

貯 法：気密容器に入れ、室温保存

使用期限：外箱等に表示(3年)

承認番号	21900AMX00429
薬価収載	2007年7月
販売開始	2007年7月
効能追加	2016年4月

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-

برانلکاستDS10%「タカタ」

シロップ用برانلکاست水和物

PRANLUKAST



【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

【組成・性状】

1. 組成

品 名	برانلکاستDS10%「タカタ」
成分・分量	1g中 برانلکاست水和物 100mg
添 加 物	D-マンニトール、エリスリトール、サッカリンナトリウム水和物、アセスルファムカリウム、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素

2. 製剤の性状

品 名	برانلکاستDS10%「タカタ」
性 状	白色～微黄色の微粒又は粉末で、においはなく、味は甘い。

【効能・効果】

気管支喘息

アレルギー性鼻炎

【用法・用量】

通常、小児にはبرانلکاست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برانلکاست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、برانلکاست水和物として成人の通常の用量である450mg/日(ドライシロップとして4.5g/日)を超えないこと。

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

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

【使用上の注意】**

1. 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。特に、小児の通年性アレルギー性鼻炎については、臨床試験において、برانلکاست製剤群のプラセボ群に対する優越性は示されなかったため、患者の状態を観察し、有益性が認められない場合には漫然と投与しないこと。
- (8) 小児では、一般に自覚症状を訴える能力が劣るので、本剤の投与に際しては、保護者等に対し、患者の状態を十分に観察し、異常が認められた場合には、速やかに主治医に連絡する等の適切な処置をするように注意を与えること。

2. 相互作用

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。

3. 副作用

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。

(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。

(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

	頻度不明
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、AI-P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。(太字)

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では、生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

5. 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。]

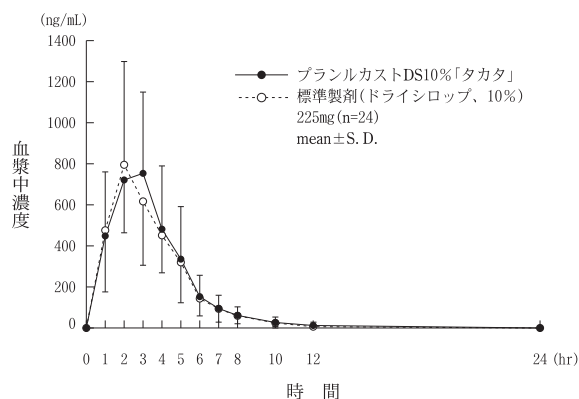
6. 小児等への投与

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。)

【薬物動態】

生物学的同等性試験¹⁾

本剤と標準製剤(ドライシロップ、10%)をクロスオーバー法により、健康成人男子24名にそれぞれ2.25g(ブランドルカスト水和物として225mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後1、2、3、4、5、6、7、8、10、12及び24時間に前腕静脈から採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したブランドルカストの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



今回改訂

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

高田製薬株式会社 学術部
〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号
電話 0120-989-813
FAX 048-816-4183

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
برانلکاستDS 10%「タカタ」	3218.7±1449.8	897.4±317.8	2.3±1.0	2.0±0.5
標準製剤 (ドライシロップ、10%)	3079.2±1346.3	889.7±452.1	2.5±0.9	1.9±0.5

(mean ± S.D.)

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。

【薬効薬理】

برانلکاست水和物は、ロイコトリエン受容体に選択的に結合して、ロイコトリエンの作用に拮抗する。気管支喘息の病態形成に関与しているロイコトリエンの気道収縮、気道過敏性亢進や血管透過性亢進を抑制する。

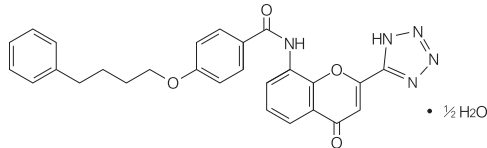
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：برانلکاست水和物[日局]

Pranlukast Hydrate

化学名：N-[4-Oxo-2-(1H-tetrazol-5-yl)-4H-chromen-8-yl]-4-(4-phenylbutyloxy)benzamide hemihydrate

構造式：



分子式：C₂₇H₂₃N₅O₄ · ½H₂O

分子量：490.51

性状：白色～淡黄色の結晶性の粉末である。

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。

融点：約233℃(分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験²⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、36ヵ月)の結果、3年間安定であることが確認された。

【包装】

برانلکاستDS10%「タカタ」

分包：0.5g×120包

0.7g×120包

1g×120包

バラ包装：100g(プラスチック瓶)

500g(プラスチック瓶)

【主要文献】

- 1) 田中孝典他：医学と薬学，57(6)：845，2007.
- 2) 高田製薬(株)社内資料(安定性)

製造販売

高田製薬株式会社
さいたま市西区宮前町203番地1