

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

トラメラス®点眼液0.5%

TRAMELAS Eye Drops 0.5%

貯 法 気密容器、遮光、室温保存
【取扱い上の注意】の項参照
使用期限 外箱及びラベルに表示

承認番号	21900AMX01266000
薬価収載	2007年12月
販売開始	1995年12月
再審査結果	2005年3月

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

※【組成・性状】

1. 組成

有効成分	1 mL中 日局 トラニラスト 5 mg
添加物	ホウ酸、ホウ砂、ポビドン、ポリソルベート80、ベンザルコニウム塩化物、エデト酸ナトリウム水和物

2. 製剤の性状

色・剤形	微黄色澄明の無菌水性点眼剤
pH	7.0～8.0
浸透圧比	0.9～1.1

【効能・効果】
アレルギー性結膜炎

【用法・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。

【使用上の注意】

1. 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え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。

2. 副作用

トラニラスト点眼液が投与された5,951例中、副作用が報告されたのは72例（1.21%）88件であった。その主なものは、刺激感・しみる22件（0.37%）、眼瞼炎12件（0.20%）、眼痒痒感12件（0.20%）、眼瞼皮膚炎8件（0.13%）などであった。（再審査終了時）

	頻度不明	0.1～5%未満
過敏症 ^{注)}	接触性皮膚炎(眼周囲)	眼瞼皮膚炎、眼瞼炎
眼	結膜充血、眼瞼腫脹	刺激感、痒痒感

注) 発現した場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦（特に約3ヵ月以内）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。]

4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児に対する安全性は確立していない（使用経験がない）。

5. 適用上の注意

(1)投与経路：点眼用のみ使用すること。

(2)点眼時：容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
眼周囲等に流出した液は拭き取ること。

【薬物動態】

(1)健康成人男子6名にトラメラス点眼液0.5%を単回点眼（両眼に2滴ずつ）したところ、約1時間後に血漿中未変化体濃度は最高値（平均17.8ng/mL）を示した。また反復点眼後（1日4回投与8日目）の最高血中濃度は25.0ng/mLであった。血中からの消失半減期は単回点眼で3.6時間、反復点眼で3.9時間であった。

速度論的パラメータ

	単回点眼 (1回投与)	反復点眼 (8日間投与)
Tmax(hr)	1.2±0.4	0.8±0.3
Cmax(ng/mL)	17.8±7.1	25.0±12.2
AUC _{0-4hr} (ng·hr/mL)	50.8±17.6	75.6±31.3
T _{1/2} (hr)	3.6±1.3	3.9±1.2

(2)ヒト肝ミクロソーム及びP450発現系ミクロソームを用いたin vitro試験の結果、トラニラストの酸化的代謝反応はCYP2C9、CYP2C18、CYP2C8、CYP1A2、CYP3A4、CYP2D6で確認され、主としてCYP2C9が代謝に関与することが示された。¹⁾²⁾

【臨床成績】

臨床効果

二重盲検比較試験を含むアレルギー性結膜炎における本剤の有効率は中等度改善以上で70.9%（175/247）であった。^{3)~8)}

【薬効薬理】

1. 実験的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（ラット、モルモット）また、結膜組織への炎症細胞の浸潤（モルモット）に対し、点眼投与で用量依存的な抑制作用を示す。⁹⁾¹⁰⁾

2. 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（in vitro）。^{11)~19)}

※【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：トラニラスト（Tranilast）

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

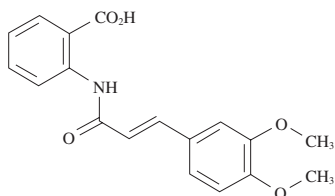
分子式：C₁₈H₁₇NO₅

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。

融点：207~210℃

構造式：



【取扱い上の注意】

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。

【包装】

5 mL×10、5 mL×50

※※【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) キッセイ薬品工業社内資料
(トラニラスト代謝に関するチトクロームP450分子種)
- 2) グラクソ・スミスクライン社内資料
(トラニラスト代謝に関するチトクロームP450分子種)
- 3) 三國郁夫 他：臨床医薬 8, 2819, 1992
- 4) 湯浅武之助 他：臨床医薬 9, 53, 1993
- 5) 中村 敏 他：臨床と研究 70, 1301, 1993
- 6) 根来良夫 他：臨床と研究 70, 1683, 1993
- 7) 岡野内俊雄 他：臨床と研究 70, 2017, 1993
- 8) 岩城陽一 他：臨床と研究 70, 1669, 1993
- 9) 芝崎泰平 他：日本眼科紀要 43, 1419, 1992
- 10) 伊東史顕 他：日薬理誌 101, 27, 1993
- 11) Azuma, H. et al. : Br.J.Pharmacol. 58, 483, 1976
- 12) 坂野和英 他：アレルギー 26, 385, 1977
- 13) 中沢政之 他：日薬理誌 74, 473, 1978
- 14) 中沢政之 他：日薬理誌 74, 483, 1978
- 15) 小松英忠 他：基礎と臨床 13, 43, 1979
- 16) 小松英忠 他：日薬理誌 82, 47, 1983
- 17) 堤 直行 他：応用薬理 25, 973, 1983
- 18) 堤 直行 他：応用薬理 33, 587, 1987
- 19) 伊東史顕 他：基礎と臨床 27, 191, 1993

〈文献請求先〉

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

ロートニッテン株式会社 医薬情報問合せ窓口

〒457-0038 名古屋市南区桜本町40番地の2

TEL：0120-691-910 FAX：052-823-9115

販売元

RN ロートニッテン株式会社
名古屋市南区桜本町40番地の2

製造販売元

ロートニッテンファーマ株式会社
名古屋市南区桜本町40番地の2

®：登録商標