

## アレルギー性疾患治療剤

日本薬局方

ペミロラストカリウム錠

ペミロラストK錠5mg「トーフ」

ペミロラストK錠10mg「トーフ」

PEMIROLAST POTASSIUM TABLETS 5mg “TOWA”/TABLETS  
10mg “TOWA”

貯 法：室温保存

有効期間：4年（錠5mg）

3年（錠10mg）

	錠5mg	錠10mg
承認番号	22900AMX00080	22900AMX00081
販売開始	2003年7月	

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5参照]
- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

## 3. 組成・性状

## 3.1 組成

販売名	ペミロラストK錠5mg「トーフ」	ペミロラストK錠10mg「トーフ」
1錠中の有効成分	日局 ペミロラストカリウム ……………5mg	日局 ペミロラストカリウム ……………10mg
添加剤	乳糖水和物、低置換度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、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク、ステアリン酸マグネシウム	

## 3.2 製剤の性状

販売名	ペミロラストK錠5mg「トーフ」	ペミロラストK錠10mg「トーフ」	
性状・剤形	微黄白色～帯黄白色の 割線入りの素錠	帯黄白色の 割線入りの素錠	
識別コード	Tw136	Tw137	
外形	表		
	裏		
	側面		
直径(mm)	6.0	6.5	
厚さ(mm)	2.4	2.2	
質量(mg)	90	90	

## 4. 効能又は効果

○気管支喘息

○アレルギー性鼻炎

## 6. 用法及び用量

〈気管支喘息〉

通常、成人にはペミロラストカリウムとして1回10mgを1日2回、朝食後及び夕食後（又は就寝前）に経口投与する。  
小児においては、通常、下記の年齢別投与量を1回量とし、1日2回、朝食後及び夕食後（又は就寝前）に経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

年 齢	1回投与量
5歳以上11歳未満	ペミロラストカリウムとして5mg
11歳以上	ペミロラストカリウムとして10mg

〈アレルギー性鼻炎〉

通常、成人にはペミロラストカリウムとして1回5mgを1日2回、朝食後及び夕食後（又は就寝前）に経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

## 7. 用法及び用量に関連する注意

高齢者への本剤の投与により副作用があらわれた場合は、減量（例えば半量）又は休業するなど注意すること。[9.8参照]

## 8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

- 本剤は、気管支拡張剤、ステロイド剤、抗ヒスタミン剤等と異なり、すでに起こっている発作や症状を速やかに軽減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。
  - 本剤の使用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。
  - 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
  - 本剤の使用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注意すること。
- 〈気管支喘息〉
- 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。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

## 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。

## 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。動物実験（ラット）で大量投与により、胎児発育遅延が報告されている。[2.1参照]

## 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。

## 9.7 小児等

低出生体重児、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。

## 9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。[7.参照]

## 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。

## 11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症	—	発疹、そう痒、蕁麻疹、浮腫（顔面、四肢等）、湿疹、顔面潮紅
精神神経系	眠気	倦怠感、頭痛、頭がボーッとする
消化器	腹痛、嘔気	下痢、口渇、便秘、食欲不振、胸やけ、胃もたれ感、嘔吐、口内炎
血液	—	貧血、血小板増加
肝臓	ALT上昇、AST上昇	γ-GTP上昇、Al-P上昇
腎臓	—	蛋白尿、BUN上昇
泌尿器	—	頻尿、血尿等の膀胱炎様症状
その他	—	全身関節痛、鼻腔乾燥感、鼻痛

注）発現頻度は、錠・ドライシロップに関する使用成績調査を含む

## 14. 適用上の注意

### 14.1 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ある。

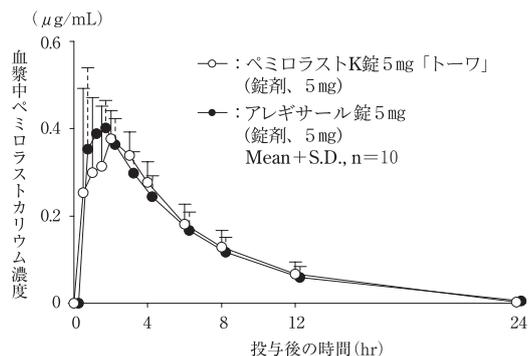
## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

#### 16.1.1 生物学的同等性試験

##### 〈ペミロラストK錠5mg「トーワ」〉

ペミロラストK錠5mg「トーワ」とアレギサル錠5mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ペミロラストカリウムとして5mg）健康成人男子（n=10）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>1)</sup>



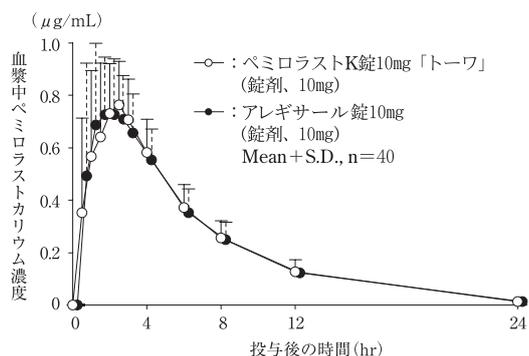
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>24</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ペミロラストK錠5mg「トーワ」	2.7704 ± 0.7039	0.4559 ± 0.1230	1.75 ± 0.89	4.1038 ± 0.8556
アレギサル錠5mg	2.6897 ± 0.6196	0.4773 ± 0.0497	0.90 ± 0.57	4.0013 ± 0.9449

(Mean ± S. D., n=10)

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。

##### 〈ペミロラストK錠10mg「トーワ」〉

ペミロラストK錠10mg「トーワ」とアレギサル錠10mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ペミロラストカリウムとして10mg）健康成人男子（n=40）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>1)</sup>



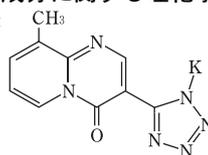
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>24</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ペミロラストK錠10mg「トーワ」	5.5285 ± 1.0685	0.9570 ± 0.1451	1.81 ± 0.97	4.047 ± 1.329
アレギサル錠10mg	5.5001 ± 1.0537	0.9661 ± 0.1625	1.59 ± 0.91	4.0762 ± 1.0444

(Mean ± S. D., n=40)

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。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：ペミロラストカリウム (Pemirolast Potassium)

化学名：Monopotassium 5-(9-methyl-4-oxo-4H-pyrido[1,2- $\alpha$ ]pyrimidin-3-yl)-1H-tetrazol-1-ide

分子式：C<sub>10</sub>H<sub>7</sub>KN<sub>6</sub>O

分子量：266.30

性状：淡黄色の結晶性の粉末である。水に溶けやすく、メタノールに溶けにくく、エタノール（99.5）に極めて溶けにくい。水酸化カリウム試液に溶ける。

融点：約322°C（分解）

## 20. 取扱い上の注意

アルミピロー開封後は遮光保存すること。

## 22. 包装

〈ペミロラストK錠5mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

〈ペミロラストK錠10mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

## 23. 主要文献

1) 新井俊彦 他：新薬と臨床. 2003；52(7)：969-974

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター

〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号

☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**東和薬品株式会社**

大阪府門真市新橋町2番11号