

抗アレルギー点眼剤

日本薬局方 ペミロラストカリウム点眼液

※※ **ペミロラストK点眼液0.1%「TS」**

※※ **PEMIROLAST K Ophthalmic Solution 0.1%「TS」**

貯 法：室温保存
 使用期限：外箱及びラベルに記載

※※ 承認番号	30100AMX00047000
※※ 薬価収載	2019年12月
※※ 販売開始	2004年 7月

※※【組成・性状】

販売名	ペミロラストK点眼液0.1%「TS」
有効成分	日局 ペミロラストカリウム
含量 (1mL中)	1mg
添加物	クエン酸水和物、トロメタモール、グリセリン、ベンザルコニウム塩化物
pH	7.5～8.5
浸透圧比	0.7～0.9
性状	無色澄明な無菌水性点眼液

【効能・効果】

アレルギー性結膜炎、春季カタル

【用法・用量】

通常、1回1滴、1日2回(朝、夕)点眼する。

【使用上の注意】

1. 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。
 副作用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なうこと。

	頻度不明
過敏症	眼瞼炎、眼瞼皮膚炎
眼	結膜充血、刺激感、眼脂、痒痒感、結膜炎

2. 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]

3. 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(使用経験がない)。

4. 適用上の注意

- (1) 投与経路：点眼用により使用すること。
- (2) 投与時：
 - 1) 点眼した時に液が眼瞼皮膚等についた場合は、すぐにふき取るよう指導すること。
 - 2) 薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意するよう指導すること。

※※【薬物動態】¹⁾

生物学的同等性試験

家兎眼結膜中における薬物滞留性
 家兎眼の結膜中薬物量の測定により、本剤の薬剤滞留性を検討したところ、点眼24時間後においてもヒスタミン遊離抑制作用のIC₅₀値(5.1×10⁻⁹g/mL)10倍以上の滞留が確認され、ペミロラストカリウムの持続効果が認められた。家兎眼に対し点眼後0.25、1、3、8、24、72及び120時間後の結膜中ペミロラストカリウム濃度を指標とし、ペミロラストK点眼液0.1%「TS」及び標準製剤において得られたペミロラストカリウム濃度についてStudentの t-検定による統計解析を行った結果、いずれの測定時点において

も有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された。

時間 (hr)	ペミロラストカリウム濃度(ng/g組織重量) mean±S.E.[各群n=5]						
	0.25	1	3	8	24	72	120
ペミロラストK点眼液0.1%「TS」	8582.2 ±2873.1	948.1 ±312.9	1016.7 ±243.3	14.2 ±9.1	96.1 ±41.9	56.4 ±30.4	10.8 ±10.8
標準製剤	8397.6 ±2744.8	1071.3 ±507.2	1136.5 ±264.6	31.3 ±13.4	236.0 ±85.5	20.9 ±13.5	5.0 ±5.0

※※【薬効薬理】¹⁾

ラットのCompound48/80及び抗卵白アルブミン抗血清による実験的アレルギー性結膜炎モデルにおいてペミロラストK点眼液0.1%「TS」は、血管透過性亢進抑制を示し、ラット実験的アレルギー性結膜炎に有効であることが認められている。

生物学的同等性試験

1. compound48/80誘発血管透過性亢進抑制作用

compound48/80により惹起したラット非アレルギー性結膜炎モデルにおいて組織中漏出色素量を血管透過性の指標とし、ペミロラストK点眼液0.1%「TS」及び標準製剤において得られた抽出色素の吸光度を用いて90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～log(1.25)の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された。

	抽出色素の吸光度 (620nm) mean±S.E. (n=10)
ペミロラストK点眼液0.1%「TS」	0.1379±0.0102
標準製剤	0.1413±0.0063
ペミロラストK点眼液0.1%「TS」 製剤ブランク	0.2508±0.0297

2. PCA誘発血管透過性亢進抑制作用

抗Egg Albuminラット抗血清により惹起されるアレルギー性結膜炎モデルにおいて組織中漏出色素量を血管透過性の指標とし、ペミロラストK点眼液0.1%「TS」及び標準製剤において得られた抽出色素の吸光度を用いて90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～log(1.25)の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された。

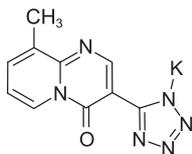
	抽出色素の吸光度 (620nm) mean±S.E. (n=6)
ペミロラストK点眼液0.1%「TS」	0.1187±0.0074
標準製剤	0.1160±0.0064
ペミロラストK点眼液0.1%「TS」 製剤ブランク	0.4584±0.0553

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ペミロラストカリウム (Pemirolast Potassium)

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

構造式：



分子式：C₁₀H₇KN₆O

分子量：266.30

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°C(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(25°C、相対湿度60%、36ヵ月)の結果、外観および含量等は規格の範囲内であり、ペミロラストK点眼液0.1%「TS」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

【包装】

5mL×5本、5mL×10本

【主要文献】

- 1) 生物学的同等性試験(テイカ製薬社内資料)
- 2) 安定性試験(テイカ製薬社内資料)

※※※【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

テイカ製薬株式会社 営業推進グループ 学術課

〒930-0982 富山市荒川一丁目3番27号

TEL 076-431-1717 FAX 076-431-6707