

貯 法：気密容器、室温保存
 使用期限：外箱及びラベルに表示(期限内に使用する
 こと)

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%「杏林」

PEMIROLAST K Ophthalmic Solution 0.1% "KYORIN"

承認番号	22900AMX00088000
薬価収載	2017年12月
販売開始	2004年7月

【組成・性状】

成分・分量(1mL中)	日局ペミロラストカリウム 1mg
添加物	濃グリセリン、トロメタモール、塩酸、エデト酸ナトリウム水和物、ベンザルコニウム塩化物、ポリソルベート80、pH調節剤
剤形	水性点眼剤
性状	無色澄明、無菌製剤
pH	7.5~8.5
浸透圧比 ^注	0.7~0.9
識別コード	PH012

注(浸透圧比)：生理食塩液に対する比

【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。

その他の副作用

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うこと。

分類	副作用(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、そう痒感、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にのみ投与すること。[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：点眼用のみ使用すること。

(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】

ウサギの眼にペミロラストK点眼液0.1%「杏林」を50 μ L点眼した時の結膜への移行は良好で、1時間後に最高に達し、経時的に低下したが24時間後においても滞留が確認された。¹⁾

【薬効薬理】

生物学的同源性試験²⁾ラットのアレルギー性結膜炎モデルを用いて、その治療効果を抗原惹起による漏出色素濃度の抑制率を指標として比較した。右眼を対照眼として生理食塩液を、左眼には被験物質のペミロラストK点眼液0.1%「杏林」基剤、ペミロラストK点眼液0.1%「杏林」、標準製剤を10 μ Lずつ、抗原惹起10分前に点眼し、右眼の色素濃度に対する左眼の色素濃度の抑制率についてTukeyの多重比較検定を行った。その結果、ペミロラストK点眼液0.1%「杏林」及び標準製剤の抑制率は対照群及び基剤群と比較して有意な抑制を示し、また、両製剤間に有意な差は認められなかったことより、生物学的な同源性が確認された。

被験物質群	色素濃度(μ g/mL)		抑制率 ^{注1)} (%)
	右眼(対照眼)	左眼	
対照	30.97 ±2.19	30.39 ±2.59	1.86±4.94
ペミロラストK点眼液 0.1%「杏林」基剤	31.22 ±1.53	29.70 ±2.54	5.00±4.69
ペミロラストK点眼液 0.1%「杏林」	31.17 ±2.04	7.72 ±1.39	75.27 ±3.86 ^{注2)} 注3)
標準製剤 (点眼剤、0.1%)	31.60 ±1.85	7.47 ±0.89	76.35 ±2.73 ^{注2)} 注3)

(平均値±標準偏差、n=10)

注1)抑制率(%)=(右眼の色素濃度-左眼の色素濃度)/右眼の色素濃度×100

注2)P<0.01, 対照群と比較してTukeyの多重比較検定で有意差あり

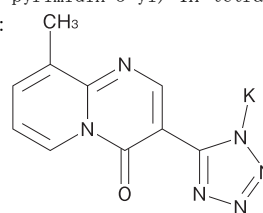
注3)P<0.01, 基剤群と比較してTukeyの多重比較検定で有意差あり

【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-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-1H-tetrazol-1-ide

構造式：

分子式：C₁₀H₇KN₆O

分子量：266.30

性状：ペミロラストカリウムは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℃(分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年間)の結果、外観及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%「杏林」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)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ペミロラストK点眼液0.1%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料(眼組織内移行試験)
- 2)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ペミロラストK点眼液0.1%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料(ラットの実験的結膜炎モデルに対する治療効果)
- 3)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ペミロラストK点眼液0.1%「杏林」の安定性試験に関する資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料は下記にご請求下さい。

キョーリンリメディオ株式会社 学術部

〒920-0017 金沢市諸江町下丁287番地1

TEL 0120-960189

FAX 0120-189099

販売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

製造販売元

キョーリンリメディオ株式会社

富山県南砺市井波885番地