

※※印：2012年 4月改訂(第7版、社名変更等に伴う改訂)
 ※印：2011年11月改訂

日本標準商品分類番号
87449

貯 法：しゃ光・室温・気密容器保存
 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。
 取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照

	錠5	錠10
承認番号	21500AMZ00307000	21500AMZ00308000
薬価収載	2003年7月	2003年7月
販売開始	2003年7月	2003年7月

※日本薬局方

ペミロラストカリウム錠

アレルギー性疾患治療剤

アルジキサル®錠5 アルジキサル®錠10

ULGIXAL

【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婦人(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

	アルジキサル錠5	アルジキサル錠10	
組 成	1錠中： ペミロラストカリウム5mg (添加物) カルメロースカルシウム、ステアリン酸カルシウム、沈降炭酸カルシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース	1錠中： ペミロラストカリウム10mg (添加物) カルメロースカルシウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸カルシウム、沈降炭酸カルシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース	
性 状	微黄白色～帯黄白色の片面1/2割線入り素錠	帯黄白色の片面1/2割線入り素錠	
識別コード(PTP)	035 5mg	036 10mg	
外形(サイズ)	表(直径mm)	6.0	6.5
	裏(重量mg)	90	90
	断面(厚さmm)	2.4	2.1

【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

- 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。
- 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。
- 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。
- 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。

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、痒疹、蕁麻疹、浮腫(顔面、四肢等)、湿疹、顔面潮紅等
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ので、副作用があらわれた場合は減量(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

- 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]
- 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

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報告されている)

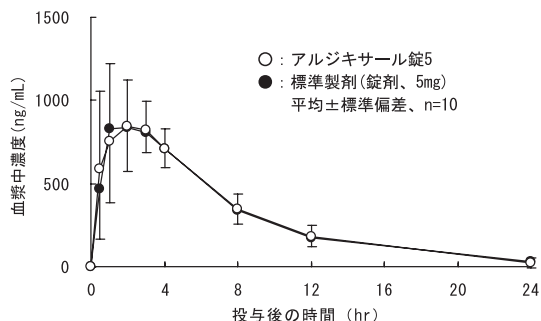


【薬物動態】

1 生物学的同等性試験¹⁾

●アルジキサル錠5

アルジキサル錠5と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠(ペミロラストカリウムとして10mg)健康成人男子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。



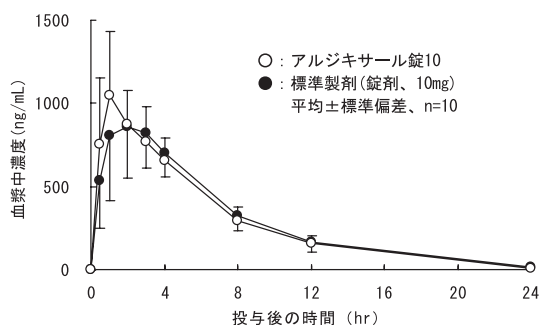
薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=10)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
アルジキサル錠5	10	7295±1845	1028.7±340.0	2.1±1.2	4.36±0.90
標準製剤(錠剤, 5mg)	10	7199±1819	997.4±234.3	1.9±1.1	4.50±0.94

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。

●アルジキサル錠10

アルジキサル錠10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。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=10)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
アルジキサル錠10	10	6902±1337	1159.2±297.2	1.8±1.2	3.84±0.62
標準製剤(錠剤, 10mg)	10	6996±1144	1065.2±218.9	2.1±1.0	4.06±0.66

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 溶出性²⁾

本剤の溶出性は、日本薬局方に定められた規格に適合していることが確認されている。

※【薬効薬理】³⁾

ペミロラストカリウムは、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。

【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

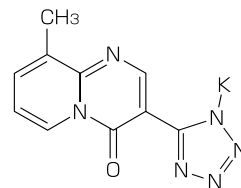
分子式：C₁₀H₇KN₆O

分子量：266.30

※融点：約322℃(分解)

※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。

※構造式：



【取扱い上の注意】⁴⁾

安定性試験結果の概要

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、アルジキサル錠5及びアルジキサル錠10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。

【包装】

- アルジキサル錠5
PTP包装：100錠(10錠×10)
- アルジキサル錠10
PTP包装：100錠(10錠×10)

【主要文献】

- 1) テバ製薬㈱社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) テバ製薬㈱社内資料(溶出試験)
- ※3) 第十六改正日本薬局方解説書
- 4) テバ製薬㈱社内資料(安定性試験)

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。
 テバ製薬株式会社 DIセンター
 〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
 TEL 0120-923-093 FAX 052-459-2853
 受付時間 9:00~17:00(土・日・祝日を除く)

※※製造販売元

テバ製薬株式会社

名古屋市中村区太閤一丁目24番11号