

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2013 に準拠して作成

日本薬局方

トラニラストカプセル

アレルギー性疾患治療剤

ケロイド・肥厚性瘢痕治療剤

**トラニラスト**カプセル  
**100mg「タイヨー」**

TRANILAST

剤 形	硬カプセル剤
製 剤 の 規 制 区 分	該当しない
規 格 ・ 含 量	1 カプセル中：トラニラスト…………… 100mg
一 般 名	和名：トラニラスト（JAN） 洋名：Tranilast（JAN）
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬 価 基 準 収 載 ・ 発 売 年 月 日	製造販売承認年月日：2008 年 3 月 7 日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2008 年 6 月 20 日（販売名変更による） 発売年月日：1990 年 7 月 13 日
開発・製造販売（輸入）・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	販 売：武田薬品工業株式会社 製造販売元：武田テバファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問 い 合 わ せ 窓 口	武田テバファーマ株式会社 武田テバ DI センター TEL 0120-923-093 受付時間 9:00～17:30（土日祝日・弊社休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.med.takeda-teva.com">https://www.med.takeda-teva.com</a>

本 IF は 2016 年 10 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

# IF 利用の手引きの概要

— 日本病院薬剤師会 —

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

### [IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤字・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

#### [IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。

また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（2013 年 4 月改訂）

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	13
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	13
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	13
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	13
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	13
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	13
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	13
5. 化学名（命名法）	2	8. 副作用	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	15
7. CAS 登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	15
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	15
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	15
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	15
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	15
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	15
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	16
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	16
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	2. 毒性試験	16
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	17
5. 調製法及び溶解後の安定性	6	1. 規制区分	17
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	6	2. 有効期間又は使用期限	17
7. 溶出性	6	3. 貯法・保存条件	17
8. 生物学的試験法	7	4. 薬剤取扱い上の注意点	17
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7	5. 承認条件等	17
10. 製剤中の有効成分の定量法	7	6. 包装	17
11. 力価	7	7. 容器の材質	17
12. 混入する可能性のある夾雑物	7	8. 同一成分・同効薬	17
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	7	9. 国際誕生年月日	17
14. その他	7	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	17
V. 治療に関する項目	8	11. 薬価基準収載年月日	18
1. 効能又は効果	8	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の 年月日及びその内容	18
2. 用法及び用量	8	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	18
3. 臨床成績	8	14. 再審査期間	18
VI. 薬効薬理に関する項目	9	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	18
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	16. 各種コード	18
2. 薬理作用	9	17. 保険給付上の注意	18
VII. 薬物動態に関する項目	10	XI. 文献	19
1. 血中濃度の推移・測定法	10	1. 引用文献	19
2. 薬物速度論的パラメータ	11	2. その他の参考文献	19
3. 吸収	11	XII. 参考資料	20
4. 分布	11	1. 主な外国での発売状況	20
5. 代謝	12	2. 海外における臨床支援情報	20
6. 排泄	12	XIII. 備考	21
7. トランスポーターに関する情報	12	その他の関連資料	21
8. 透析等による除去率	12		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

トラニラストは、ヒスタミンやロイコトリエン C4・D4 などのケミカルメディエーターの遊離を抑制し、抗アレルギー作用を示すと共に、繊維芽細胞からの過剰のコラーゲン合成を抑制する。弊社は、後発医薬品としてリザモントカプセルの開発を企画し、薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、1990 年 1 月に承認を取得、1990 年 7 月発売に至った。

その後、「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成 12 年 9 月 19 日医薬発第 935 号）に基づき、販売名をトラニラストカプセル 100mg「タイヨー」と変更し、2008 年 3 月に承認を取得し、2008 年 6 月に薬価基準収載された。

また、2005 年 1 月、「ケロイド・肥厚性瘢痕」の効能・効果が追加された。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、ケロイド・肥厚性瘢痕に適応を有している。

（「V－1. 効能又は効果」の項参照）

2. 本剤は、使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していないのでいずれも頻度は不明であるが、重大な副作用として、膀胱炎様症状、肝機能障害、黄疸、腎機能障害、白血球減少、血小板減少があらわれることがある。

（「VIII－8. 副作用」の項参照）

## Ⅱ．名称に関する項目

### 1．販売名

#### (1) 和名

トラニラストカプセル 100mg 「タイヨー」

#### (2) 洋名

TRANILAST

#### (3) 名称の由来

主成分「トラニラスト」より命名

### 2．一般名

#### (1) 和名（命名法）

トラニラスト（JAN）

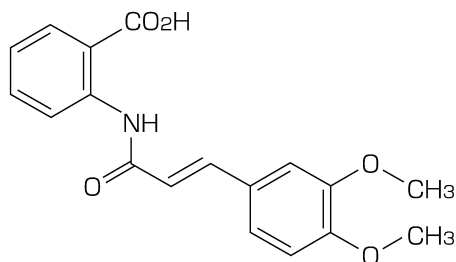
#### (2) 洋名（命名法）

Tranilast（JAN）

#### (3) ステム

-ast：抗ヒスタミン薬とは異なる作用機序の抗ぜんそく薬または抗アレルギー薬

### 3．構造式又は示性式



### 4．分子式及び分子量

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

分子量：327.33

### 5．化学名（命名法）

2-{[(2*E*)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)prop-2-enoyl]amino}benzoic acid

### 6．慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

### 7．CAS 登録番号

53902-12-8

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。結晶多形が認められる。

##### (2) 溶解性

*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。

各種 pH における溶解度<sup>1)</sup>

溶液	溶解度 (37℃)
pH1.2	0.7 $\mu$ g/mL
pH5.5	163.0 $\mu$ g/mL
pH6.8	2058.0 $\mu$ g/mL
水	14.5 $\mu$ g/mL

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：207～210℃

##### (5) 酸塩基解離定数<sup>1)</sup>

p*K*<sub>a</sub>：3.25 (25℃、カルボキシル基、溶解度法)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

光によって徐々に淡い黄褐色となる。

水	遮光、37℃、24 時間は安定である。
液性 (pH)	遮光、pH1.2、pH5.5 及び pH6.8 において、37℃、20 時間は安定である。
光	白色蛍光灯 (約 4800lx・hr) 下、37℃において、pH5.5 は安定であるが、pH6.8 及び水で、それぞれ約 2% 及び約 5% 分解する。

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「トラニラスト」の確認試験法による

- 1) 紫外可視吸光度測定法 (吸収スペクトル)
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

#### 4. 有効成分の定量法

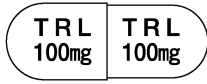

日局「トラニラスト」の定量法による

0.1mol/L 水酸化ナトリウム液による滴定法

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	性状	外形	
		側面	断面
トラニラストカプセル 100mg 「タイヨー」	蓋部・胴体部とも白色不透明、内容物が淡黄色の粒を含む粉末の3号カプセル剤		
		(全長：15.8mm) (重量：189mg)	(蓋部：5.9mm) (胴体部：5.6mm)

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

販売名	PTP 識別コード	薬物本体識別コード
トラニラストカプセル 100mg 「タイヨー」	t TRL 100mg	TRL 100mg

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1 カプセル中：トラニラストを 100mg 含有

#### (2) 添加物

軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、タルク、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ラウリル硫酸ナトリウム

#### (3) その他

特になし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない



#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

<加速試験><sup>2)</sup>

通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

試験条件

保存条件	包装形態
40±1℃・75±5%RH	PTP
	バラ（ガラス製容器）

試験結果（上段：PTP、下段：バラ）

試験項目			試験開始時	1 ヲ月	3 ヲ月	6 ヲ月
性状	外観		蓋部、胴体部共に白色 不透明の硬カプセル剤	同左	同左	同左
				同左	同左	同左
	内容物	色	淡黄色	同左	同左	同左
				同左	同左	同左
		形状	粒を含む粉末	同左	同左	同左
				同左	同左	同左
		におい	なし	同左	同左	同左
				同左	同左	同左
崩壊試験（分）			4～5	4～6	4～5	4～5
				4～5	4～5	4～6
定量（％）			100.1±0.4	100.1±0.4	100.2±0.5	100.2±0.4
				100.2±0.3	100.4±0.3	100.3±0.4

[平均値±S.D.]

<無包装状態での安定性試験><sup>3)</sup>

試験条件

保存条件		保存容器
温度	40℃	遮光・気密
湿度	25℃・75%RH	遮光・開放
光	60 万 lx・hr	透明・気密

試験結果

検体	性状	色差 (dE)	溶出試験 (%)	定量*1 (%)
試験開始時	蓋部、胴体部共に白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は淡黄色の粒を含む粉末で、においはなかった。	—	80.6～86.3	100
40℃ 3 ヶ月	蓋部、胴体部共に白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は淡黄色の粒を含む粉末で、においはなかった。	1.16	80.1～86.6	103.5
25℃・75%RH 3 ヶ月	蓋部、胴体部共に白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は淡黄色の粒を含む粉末で、においはなかった。	1.19	76.5～82.3	105.5
60 万 lx・hr	蓋部、胴体部共に白色不透明の硬カプセル剤で、内容物は淡黄色の粒を含む粉末で、においはなかった。	1.34	79.1～88.4	103.4

\*1 試験開始時を 100 とした

## 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

## 7. 溶出性

### (1) 溶出挙動における同等性<sup>4)</sup>

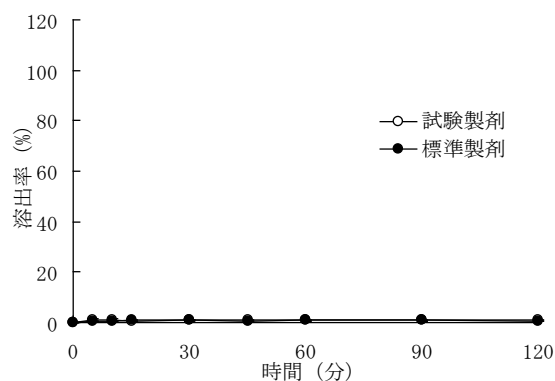
通知	「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について」 (平成 10 年 7 月 15 日、医薬発第 634 号) (その 41)				
試験方法	日本薬局方一般試験法 溶出試験法 パドル法				
試験液	pH1.2 : 日本薬局方溶出試験の第 1 液				
	pH5.5 : 薄めた McIlvaine の緩衝液				
	pH6.8 : 薄めた pH6.8 のリン酸塩緩衝液 (1→2)				
	水 : 日本薬局方精製水				
試験液温	37℃	試験液量	900mL	試験回数	6 ベッセル

### <試験結果>

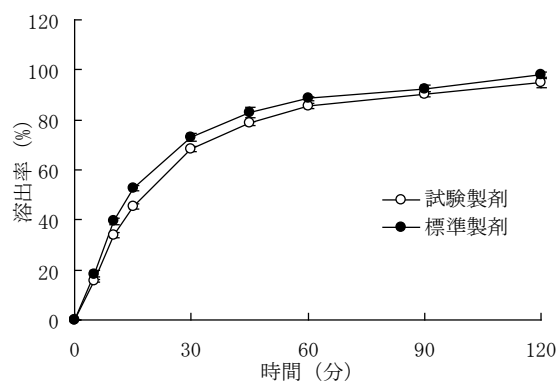
全ての試験条件において基準に適合したため、両製剤の溶出性は同等であると判断した。

回転数	試験液	溶出挙動	判定
75 回転/分	pH1.2	規定された時間 (120 分) 以内に平均 85%以上溶出せず、その 120 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあった。	適合
	pH5.5	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる 2 時点 (10 分及び 45 分) において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあった。	適合
	pH6.8	標準製剤、試験製剤ともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。	適合
	水	標準製剤の 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示した 10 分、及び 360 分の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあった。	適合

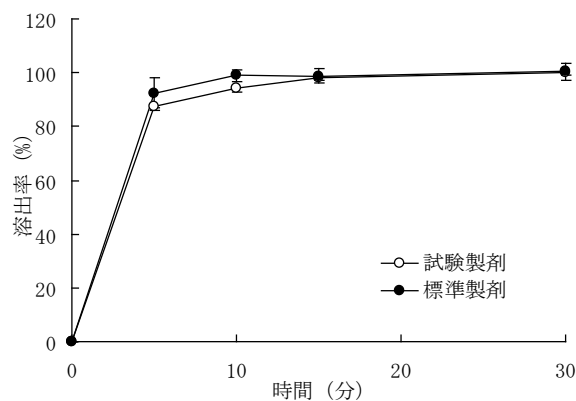
### <pH1.2、75rpm>



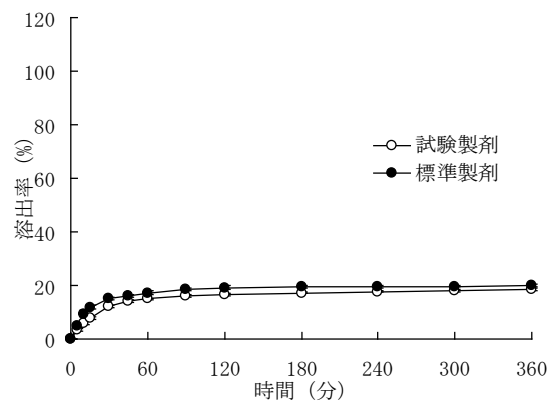
### <pH5.5、75rpm>



<pH6.8、75rpm>



<水、75rpm>



## (2) 公的溶出規格への適合

本剤の溶出性は、日本薬局方に定められた規格に適合していることが確認されている。

規定時間	溶出率
60 分	75%以上

## 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「トラニラストカプセル」の確認試験法による  
紫外可視吸光度測定法（吸収スペクトル）

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「トラニラストカプセル」の定量法による  
液体クロマトグラフィー

## 11. 力価

該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

## 14. その他

特になし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、ケロイド・肥厚性瘢痕

### 2. 用法及び用量

通常、成人には1回1カプセル（トラニラストとして100mg）を1日3回経口投与する。  
ただし、年齢、症状により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6) 治療的使用

##### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

##### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

クロモグリク酸ナトリウム、アンレキサノクス、イブジラスト、ペミロラストカリウム 等のメ  
ディエーター遊離抑制薬

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 1. 抗アレルギー作用<sup>5)</sup>

トラニラストは、抗原抗体反応に伴って起こる肥満細胞等からのヒスタミンやロイコトリエン  
C4・D4 などのケミカルメディエーターの遊離を抑制し、抗アレルギー作用を示す。受容体拮  
抗はない。

##### 2. ケロイド・肥厚性瘢痕に対する作用<sup>6)</sup>

線維芽細胞への直接作用、サイトカイン・活性酸素の産生あるいは遊離の抑制、SOD 活性上昇  
などの作用を有し、ケロイド・肥厚性瘢痕に対し効果を示すと考えられる。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

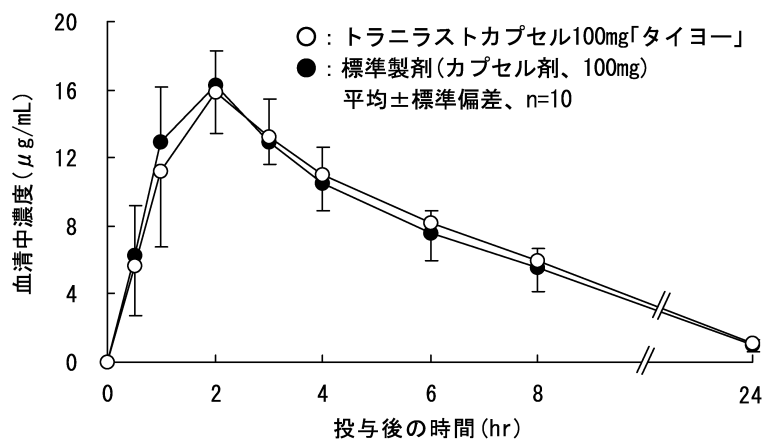
#### (2) 最高血中濃度到達時間

「VII-1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>7)</sup>

トラニラストカプセル 100mg「タイヨー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル（トラニラストとして100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

通知	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取り扱い等について」（昭和55年5月30日、薬審第718号）
被験者数	10名
投与方法	2剤2期のクロスオーバー法 水100mLと共に絶食単回経口投与
投与量	製剤1カプセル（トラニラストとして100mg）
採血時間	9時点（投与前、投与後0.5、1、2、3、4、6、8、24時間）
休薬期間	5日間以上
分析法	HPLC法



#### <薬物動態パラメータ>

(平均±標準偏差、n=10)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-24</sub> (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
トラニラストカプセル 100mg「タイヨー」	100	135.49±14.95	16.21±2.44	2.0±0.5	6.3±0.4
標準製剤 (カプセル剤、100mg)	100	131.29±22.42	16.58±1.86	1.9±0.3	6.2±0.6

#### <判定結果>

	AUC <sub>0-24</sub>	Cmax
母平均の比	1.04	0.97
90%信頼区間	log(0.95)~log(1.15)	log(0.87)~log(1.09)

血清中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ－７．相互作用」の項参照

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数<sup>5)</sup>

1.28 hr<sup>-1</sup>

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数<sup>5)</sup>

0.131 hr<sup>-1</sup>

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率<sup>5)</sup>

81.7%

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

「Ⅷ－10．妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ－10．妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路<sup>5)</sup>

主代謝経路はトラニラストの 4 位の脱メチル化とそれに続く硫酸抱合及びトラニラストのグルクロン酸抱合

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

主として CYP2C9

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

### (2) 排泄率<sup>5)</sup>

尿中排泄率は 37.74% であり、うち大部分は 24 時間以内に排泄された。

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 8. 透析等による除去率

該当資料なし



## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 妊婦（特に約 3 ヶ月以内）又は妊娠している可能性のある婦人（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
- (2) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 肝障害又はその既往歴のある患者〔肝機能を悪化させるおそれがある〕
- (2) 腎障害又はその既往歴のある患者〔腎機能を悪化させるおそれがある〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 本剤による膀胱炎様症状、肝機能障害が出現する場合には、末梢血中好酸球増多を伴うことが多いので、本剤投与中は定期的に血液検査（特に白血球数・末梢血液像の検査）を行うことが望ましい。好酸球数が増加した場合には、十分な経過観察を行うこと。
- (2) 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。
- (3) 長期ステロイド療法を受けている患者で、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。
- (4) 本剤の投与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。
- (5) 気管支喘息患者に本剤を投与中、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。
- (6) 本剤投与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に注意すること。

### 7. 相互作用

本剤の代謝には主として CYP2C9 が関与している。

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

## (2) 併用注意とその理由

併用に注意すること		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ワルファリン カリウム	本剤との併用（又は併用中止）により、ワルファリンカリウムの作用が増強（又は減弱）し、トロンボテスト値が低下（又は上昇）したとの報告がある。 本剤との併用（又は併用の中止）を行う場合には、凝血能の変動に十分注意すること。	ヒト肝ミクロソームを用いた <i>in vitro</i> の試験で、ワルファリンカリウムの代謝を抑制することが確認されていることから、凝血能を変動させる可能性がある。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### 重大な副作用（頻度不明）

- 1) **膀胱炎様症状** 頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等の膀胱炎様症状があらわれることがある。観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には、直ちに投与を中止すること。
- 2) **肝機能障害、黄疸** 黄疸、AST (GOT)、ALT (GPT)、A1-P 等の著しい上昇を伴う肝機能障害又は肝炎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。
- 3) **腎機能障害** BUN、クレアチニンの上昇等を伴う腎機能障害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。
- 4) **白血球減少、血小板減少** 白血球減少、血小板減少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。

### (3) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹、そう痒、蕁麻疹、紅斑、湿疹、落屑
消化器	食欲不振、嘔気、腹痛、下痢、胃部不快感、消化不良、便秘、嘔吐
血液	貧血、好酸球増多、溶血性貧血
精神神経系	頭痛、眠気、不眠、めまい、倦怠感、しびれ感
その他	月経異常、動悸、浮腫、潮紅、発熱、口内炎、脱毛、緑色尿

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。

### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

### (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

下記の項目参照

VIII－2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）(2)

VIII－8. (3) その他の副作用：過敏症

## 9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、副作用があらわれた場合は減量するなど慎重に投与すること。

## 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦（特に約 3 ヶ月以内）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。[マウスに大量投与した実験で、骨格異常例の増加が認められている]
- (2) 授乳中の婦人に投与する場合には授乳を避けさせること。[動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている]

## 11. 小児等への投与

該当資料なし

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルゲン皮内反応を抑制し、アレルゲンの確認に支障を来すので、アレルゲン皮内反応検査は本剤の投与前に実施すること。

## 13. 過量投与

該当資料なし

## 14. 適用上の注意

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報告されている）

## 15. その他の注意

該当資料なし

## 16. その他

### 【本剤投与に当たって】

本剤を季節性のアレルギー性疾患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つづけることが望ましい。

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）

該当資料なし

#### (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### (3) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

#### (1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

#### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

#### (3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3 年（安定性試験結果（加速）に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

しゃ光保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

特になし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ－14. 適用上の注意」の項参照

・患者向医薬品ガイド：有り

・くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

特になし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

PTP 包装：100 カプセル（10 カプセル×10）

### 7. 容器の材質

PTP 包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：リザベンカプセル 100mg

同 効 薬：クロモグリク酸ナトリウム、ペミロラストカリウム、アンレキサノクス、イブジラスト 等

### 9. 国際誕生年月日

該当しない

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
トラニラストカプセル 100mg 「タイヨー」	2008 年 3 月 7 日	22000AMX00497000

<旧販売名>

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
リザモントカプセル	1990 年 1 月 18 日	(02AM) 第 0019 号

## 11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
トラニラストカプセル 100mg 「タイヨー」	2008 年 6 月 20 日

&lt;旧販売名&gt;

製品名	薬価基準収載年月日
リザモントカプセル	1990 年 7 月 13 日

## 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

効能追加：2005 年 1 月 26 日

「ケロイド・肥厚性瘢痕」の追加

## 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

## 14. 再審査期間

該当しない

## 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

## 16. 各種コード

製品名	HOT(9 桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード (YJ コード)	レセプト電算コード
トラニラストカプセル 100mg 「タイヨー」	109442841	4490002M1013 (4490002M1382)	620008322

## 17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 医療用医薬品 品質情報集 No. 12, 日本公定書協会 (2002)
- 2) 武田テバファーマ(株)社内資料 (加速試験)
- 3) 武田テバファーマ(株)社内資料 (無包装状態での安定性試験)
- 4) 武田テバファーマ(株)社内資料 (溶出試験)
- 5) 第十六改正日本薬局方第一追補解説書 (2011)
- 6) 西野：京府医大誌, 109 (12), 803, 2000
- 7) 武田テバファーマ(株)社内資料 (生物学的同等性試験)

### 2. その他の参考文献

特になし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし



## XIII. 備考

その他の関連資料