2025 年 4 月作成(第 1 版)

貯　　法：室温保存
有効期間：3 年

日本標準商品分類番号
87449

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
アレギサール錠 5mg
アレギサール錠 10mg
日本薬局方　シロップ用ペミロラストカリウム
アレギサールドライシロップ 0.5%

ALEGYSAL Tablets, Dry Syrup

	錠 5mg	錠 10mg	ドライシロップ 0.5%
承認番号	20600AMZ01417	20300AMZ00034	22000AMX02065
販売開始	1994 年 12 月	1991 年 3 月	1992 年 8 月

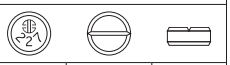
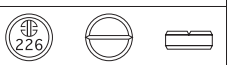
2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)
2.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性[9.5 参照]
2.2 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販　売　名	有効成分	添　加　剤
アレギサール錠 5mg	1 錠中 日本薬局方　ペミロラストカリウム 5mg	乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、セルロース、無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム
アレギサール錠 10mg	1 錠中 日本薬局方　ペミロラストカリウム 10mg	
アレギサールドライシロップ 0.5%	1g 中 日本薬局方　ペミロラストカリウム 5mg	白糖、クエン酸ナトリウム水和物

3.2 製剤の性状

販　売　名	性　　状	外形・大きさ		
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
		識別コード		
アレギサール錠 5mg	微黄白色～帯黄白色の割線入り素錠で、わずかに苦い			
		6.0	約 2.4	90
		227		
アレギサール錠 10mg	帯黄白色の割線入り素錠で、わずかに苦い			
		6.5	約 2.3	90
		226		

販　売　名	性　　状
アレギサールドライシロップ 0.5%	白色～微黄白色の粒状シロップで、甘い

4. 効能・効果

○ 気管支喘息
○ アレルギー性鼻炎

6. 用法・用量

〈錠〉

・気管支喘息

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

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。

〈ドライシロップ〉

・気管支喘息

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

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)

7. 用法・用量に関連する注意

高齢者への本剤の投与により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。[9.8 参照]

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 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。

8.2 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。

8.3 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。

8.4 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。

〈気管支喘息〉

8.5 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 長期ステロイド療法を受けている患者

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。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。[2.1 参照]

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。

9.7 小児等

低出生体重児、新生児を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。[7. 参照]

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。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症		発疹、そう痒、蕁麻疹、浮腫(顔面、四肢等)、湿疹、顔面潮紅
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
肝臓	ALT 上昇、AST 上昇	γ-GTP 上昇、Al-P 上昇
腎臓		蛋白尿、BUN 上昇
泌尿器		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：発現頻度は、錠・ドライシロップに関する使用成績調査を含む

14. 適用上の注意

14.1 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ある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

〈錠〉

16.1.1 成人

健康成人 3 名にそれぞれペミロラストカリウムとして 5 及び 10mg/body を空腹時単回経口投与したときの、血漿中濃度パラメータを示す[1]。

投与量 (mg)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	$t_{1/2}$ (h)	AUC (ng・h/mL)
5	416	1.0	4.31	2,279
10	723	1.7	4.74	5,020

〈ドライシロップ〉

16.1.2 小児

気管支喘息児 6 名(7～13 歳)にペミロラストカリウムとして 0.2mg/kg を単回経口投与したときの、血漿中濃度パラメータを示す[2]。

投与量 (mg/kg)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	$t_{1/2}$ (h)	AUC (ng・h/mL)
0.2	682	1.5	4.12	5,278

〈製剤共通〉

16.1.3 生物学的同等性

健康成人 12 名を対象に、ペミロラストカリウム 5mg 錠、10mg 錠及びドライシロップをペミロラストカリウムとして 10mg 単回経口投与し生物学的同等性試験を行った結果、3 製剤間の生物学的利用性には差がないと判断された[3]。

16.4 代謝

〈錠〉

16.4.1 成人

健康成人 3 名にペミロラストカリウムとして 10mg を空腹時単回経口投与し、尿中代謝物について検討したところ、大部分はグルクロン酸抱合体であった[4]。

〈ドライシロップ〉

16.4.2 小児

気管支喘息児 3 名にペミロラストカリウムとして 0.2mg/kg を単回経口投与し、尿中代謝物について検討したところ、大部分はグルクロン酸抱合体であった[2]。

16.5 排泄

〈錠〉

16.5.1 成人

健康成人 3 名にペミロラストカリウムとして 10mg を空腹時単回経口投与し、尿中排泄は、投与後 12 時間までに 71.6%、投与後 24 時間までに 83.5%であった[4]。

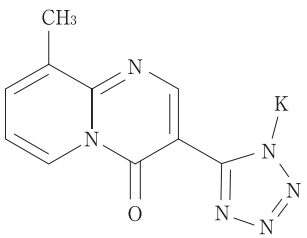
〈ドライシロップ〉
16.5.2 小児
気管支喘息児 3 名にペミロラストカリウムとして 0.2mg/kg を単回経口投与し、尿中排泄は、投与後 12 時間までに 71.3%であった[2)]。

17. 臨床成績
17.1 有効性及び安全性に関する試験
二重盲検比較試験を含む臨床試験における改善率は次のとおりであった[5)-22)]。

疾患名 ＼ 改善率(%)		改善以上
気管支喘息	成人	48.0(159 例/331 例)
	小児	64.5(227 例/352 例)
アレルギー性鼻炎	成人	51.1(116 例/227 例)
	小児	59.7(40 例/67 例)

18. 薬効薬理
18.1 作用機序
マスト細胞のイノシトールリン脂質代謝を阻害することにより、ケミカルメディエーターの遊離に重要な要素である細胞外 Ca^{2+} の流入と細胞内 Ca^{2+} の遊離を強く抑制する。また、同時にアラキドン酸遊離も阻害する。更にホスホジエステラーゼ阻害に基づく c-AMP 増加作用の関与も示唆されている[23)-25)]。
18.2 ケミカルメディエーターの遊離抑制作用(*in vitro*)
ヒト肺組織、鼻粘膜擦過片及び末梢白血球、ラット腹腔浸出細胞、ラット及びモルモット肺組織からのケミカルメディエーター(ヒスタミン、LTB_4、LTC_4、LTD_4、PGD_2、TXB_2、PAF 等)の遊離を濃度依存的に抑制した[23)、26)-29)]。
18.3 Ⅰ型アレルギーに対する作用
ラット及びモルモットの受身皮膚アナフィラキシー(PCA)反応や実験的喘息、実験的アレルギー性鼻炎を用量依存的に抑制した[28)、30)、31)]。
18.4 好酸球機能抑制作用(*in vitro*)
ヒト好酸球遊走並びにヒト好酸球からの LTC_4、ECP、EPX の遊離を濃度依存的に抑制した[32)-34)]。

19. 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-α]pyrimidin-3-yl)-1*H*-tetrazol-1-ide
分子式：$C_{10}H_7KN_6O$
分子量：266.30
構造式：



性　状：・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)。

20. 取扱い上の注意
外箱開封後は遮光して保存すること。

22. 包装
〈アレギサール錠 5mg〉
100 錠[10 錠(PTP)×10]
500 錠[10 錠(PTP)×50]
〈アレギサール錠 10mg〉
100 錠[10 錠(PTP)×10]
500 錠[10 錠(PTP)×50]
〈アレギサールドライシロップ 0.5%〉
200 包[0.5g×200]
100g[瓶、乾燥剤入り]
500g[瓶、乾燥剤入り]

23. 主要文献

1)金原美穂子　他：薬理と治療 1990；18(3)：1035-1040(L20240141)
2)黒沼忠由樹　他：診療と新薬 1990；27(10)：1961-1965(L20240142)
3)西野晴夫　他：薬理と治療 1992；20(3)：869-877(L20240144)
4)金原美穂子　他：薬理と治療 1990；18(3)：1041-1047(L20240143)
5)吉田　尚　他：薬理と治療 1989；17(3)：883-905(L20240145)
6)吉田　尚　他：薬理と治療 1989；17(3)：907-931(L20240146)
7)吉田　尚　他：薬理と治療 1989；17(3)：933-981(L20240147)
8)岡安大仁　他：新薬と臨牀 1989；38(7)：1043-1056(L20240148)
9)佐竹辰夫　他：新薬と臨牀 1989；38(7)：1058-1068(L20240149)
10)山本正彦　他：新薬と臨牀 1989；38(7)：1070-1082(L20240150)
11)馬場　實　他：Progress in Medicine 1990；10(9)：2229-2235(L20240151)
12)根本紀夫　他：小児科臨床 1990；43(11)：2467-2475(L20240152)
13)三河春樹　他：基礎と臨床 1990；24(15)：8093-8100(L20240153)
14)馬場　實　他：小児科臨床 1991；44(4)：1071-1093(L20240154)
15)馬場　實　他：小児科臨床 1990；43(11)：2477-2484(L20240155)
16)三河春樹　他：基礎と臨床 1990；24(15)：8085-8092(L20240156)
17)市村登寿　他：小児科臨床 1991；44(2)：401-407(L20240157)
18)奥田　稔　他：耳鼻咽喉科展望 1993；36(2)：213-237(L20240158)
19)奥田　稔　他：耳鼻咽喉科展望 1993；36(3)：377-401(L20240159)
20)朝倉光司　他：耳鼻と臨床 1993；39(3)：469-479(L20240160)
21)石川　哮　他：耳鼻と臨床 1993；39(3)：480-493(L20240161)
22)馬場駿吉　他：耳鼻咽喉科展望 1995；38(5)：657-676(L20240162)
23)Y. Yanagihara et al.：Jpn. J. Pharmacol. 1988；48(1)：103-112(L20240165)
24)H. Fujimiya et al.：Int. Arch. Allergy Appl. Immunol. 1991；96：62-67(L20240173)

25)H. Fujimiya et al.：アレルギー 1994；43：142-151（L20240174）
26)川島敏男　他：アレルギー 1988；37(7)：438-447（L20240163）
27)大塚博邦　他：薬理と治療 1992；20(10)：4081-4087(L20240164)
28)Y. Yanagihara et al.：Jpn. J. Pharmacol. 1989；51(1)：83-92(L20240166)
29)T. Kawashima et al.：Pharmacometrics 1993；46(4)：265-271(L20240167)
30)Y. Yanagihara et al.：Jpn. J. Pharmacol. 1988；48(1)：91-101(L20240168)
31)鈴木義裕　他：応用薬理 1992；44(6)：675-678（L20240169）
32)松井秀樹：炎症 1992；12(5)：467-473（L20240170）
33)T. Kawashima et al.：Int. Arch. Allergy Immunol. 1994；103：405-409(L20240171)
34)N. Yamashita et al.：Allergology International 1999；48：37-42(L20240172)

24. 文献請求先及び問い合わせ先

ニプロ株式会社　医薬品情報室
〒566-8510 大阪府摂津市千里丘新町 3 番 26 号
TEL 0120-226-898
FAX 050-3535-8939

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

ニプロ株式会社
大阪府摂津市千里丘新町3番26号