

※※2017年9月改訂(第10版)
※2014年4月改訂

貯 法：室温保存
使用期限：外箱、容器に記載あり(使用期間：3年6ヵ月)

日本標準商品分類番号

871319

承認番号	薬価収載	販売開始
21200AMZ00559	2000年11月	2000年11月
国際誕生	2000年9月	再審査結果 2010年3月

アレルギー性結膜炎治療剤<アシタザノラスト水和物>製剤

ゼペリン®点眼液0.1%

ZEPELIN®OPHTHALMIC SOLUTION 0.1%

〔組成・性状〕

販売名	ゼペリン点眼液0.1%
剤形	点眼剤
成分・含量 (1mL中)	アシタザノラスト水和物1.08mg(アシタザノラストとして1.0mg)を含有する。 添加物としてモノエタノールアミン、イプシロン-アミノカプロン酸、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、クロロブタノール、プロピレングリコール、ポリソルベート80、pH調節剤を含有する。
pH	4.5~6.0
浸透圧比	0.8~1.3(生理食塩液に対する比)
性状	無色澄明の無菌製剤

〔効能・効果〕

○アレルギー性結膜炎

〔用法・用量〕

1回1~2滴、1日4回(朝、昼、夕方及び就寝前)点眼する。

〔使用上の注意〕

1. 副作用

申請時における臨床試験において374例中9例(2.41%)に副作用が認められた。主な副作用として眼刺激8件(2.14%)、眼痛2件(0.53%)、流涙増加2件(0.53%)が認められた。(承認時における集計)

市販後の使用成績調査において副作用集計の対象となった3,078例中36例(1.17%)に副作用が認められた。主な副作用として眼刺激10件(0.32%)、眼瞼炎(眼瞼皮膚炎を含む)5件(0.16%)、眼痛4件(0.13%)、眼瞼浮腫4件(0.13%)、結膜充血3件(0.10%)が認められた。(再審査終了時における集計)

	頻度不明	0.1%~3%未満	0.1%未満
過敏症*	接触性皮膚炎		眼瞼皮膚炎、眼瞼炎
眼		眼刺激、眼痛、眼瞼浮腫	結膜浮腫、結膜充血、眼充血、角膜炎、流涙増加、眼そう痒症

*このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

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及び授乳中の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。[妊娠中及び授乳中の婦人へ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

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

4. 適用上の注意

- (1)投与経路 点眼用에만使用すること。
- (2)薬剤交付時 次のことを患者へ指導すること。
 - 1)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。
 - 2)点眼のとき、液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。
 - 3)他の点眼剤を併用する場合には、5分間以上の間隔をあけて点眼すること。

〔薬物動態〕

血中濃度

健常成人男子(6例)に0.01%、0.1%又は1.0%アシタザノラスト水和物点眼液を1回2滴、1日4回点眼する短期点眼試験及び1.0%アシタザノラスト水和物点眼液を1回2滴、1日4回7日間連続点眼する1週間点眼試験において、最終点眼30分後の血中アシタザノラスト濃度は検出限界(0.02 μ g/mL)以下であった¹⁾。

(注)本剤の承認された用法・用量は0.1%濃度、1回1~2滴、1日4回点眼である。

〔参考〕

家兎眼組織内移行

白色家兎に0.11%¹⁴C-アシタザノラスト水和物点眼液(無水物換算：0.1%)50 μ Lを1回点眼し、経時的に各眼組織内濃度を測定した結果、眼球結膜、眼瞼結膜及び眼瞼では投与5分後に、角膜では投与30分後に最高濃度に達した。一方、水晶体、網膜、硝子体及び視神経では、網膜で微量に検出された以外はいずれも検出限界以下であった²⁾。

〔臨床成績〕

アレルギー性結膜炎を対象とした比較試験を含む臨床試験210例における最終全般改善度の改善率(改善以上)は69.0%(145/210)であった³⁾⁻⁶⁾(承認時における集計)。

〔薬効薬理〕

1. 化学伝達物質遊離抑制作用

(1)ヒスタミン遊離抑制作用(in vitro)

アシタザノラスト水和物は、抗原刺激によるラット腹腔肥満細胞からのヒスタミン遊離を濃度依存的に抑制した⁷⁾。

(2)血小板活性化因子(PAF)、ロイコトリエン遊離抑制作用(in vitro)

アシタザノラスト水和物は、抗原刺激によるラット腹腔肥満細胞からのPAF遊離、モルモット肺切片からのロイコトリエンB₄・D₄遊離を濃度依存的に抑制した⁸⁾。

2. 実験的アレルギー性結膜炎に対する作用(in vivo)

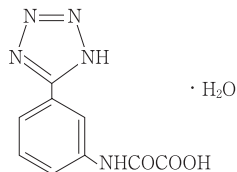
アシタザノラスト水和物点眼液は、ラット及びモルモットのアレルギー性結膜炎モデルにおける血管透過性亢進を濃度依存的に抑制した⁹⁾。

〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名 アシタザノラスト水和物(Acitazanolast Hydrate)(JAN)

化学名 3'-(1*H*-Tetrazol-5-yl)oxanilic acid monohydrate

構造式



分子式 $C_9H_7N_5O_3 \cdot H_2O$

分子量 251.20

性状 本品は白色の粉末である。
本品にはおいはなく、弱い苦味及び酸味がある。本品は*N,N*-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けにくく、水又はアセトンに極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

〔包装〕

ゼベリン点眼液0.1%



5 mL×5本、5 mL×10本、5 mL×50本

〔主要文献〕

- 1)中村 健 他：眼科臨床医報, **87**(7), 1519(1993)
- 2)江角凱夫 他：基礎と臨床, **29**(3), 673(1995)
- 3)増田寛次郎 他：臨床医薬, **11**(1), 139(1995)
- 4)増田寛次郎 他：臨床医薬, **11**(1), 151(1995)
- 5)増田寛次郎 他：臨床医薬, **13**(17), 4547(1997)
- 6)小暮文雄 他：臨床医薬, **13**(17), 4563(1997)
- 7)橋本光正 他：日本薬理学会誌, **95**(4), 159(1990)
- 8)橋本光正 他：呼吸, **12**(4), 484(1993)
- 9)豊田好洋 他：基礎と臨床, **29**(4), 907(1995)

※※**〔文献請求先〕**

わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション
〒103-8330 東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号
TEL 03-3279-0379
FAX 03-3279-1272

※製造販売元
 **わかもと製薬株式会社**
東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号
®登録商標  2017.9