

貯法：室温保存  
有効期間：3年

アレルギー性結膜炎治療剤

日本薬局方 トラニラスト点眼液

# トラニラスト点眼液0.5% [FFP]

## TRANILAST Ophthalmic Solution 0.5% [FFP]

承認番号	22300AMX00863000
販売開始	2011年11月

### 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

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	トラニラスト点眼液0.5% [FFP]
有効成分	日局 トラニラスト 5.0mg/mL
添加剤	ホウ酸、ホウ砂、ポビドン、ポリソルベート80、グリセリン、エドト酸ナトリウム水和物、水酸化ナトリウム、ベンザルコニウム塩化物

#### 3.2 製剤の性状

販売名	トラニラスト点眼液0.5% [FFP]
性状	微黄色澄明、無菌水性点眼液
pH	7.0～8.0
浸透圧比 <sup>注1)</sup>	0.9～1.1

注1) 生理食塩液に対する比

### 4. 効能又は効果

アレルギー性結膜炎

### 6. 用法及び用量

通常、1回1～2滴を1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

### 8. 重要な基本的注意

重症例には本剤単独では十分な効果が得られないので、他の適切な治療法への切替あるいはそれとの併用を考慮し、本剤のみを漫然と長期に使用しないこと。

### 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### 9.5 妊婦

##### 9.5.1 妊婦（特に約3カ月以内）又は妊娠している可能性のある女性

投与しないことが望ましい。動物実験（マウス）で、本剤の経口大量投与により、骨格異常例の増加が認められている。

#### 9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児又は6歳未満の幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

### 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

	0.1～1%未満	頻度不明
過敏症	眼瞼皮膚炎、眼瞼炎	接触性皮膚炎（眼周囲）
眼	刺激感	結膜充血、眼瞼腫脹、そう痒感

### 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。
- 患眼を開眼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉眼して涙嚢部を圧迫させた後、開眼すること。
- 眼周囲等に流出した液は拭き取ること。

- 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。
- 本剤を冷蔵庫等で保存すると、結晶が析出することがあるので避けること。[20.1 参照]
- 遮光して保存すること。[20.2 参照]

### 16. 薬物動態

#### 16.8 その他

##### 16.8.1 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

(1) 抗卵白アルブミンラット血清により受動感作させたラット実験的アレルギー性結膜炎モデルを用い、結膜部位の漏出色素量を比較した。トラニラスト点眼液0.5% [FFP] あるいはリザベン点眼液0.5%はアレルギー反応惹起20分前および10分前に点眼し、惹起30分後につき、結膜中漏出色素量について比較検討を行ったところ両製剤は有意な抑制を示し、また90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。

	色素漏出量 ( $\mu\text{g}/\text{site}$ )
トラニラスト点眼液0.5% [FFP]	14.77 $\pm$ 0.90
リザベン点眼液0.5%	16.08 $\pm$ 1.13
基剤	20.95 $\pm$ 1.33

(Mean $\pm$ S.E., n=10)

(2) 卵白アルブミンにより能動感作させたモルモットに対しアレルギー反応惹起15分前にトラニラスト点眼液0.5% [FFP] あるいはリザベン点眼液0.5%を点眼し結膜炎症をスコア化し評価した。反応惹起後30分におけるスコア値を用い統計解析を行った結果、両製剤は基剤群と比較して有意な結膜症状抑制作用を示し、また90%信頼区間法により生物学的同等性が確認された。

### 17. 臨床成績

#### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

##### 17.1.1 国内第III相二重盲検比較試験

I型アレルギーの関与が明らかなアレルギー性結膜炎の患者200例を対象にトラニラスト点眼液0.5%又はクロモグリク酸ナトリウム点眼液2%を1回1～2滴、1日4回朝、昼、夕方及び就寝前に4週間投与した。全般改善度を著明改善、中等度改善、軽度改善、不変、悪化の5段階にて評価した結果、中等度改善以上の改善率はトラニラスト点眼液群63.4%、クロモグリク酸ナトリウム点眼液群52.7%であり、同等性検定により同等であった。副作用の発現割合はトラニラスト点眼液群1.0% (1/98例) であり、しみるが1.0% (1/98例) であった<sup>2)</sup>。

### 18. 薬効薬理

#### 18.1 作用機序

抗原刺激による肥満細胞及び各種炎症細胞からのケミカルメディエーター（ヒスタミン、ロイコトリエン等）の遊離を抑制することにより、抗アレルギー作用を示す<sup>3) -11)</sup>（ラット、モルモット、*in vitro*）。

#### 18.2 アレルギー性結膜炎抑制作用

動物結膜炎モデルにおいて、血管透過性の亢進に対し、点眼投与で用量依存的な抑制作用を示す<sup>12)</sup>（ラット）。また、血管透過性の亢進及び結膜組織への炎症細胞の浸潤に対し、点眼投与で用量依存的な抑制作用を示す<sup>13)</sup>（モルモット）。

### 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：トラニラスト (Tranilast)

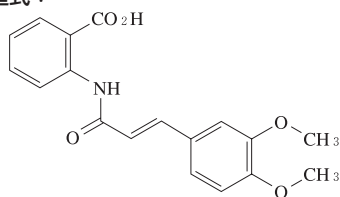
化学名：2- {[ (2E) -3- (3,4-Dimethoxyphenyl) prop-2-enoyl] amino} benzoic acid

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>17</sub>NO<sub>5</sub>

分子量：327.33

**性状：**淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。  
*N,N*-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、アセトニトリル、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けにくく、水にほとんど溶けない。  
光によって徐々に淡い黄褐色となる。  
結晶多形が認められる。

**化学構造式：**



**融点：**207～210℃

## 20. 取扱い上の注意

- 20.1 本剤を冷蔵庫等で保存すると、結晶が析出することがあるので避けること。[14.1 参照]
- 20.2 外箱開封後は遮光して保存すること。[14.1 参照]

## 22. 包装

5mL×10本

## 23. 主要文献

- 1) 共創未来ファーマ株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 三國郁夫ほか：臨床医薬. 1993；9(3)：669-683
- 3) 東洋ほか：Br. J. Pharmacol. 1976；58(4)：483-488
- 4) 坂野和英ほか：アレルギー. 1977；26(4)：385-391
- 5) 中沢政之ほか：日薬理誌. 1978；74(4)：473-481
- 6) 中沢政之ほか：日薬理誌. 1978；74(4)：483-490
- 7) 小松英忠ほか：基礎と臨床. 1979；13(1)：43-49
- 8) 小松英忠ほか：日薬理誌. 1983；82(1)：47-55
- 9) 堤直行ほか：応用薬理. 1983；25(6)：973-979
- 10) 堤直行ほか：応用薬理. 1987；33(4)：587-597
- 11) 伊東史顕ほか：基礎と臨床. 1993；27(1)：191-194
- 12) 芝崎泰平ほか：日本眼科紀要. 1992；43(12)：1419-1424
- 13) 伊東史顕ほか：日薬理誌. 1993；101(1)：27-32

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室  
〒155-8655 東京都世田谷区代沢5-2-1  
TEL 050-3383-3846

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

 **共創未来ファーマ株式会社**  
東京都品川区広町1-4-4