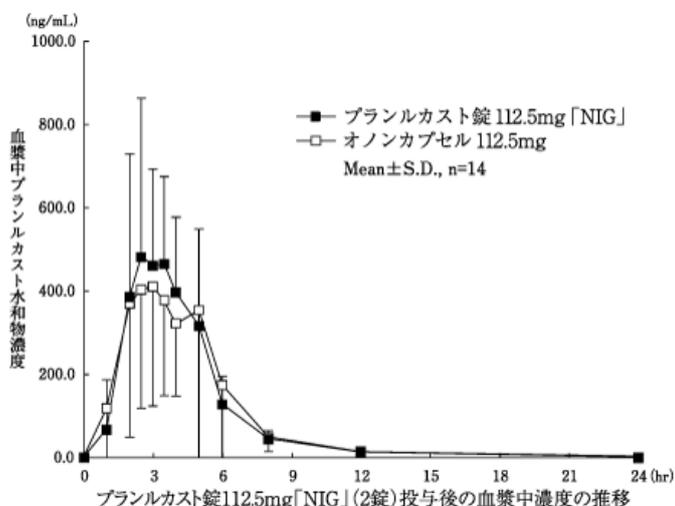
#### 〈プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」〉

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 18 年 11 月 24 日薬食審査発第 1124004 号）

プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」とオノンカプセル 112.5mg をクロスオーバー法により、それぞれ 2 錠又は 2 カプセル（プラシルカスト水和物として 225mg）を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中プラシルカスト水和物濃度を測定し、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<sup>28)</sup>。

	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)
プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」	2101.29±815.84	665.43±348.75	3.25±0.80	2.45±1.31
オノンカプセル 112.5mg	2105.57±872.96	664.93±347.70	3.21±1.46	2.97±1.68

(Mean±S.D.,n=14)

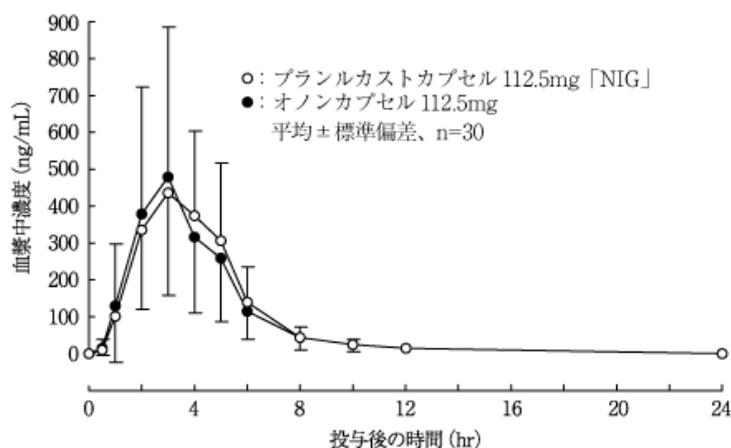


血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### 〈プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」〉

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）

プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」とオノンカプセル 112.5mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 カプセル（プラシ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、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<sup>29)</sup>。



薬物動態パラメータ

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-24</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」	112.5	1998.4±924.3	567.1±253.3	3.1±1.1	3.31±1.93
オノンカプセル 112.5mg	112.5	1956.8±1227.7	588.5±405.8	3.1±1.1	4.33±3.69

（平均±標準偏差、n=30）

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。

### 〈プラシルカスト錠 225mg 「NIG」〉

プラシルカスト錠 225mg 「NIG」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日付薬食審発第 1124004 号）」に基づき、プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた<sup>4)</sup>。

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

##### 16.7.1 動物における薬物相互作用

カニクイザルでケトコナゾールとの併用によりプラシルカストの血中濃度が上昇（Cmax が 2.8 倍、AUC が 2 倍）するとの報告がある<sup>30)</sup>。[10.2 参照]

（「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**

ヒト血清に対する蛋白結合率は99.7～99.8%であり、その主結合蛋白はアルブミンである<sup>31)</sup>(*in vitro*、限外ろ過法)。

**6. 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（CYP等）の分子種、寄与率**

プラナルカストは主として肝薬物代謝酵素チトクローム P450 (CYP3A4) で代謝される<sup>32)</sup>(*in vitro*)。

**(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

健康成人 5 例にプラシルカスト水和物カプセル 225mg を食後に単回経口投与すると、投与後 72 時間までに尿中及び糞中にそれぞれ投与量の 0.24%及び 98.9%が排泄される。血漿中、尿中及び糞中の主要代謝物は水酸化体で、尿中排泄物の大部分はそのグルクロン酸抱合体である<sup>27)</sup>。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

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）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者に本剤を投与した場合、重篤な過敏症症状が発現する可能性が考えられる。本剤投与によるショック、アナフィラキシー様症状の報告もあるので、本剤の投与に際しては、問診を十分に行い、本剤の成分に対して過敏症の既往歴を有することが判明した場合には、本剤の投与は避けること。

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

（「V. 4. 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

##### 〈気管支喘息〉

8.1 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。

8.2 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。

##### 〈効能共通〉

8.3 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。

8.4 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びびれ、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。

8.5 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。

8.6 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。

（解説）

8.1 本剤はその薬理作用（cysLTs 受容体拮抗作用）から、気管支拡張剤、ステロイド剤等とは異なり、すでに起こっている喘息発作を緩解する薬剤ではないことから注意を喚起した。

8.2 本剤は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、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、ステロイド剤の投与など適切な処置を行うこと。

8.3 本剤の併用によりステロイド維持量を減量し得た患者において、本剤の投与を中止した場合には、本剤併用による上乗せ効果がなくなることによって原疾患が再発するおそれがあることから注意を喚起した。

8.4 Churg-Strauss 症候群は現在好酸球性多発血管炎性肉芽腫症といわれ、中・高年の喘息患者に稀（100万人当たり数十例）に発症する。ロイコトリエン拮抗剤の効果の1つとして経口ステロイド剤の減量が報告されているが、経口ステロイド剤を減量・中止することにより、今までステロイド剤によって抑えられていた Churg-Strauss 症候群が発現する可能性があるため、因果関係は明確にされていないが、ロイコトリエン拮抗剤を使用する際の一般的な注意喚起として設定した。

8.5 海外において、ロイコトリエン拮抗剤及び阻害剤（montelukast、zafirlukast、zileuton\*）で報告されているうつ病、自殺念慮、自殺及び攻撃的行動を含む精神症状について、FDA は「因果関係は明らかではなく、確定的な結論には至っていない」としながらも、使用上の注意の項に精神神経系障害の有害事象の追記を製造販売業者に要請し、上記3剤の添付文書が改訂された。以上のことを踏まえ、国内でもロイコトリエン拮抗剤を使用する際の一般的な注意喚起として設定した。

\*：国内未承認の5-リポキシゲナーゼ（ロイコトリエン合成酵素）阻害剤

8.6 気管支喘息及びアレルギー性鼻炎の二重盲検比較試験及び長期投与試験において、本剤の改善効果は投与1～2週から現れ、投与4～8週まで経時的に上昇した。本剤を4～8週間投与して効果が認められない場合は漫然と投与せず、他の治療への変更も考慮すること。

〈参考〉

Churg-Strauss 症候群（好酸球性多発血管炎性肉芽腫症）とは、「気管支喘息、アレルギー鼻炎などのアレルギー性疾患が先行し（prodromic phase）、これらの治療薬糖質コルチコイド（副腎皮質ステロイド）の減量による再燃を繰り返すうちに、末梢血の著明な好酸球増加を伴って（eosinophilic phase）、発熱、体重減少などの全身症状、多発性単神経炎による手袋・靴下型の知覚障害、運動障害、虚血性腸炎による腹痛や下血、皮膚血管炎による紫斑などの血管炎症状が出現する（vasculitic phase）というのが典型的経過である。」<sup>33)</sup> 本剤を含むロイコトリエン拮抗薬との関連性は不明であり、小児期の発症は稀である。初発症状として、喘息の悪化、発熱、体重減少、関節痛や筋力低下、多発性単神経炎、出血斑等が認められ、経過中、炎症反応の亢進（好酸球増多： $2,000/\text{mm}^3$ 以上、白血球増多、高IgE症： $600\text{U}/\text{mL}$ 以上、CRP陽性、赤沈亢進等）が認められている。治療にはプレドニゾロンの経口投与、ステロイドパルス療法、免疫抑制薬の投与等が行われる。

## 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 長期ステロイド療法を受けている患者

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。

(解説)

長期のステロイド剤使用によって副腎皮質機能が低下していることも考えられ、ステロイド剤の減量をはかる場合には、喘息発作の状態を見ながら徐々に行うのが望ましいことから注意を喚起した。

### (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。

(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。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。[7. 参照]

(解説)

高齢者では腎機能、肝機能が低下していることが多く、医薬品の副作用が発現しやすい傾向があり、一般的に医薬品の投与にあたっては十分な注意が必要である。

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
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 [16.7.1 参照]	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

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（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）

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。

11.1.2 白血球減少（頻度不明）

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。

11.1.3 血小板減少（頻度不明）

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。

11.1.4 肝機能障害

黄疸、AST・ALTの著しい上昇等を伴う肝機能障害（頻度不明）があらわれることがある。

11.1.5 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（頻度不明）、好酸球性肺炎（0.1%未満）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。

11.1.6 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹、そう痒等	蕁麻疹	多形滲出性紅斑
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・ALTの上昇等	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) 発現頻度は使用成績調査を含む。

**9. 臨床検査結果に及ぼす影響**

設定されていない

**10. 過量投与**

設定されていない

**11. 適用上の注意**

**14.適用上の注意**

**14.1 薬剤交付時の注意**

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

**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**

設定されていない

## 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」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	プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」 プラシルカスト錠 225mg 「NIG」 プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」	なし
有効成分	プラシルカスト水和物	なし

### 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

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有

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：オノンカプセル 112.5mg

### 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

<プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」>

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	プラシルカスト錠 112.5mg 「TYK」	2009年 1月 8日	22100AMX00025000	2009年 5月 15日	2009年 5月 15日
承継	プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」	〃	〃	2022年 12月 9日	2022年 12月 9日

<プラシルカスト錠 225mg 「NIG」>

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	プラシルカスト錠 225mg 「TYK」	2011年 1月 14日	22300AMX00238000	2011年 6月 24日	2011年 9月 1日
承継	プラシルカスト錠 225mg 「NIG」	〃	〃	2022年 12月 9日	2022年 12月 9日

< プランルカストカプセル 112.5mg 「NIG」 >

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	プランルカストカプセル 112.5mg「タイヨー」	2007年 3月15日	21900AMX00490000	2007年 7月6日	2007年 7月6日
承継	プランルカストカプセル 112.5mg「NIG」	〃	〃	2023年 5月24日	2023年 5月24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

< 効能又は効果追加 >

追加年月日：2009年9月4日

販売名：プランルカストカプセル 112.5mg「タイヨー」

内容：

新	旧
【効能又は効果】 気管支喘息 アレルギー性鼻炎	【効能又は効果】 気管支喘息

( \_ : 効能又は効果追加に伴う変更箇所)

< 効能又は効果追加 >

追加年月日：2009年9月14日

販売名：プランルカスト錠 112.5mg「TYK」

内容：

新	旧
【効能又は効果】 気管支喘息 アレルギー性鼻炎	【効能又は効果】 気管支喘息

( \_ : 効能又は効果追加に伴う変更箇所)

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
プランルカスト錠 112.5mg「NIG」	4490017F1010	4490017F1070	119182005	621918205
プランルカスト錠 225mg「NIG」	4490017F2076	4490017F2076	120625804	622062504
プランルカストカプセル 112.5mg「NIG」	4490017M1010	4490017M1125	117807403	621780703

#### **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。

## X I. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験（錠 112.5mg）
- 3) 社内資料：溶出試験（カプセル 112.5mg）
- 4) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 225mg）
- 5) 宮本昭正ほか：医学のあゆみ，1993；164：225-247
- 6) 宮本昭正ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：53-70
- 7) 宮本昭正ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：71-107
- 8) 宮本昭正ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：109-129
- 9) 岸本 進 ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：131-158
- 10) 佐竹辰夫ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：159-184
- 11) 長野 準 ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：185-207
- 12) 奥田 稔 ほか：耳鼻と臨床，1998；44：47-72
- 13) 〈アレルギー性鼻炎〉臨床成績集計（オノンカプセル；2000年1月18日承認、申請資料概要ト、臨床試験）
- 14) 朝倉光司ほか：臨床医薬，1997；13：2951-2973
- 15) 小島隆明ほか：Jpn.J.Pharmacol., 1992；60：227-237（PMID：1491512）
- 16) 藤田 学 ほか：Jpn.J.Pharmacol., 1997；75：355-362（PMID：9469641）
- 17) 田村 弦 ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：217-220
- 18) 中河直樹ほか：Eur.J.Pharmacol., 1993；235：211-219（PMID：8508902）
- 19) 山口哲朗ほか：Am.Rev.Respir.Dis., 1992；146：923-929（PMID：1416420）
- 20) 藤村政樹ほか：Respir.Med., 1993；87：133-138（PMID：8497683）
- 21) 中河直樹ほか：基礎と臨床，1992；26：5251-5254
- 22) 淀縄 聡 ほか：日胸疾会誌，1992；30：302-309
- 23) 小島隆明ほか：Life Sci., 1992；51：1577-1583（PMID：1435065）
- 24) 今野昭義ほか：臨床医薬，1997；13：1921-1939
- 25) 藤田 学 ほか：薬理と治療，1997；25：1379-1386
- 26) 鼻粘膜過敏性抑制作用（オノンカプセル；2000年1月18日承認、申請資料概要ホ、薬理）
- 27) 中島光好ほか：臨床医薬，1993；9（Suppl.1）：3-29
- 28) 社内資料：生物学的同等性試験
- 29) 宮脇寛海ほか：医学と薬学，2007；57：641-650
- 30) 第十八改正日本薬局方 医薬品情報 JPDI2021.じほう；2021：642
- 31) 石堂雅恒ほか：薬物動態，1993；8：49-66
- 32) 松本一郎ほか：現代医療，1999；31（増IV）：2936-2943
- 33) 磯部光章ほか：血管炎症候群の診断ガイドライン（2017年改訂版）、p67：2018

### 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

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

##### 粉砕物の安定性試験

##### プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」

プラシルカスト錠 112.5mg 「NIG」の粉砕物安定性を 40℃、30℃・75%RH、曝光下の保存条件で検討した結果、性状は白色であり、含量は規格内であった。

#### ● 粉砕物 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	1 週	2 週	3 週	4 週
性状	1	白色	白色	白色	白色	白色
含量* (%) ＜95.0～105.0%＞	1	99.1	98.4	99.8	99.5	100.3

※：表示量に対する含有率

#### ● 粉砕物 30℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	1 週	2 週	3 週	4 週
性状	1	白色	白色	白色	白色	白色
含量* (%) ＜95.0～105.0%＞	1	99.1	98.4	98.1	100.7	100.1

※：表示量に対する含有率

#### ● 粉砕物 曝光量 120 万 Lx・hr [2000Lx・気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量				
		開始時	30 万 Lx・hr	60 万 Lx・hr	90 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状	1	白色	白色	白色	白色	白色
含量* (%) ＜95.0～105.0%＞	1	99.1	99.2	97.9	97.7	100.6

※：表示量に対する含有率

### プラシルカスト錠 225mg 「NIG」

プラシルカスト錠 225mg 「NIG」の粉砕物安定性を 40℃、30℃・75%RH、曝光下の保存条件で検討した結果、性状は白色であり、含量は規格内であった。

#### ● 粉砕物 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	1 週	2 週	3 週	4 週
性状	1	白色	白色	白色	白色	白色
含量* (%) <95.0~105.0%>	1	99.2	99.0	99.1	99.9	98.7

※：表示量に対する含有率

#### ● 粉砕物 30℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	1 週	2 週	3 週	4 週
性状	1	白色	白色	白色	白色	白色
含量* (%) <95.0~105.0%>	1	99.2	98.9	99.7	100.0	100.0

※：表示量に対する含有率

#### ● 粉砕物 曝光量 120 万 Lx・hr [2000Lx・気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量				
		開始時	30 万 Lx・hr	60 万 Lx・hr	90 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状	1	白色	白色	白色	白色	白色
含量* (%) <95.0~105.0%>	1	99.2	99.0	99.2	100.0	100.2

※：表示量に対する含有率

### 脱カプセルの安定性試験

#### プラシルカストカプセル 112.5mg 「NIG」

脱カプセルの安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は微黄白色の粉末を含む粒であった。

#### ● 脱カプセル 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目	ロット 番号	保存期間		
		開始時	2 週	4 週
性状	N2KC	微黄白色の 粉末を含む粒	微黄白色の 粉末を含む粒	微黄白色の 粉末を含む粒
残存率 (%)	N2KC	100	98.4	99.6

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### プラナルカスト錠 112.5mg 「NIG」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。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。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
プラナルカスト錠 112.5mg 「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分で崩壊せず、10 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

### プラナルカスト錠 225mg 「NIG」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。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。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
プラナルカスト錠 225mg 「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分で崩壊せず、10 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

## プラナルカストカプセル 112.5mg 「NIG」

### 1) 試験方法

#### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、カプセルを開封し、内容物を用いて同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

#### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。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。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

ロット番号：L8KH2

### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
プラナルカストカプセル 112.5mg 「NIG」	5 分以内に崩壊・懸濁した	8Fr.チューブを通過した

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

## 2. その他の関連資料

該当資料なし