

※※2013年3月改訂（ 部分：第12版、日本薬局方改正に伴う改訂）
 ※2009年6月改訂（ 部分：第11版）

アレルギー性疾患治療剤
 ケロイド・肥厚性瘢痕治療剤

※※日本薬局方 トラニラストカプセル

ブレクルス®カプセル100mg

※※日本薬局方 トラニラスト細粒

ブレクルス®細粒10%

BRECRUS® CAPSULES 100mg / FINE GRANULES 10%

日本標準商品分類番号 87449

	承認番号	薬価収載	販売開始	再評価(品質)	効能追加
カプセル100mg	22000AMX01017	2008年6月	1990年7月	2002年3月	2001年2月
細粒10%	22000AMX01016	2008年6月	1990年7月	2002年3月	2001年2月


貯 法：遮光・室温保存
 使用期限：外箱に記載

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- 1) 妊婦（特に約3ヵ月以内）又は妊娠している可能性のある女性（「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

※※【組成・性状】

1. ブレクルスカプセル100mg

※※ 1カプセル中の有効成分	日局 トラニラスト……………100mg	
添加物	セルロース、カルメロースCa、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸Ca、タルク カプセル本体：酸化チタン、ラウリル硫酸Na、ゼラチン	
性状	頭部及び胴部が共に白色の不透明な硬カプセルで、内容物は淡黄色の粒状又は粉末で味及びにおいはない。	
識別コード	本体	Tw. BRC
	包装	
外形全長号数		
質量(mg)	約219	

2. ブレクルス細粒10%

※※ 1g中の有効成分	日局 トラニラスト……………100mg
添加物	乳糖水和物、D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク
性状	淡黄色の細粒で、においはなく、味はわずかに甘い。

【効能・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

【用法・用量】

ブレクルスカプセル100mg：

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。

ブレクルス細粒10%：

通常、成人には1回1g（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。

通常、小児には1日量0.05g/kg（トラニラストとして5mg/kg）を3回に分けて経口投与する。

ただし、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 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。〕

2. 重要な基本的注意

- 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。

3. 相互作用

本剤の代謝には主としてCYP2C9が関与している。

併用注意（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。

4. 副作用

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。

1) 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)、ALP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。

2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	落屑、発疹、そう痒、蕁麻疹、紅斑、湿疹
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	溶血性貧血、貧血、好酸球増多
精神神経系	頭痛、眠気、不眠、めまい、けん怠感、しびれ感
その他	脱毛、緑色尿、月経異常、動悸、浮腫、潮紅、発熱、口内炎

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。

5. 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。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦（特に約3ヵ月以内）又は妊娠している可能性のある女性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) 授乳中の女性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。]

7. 臨床検査結果に及ぼす影響

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

8. 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、更には穿孔を起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。]

【本剤投与に当たって】

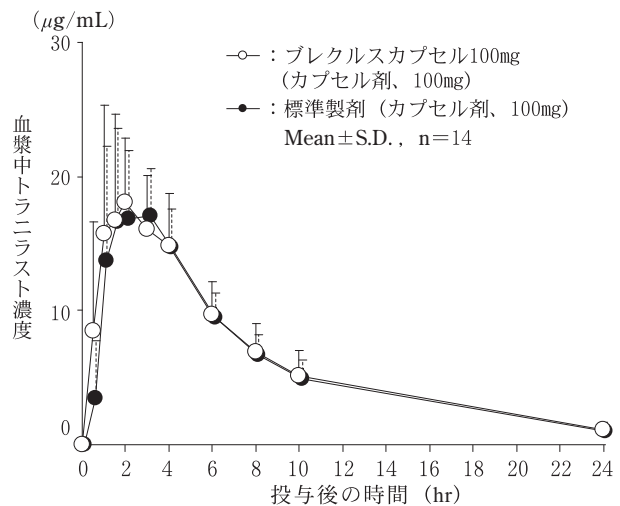
本剤を季節性のアレルギー性疾患患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

***【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

1) プレクルスカプセル100mg

プレクルスカプセル100mg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(n=14)に絶食単回経口投与して血漿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(昭和55年5月30日 薬審第718号に基づく)¹⁾。



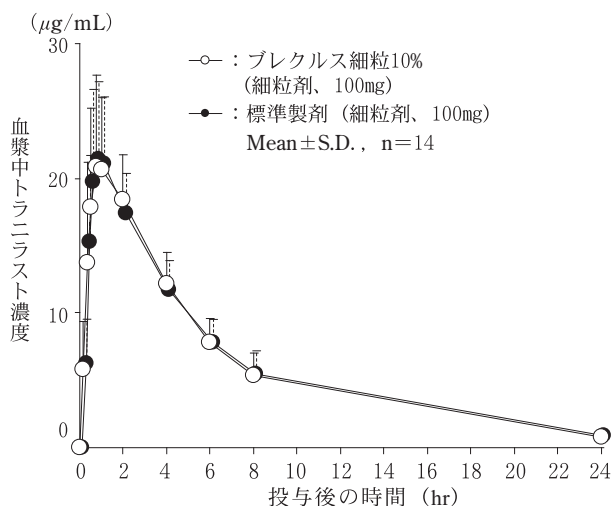
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₂₄ (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
プレクルスカプセル100mg (カプセル剤, 100mg)	154.40 ± 35.07	22.05 ± 4.09	1.75 ± 0.96	5.95 ± 0.73
標準製剤 (カプセル剤, 100mg)	147.82 ± 30.12	21.03 ± 3.91	2.11 ± 0.94	6.02 ± 0.51

(Mean ± S. D., n = 14)

血漿中濃度並びに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。

2) プレクルス細粒10%

プレクルス細粒10%と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1g(トラニラストとして100mg)健康成人男子(n=14)に絶食単回経口投与して血漿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(昭和55年5月30日 薬審第718号に基づく)²⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₂₄ (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
プレクルス細粒10% (細粒剤, 100mg)	147.74 ± 32.02	22.43 ± 5.41	1.18 ± 0.65	5.61 ± 0.53
標準製剤 (細粒剤, 100mg)	147.32 ± 32.73	22.68 ± 4.55	0.82 ± 0.40	5.71 ± 0.71

(Mean ± S. D., n=14)

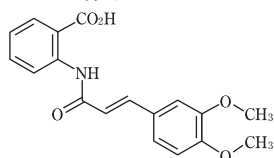
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

※※ 2. 溶出挙動

プレクルスカプセル100mg及びプレクルス細粒10%は、日本薬局方医薬品各条に定められたトラニラストカプセル及びトラニラスト細粒の溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている³⁾⁴⁾。

※※【有効成分に関する理化学的知見】

構造式:



一般名: 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: 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℃

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験 (40℃、相対湿度75%、6ヵ月) の結果、プレクルスカプセル100mg及びプレクルス細粒10%は通常の市場流通下においてそれぞれ3年間安定であることが推測された⁵⁾⁶⁾。

【包装】

プレクルスカプセル100mg: 100カプセル、1000カプセル (PTP)

プレクルス細粒10%: 1kg (バラ)

【主要文献】

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料: 生物学的同等性試験 (カプセル100mg)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料: 生物学的同等性試験 (細粒10%)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料: 溶出試験 (カプセル100mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料: 溶出試験 (細粒10%)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料: 安定性試験 (カプセル100mg)
- 6) 東和薬品株式会社 社内資料: 安定性試験 (細粒10%)

※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献 (社内資料を含む) は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター (24時間受付対応)

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号