

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
モナソサル[®]錠5mg
モナソサル[®]錠10mg

MONASOSAL[®] TABLETS 5mg/TABLETS 10mg

貯 法：遮光した気密容器・室温保存
 使用期限：外箱に記載

日本標準商品分類番号 87449			
	承認番号	薬価収載	販売開始
錠5mg	21500AMZ00122	2003年7月	2003年7月
錠10mg	21500AMZ00123	2003年7月	2003年7月

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
- 2) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

※※【組成・性状】

		モナソサル錠5mg	モナソサル錠10mg
※※	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
	添加物	乳糖水和物、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、タルク、ステアリン酸Mg	
性状		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	本体	Tw136	Tw137
	包装		
外形	表		
	裏		
	側面		
錠径(mm)		6.0	6.5
厚さ(mm)		2.4	2.2
質量(mg)		90	90

【効能・効果】

気管支喘息、アレルギー性鼻炎

【用法・用量】

気管支喘息の場合：

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

アレルギー性鼻炎の場合：

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。

【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、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。
- 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。
- 5) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、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。
- 6) 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。

2. 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。

	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、そう痒、蕁麻疹、浮腫（顔面、四肢等）、湿疹、顔面潮紅等
精神神経系	眠気、けん怠感、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、血小板増加等
肝臓	ALT(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、 γ -GTP上昇、Al-P上昇等
腎臓	蛋白尿、BUN上昇
泌尿器 ^{注2)}	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1) このような場合には、投与を中止すること。

注2) このような場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

3. 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ため、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。

4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 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) 授乳中の女性には、本剤投与中は授乳を避けさせること。[動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。]

5. 小児等への投与

低出生体重児、新生児に対する安全性は確立していない。(使用経験が少ない)

6. 適用上の注意

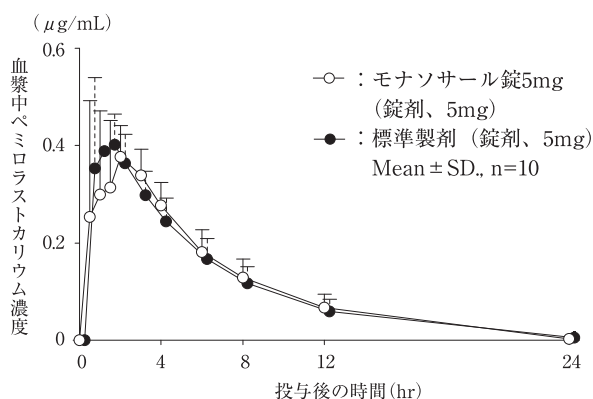
薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

※※【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

1) モナソサル錠 5 mg

モノソサル錠 5 mg と標準製剤を、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 5 mg) 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¹⁾。



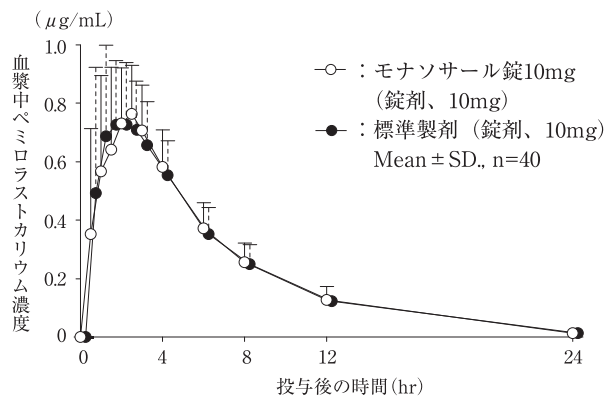
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₂₄ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
モノソサル錠 5mg (錠剤、5 mg)	2.7704 ± 0.7039	0.4559 ± 0.1230	1.75 ± 0.89	4.1038 ± 0.8556
標準製剤 (錠剤、5mg)	2.6897 ± 0.6196	0.4773 ± 0.0497	0.90 ± 0.57	4.0013 ± 0.9449

(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。

2) モナソサル錠 10mg

モノソサル錠 10mg と標準製剤を、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¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₂₄ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
モノソサル錠 10mg (錠剤、10mg)	5.5285 ± 1.0685	0.9570 ± 0.1451	1.81 ± 0.97	4.047 ± 1.329
標準製剤 (錠剤、10mg)	5.5001 ± 1.0537	0.9661 ± 0.1625	1.59 ± 0.91	4.0762 ± 1.0444

(Mean ± S. D., n=40)

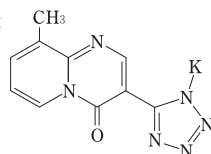
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

※※ 2. 溶出挙動

モノソサル錠 5 mg 及びモノソサル錠 10mg は、日本薬局方医薬品各条に定められたペミロラストカリウム錠の溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている²⁾³⁾。

【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- α]pyrimidin-3-yl)-1H-tetrazol-1-ide

分子式：C₁₀H₇KN₆O

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)

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験 (40°C、相対湿度75%、6 ヶ月) の結果、モノソサル錠 5 mg 及びモノソサル錠 10mg は通常の市場流通下においてそれぞれ 3 年間安定であることが推測された⁴⁾⁵⁾。

【包装】

モノソサル錠 5 mg：100錠、1000錠 (PTP)

モノソサル錠 10mg：100錠、1000錠 (PTP)

【主要文献】

- 1) 新井 俊彦ほか：新薬と臨牀, 52(7), 969, 2003
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験（錠 5 mg）
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験（錠10mg）
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験（錠 5 mg）
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験（錠10mg）

※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献（社内資料を含む）は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター（24時間受付対応）

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



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