

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「マイラン」
ペミロラストK錠10mg「マイラン」

※日本薬局方 シロップ用ペミロラストカリウム

ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」
Pemirolast K

貯 法：遮光、気密容器、室温保存
 使用期限：3年
 （外箱等に表示の使用期限内
 に使用すること）

| | | |
|------|---------|---------------|
| 承認番号 | 錠5mg | 22100AMX00144 |
| | 錠10mg | 22100AMX00151 |
| | ドライシロップ | 22100AMX00152 |
| 薬価収載 | 2009年5月 | |
| 販売開始 | 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婦人（「4. 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】

組成

| | | |
|----------------|---|--------------------|
| 販売名 | ペミロラストK錠5mg「マイラン」 | ペミロラストK錠10mg「マイラン」 |
| 成分・含量 (1錠中) | 日局 ペミロラストカリウム | |
| | 5mg | 10mg |
| 添加物 | 乳糖水和物、結晶セルロース、部分アルファ化デンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム | |
| 販売名 | ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」 | |
| 成分・含量 (1g中) | 日局 ペミロラストカリウム 5mg | |
| 添加物 | 精製白糖 | |

製剤の性状

- ペミロラストK錠5mg「マイラン」：
 微黄白色～帯黄白色の割線入り素錠である。
- ペミロラストK錠10mg「マイラン」：
 帯黄白色の割線入り素錠である。
- ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」：
 白色～微黄白色のシロップ(粒状)である。

| | 外形 | | | 直径 (mm) | 厚さ (mm) | 質量 (mg) | 識別 コード |
|-----------|----|----|----|------------|------------|------------|-----------|
| | 表面 | 裏面 | 側面 | | | | |
| 錠 5mg | | | | 6.0 | 2.4 | 90 | MH797 |
| 錠 10mg | | | | 6.5 | 2.1 | 90 | MH798 |

ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」：
 識別コード：MH799(分包シート)

【効能・効果】

気管支喘息、アレルギー性鼻炎

【用法・用量】

《ペミロラストK錠5mg「マイラン」、ペミロラストK錠10mg「マイラン」》

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。

《ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」》

気管支喘息の場合

通常、小児にはペミロラストカリウムとして1回0.2mg/kgを1日2回、朝食後及び就寝前に、用時溶解して経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

年齢別の標準投与量は、通常、下記の用量を1回量とし、1日2回朝食後及び就寝前に用時溶解して経口投与する。

| 年齢 | ドライシロップ1回投与量 |
|-----------|---------------------------|
| 1歳以上5歳未満 | 0.5g（ペミロラストカリウムとして2.5mg） |
| 5歳以上11歳未満 | 1.0g（ペミロラストカリウムとして5.0mg） |
| 11歳以上 | 2.0g（ペミロラストカリウムとして10.0mg） |

アレルギー性鼻炎の場合

通常、小児にはペミロラストカリウムとして1回0.1mg/kgを1日2回、朝食後及び就寝前に、用時溶解して経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

年齢別の標準投与量は、通常、下記の用量を1回量とし、1日2回朝食後及び就寝前に、用時溶解して経口投与する。

| 年齢 | ドライシロップ1回投与量 |
|-----------|----------------------------|
| 1歳以上5歳未満 | 0.25g（ペミロラストカリウムとして1.25mg） |
| 5歳以上11歳未満 | 0.5g（ペミロラストカリウムとして2.5mg） |
| 11歳以上 | 1.0g（ペミロラストカリウムとして5.0mg） |

【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。

| 種類 | 頻度 | 頻度不明 |
|--------------------|----|-------------------------------|
| 過敏症 ^{注1)} | 頻度 | 発疹、痒疹、蕁麻疹、浮腫（顔面、四肢等）、湿疹、顔面潮紅等 |

| 種類 | 頻度 | 頻度不明 |
|--------------------|----|--|
| 精神神経系 | | 眠気、倦怠感、頭痛、頭がぼーとする |
| 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、AI-P 上昇等 |
| 腎臓 | | 蛋白尿、BUN 上昇 |
| 泌尿器 ^{※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には減量（例えば半量）又は休薬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婦人には、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) 授乳中の婦人には、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

(1) 調製時：ドライシロップは他剤と配合し液剤とした場合には、pHの変化により沈殿が生じることがあるので配合を避けること。

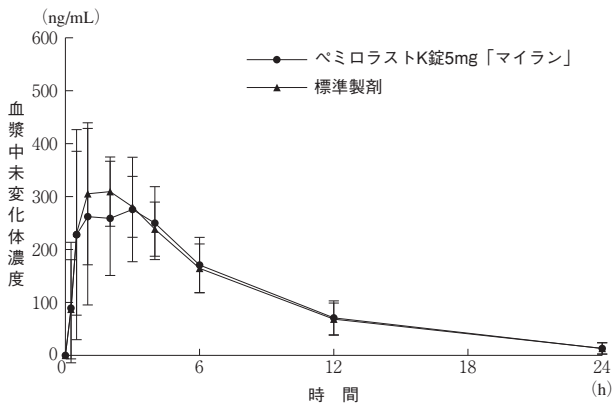
(2) 薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

※【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

〈ベミロラストK錠5mg「マイラン」〉

ベミロラストK錠5mg「マイラン」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ベミロラストカリウムとして5mg）健康成人男子10名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⁾



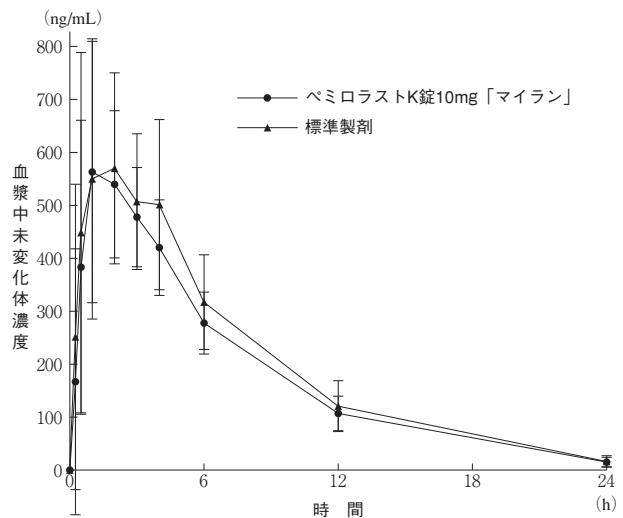
| | Cmax (ng/mL) | AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL) | Tmax (h) | T _{1/2} (h) |
|-----------------------|-----------------|----------------------------------|-------------|-------------------------|
| ベミロラストK錠 5mg「マイラン」 | 403.56 ± 128.67 | 2610.40 ± 726.44 | 2.05 ± 1.40 | 4.55 ± 1.02 |
| 標準製剤 | 389.57 ± 70.26 | 2637.56 ± 640.81 | 1.65 ± 0.88 | 4.64 ± 0.96 |

(mean ± sd, 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。

〈ベミロラストK錠10mg「マイラン」〉

ベミロラストK錠10mg「マイラン」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ベミロラストカリウムとして10mg）健康成人男子20名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。²⁾



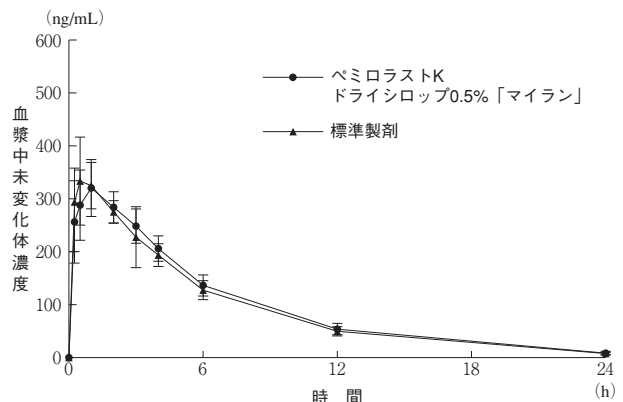
| | Cmax (ng/mL) | AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL) | Tmax (h) | T _{1/2} (h) |
|------------------------|-----------------|----------------------------------|-------------|-------------------------|
| ベミロラストK錠 10mg「マイラン」 | 723.24 ± 162.66 | 4418.70 ± 843.52 | 1.49 ± 1.09 | 4.17 ± 0.62 |
| 標準製剤 | 797.78 ± 133.76 | 4923.54 ± 978.04 | 1.69 ± 1.29 | 4.08 ± 0.56 |

(mean ± sd, n=20)

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。

〈ベミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」〉

ベミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1g（ベミロラストカリウムとして5mg）健康成人男子10名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。³⁾



| | Cmax (ng/mL) | AUC ₀₋₂₄ (ng·h/mL) | Tmax (h) | T _{1/2} (h) |
|--------------------------|-----------------|----------------------------------|-------------|-------------------------|
| ペミロラストKドライシロップ0.5%[マイラン] | 338.29±51.72 | 2332.14±322.93 | 0.90±0.50 | 4.39±0.54 |
| 標準製剤 | 360.78±37.34 | 2237.60±241.41 | 0.93±0.62 | 4.37±0.38 |

(mean±sd, 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. 溶出挙動

ペミロラストK錠5mg「マイラン」及びペミロラストK錠10mg「マイラン」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、またペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたペミロラストカリウムドライシロップ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。^{4)~6)}

【薬効薬理】

抗原抗体反応に伴って起こる肥満細胞からのヒスタミンやロイコトリエンC₄・D₄などのケミカルメディエーターの遊離を抑制することによって、アレルギー症状を緩和する。抗ヒスタミン作用、抗PAF作用などの受容体拮抗作用はない。⁷⁾

*【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：〔日局〕 ペミロラストカリウム

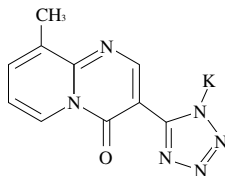
Pemiroloast Potassium

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

分子式：C₁₀H₇KN₆O

分子量：266.30

構造式：



性状：本品は淡黄色の結晶性の粉末である。

本品は水に溶けやすく、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。

本品は水酸化カリウム試液に溶ける。

融点：約322℃(分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験：加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ペミロラストK錠5mg「マイラン」、ペミロラストK錠10mg「マイラン」及びペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。^{8)~10)}

【包装】

ペミロラストK錠5mg「マイラン」 PTP 100錠(10錠×10)

ペミロラストK錠10mg「マイラン」 PTP 100錠(10錠×10)

ペミロラストKドライシロップ0.5%「マイラン」 100g

【主要文献】

- 1) 社内資料(錠5mg：生物学的同等性試験資料)
- 2) 社内資料(錠10mg：生物学的同等性試験資料)
- 3) 社内資料(ドライシロップ0.5%：生物学的同等性試験資料)
- 4) 社内資料(錠5mg：溶出試験資料)
- 5) 社内資料(錠10mg：溶出試験資料)
- 6) 社内資料(ドライシロップ0.5%：溶出試験資料)
- 7) 第十六改正日本薬局方解説書：C-4491, 廣川書店, 2011
- 8) 社内資料(錠5mg：安定性試験資料)
- 9) 社内資料(錠10mg：安定性試験資料)
- 10) 社内資料(ドライシロップ0.5%：安定性試験資料)

**【文献請求先】

「主要文献」に記載の社内資料につきまして下記にご請求ください。

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053



製造販売元
マイラン製薬株式会社
大阪市中央区本町2丁目6番8号

**販売
ファイザー株式会社
東京都渋谷区代々木3-22-7



