

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018(2019年更新版)に準拠して作成

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”

剤 形	水性点眼剤
製 剤 の 規 制 区 分	該当しない
規 格 ・ 含 量	1mL 中、日局ペミロラストカリウム 1mg
一 般 名	和名：ペミロラストカリウム (JAN) 洋名：Pemirolast Potassium (JAN)
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬 価 基 準 収 載 ・ 販 売 開 始 年 月 日	製造販売承認年月日：2017年 2月 1日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2017年12月 8日（販売名変更による） 販売開始年月日：2004年 7月 9日
製 造 販 売（ 輸 入 ） ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販 売 元：日東メディック株式会社
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	
問 い 合 わ せ 窓 口	日東メディック株式会社 おくすり相談窓口 TEL：03-3523-0345 FAX：03-6264-4086 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nittomedic.co.jp/info/">https://www.nittomedic.co.jp/info/</a>

本 IF は 2023 年 6 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

## 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

## 4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	13
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	13
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	13
3. 製品の製剤学的特性	1		
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	14
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	14
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	14
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	14
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	14
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	15
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	15
5. 化学名(命名法)又は本質	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 過量投与	15
		11. 適用上の注意	16
III. 有効成分に関する項目	3	12. その他の注意	16
1. 物理化学的性質	3		
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	IX. 非臨床試験に関する項目	17
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 薬理試験	17
		2. 毒性試験	17
IV. 製剤に関する項目	4		
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	18
2. 製剤の組成	4	1. 規制区分	18
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	2. 有効期間	18
4. 力価	4	3. 包装状態での貯法	18
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	4. 取扱い上の注意	18
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	5. 患者向け資材	18
7. 調製法及び溶解後の安定性	6	6. 同一成分・同効薬	18
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	7. 国際誕生年月日	18
9. 溶出性	6	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	18
10. 容器・包装	6	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	18
11. 別途提供される資材類	6	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
12. その他	6	11. 再審査期間	19
		12. 投薬期間制限に関する情報	19
V. 治療に関する項目	7	13. 各種コード	19
1. 効能又は効果	7	14. 保険給付上の注意	19
2. 効能又は効果に関連する注意	7		
3. 用法及び用量	7	XI. 文献	20
4. 用法及び用量に関連する注意	7	1. 引用文献	20
5. 臨床成績	8	2. その他の参考文献	20
VI. 薬効薬理に関する項目	10	XII. 参考資料	21
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10	1. 主な外国での発売状況	21
2. 薬理作用	10	2. 海外における臨床支援情報	21
VII. 薬物動態に関する項目	11	XIII. 備考	22
1. 血中濃度の推移	11	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	22
2. 薬物速度論的パラメータ	11	2. その他の関連資料	22
3. 母集団(ポピュレーション)解析	11		
4. 吸収	11		
5. 分布	12		
6. 代謝	12		
7. 排泄	13		
8. トランスポーターに関する情報	13		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

本剤は、後発医薬品として医薬発第 481 号(平成 11 年 4 月 8 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2004 年 2 月に承認を取得、2004 年 7 月に「アラジオフ点眼液 0.1%」として薬価収載した。その後、2017 年 2 月に販売名変更の承認を取得、2017 年 12 月に『ペミロラスト K 点眼液 0.1%「杏林」』として薬価収載された。

## 2. 製品の治療学的特性

- 本剤は抗アレルギー点眼剤であり、アレルギー性結膜炎、春季カタルの効能又は効果を有している。  
(「V. 1. 効能又は効果」の項参照)
- 副作用として、眼瞼炎、眼刺激、結膜充血、眼脂、そう痒感、結膜炎がある。  
(「VIII. 8. (2)その他の副作用」の項参照)

## 3. 製品の製剤学的特性

特になし

## 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

## 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

- (1) 承認条件  
該当しない
- (2) 流通・使用上の制限事項  
該当しない

## 6. RMP の概要

該当しない

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

(1) 和名

ペミロラスト K 点眼液 0.1% 「杏林」

(2) 洋名

PEMIROLAST K Ophthalmic Solution 0.1% “KYORIN”

(3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

### 2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

ペミロラストカリウム (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

Pemirolast Potassium (JAN)

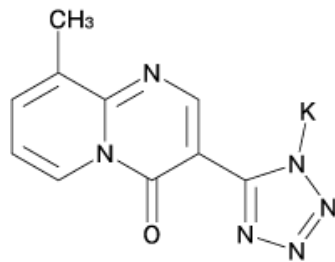
Pemirolast (INN)

(3) ステム

抗ヒスタミン薬として作用しない抗喘息薬又は抗アレルギー薬：-ast

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>10</sub>H<sub>7</sub>KN<sub>6</sub>O

分子量：266.30

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

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

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

淡黄色の結晶性の粉末である。  
においはなく、味は苦い。<sup>1)</sup>

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 322℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

● 確認試験法

日本薬局方「ペミロラストカリウム」の確認試験による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
- (3) カリウム塩の定性反応(1)

● 定量法

日本薬局方「ペミロラストカリウム」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

(1) 剤形の区別

点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

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	0.7～0.9（生理食塩液に対する比）

(3) 識別コード

PH012

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

有効成分（1mL 中）	日局ペミロラストカリウム 1mg
添加剤	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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 4. 力価

該当しない

### 5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし



## 6. 製剤の各種条件下における安定性

### 1) 加速試験<sup>2)</sup>

[保存条件]

40°C±1°C、75%RH±5%RH

[試験検体]

最終包装品：ポリプロピレン製容器、ポリエチレン製中栓及びポリプロピレン製キャップ、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	無色澄明の水溶性点眼剤
pH	7.5～8.5
浸透圧比	0.7～0.9（生理食塩液に対する比）
不溶性異物検査	日局製剤総則、点眼剤の項により試験を行うとき、これに適合する。
不溶性微粒子試験	日局一般試験法、点眼剤の不溶性微粒子試験法により試験を行うとき、これに適合する。
無菌試験	日局一般試験法、無菌試験法のメンブランフィルター法により試験を行うとき、これに適合する。
定量法	含量：93～107%

[結果]

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
pH	7.97	7.90	7.93	7.93
浸透圧比	0.80	0.79	0.81	0.80
不溶性異物検査	適	適	適	適
不溶性微粒子試験	適	適	適	適
無菌試験	(-)			(-)
定量法	99.1%	99.0%	98.0%	98.0%

(-)：菌の発育を認めず ※1ロット n=3 の3ロットの平均値

### 2) 長期保存試験<sup>3)</sup>

[保存条件]

25°C±2°C、60%RH±5%RH

[試験検体]

最終包装品：ポリプロピレン製容器、ポリエチレン製中栓及びポリプロピレン製キャップ、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	無色澄明の液
確認試験	波長 255～259nm 及び 355～359nm に吸収の極大を示す。
pH	7.5～8.5
浸透圧比	0.7～0.9（生理食塩液に対する比）
純度試験	類縁物質 個々：0.3%以下、合計：1.0%以下
不溶性異物	日局一般試験法、点眼剤の不溶性異物検査法により試験を行うとき、これに適合する。（澄明で、たやすく検出される不溶性異物を認めない。）
不溶性微粒子	日局一般試験法、点眼剤の不溶性微粒子試験法により試験を行うとき、これに適合する。（本剤 1mL 中の個数に換算するとき、300 μm 以上の不溶性微粒子が 1 個以下である。）
無菌	日局一般試験法、無菌試験法のメンブランフィルター法により試験を行うとき、これに適合する。（微生物の増殖が観察されない。）
定量法	含量：95.0～105.0%

[結果]

試験項目	開始時	0.5年後	1年後	2年後	3年後
性状	適	適	適	適	適
確認試験	適				適
pH <sup>*</sup>	7.83	7.88	7.88	7.88	7.84
浸透圧比 <sup>*</sup>	0.80				0.81
純度試験	適	適	適	適	適
不溶性異物	適				適
不溶性微粒子	適				適
無菌	(-)				(-)
定量法(含量) <sup>**</sup>	98.6%	98.6%	99.0%	98.9%	99.4%

(-) : 微生物の増殖が観察されなかった

※1ロット n=1 の3ロットの平均値

※※1ロット n=3 の3ロットの平均値

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 9. 溶出性

該当しない

## 10. 容器・包装

### (1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

### (2) 包装

プラスチック点眼容器 5mL×10本（投薬袋10枚同梱）

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

本体：ポリプロピレン(PP)

中栓：ポリエチレン(PE)

キャップ：ポリプロピレン(PP)

シュリンクラベル：ポリエチレンテレフタレート(PET)

## 11. 別途提供される資材類

該当しない

## 12. その他

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 4.効能又は効果

アレルギー性結膜炎、春季カタル

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

#### 6.用法及び用量

通常、1回1滴、1日2回（朝、夕）点眼する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

## 5. 臨床成績

### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

### (4) 検証的試験

#### 1) 有効性検証試験

#### 17.臨床成績

##### 17.1.1 国内第Ⅲ相試験（クロモグリク酸ナトリウム対照比較試験）

アレルギー性結膜炎患者 205 例（解析対象 194 例）及び春季カタル患者 59 例（解析対象 54 例）を対象とした無作為化二重盲検比較試験において、ペミロラストカリウム点眼液 0.1%又は 2%クロモグリク酸ナトリウム点眼液を 1 回 1～2 滴、1 日 4 回<sup>注)</sup>、原則としてアレルギー性結膜炎は 2 週間、春季カタルは 4 週間点眼した結果、全般改善度は表 17-1 の通りであり、両疾患とも両群間に有意差は認められなかった。

副作用はペミロラストカリウム点眼液群では 123 例中 2 例（2%）に認められ、結膜浮腫及び眼刺激が各 1 件であった<sup>4)</sup>。

表 17-1 全般改善度（良好以上）

	ペミロラストカリウム点眼液 0.1%	2%クロモグリク酸ナトリウム点眼液
アレルギー性結膜炎	67%	68%
春季カタル	60%	61%

注)本剤が承認されている用法・用量は、通常、1 回 1 滴、1 日 2 回（朝、夕）点眼である。

##### 17.1.2 国内第Ⅲ相試験（至適点眼回数の検討）

アレルギー性結膜炎患者 81 例（解析対象 74 例）及び春季カタル患者 9 例（解析対象 8 例）を対象に、ペミロラストカリウム点眼液 0.1%を 1 回 1 滴、1 日 2 回又は 1 日 4 回<sup>注)</sup>、原則としてアレルギー性結膜炎は 2 週間、春季カタルは 4 週間点眼した結果、全般改善度は表 17-2 の通りであり、両疾患とも 1 日 2 回群と 1 日 4 回群の間に有意差は認められなかった。

副作用は 1 日 2 回群では 39 例中 2 例（5%）に認められ、眼瞼発赤、違和感及び刺激感が各 1 件であり、1 日 4 回群では 43 例中 2 例（5%）に認められ、眼瞼縁炎及び刺激感が各 1 件であった<sup>6)</sup>。

表 17-2 全般改善度（良好以上）

	1 日 2 回	1 日 4 回
アレルギー性結膜炎	68%	71%
春季カタル	67%	50%

注)本剤が承認されている用法・用量は、通常、1 回 1 滴、1 日 2 回（朝、夕）点眼である。

##### 17.1.3 国内第Ⅲ相試験（追加試験）

アレルギー性結膜炎患者 85 例（解析対象 69 例）及び春季カタル患者 35 例（解析対象 33 例）を対象に、ペミロラストカリウム点眼液 0.1%を 1 回 1 滴、1 日 2 回、原則としてアレルギー性結膜炎は 2 週間、春季カタルは 4 週間点眼した結果、全般改善度は表 17-3 の通りであった。

副作用は 120 例中 2 例（2%）に認められ、眼脂の増加、眼瞼の粘着感、異物感及び充血が各 1 件であった<sup>6)</sup>。

表 17-3 全般改善度（良好以上）

アレルギー性結膜炎	76%
春季カタル	67%

注)本剤が承認されている用法・用量は、通常、1 回 1 滴、1 日 2 回（朝、夕）点眼である。

#### 2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

クロモグリク酸ナトリウム、ケトチフェンフマル酸塩、レボカバスチン塩酸塩、アシタザノラスト水和物、イブジラスト、オロパタジン塩酸塩、トラニラスト

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

ラット腹腔肥満細胞において膜のリン脂質代謝阻害によりケミカルメディエーターの遊離を抑制する<sup>7)</sup> (*in vitro*)。

また、ヒト肺、ヒト末梢白血球及びモルモット肺からの抗原あるいは抗 IgE 抗体刺激によるヒスタミン、SRS-A などの遊離を抑制する<sup>8)</sup> (*in vitro*)。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 実験的アレルギー性結膜炎抑制作用

ラットを用いた I 型アレルギー反応による結膜の血管透過性亢進に対して静脈内投与及び点眼で強い抑制作用を示した<sup>9)</sup>。

##### 18.3 作用持続性

ウサギ受動感作アレルギー性結膜炎に対する抑制作用を経時的に検討した結果、2 時間後で約 60% の最高抑制率を示した後、40~50% 程度の有意な抑制作用を 12 時間後まで維持した<sup>10)</sup>。

##### 18.4 生物学的同等性試験

###### 18.4.1 ラットの実験的結膜炎モデルに対する治療効果

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」、アレギサル点眼液 0.1% を 10  $\mu$ 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」及びアレギサル点眼液 0.1% 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、生物学的な同等性が確認された<sup>11)</sup>。

表 18-1 抗原惹起による漏出色素濃度の抑制率

被験物質群	色素濃度 ( $\mu$ g/mL)		抑制率 <sup>注1)</sup> (%)
	右眼 (対照眼)	左眼	
対照	30.97 $\pm$ 2.19	30.39 $\pm$ 2.59	1.86 $\pm$ 4.94
ペミロラスト K 点眼液 0.1% 「杏林」基剤	31.22 $\pm$ 1.53	29.70 $\pm$ 2.54	5.00 $\pm$ 4.69
ペミロラスト K 点眼液 0.1% 「杏林」	31.17 $\pm$ 2.04	7.72 $\pm$ 1.39	75.27 $\pm$ 3.86 <sup>注2 注3)</sup>
アレギサル点眼液 0.1%	31.60 $\pm$ 1.85	7.47 $\pm$ 0.89	76.35 $\pm$ 2.73 <sup>注2 注3)</sup>

(平均値 $\pm$ 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  $\times$  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

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移

- (1) 治療上有効な血中濃度  
該当資料なし
- (2) 臨床試験で確認された血中濃度  
該当資料なし
- (3) 中毒域  
該当資料なし
- (4) 食事・併用薬の影響  
該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法  
該当資料なし
- (2) 吸収速度定数  
該当資料なし
- (3) 消失速度定数  
該当資料なし
- (4) クリアランス  
該当資料なし
- (5) 分布容積  
該当資料なし
- (6) その他  
該当資料なし

### 3. 母集団（ポピュレーション）解析

- (1) 解析方法  
該当資料なし
- (2) パラメータ変動要因  
該当資料なし

### 4. 吸収

該当資料なし

## 5. 分布

### (1) 血液—脳関門通過性

該当資料なし

### (2) 血液—胎盤関門通過性

該当資料なし

### (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

### (4) 髄液への移行性

該当資料なし

### (5) その他の組織への移行性

#### 16.3 分布

0.1%ペミロラストカリウム点眼液 50 $\mu$ L をウサギに点眼したときの眼組織中のペミロラスト濃度は、結膜、角膜及び前部強膜等の外眼部では内眼部に比べて高い値を示した。角膜及び前部強膜ではペミロラスト濃度は経時的に低下したが、結膜では滞留性があり、点眼後 24 時間でも十分薬効を期待できる濃度を維持した。房水、虹彩・毛様体及び網脈絡膜では点眼後 15~30 分に最大となり、8 時間以降では痕跡程度となった。水晶体、硝子体への移行はわずかであった。血漿では、点眼後 15 分にわずかに検出されたが、4 時間では検出限界 (1.0ng/mL) 以下となった<sup>12)</sup>。

#### 生物学的同等性試験

#### 16.8 その他

##### 16.8.1 ウサギの眼組織内移行試験

ウサギの右眼にはペミロラスト K 点眼液 0.1%「杏林」、左眼にはアレギサル点眼液 0.1%をそれぞれ 50 $\mu$ L 点眼した時の結膜中のペミロラスト濃度は両製剤とも 1 時間で最高値を示し、2 時間以降は減少したものの、8 時間まで比較的高い濃度を維持し、24 時間においても結膜中への滞留が認められた<sup>13)</sup>。

表 16-1 ウサギ結膜中ペミロラスト濃度推移

群	結膜中ペミロラスト濃度 (ng/g wet tissue)				
	1 時間	2 時間	4 時間	8 時間	24 時間
ペミロラスト K 点眼液 0.1%「杏林」	1776.5 $\pm$ 1335.1	304.2 $\pm$ 206.3	149.3 $\pm$ 253.6	200.5 $\pm$ 384.9	79.5 $\pm$ 99.4
アレギサル点眼液 0.1%	1708.0 $\pm$ 1189.2	381.6 $\pm$ 189.8	197.0 $\pm$ 244.4	75.6 $\pm$ 152.0	98.8 $\pm$ 137.5

(平均値 $\pm$ 標準偏差、n=10)

### (6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし



(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

設定されていない

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### (1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

#### (5) 妊婦

##### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。

#### (6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

**9.7 小児等**

低出生体重児、新生児、乳児を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

設定されていない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

**11.副作用**

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

**11.2 その他の副作用**

	1%未満	頻度不明
眼	眼瞼炎、眼刺激、結膜充血、眼脂	そう痒感、結膜炎

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

## 11. 適用上の注意

### 14.適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・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こと。
- ・点眼したときに液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。
- ・患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験  
「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照
- (2) 安全性薬理試験  
該当資料なし
- (3) その他の薬理試験  
該当資料なし

### 2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験  
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験  
該当資料なし
- (3) 遺伝毒性試験  
該当資料なし
- (4) がん原性試験  
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験  
眼粘膜刺激性試験<sup>14)</sup>  
ペミロラスト K 点眼液 0.1%「杏林」投与群、ペミロラスト K 点眼液 0.1%「杏林」基剤投与群、標準製剤（点眼剤、0.1%）投与群の 3 群を設け、各群に日本白色種雄性ウサギ 6 匹ずつを割り付けた。投与期間は 1 日間とし、右眼結膜嚢内に 50  $\mu$ L の投与物質を 30 分毎に 10 回点眼した。左眼には生理食塩液を同様に点眼した。投与開始前、最終投与終了後 1、3、24、48、72、96 及び 168 時間に角膜、虹彩、結膜について生理食塩液を点眼した対照眼と比較し、肉眼的に観察した。障害の程度を Draize 法の基準により判定・評価し、投与物質の刺激性を評価した。  
その結果、いずれの群においても観察期間を通じて刺激性反応は全く認められず、いずれも無刺激物と判定された。各群の生理食塩液投与眼にも変化はみられなかった。  
以上より、ペミロラスト K 点眼液 0.1%「杏林」は標準製剤（点眼剤、0.1%）と同様にウサギ眼粘膜に対する刺激性がないものと判定された。
- (7) その他の特殊毒性  
該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：ペミロラストK点眼液 0.1%「杏林」 該当しない  
有効成分：ペミロラストカリウム 該当しない

### 2. 有効期間

有効期間：3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし  
くすりのしおり：あり

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレギサル点眼液 0.1%、ペミラストン点眼液 0.1%  
同 効 薬：クロモグリク酸ナトリウム、ケトチフェンフマル酸塩、レボカバスチン塩酸塩、アシタザノラスト水和物、イブジラスト、オロパタジン塩酸塩、トラニラスト

### 7. 国際誕生年月日

1991年1月18日

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
(旧販売名 <sup>注</sup> ) アラジオフ点眼液 0.1%	2004年 2月 25日	21600AMZ00327000	2004年 7月 9日	2004年 7月 9日
ペミロラストK点眼液 0.1%「杏林」	2017年 2月 1日	22900AMX00088000	2017年12月 8日	

注：経過措置期限：2018年 9月 30日

### 9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

#### 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

#### 11. 再審査期間

該当しない

#### 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

#### 13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ペミロラストK点眼 液0.1%「杏林」	1319735Q1080	1319735Q1080	116238703	621623804

#### 14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 第十八改正日本薬局方解説書, C -5275 (廣川書店 2021)
- 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」の安定性に関する資料 (加速試験)
- 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」の安定性に関する資料 (長期保存試験)
- 4) 北野周作他：日本眼科紀要 1991 ; 42 : 532-544
- 5) 北野周作他：日本眼科紀要 1991 ; 42 : 201-211
- 6) 北野周作他：あたらしい眼科 1993 ; 10 : 323-332
- 7) Fujimiya, H. et al. : Int. Arch. Allergy Appl. Immunol. 1991 ; 96 : 62-67
- 8) 川島敏男他：アレルギー 1988 ; 37 : 438-447
- 9) 壬生寛之他：日本眼科紀要 1990 ; 41 : 867-870
- 10) 澤健治郎他：あたらしい眼科 1995 ; 12 : 1565-1567
- 11) 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)
- 12) 山口秀文他：日本眼科紀要 1990 ; 41 : 2095-2100
- 13) 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)
- 14) 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」の眼粘膜刺激性試験に関する資料

### 2. その他の参考文献

該当資料なし



## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

#### (1) 粉碎

該当しない

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

### 2. その他の関連資料

該当資料なし