

**2021年3月改訂（第5版）
*2020年3月改訂

日本標準商品分類番号
871319

貯 法：遮光した気密容器、室温保存 [取扱い上の注意参照]
使用期限：3年（外装容器に表示）

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
リザベン[®]点眼液0.5%
RIZABEN[®]Eye Drops 0.5%

承認番号	21900AMX00014000
薬価収載	2007年6月
販売開始	2007年6月
再審査結果	2005年3月

※リザベン点眼液(旧製品名)として
1995年12月 販売開始

—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

成分・分量	日局トラニラスト 5 mg/mL
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. 性状

色・剤形	微黄色澄明の無菌水性点眼液
pH	7.0~8.0
浸透圧比	0.9~1.1 (0.9%生理食塩液に対する比)

—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%)、眼癢痒感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, 癢痒感

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カ月以内）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에만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名にリザベン点眼液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17.8 ng/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25.0 ng/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—

二重盲検比較試験及び一般臨床試験^{3)~8)}

国内で実施された二重盲検比較試験を含むアレルギー性結膜炎に対する臨床試験成績の有効率は、中等度改善以上で70.9%（175/247）であった。

—薬効薬理—

- (1) 実験的アレルギー性結膜炎抑制作用^{9), 10)}

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。

(2) 作用機序^{11)~19)}

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）。

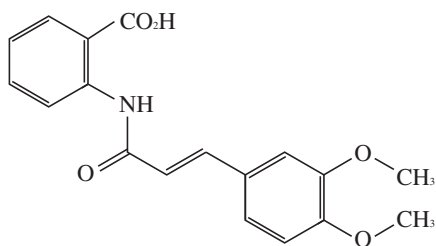
－有効成分に関する理化学的知見－

一般名：トラニラスト (JAN)

Tranilast (JAN, INN)

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

構造式：



分子式：C₁₈H₁₇NO₅

分子量：327.33

性状：本品は淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。
本品は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。
本品は光によって徐々に淡い黄褐色となる。
本品は結晶多形が認められる。

融点：207～210℃

－取り扱い上の注意－

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－

リザベン点眼液0.5% 5mL×5, 5mL×10

－主要文献－

- 1) トラニラスト代謝に関与するチトクロームP450分子種（社内資料）
- 2) トラニラスト代謝に関与するチトクロームP450分子種（グラクソ・スミスクライン社内資料）
- 3) 三國郁夫ほか：臨床医薬, 8(12), 2819, 1992.
- 4) 湯浅武之助ほか：臨床医薬, 9(1), 53, 1993.
- 5) 中村 敏ほか：臨床と研究, 70(4), 1301, 1993.
- 6) 根来良夫ほか：臨床と研究, 70(5), 1683, 1993.
- 7) 岡野内俊雄ほか：臨床と研究, 70(6), 2017, 1993.
- 8) 岩城陽一ほか：臨床と研究, 70(5), 1669, 1993.
- 9) 芝崎泰平ほか：日本眼科紀要, 43(12), 1419, 1992.
- 10) 伊東史顕ほか：日薬理誌, 101(1), 27, 1993.

- 11) Azuma, H. et al. : Br. J. Pharmacol., 58(4), 483, 1976.
- 12) 坂野和英ほか：アレルギー, 26(4), 385, 1977.
- 13) 中沢政之ほか：日薬理誌, 74(4), 473, 1978.
- 14) 中沢政之ほか：日薬理誌, 74(4), 483, 1978.
- 15) 小松英忠ほか：基礎と臨床, 13(1), 43, 1979.
- 16) 小松英忠ほか：日薬理誌, 82(1), 47, 1983.
- 17) 堤 直行ほか：応用薬理, 25(6), 973, 1983.
- 18) 堤 直行ほか：応用薬理, 33(4), 587, 1987.
- 19) 伊東史顕ほか：基礎と臨床, 27(1), 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ください。

キッセイ薬品工業株式会社 くすり相談センター
〒112-0002 東京都文京区小石川3丁目1番3号
フリーダイヤル：0120-007-622

® 登録商標

製造販売元  キッセイ薬品工業株式会社
松本市芳野19番48号

05-PH