

**2010年1月改訂(第4版)

*2007年12月改訂

日本標準商品分類番号	871319
*承認番号	21900AMX01433
*薬価収載	2007年12月
販売開始	1989年4月
再審査結果	1998年3月

貯法：室温保存

*使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること(使用期限内であっても、開栓後は速やかに使用すること)。

抗アレルギー点眼剤

** (指定医薬品の削除) * エリックス®点眼液0.25%

* ELICS® OPHTHALMIC SOLUTION 0.25%

アンレキサノクス点眼液



【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】

成分・含量 (1mL中)	アンレキサノクス2.5mg
添加物	ホウ酸、ホウ砂、ポビドン、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
剤形	水性点眼剤
色	無色～微黄色澄明
pH	6.8～7.8
その他	無菌製剤

【効能・効果】

アレルギー性結膜炎、花粉症、春季カタル

【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. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕

2. 副作用

承認時及び使用成績調査での総症例2,862例中64例(2.24%)に副作用が認められた。

主な副作用は、接触皮膚炎26件(0.91%)、刺激感17件(0.59%)、眼瞼炎9件(0.31%)、結膜充血8件(0.28%)であった(再審査終了時)。

以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^(注)	接触皮膚炎、眼瞼炎	
眼	刺激感、結膜充血、結膜濾胞形成、痒痒感	眼脂

注)発現した場合には、投与を中止すること。

なお、長期連用によりこれらの副作用の発現率が高くなる傾向が認められているので、慎重に投与すること。

3. 高齢者への投与

使用成績調査において、高齢者に接触皮膚炎、眼瞼炎の副作用の発現率が高い傾向が認められているので、慎重に投与すること。

4. 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。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

5. 小児等への投与

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

6. 適用上の注意

(1)投与経路：点眼用にのみ使用すること。

(2)投与時：1)点眼したときに、点眼液が目からあふれ出て、眼瞼皮膚等に付いた場合には、すぐに拭き取るように指導すること。

2)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。

【薬物動態】

血中濃度

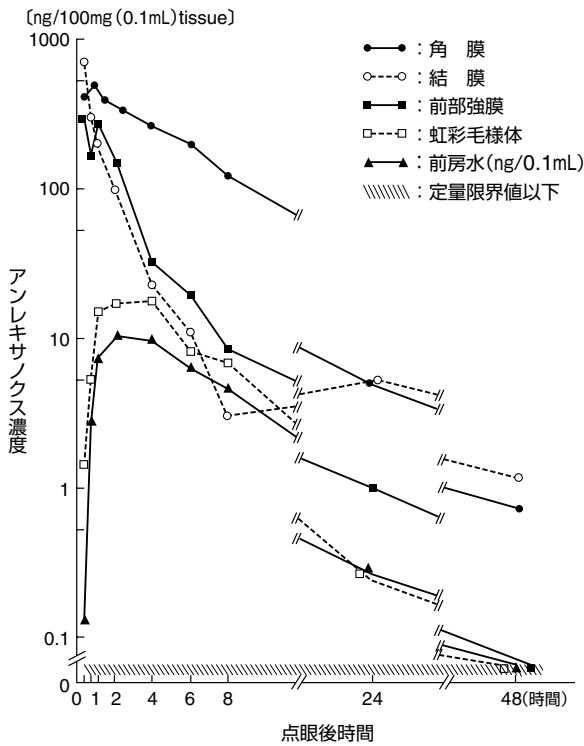
健康成人(12例)の両眼にエリックス点眼液0.25%を1回2滴、4時間間隔で1日4回、28日間点眼し、7日目及び28日目に血中濃度を測定したところ、アンレキサノクスは血清中に移行し、その値は7日間点眼で7.3ng/mL、28日間点眼で7.0ng/mLとほぼ同等である。また、最終点眼の24時間後には、アンレキサノクスは検出されていない。

(参考)

眼内移行(ウサギ)^{1, 2)}

ウサギの両眼にエリックス点眼液0.25%を0.05mL点眼した試験では、点眼20、40分、1、2、4、6、8、24、48時間後の各眼組織内のアンレキサノクス濃度の時間的推移は図のとおりである。なお、水晶体、硝子体及び網・脈絡膜への移行はわずかである。また、ウサギの両眼に1.0%アンレキサノクスを1日1回、0.05mLずつ、1、7、14、21日間点眼し、1回点眼と7、14、21回連続点眼の各眼組織内のアンレキサノクス濃度を比較した。

その結果、連続点眼による濃度の増加がみられているが、点眼終了とともにアンレキサノクスの消失が認められ、角膜、結膜での消失速度定数は1回点眼とほぼ同様である。



【臨床成績】

259例での臨床試験の成績概要は表のとおりである。
 自觉症状では掻痒感、眼脂、流涙、異物感、羞明、眼痛、他覚的所見では眼瞼及び球結膜の充血、浮腫、びまん性表層角膜炎、結膜及び角膜輪部病変が改善されている。
 なお、1日投与量、投与期間は大部分が1回1～2滴、1日4回、5週間未満である。

表、疾患別臨床効果

疾患名	有効率(%)有効以上
アレルギー性結膜炎	72.6 (138/190)
花粉症	69.8 (30/43)
春季カタル	50.0 (13/26)
合計	69.9 (181/259)

【薬効薬理】

1. 実験的アレルギー性結膜炎抑制作用³⁾

ラット及びモルモットにおけるIgE関与の受動結膜アナフィラキシー反応(I型アレルギー反応)を用量依存的に抑制する(点眼)。

2. 作用機序⁴⁻⁶⁾

(1) ヒスタミン遊離抑制作用

ラット肥満細胞からのIgE関与のヒスタミン遊離反応を抑制する(*in vitro*)。ヒスタミン遊離抑制の作用機序として細胞内c-AMP量増加作用に基づくことが示唆されている。

(2) ロイコトリエン生成抑制作用

能動感作モルモット肺切片における抗原惹起のロイコトリエン生成、ラット腹腔マクロファージにおけるカルシウムイオノフォア刺激によるロイコトリエン生成をいずれも抑制する(*in vitro*)。

(3) 抗ロイコトリエン作用

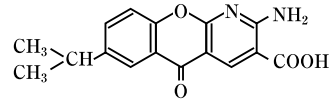
モルモット摘出肺、気管筋及び回腸標本でロイコトリエンD₄惹起収縮反応を抑制する(*in vitro*)。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アンレキサノクス (Amlexanox) [JAN]

化学名：2-amino-7-isopropyl-5-oxo-5H-[1] benzopyrano [2,3-b] pyridine-3-carboxylic acid

構造式：



分子式：C₁₆H₁₄N₂O₄

分子量：298.29

性状：アンレキサノクスは、白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

ジメチルスルホキシドに溶けやすく、ジメチルホルムアミドにやや溶けやすく、メタノール又は無水エタノールに極めて溶けにくく、水、アセトニトリル又はエーテルにほとんど溶けない。

【包装】

5mL×10

【主要文献】

- 1) 小河貴裕他：日本眼科紀要, **39**, 633, 1988.
- 2) 小河貴裕他：日本眼科学会雑誌, **92**, 1190, 1988.
- 3) 小河貴裕他：日本眼科紀要, **39**, 202, 1988.
- 4) 栗木 久他：薬理と治療, **13**, 6435, 1985.
- 5) Saijo, T. et al. : Int. Archs Allergy appl. Immun., **78**, 43, 1985.
- 6) Saijo, T. et al. : Int. Archs Allergy appl. Immun., **79**, 231, 1986.

【文献請求先】*

〈文献請求先・製品情報お問合せ先〉

千寿製薬株式会社 カスタマーサポート室
 〒541-0046 大阪市中央区平野町二丁目5番8号
 TEL ☎ 0120-06-9618 FAX 06-6201-0577
 受付時間 9:00～17:30 (土、日、祝日を除く)

製造販売元 千寿製薬株式会社
 大阪市中央区平野町二丁目5番8号

販売 武田薬品工業株式会社
 大阪市中央区道修町四丁目1番1号