

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

5-HT₃ 受容体拮抗型制吐剤

グラニセトロン塩酸塩注射液

グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」

グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」

グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」

Granisetron for I.V. Infusion

剤形	注射剤			
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）			
規格・含量	グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」 1袋（50mL）中 グラニセトロン塩酸塩 1.12mg（グラニセトロンとして 1mg） グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」 1袋（50mL）中 グラニセトロン塩酸塩 3.35mg（グラニセトロンとして 3mg） グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」 1袋（100mL）中 グラニセトロン塩酸塩 3.35mg（グラニセトロンとして 3mg）			
一般名	和名：グラニセトロン塩酸塩（JAN） 洋名：Granisetron Hydrochloride（JAN）			
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日		製造販売承認年月日	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
	1mg/50mL	2014年2月14日	2014年6月20日	2014年6月20日
	3mg/50mL	2010年7月15日	2010年11月19日	2010年11月19日
	3mg/100mL	2010年1月21日*	2010年11月19日*	2008年7月4日
	※販売名変更による			
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：光製薬株式会社			
医薬情報担当者の 連絡先				
問い合わせ窓口	光製薬株式会社 医薬情報部 TEL：03-3874-9351 FAX：03-3871-2419 受付時間：8時30分～17時30分 （土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ： https://www.hikari-pharm.co.jp/hikari/medical			

本 IF は 2022 年 7 月改訂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 ー日本病院薬剤師会ー

(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

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	13
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	13
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	13
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	13
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	13
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	13
6. RMP の概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	13
II. 名称に関する項目	2	7. 相互作用	14
1. 販売名	2	8. 副作用	14
2. 一般名	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
3. 構造式又は示性式	2	10. 過量投与	15
4. 分子式及び分子量	2	11. 適用上の注意	15
5. 化学名（命名法）又は本質	2	12. その他の注意	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	IX. 非臨床試験に関する項目	16
III. 有効成分に関する項目	3	1. 薬理試験	16
1. 物理化学的性質	3	2. 毒性試験	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	X. 管理的事項に関する項目	17
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 規制区分	17
IV. 製剤に関する項目	4	2. 有効期間	17
1. 剤形	4	3. 包装状態での貯法	17
2. 製剤の組成	4	4. 取扱い上の注意	17
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	5. 患者向け資材	17
4. 力価	4	6. 同一成分・同効薬	17
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	7. 国際誕生年月日	17
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	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
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	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
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ の内容	18
9. 溶出性	6	11. 再審査期間	18
10. 容器・包装	6	12. 投薬期間制限に関する情報	18
11. 別途提供される資材類	6	13. 各種コード	18
12. その他	6	14. 保険給付上の注意	18
V. 治療に関する項目	7	X I. 文献	19
1. 効能又は効果	7	1. 引用文献	19
2. 効能又は効果に関連する注意	7	2. その他の参考文献	19
3. 用法及び用量	7	X II. 参考資料	20
4. 用法及び用量に関連する注意	7	1. 主な外国での発売状況	20
5. 臨床成績	7	2. 海外における臨床支援情報	20
VI. 薬効薬理に関する項目	9	X III. 備考	21
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	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	21
2. 薬理作用	9	2. その他の関連資料	21
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	11		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	11		
4. 吸収	11		
5. 分布	11		
6. 代謝	12		
7. 排泄	12		
8. トランスポーターに関する情報	12		
9. 透析等による除去率	12		
10. 特定の背景を有する患者	12		
11. その他	12		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL「HK」、グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL「HK」、グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL「HK」は、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、加速試験を行い、2014年2月、2010年7月、2008年3月に承認を取得、2014年6月、2010年11月、2008年7月に上市した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) グラニセトロンは主に腸管壁粘膜の求心性の腹部迷走神経上にある5-HT₃受容体に対する拮抗作用によって制吐作用を示す。
(「V.-1. 効能又は効果」、「VI.-1. 2. (1) 作用部位・作用機序」の項 参照)
- (2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーが報告されている。
(「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) 薬剤調製作業が簡略化できる。
- (2) 薬液吸引が不要なので、微生物汚染、異物混入の可能性が低減する。
- (3) バッグに薬剤名が表示されているので、誤投薬を防止できる。
- (4) 1袋ずつフィルム包装しているため、衛生的で保管・携帯にも便利。
- (5) 薬剤調製のためのシリンジ、針が不要であり、医療廃棄物を削減できる。

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料、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	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

(2025年3月時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

- (1) 承認条件
特になし
- (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

グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL「HK」

グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL「HK」

グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL「HK」

(2) 洋名

Granisetron for I.V. Infusion

(3) 名称の由来

「有効成分名」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」より命名

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

グラニセトロン塩酸塩（JAN）

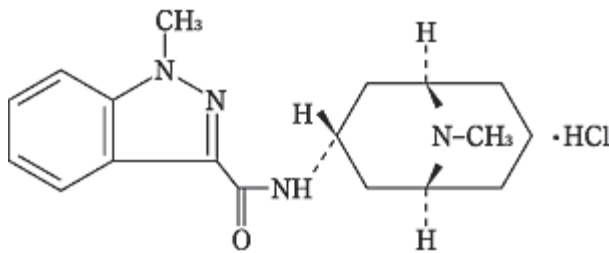
(2) 洋名（命名法）

Granisetron Hydrochloride（JAN）

(3) ステム

5-HT₃受容体拮抗薬：-setron

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₈H₂₄N₄O · HCl

分子量：348.87

5. 化学名（命名法）又は本質

1-Methyl-*N*-(endo-9-methyl-9-azabicyclo[3.3.1]non-3-yl)-1*H*indazole-3-carboxamide hydrochloride
(IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

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～微黄色の粉末又は塊のある粉末である。

(2) 溶解性

水に溶けやすく、メタノールにやや溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 291℃（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

pH：本品 0.1g を水 10mL に溶かした液の pH は 4.0～6.5 である。

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

確認試験法：(1) 定性反応

(2) 赤外吸収スペクトル測定法

定量法：液体クロマトグラフィー又は電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

注射剤（ソフトバッグ）

(2) 製剤の外観及び性状

無色澄明の液

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH : 5.0~7.0

浸透圧比 : 0.9~1.1（生理食塩液に対する比）

(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

		1mg/50mL	3mg/50mL	3mg/100mL
容量（1袋中）		50mL	50mL	100mL
有効成分	グラニセトロン塩酸塩	1.12mg	3.35mg	3.35mg
	（グラニセトロンとして）	（1mg）	（3mg）	（3mg）
添加剤	塩化ナトリウム	450mg	450mg	900mg
	クエン酸水和物	3mg	3mg	6mg
	pH調節剤（塩酸、水酸化ナトリウム）	適量	適量	適量

(2) 電解質等の濃度

Na⁺ : 154mEq/L

(3) 熱量

該当しない

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) 加速試験^{1), 2), 3)}

規格	保存条件			試験項目	保存期間	結果
	温度	湿度	容器			
1mg/50mL	40℃	75% RH	ソフト バッグ	性状、確認試験、浸透圧比、 pH、純度試験、エンドトキ シン、採取容量、不溶性異 物、不溶性微粒子、無菌、 定量	6 ヶ月	変化なし
3mg/50mL						
3mg/100mL						

(2) 長期保存試験^{4), 5), 6)}

規格	保存条件			試験項目	保存期間	結果
	温度	湿度	容器			
1mg/50mL	25℃	60% RH	ソフト バッグ	性状、確認試験、浸透圧比、 pH、純度試験、エンドトキ シン、採取容量、不溶性異 物、不溶性微粒子、無菌、 定量	36 ヶ月	変化なし
3mg/50mL						
3mg/100mL						

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）

(1) pH 変動試験^{7), 8), 9)} A : 0.1mol/L HCl, B : 0.1mol/L NaOH

○グラニセトロン点滴静注バッグ1mg/50mL「HK」：規格pH域：5.0～7.0

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	
	←A : 10mL										B : 10mL→				
	1.38					←5.42 5.43→					12.56				

○グラニセトロン点滴静注バッグ3mg/50mL「HK」：規格pH域：5.0～7.0

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	
	←A : 10mL										B : 10mL→				
	1.38					←6.03 6.01→					12.55				

○グラニセトロン点滴静注バッグ3mg/100mL「HK」：規格pH域：5.0～7.0

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	
	←A : 10mL										B : 10mL→				
	1.39					5.91					12.48				

(2) 配合変化

＜配合変化表＞

光製薬株式会社・医療関係者の皆様向け情報サイト内

○グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」 製品情報 参照

○グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」 製品情報 参照

○グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」 製品情報 参照

<https://www.hikari-pharm.co.jp/hikari/medical>

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

「Ⅷ.－11. 適用上の注意」、「Ⅹ.－4. 取扱い上の注意」の項 参照

(2) 包装

グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」：50mL×10 袋（ソフトバッグ）

グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」：50mL×10 袋（ソフトバッグ）

グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」：100mL×10 袋（ソフトバッグ）

(3) 予備容量

	混注可能量 ^{a)}	容器全満量 ^{b)}	実容量 ^{c)}
グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」	70mL	170mL	54±1mL
グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」	70mL	170mL	54±1mL
グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」	100mL	250mL	106±2mL

a) 容器内の空気は残したまま、混注できる薬液の量

b) 「実容量」＋「容器内の空気を抜いて混注できる薬液の量」

c) 充填目標量

(4) 容器の材質

ソフトバッグ：ポリエチレン

ゴム栓：イソブレン

口部シール：ポリエチレンテレフタレート

外袋：ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

- 抗悪性腫瘍剤（シスプラチン等）投与及び放射線照射に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）
- 術後の消化器症状（悪心、嘔吐）

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

- 5.1 本剤を抗悪性腫瘍剤の投与に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）に対して使用する場合は、強い悪心、嘔吐が生じる抗悪性腫瘍剤（シスプラチン等）の投与に限り使用すること。
- 5.2 本剤を放射線照射に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）に対して使用する場合は、強い悪心、嘔吐が生じる全身照射や上腹部照射等に限り使用すること。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

〈抗悪性腫瘍剤（シスプラチン等）投与に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）〉

成人：通常、成人にはグラニセトロンとして40 μ g/kgを1日1回点滴静注する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、症状が改善されない場合には、40 μ g/kgを1回追加投与できる。

小児：通常、小児にはグラニセトロンとして40 μ g/kgを1日1回点滴静注する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、症状が改善されない場合には、40 μ g/kgを1回追加投与できる。

〈放射線照射に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）〉

通常、成人にはグラニセトロンとして1回40 μ g/kgを点滴静注する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、1日2回投与までとする。

〈術後の消化器症状（悪心、嘔吐）〉

通常、成人にはグラニセトロンとして1回1mgを点滴静注する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、1日3mgまでとする。

(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

- 7.1 放射線照射に伴う消化器症状に対して使用する場合は、放射線照射前に点滴静注する。なお造血幹細胞移植前処置時の放射線全身照射（TBI：Total Body Irradiation）に伴う消化器症状に対して使用する場合は、投与期間は4日間を目安とする。
- 7.2 術後の消化器症状に対して使用する場合は、患者背景や術式等を考慮し、術前から術後の適切なタイミングで投与すること。

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

<抗悪性腫瘍剤誘発嘔吐の抑制>

①成人の成績

二重盲検比較試験¹⁰⁾及び一般臨床試験^{11), 12)}の概要は次のとおりである。抗悪性腫瘍剤（主としてシスプラチン）投与により発現した悪心、嘔吐に対しグラニセトロンとして40µg/kgを点滴静注したところ、有効率（有効以上）は86.6%（71/82例）であった。また、抗悪性腫瘍剤（主としてシスプラチン）投与30分前にグラニセトロンとして40µg/kgを点滴静注した場合の有効率（有効以上）は83.3%（100/120例）であった。

②小児の成績

一般臨床試験¹³⁾の概要は次のとおりである。

抗悪性腫瘍剤（主としてシスプラチン）投与30分前にグラニセトロンとして40µg/kgを点滴静注したところ、著効率（嘔吐なし）は73.0%（119/163例）であり、また、有効率（嘔吐2回以内）は85.3%（139/163例）であった。副作用は、GOT上昇3件、GPT上昇2件、肝機能異常、ビリルビン値上昇、発疹及び便秘が各1件であった。

<放射線照射誘発嘔吐の抑制>

一般臨床試験¹⁴⁾の概要は次のとおりである。

放射線全身照射30分前にグラニセトロンとして40µg/kgを点滴静注したところ、著効率（嘔吐なし）は54.4%（37/68例）であり、また、有効率（嘔吐2回以内）は77.9%（53/68例）であった。副作用は、血中ナトリウム低下、好酸球増多、リンパ球減少、単球減少、GOT上昇、GPT上昇及びビリルビン値上昇が各1件であった。

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

該当資料なし

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

5-HT₃受容体拮抗薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

5-HT₃受容体拮抗薬であるグラニセトロン塩酸塩は腹部迷走神経末端の5-HT₃受容体を介する5-HTの反応を遮断することによって制吐作用を発現すると考えられる。¹⁵⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

<抗悪性腫瘍剤誘発嘔吐の抑制>

1) シスプラチン誘発嘔吐の抑制^{16),17)}

フェレットにグラニセトロン塩酸塩を静注し、15分後にシスプラチン10mg/kgを静注したところ、グラニセトロン塩酸塩0.5mg/kg以上で嘔吐回数の有意な減少及び嘔吐潜伏時間の有意な延長が認められた。

2) シスプラチン誘発嘔吐に対する制吐作用¹⁶⁾

フェレットにシスプラチン10mg/kgを静注し、嘔吐を生じさせて、グラニセトロン塩酸塩0.5mg/kgを静注したところ、嘔吐は投与後30秒以内に抑制された。

3) ドキソルビシンとシクロホスファミド併用による誘発嘔吐に対する作用¹⁶⁾

フェレットにドキソルビシン6mg/kgとシクロホスファミド80mg/kgを静注する30分前及び30分後の2回、グラニセトロン塩酸塩0.5mg/kgを静注したところ、嘔吐回数の減少及び嘔吐潜伏時間の延長が認められた。

<放射線照射誘発嘔吐の抑制>

1) 放射線全身照射誘発嘔吐に対する作用¹⁸⁾

フェレットにグラニセトロン塩酸塩を静注し、15分後に放射線全身照射を行ったところ、グラニセトロン塩酸塩0.05mg/kg以上で嘔吐回数の有意な減少及び嘔吐潜伏時間の有意な延長が認められた。

<作用機序の検討>

1) 各種受容体に対する親和性¹⁹⁾

ラット又はモルモット脳標本を用いて、各種受容体に対するグラニセトロン塩酸塩の親和性を検討したところ、グラニセトロンは5-HT₃受容体に対しては極めて高い親和性を示したが(K_i 値=0.26nM)、5-HT₁(5-HT_{1A}、5-HT_{1B/C}、5-HT_{1C})、5-HT₂、ドパミンD₂、アドレナリン α 1、 α 2及び β 、ベンゾジアゼピン、ピクトキシシン並びにヒスタミンH₁、オピオイド μ 、 κ 及び δ の各受容体に対する親和性はほとんど認められなかった(K_i 値>1000nM)。

2) 5-HT誘発徐脈に対する作用²⁰⁾

5-HTによる5-HT₃受容体を介した一過性の徐脈(von Bezold-Jarisch reflex)に対する作用を麻酔ラットで検討したところ、グラニセトロン塩酸塩はこの反射を用量依存的に抑制した。

(3) 作用発現時間・持続時間

「VI.-2.(2)<抗悪性腫瘍剤誘発嘔吐の抑制>2)」の項 参照

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

<日本人における成績>

1) 単回静脈内点滴投与^{21), 22)}

健康成人男子 6 例にグラニセトロンとして 40 μ g/kg を 30 分かけて静脈内点滴投与した。血漿中濃度は点滴終了時に最高値を示し、以後 2 相性に消失した。

投与量 (μ g/kg)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2\beta}$ (hr)	AUC (ng \cdot hr/mL)	Vd (L/kg)
40	19.48 \pm 6.05	3.14 \pm 1.20	63.06 \pm 36.54	3.30 \pm 1.22

mean \pm SD

2) 単回静脈内投与²³⁾

健康成人男子 11 例にグラニセトロンとして 40 μ g/kg を 2 分間かけて静脈内投与した。血漿中濃度は投与後 5 分で最高値に達し、以後 2 相性に消失した。

投与量 (μ g/kg)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	AUC (ng \cdot hr/mL)
40	42.77 \pm 22.33	3.18 \pm 1.57	64.99 \pm 39.60

mean \pm SD

<外国人における成績²⁴⁾ (参考) >

欧米人小児癌患者 (2~16 歳、36 例) にグラニセトロンとして 40 μ g/kg を 30 分かけて静脈内点滴投与した。血漿中濃度は点滴終了時に最高値を示した (各患者の採血時間が異なるため、薬物動態学的パラメータは中央値と最小-最大で示した)。

投与量 (μ g/kg)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	AUC (ng \cdot hr/mL)	Vd (L/kg)
40	43.1 (14.3-276) n=36	5.63 (0.9-21.1) n=27	185 (43.7-781) n=22	1.34 (0.541-2.71) n=22

中央値 (最小-最大)

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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) 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

「VII.-1. (2) 臨床試験で確認された血中濃度」の項 参照

(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

該当資料なし

(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

1) 代謝部位²⁵⁾

肝臓

2) 代謝経路²⁵⁾

グラニセトロンは水酸化及び脱メチル化の代謝を受け、主な代謝は芳香環 7 位の水酸化である。ヒト肝マイクロソームを用いて行なった *in vitro* 試験の結果では、グラニセトロンの芳香環 7 位の水酸化及び *N*-脱メチル化の代謝には P450 (CYP3A) の関与が報告されている。

(2) 代謝に關与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

「VII-6. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項 参照

(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

<尿中代謝物²⁶⁾>

尿中代謝物は、7-hydroxy の遊離型及び抱合型が主であり、*N*9'-desmethyl 及び *M*1-desmethyl も認められた。

7. 排泄

(1) 排泄部位²⁶⁾

主な排泄経路は腎臓

(2) 排泄率

1) 単回静脈内点滴投与²¹⁾

健康成人男子 6 例に、グラニセトロンとして 40µg/kg を 30 分かけて静脈内点滴投与した際の尿中排泄を検討した。その結果、グラニセトロンの平均排泄率は以下のとおりであった。

時間 (hr)	0~2	2~4	4~6	6~12	12~24	24~48
排泄率	7.6%	2.1%	1.9%	2.1%	1.8%	1.0%

2) 単回静脈内投与²³⁾

健康成人男子 11 例にグラニセトロンとして 40µg/kg を約 2 分間かけて静脈内投与した際の 48 時間後までの尿中グラニセトロン排泄率は 11.04%であった。

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

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」の項 参照

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」の項 参照

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

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 心臓、循環器系機能障害のある患者

(生理食塩液に関する注意)

循環血液量を増すことから心臓に負担をかけ、症状が悪化するおそれがある。

9.1.2 消化管通過障害の症状のある患者

本剤投与後観察を十分に行うこと。本剤の投与により消化管運動の低下があらわれることがある。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

(生理食塩液に関する注意)

水分、塩化ナトリウムの過剰投与に陥りやすく、症状が悪化するおそれがある。

(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

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。妊娠前及び妊娠初期投与(ラット、0.1~6.0mg/kg 皮下)、胎児の器官形成期投与(ラット、0.3~9.0mg/kg 静注、ウサギ、0.3~3.0mg/kg 静注)、周産期及び授乳期投与(ラット、0.1~6.0mg/kg 皮下)の各試験において、雌雄の生殖能、次世代児の発育・生殖能に影響はなく、催奇性もみられなかった。^{27), 28)}

(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。授乳中のラットに¹⁴C 標識グラニセトロン塩酸塩 3mg/kg を静脈内投与し、乳児に哺乳させた際の乳児の胃（乳汁を含む内容物）中の放射能を測定したところ、投与量の 0.5%以下であった。²⁹⁾

(7) 小児等

9.7 小児等

〈抗悪性腫瘍剤（シスプラチン等）投与に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）〉

9.7.1 低出生体重児、新生児、乳児を対象とした臨床試験は実施していない。

〈放射線照射に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）、術後の消化器症状（悪心、嘔吐）〉

9.7.2 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

副作用の発現に注意し、慎重に投与すること。

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	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
セロトニン作用薬 選択的セロトニン再取り込み 阻害剤(SSRI) セロトニン・ノルアドレナリン 再取り込み阻害剤(SNRI) MAO 阻害剤 等	セロトニン症候群(不安、焦燥、 興奮、錯乱、発熱、発汗、頻脈、 振戦、ミオクローヌス等)があら われるおそれがある。	セロトニン作用が増強す るおそれがある。

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、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

ショック、アナフィラキシー（掻痒感、発赤、胸部苦悶感、呼吸困難、血圧低下等）があらわれるとの報告がある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用		
	0.1～2%未満	頻度不明
過敏症	発疹	発赤
精神神経系	不眠	めまい、頭痛
循環器	頻脈	胸内苦悶
消化器	便秘、胃もたれ感	下痢、腰痛
肝臓		AST (GOT)、ALT (GPT) 上昇等の肝機能検査値異常
その他	発熱、全身倦怠感	顔面潮紅

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

<p>14. 適用上の注意</p> <p>14.1 薬剤調製時の注意</p> <p>14.1.1 次の場合は使用しないこと</p> <ul style="list-style-type: none">・外袋が破損しているときや内側に液滴が認められるとき。・内容液が着色又は混濁しているとき。 <p>14.1.2 残液は使用しないこと</p> <p>14.1.3 容器の液目盛りはおよその目安として使用すること。</p> <p>14.2 薬剤投与時の注意</p> <p>患者の体重による適正な用量を遵守すること。</p>
--

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

<p>15. その他の注意</p> <p>15.2 非臨床試験に基づく情報</p> <p>15.2.1 がん原性</p> <p>マウス及びラットに 1、5、50mg/kg を 2 年間経口投与し対照群と比較した。マウスでは 50mg/kg 群の雄で肝細胞がん、50mg/kg 群の雌で肝細胞腺腫の増加がみられた。また、ラットでは 5mg/kg 以上群の雄及び 50mg/kg 群の雌で肝細胞腫瘍の増加がみられた。しかし、1mg/kg 群（臨床用量の 25 倍に相当する）では、マウス及びラットとも肝細胞腫瘍の増加は認められなかった。</p>
--

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：劇薬

処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：劇薬

2. 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

20. 取扱い上の注意

製品の品質を保持するため、本品を包んでいる外袋は使用時まで開封しないこと。
また、開封後は速やかに使用すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：なし

その他の患者向け資材：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：カイトリル注 1mg、カイトリル注 3mg、カイトリル点滴静注バッグ 3mg/100mL 等

同 効 薬：オンダンセトロン塩酸塩水和物、パロノセトロン塩酸塩、ラモセトロン塩酸塩

先発医薬品名：カイトリル注 1mg、カイトリル点滴静注バッグ 3mg/100mL

7. 国際誕生年月日

1991年2月

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

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
グラニセトロン点滴静注 バッグ 1mg/50mL 「HK」	2014年2月14日	22600AMX00253	2014年6月20日	2014年6月20日
グラニセトロン点滴静注 バッグ 3mg/50mL 「HK」	2010年7月15日	22200AMX00598	2010年11月19日	2010年11月19日
グラニセトロン点滴静注 バッグ 3mg/100mL 「HK」	2010年1月21日	22200AMX00259	2010年11月19日	2008年7月4日

注) 旧販売名：グラニセトロン点滴静注 3mg バッグ「HK」

製造販売承認年月日：2008年3月13日

承認番号：22000AMX00634

薬価基準収載年月日：2008年7月4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

2011年4月26日	造血幹細胞移植前処置時の放射線全身照射（TBI:Total Body Irradiation）に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）
2012年3月9日	放射線照射に伴う消化器症状（悪心、嘔吐）
2022年7月27日	術後の消化器症状（悪心、嘔吐）

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（あるいは投与）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
グラニセトロン点滴静注 バッグ 1mg/50mL 「HK」	2391400G5054	2391400G5054	123469501	622346901
グラニセトロン点滴静注 バッグ 3mg/50mL 「HK」	2391400G4031	2391400G4031	120270001	622027001
グラニセトロン点滴静注 バッグ 3mg/100mL 「HK」	2391400G1156	2391400G1156	118414301	621841401

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) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」 安定性試験)
- 2) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」 安定性試験)
- 3) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」 安定性試験)
- 4) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」 長期保存試験)
- 5) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」 長期保存試験)
- 6) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」 長期保存試験)
- 7) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 1mg/50mL 「HK」 pH 変動試験)
- 8) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/50mL 「HK」 pH 変動試験)
- 9) 光製薬社内資料 (グラニセトロン点滴静注バッグ 3mg/100mL 「HK」 pH 変動試験)
- 10) 古江尚他 : 臨床医薬, 1990 ; 6(Suppl.5) : 63-86
- 11) 仁井谷久暢他 : 臨床医薬, 1990 ; 6(Suppl.5) : 87-105
- 12) 町田豊平他 : 臨床医薬, 1990 ; 6(Suppl.5) : 107-120
- 13) 小児領域における抗悪性腫瘍剤投与に伴う悪心・嘔吐に対する臨床試験 (カイトリル注射液 : 2000年7月3日承認、申請資料概要ト. 1)
- 14) 岡本真一郎他 : 今日の移植, 1999 ; 12 : 437-444
- 15) 作用機序 (カイトリル注射液 : 2000年7月3日承認、申請資料概要ホ. 2)
- 16) Bermudez, J. et al. : Br. J. Cancer, 1988 ; 58 : 644-650 [PMID:2851311]
- 17) シスプラチン誘発嘔吐に対する作用 (カイトリル注射液 : 2000年7月3日承認、申請資料概要ホ.1. 1-1)
- 18) 全身 X 線照射誘発嘔吐に対する作用 (カイトリル注射液 : 2000年7月3日承認、申請資料概要ホ.1. 1-1)
- 19) Blower, P. R. : Eur. J. Cancer, 1990 ; 26(Suppl.1) : 8-11 [PMID:2169786]
- 20) Sanger, G. J. et al. : Eur. J. Pharmacol., 1989 ; 159 : 113-124 [PMID:2540014]
- 21) 熊倉博之他 : 臨床医薬, 1990 ; 6 (Suppl.5) : 25-34
- 22) 小柳純子他 : 臨床医薬, 1990 ; 6 (Suppl.5) : 3-24
- 23) 小柳純子他 : 臨床医薬, 1990 ; 6 (Suppl.5) : 35-47
- 24) 欧米人小児癌患者及び成人癌患者における薬物動態 (カイトリル注射液 : 2000年7月3日承認、申請資料概要へ.2.2-1)
- 25) Bloomer, J. C. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol., 1994 ; 38(6) : 557-566 [PMID:7888294]
- 26) Clarke, S. E. et al. : Xenobiotica, 1994 ; 24(11) : 1119-1131 [PMID:7701853]
- 27) Baldwin, J. A. et al. : 基礎と臨床, 1990 ; 24 : 5043-5053
- 28) Baldwin, J. A. et al. : 基礎と臨床, 1990 ; 24 : 5055-5069
- 29) Haddock, R. E. et al. : 基礎と臨床, 1990 ; 24 : 6821-6843

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
海外では発売されていない（2025年3月時点）
2. 海外における臨床支援情報
該当資料なし

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

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし