

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 2018(2019年更新版)に準拠して作成

点鼻用血管収縮剤
トラマゾリン塩酸塩点鼻液

トラマゾリン点鼻液0.118%「AFP」

TRAMAZOLINE Nasal Solution 0.118%「AFP」

剤形	点鼻剤	
製剤の規制区分	劇薬	
規格・含量	1mL 中トラマゾリン塩酸塩 1.18mg	
一般名	和名:トラマゾリン塩酸塩(JAN) 洋名:Tramazoline Hydrochloride(JAN)	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日	2010年5月24日(販売名変更による)
	薬価基準収載年月日	2010年11月19日(販売名変更による)
	販売開始年月日	1968年3月21日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元:アルフレッサ 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	アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部 TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212 医療関係者向けホームページ https://www.alfresa-pharma.co.jp/auth/confirm/ref=/medical/	

本IFは2021年3月改訂(第1版)の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

— 日本病院薬剤師会 —

(2020年4月改訂)

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)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り、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯……………1
2. 製品の治療学的特性……………1
3. 製品の製剤学的特性……………1
4. 適正使用に関して周知すべき特性……………1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項……………1
6. RMPの概要……………1

II. 名称に関する項目

1. 販売名……………2
2. 一般名……………2
3. 構造式又は示性式……………2
4. 分子式及び分子量……………2
5. 化学名(命名法)又は本質……………2
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号……………2

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………3
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………3
3. 有効成分の確認試験法, 定量法……………4

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形……………5
2. 製剤の組成……………5
3. 添付溶解液の組成及び容量……………5
4. 力価……………5
5. 混入する可能性のある夾雑物……………5
6. 製剤の各種条件下における安定性……………6
7. 調製法及び溶解後の安定性……………6
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)……………6
9. 溶出性……………6
10. 容器・包装……………6
11. 別途提供される資材類……………7
12. その他……………7

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果……………8
2. 効能又は効果に関連する注意……………8
3. 用法及び用量……………8
4. 用法及び用量に関連する注意……………8
5. 臨床成績……………8

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……………11
2. 薬理作用……………11

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移……………12
2. 薬物速度論的パラメータ……………12
3. 母集団(ポピュレーション)解析……………12
4. 吸収……………12
5. 分布……………13
6. 代謝……………13
7. 排泄……………13
8. トランスポーターに関する情報……………14
9. 透析等による除去率……………14
10. 特定の背景を有する患者……………14
11. その他……………14

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……………15
2. 禁忌内容とその理由……………15
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………15
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………15
5. 重要な基本的注意とその理由……………15
6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………15
7. 相互作用……………17
8. 副作用……………17
9. 臨床検査結果に及ぼす影響……………17
10. 過量投与……………18
11. 適用上の注意……………18
12. その他の注意……………18

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 19
2. 毒性試験 19

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分 21
2. 有効期間 21
3. 包装状態での貯法 21
4. 取扱い上の注意 21
5. 患者向け資材 21
6. 同一成分・同効薬 21
7. 国際誕生年月日 21
8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準
収載年月日, 販売開始年月日 21
9. 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 21
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその
内容 22
11. 再審査期間 22
12. 投薬期間制限に関する情報 22
13. 各種コード 22
14. 保険給付上の注意 22

XI. 文献

1. 引用文献 23
2. その他の参考文献 23

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 24
2. 海外における臨床支援情報 24

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたって
の参考情報 25
2. その他の関連資料 25

略 語 表

なし（個別に各項目において解説する。）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

トラマゾリン塩酸塩はドイツ・ベーリンガーインゲルハイム社の Berg によって合成されたイミダゾリン誘導体である。本剤は、強い血管収縮作用を示し、Engelhorn らによって点鼻用血管収縮剤として開発され、1965 年 9 月に販売名「トーク」で製造販売承認を得た。医療事故防止対策に基づき、2007 年 12 月に販売名を「トーク」から「トーク点鼻液 0.118%」に変更した。その後、2010 年 11 月に「トーク点鼻液 0.118%」から「トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」」に販売名を変更した。

また、効能又は効果について、1981 年 8 月 7 日に諸種疾患による鼻充血・うっ血に対して有効であることが推定できるとの再評価結果が通知された。

2. 製品の治療学的特性

(1)薬理学

本剤はイミダゾリン系化合物で、局所血管収縮作用を有し、鼻粘膜の充血を除去する点鼻用血管収縮剤である。（「VI.薬効薬理に関する項目」の項参照）

(2)安全性

主な副作用としては心悸亢進、悪心、乾燥感、刺激痛が報告されている。（「VIII.安全性（使用上の注意等）に関する項目」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない（RMP 策定対象外の事例）

Ⅱ.名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」

(2) 洋名

TRAMAZOLINE Nasal Solution 0.118%「AFP」

(3) 名称の由来

成分名より命名

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

トラマゾリン塩酸塩 (JAN)

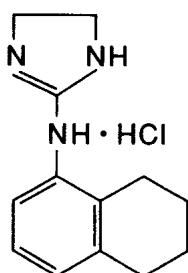
(2) 洋名(命名法)

Tramazoline Hydrochloride (JAN)

(3) ステム(stem)

アンタゾリン系抗ヒスタミン薬あるいは局所血管収縮薬：-azoline

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₃H₁₇N₃ · HCl

分子量：251.76

5. 化学名(命名法)又は本質

N-(5,6,7,8-tetrahydronaphthalen-1-yl)-4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-amine (IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

記号番号：KB-227

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～類白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。

(2) 溶解性

メタノールに極めて溶けやすく、水、酢酸（100）、エタノール（99.5）、1-ブタノール又はクロロホルムに溶けやすく、無水酢酸にやや溶けにくく、無水ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

吸湿性である。

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点：171～176℃（乾燥後）

(5) 酸塩基解離定数

pKa₁ = 10.56

pKa₂ = 1.64

(6) 分配係数

$$P_{\text{base}} = \frac{C_{\text{Octanol}}}{C_{0.1\text{mol/L NaOH}}} = 224 \quad (\log P_{\text{base}} = 2.35)$$

$$P_{\text{salt}} = \frac{C_{\text{Octanol}}}{C_{\text{buffer pH7}}} = 0.094 \quad (\log P_{\text{salt}} = -1.03)$$

(7) その他の主な示性値

水溶液（1→10）のpHは4.0～6.5

2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験項目：外観、水分含量、溶液の色、TLC、溶解性、含量、溶液の濁度

保存条件	保存形態	外観	水分含量	溶液の色	TLC	溶解性	含量	溶液の濁度
25℃ 58 ヶ月	褐色ビン	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内	低下	規格内
25℃ 80%RH 4 週間	褐色ビン	規格内	規格内	—	規格内	—	—	—

本品は吸湿性がある為、保存中に含量の低下がみられたが、TLCでは変化はみられなかった。

Ⅲ. 有効成分に関する項目

3. 有効成分の確認試験法, 定量法

確認試験法

局外規「トラマゾリン塩酸塩」の確認試験法による。

定量法

局外規「トラマゾリン塩酸塩」の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

点鼻剤

(2) 製剤の外観及び性状

性状：無色澄明の液剤、においはない

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

無菌に製されていない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販売名	有効成分	添加剤
トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」	1mL 中トラマゾリン 塩酸塩 1.18mg	ベンザルコニウム塩化物、D-ソルビトール、クエン酸水和物、リン酸水素ナトリウム水和物、塩化ナトリウム

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

6. 製剤の各種条件下における安定性

各種条件下における安定性

試験項目：外観、含量、TLC

保存条件	保存期間	外観	含量	TLC
4℃	12 ヶ月	規格内	規格内	規格内
25℃	36 ヶ月	規格内	規格内	規格内
35℃	36 ヶ月	規格内	規格内	TLC にかすかな異種スポット
45℃	12 ヶ月	やや褐色を帯びる	規格内	TLC にかすかな異種スポット

開栓後の安定性¹⁾

試験項目：主薬含量、防腐剤含量、色差、pH、性状

保存条件	保存期間	結果
室温、密栓	6 ヶ月	規格内

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

生理食塩液で希釈した場合²⁾

試験項目：外観、pH、定量

保存条件	希釈	保存期間	保存形態	結果
室温散光下	2 倍	1 ヶ月	褐色瓶及び ポリエチレン容器	規格内
	3 倍			規格内
	4 倍			規格内
	5 倍			規格内

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

(2) 包装

100mL、500mL [ガラス瓶 (褐色)]

IV. 製剤に関する項目

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

瓶：褐色ガラス瓶

キャップ：100mL ポリプロピレン・ポリエチレン製パッキン付きポリプロピレン製キャップ

500mL ポリエチレン製中栓付きポリプロピレン製キャップ

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

諸種疾患による鼻充血・うっ血

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

通常成人 1 回 2～3 滴を 1 日数回点鼻するか、又は 1 日数回噴霧する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

他のイミダズリン誘導体を比較薬剤とした二重盲検比較法

目的：本剤の有効性を他のイミダズリン誘導体と比較検討する。

試験デザイン：二重盲検群間比較試験

対象：急性及び慢性鼻炎、アレルギー性鼻炎、その他の鼻炎の患者 合計 562 例

試験方法：本剤及び比較薬剤（それぞれ 0.05 及び 0.1%）をプラスチック製噴霧容器に入れ、1 回 1 噴霧とし、必要に応じて 1 日数回鼻腔内に噴霧させた。観察期間は 24 時間とした。

評価項目：効果発現時間、作用持続時間、就寝前噴霧の効果

V. 治療に関する項目

結果：

[効果発現時間]

	0.05%溶液		0.1%溶液	
	本剤	比較薬剤	本剤	比較薬剤
	例数 (%)	例数 (%)	例数 (%)	例数 (%)
1分以内	35 (25.0)	36 (24.0)	17 (14.9)	11 (9.9)
1～2分	6 (4.3)	1 (0.7)	30 (26.3)	22 (19.8)
2～3分	18 (12.9)	13 (8.7)	27 (23.7)	34 (30.6)
3～4分	10 (7.1)	19 (12.7)	13 (11.4)	14 (12.6)
4～5分	3 (2.1)	5 (3.3)	5 (4.4)	4 (3.6)
5～6分	9 (6.4)	26 (17.3)	10 (8.8)	8 (7.2)
6～10分	44 (31.4)	33 (22.0)	8 (7.0)	13 (11.7)
10分以上	15 (10.7)	17 (11.3)	4 (3.5)	5 (4.5)
合計	140	150	114	111

効果発現時間については表に示す通りであった。

χ^2 検定の結果、同一薬剤で濃度が異なるものについてトラマゾリン、比較薬剤とも $p < 0.1\%$ で有意差が認められた。

同一濃度で薬剤の異なるものの比較では、0.05%溶液の場合 $1.0\% < p < 2.5\%$ となった。これは効果発現時間に6分以上を要した例がトラマゾリンに多かったためと考えられる。

0.1%溶液の場合は $60\% < p < 70\%$ であった。

[作用持続時間]

	0.05%溶液		0.1%溶液	
	本剤	比較薬剤	本剤	比較薬剤
	例数 (%)	例数 (%)	例数 (%)	例数 (%)
1分以内	29 (20.7)	19 (12.7)	12 (8.8)	16 (11.9)
1～2分	34 (24.3)	42 (28.0)	24 (17.7)	20 (14.9)
2～3分	28 (20.0)	32 (21.3)	16 (11.8)	15 (11.2)
3～4分	15 (10.7)	19 (12.7)	15 (11.0)	18 (13.4)
4～5分	16 (11.4)	18 (12.0)	16 (11.8)	17 (12.7)
5～6分	4 (2.9)	8 (5.3)	28 (20.6)	16 (11.9)
6～10分	4 (2.9)	2 (1.3)	13 (9.6)	23 (17.2)
10分以上	10 (7.1)	10 (6.7)	12 (8.8)	9 (6.7)
合計	140	150	136	134

V. 治療に関する項目

作用持続時間は表に示すとおりであった。

χ^2 検定では濃度の差による持続時間変化は両薬剤とも0.1%溶液のほうが $p < 0.1\%$ で有意に長かった。同濃度の薬剤間の差は0.05%溶液では $60\% < p < 70\%$ 、0.1%溶液では $30\% < p < 40\%$ であった。

[就寝前噴霧の効果]

就寝前噴霧の効果について、自覚症状として鼻呼吸自由、乾燥感、痂皮形成、睡眠障害を確認したところ、それぞれの症状において濃度による差は統計的に認められなかった。しかし、4種の症状を総合して χ^2 検定を行ったところ、トラマゾリン投与群では濃度による差が $1.0\% < p < 2.5\%$ で認められたが、比較薬剤では $50\% < p < 60\%$ であった。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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(一般使用成績調査, 特定使用成績調査, 使用成績比較調査), 製造販売後データベース調査, 製造販売後臨床試験の内容

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

イミダゾリン誘導体（ナファゾリン硝酸塩、テトラヒドロゾリン塩酸塩）

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

α 受容体を刺激することにより鼻腔内の局所血管を収縮し、鼻粘膜の充血、腫脹を除去する³⁻⁵⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 局所血管収縮作用

イヌの膣粘膜の血管、ウサギの眼瞼粘膜及び耳介の血管を収縮することが確認されている^{6,7)}。

2) 鼻粘膜腫脹に対する作用

慢性副鼻腔炎患者において、鼻粘膜の充血、腫脹を除去することが認められている⁵⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間⁸⁾

作用発現時間：3分

作用持続時間：7時間

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

<参考：サル>

点鼻投与した場合、5分で血中にあらわれ、24時間後までほぼ一定した濃度が継続した。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

吸収部位：鼻粘膜

吸収率：<参考：サル>

静注1時間後の肝分布量（投与量に対する%）を1とした場合、点鼻1時間後の肝分布量による吸収率比は0.27であった。

5. 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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

<参考：サル>

投与後 1 時間で肝に投与量の 4%が分布したが、その他の臓器への分布はわずかであった。

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種,寄与率

該当資料なし

(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活性比,存在比率

該当資料なし

<参考：サル>

尿中から回収した代謝産物については、アミン型のものであり、フェノール性およびカルボキシル性の代謝物は存在しない。

7. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

<参考：ラット>

尿中、糞中

(2) 排泄率

該当資料なし

<参考：ラット>

VII. 薬物動態に関する項目

経口投与した場合、24 時間で約 49%が尿中に、25%が糞中に排泄された。

(3) 排泄速度

該当資料なし

<参考：ラット>

「VII.7. (2) 排泄率」の項参照

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

「VIII.6.特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 乳児及び2歳未満の幼児 [9.7.1、13.1 参照]
- 2.3 モノアミン酸化酵素阻害剤投与中の患者 [10.1 参照]

(解説)

- 2.3 モノアミン酸化酵素阻害剤により体内のカテコラミンが増加し、本剤の血管収縮作用が増強され急激な血圧上昇を起こすおそれがある。

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

連用又は頻回使用により反応性の低下や局所粘膜の二次充血を起こすことがあるので、急性充血期に限って使用するか又は適切な休薬期間をおいて使用すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 冠動脈疾患のある患者

症状を悪化させるおそれがある。

9.1.2 高血圧症の患者

血圧が上昇するおそれがある。

9.1.3 甲状腺機能亢進症の患者

症状を悪化させるおそれがある。

9.1.4 糖尿病の患者

症状を悪化させるおそれがある。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(解説)

- 9. 1. 1 本剤の交感神経 α 受容体刺激作用により、症状を悪化させるおそれがある。
- 9. 1. 2 本剤の交感神経 α 受容体刺激作用により血圧が上昇し、血圧のコントロールに悪影響を及ぼすおそれがある。
- 9. 1. 3 本剤の交感神経 α 受容体刺激作用により、甲状腺機能亢進症の患者に認められる交感神経の興奮をさらに強めるおそれがある。
- 9. 1. 4 本剤の交感神経 α 受容体刺激作用によりインスリン分泌を抑制するため、血糖値のコントロールに悪影響を及ぼすおそれがある。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9. 5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

(6) 授乳婦

9. 6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9. 7 小児等

9. 7. 1 乳児及び2歳未満の幼児

投与しないこと。[2.2 参照]

9. 7. 2 2歳以上の幼児、小児

- ・過量投与により、発汗、徐脈等の全身症状があらわれやすいので使用しないことが望ましい。[13.1 参照]
- ・やむを得ず使用する場合には、精製水あるいは生食水にて倍量に希釈して使用することが望ましい。使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。

(8) 高齢者

9. 8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

10.1 併用禁忌（併用しないこと）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
モノアミン酸化酵素阻害剤 セレギリン塩酸塩（エフピー） ラサギリンメシル酸塩 （アジレクト） サフィナミドメシル酸塩 （エクフィナ） [2.3 参照]	急激な血圧上昇を起こすおそれがある。	本剤の血圧上昇作用を増強するおそれがある。

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	—	—	過敏症状
循環器	心悸亢進	—	—
消化器	悪心	—	嘔気
鼻	乾燥感、刺激痛	反応性充血	鼻灼熱感、鼻汁
長期使用	—	—	反応性の低下
その他	—	—	めまい、頭痛、味覚障害

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

交感神経α受容体刺激作用により疲労、不眠、めまい、嘔気、血圧の上昇や頻脈等の症状の発現が予測される。また、小児において体温低下、ショック及び反射性徐脈の報告がある。[2.2、9.7.2 参照]

13.2 処置

直ちに鼻を水で洗い、症状に応じて対症療法を行うこと。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

眼科用として使用しないこと。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

① 心臓に対する作用⁷⁾

家兔摘出心臓の灌流液に 5 μ g 添加では著しい影響を認めなかったが、10 μ g 以上の添加によって心運動の抑制と冠血管灌流量の減少を認めた。

② 気管支に対する作用⁶⁾

ウレタン麻酔下のモルモットに 5~500 μ g/kg を頸静脈に注射しても、アセチルコリンによる気管支痙攣は緩解しなかった。

③ 子宮に対する作用⁷⁾

家兔生体内子宮に対し 1 μ g/kg 以上の静注で、子宮は収縮し、その効果はアドレナリンとほぼ同等であった。

④ 腸管に対する作用⁹⁾

家兔摘出腸管運動に対して抑制的に働き、その作用強度はノルアドレナリンの 1/10 であった。

⑤ 呼吸に対する作用⁷⁾

家兔に 20 μ g/kg 以上静注すると呼吸は一過性に抑制された。

⑥ 酸素消費量に対する作用⁶⁾

0.25~20mg/kg 皮下内又は 5~20mg/kg 経口投与により酸素消費量の低下が認められた (ラット)。

(3) 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

LD₅₀ (mg/kg)

動物	投与経路	期間	経口	皮下	腹腔内
	マウス♂		48 時間	236.7	83.3
		7 日間	195	77	57

低用量で自発運動減少、音刺激への反応性現象を来たし、用量の増大に伴って、呼吸数減少、眼球突出、立毛、皮膚の蒼白化、振戦、痙攣を起こして死亡した。

(2) 反復投与毒性試験

体重約 110g の雄性 Wistar-King 系ラットに対し 25、5、1 および 0.2mg/kg を 6 ヶ月間

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

連日 1 日 1 回胃ゾンデにより経口投与し、投与終了後動物を全て屠殺剖検し、病理学的検査を行った。25mg/kg 投与群で体重増加の抑制および軽度の貧血が認められた以外には、各群とも体重変化、尿所見、血液所見に異常を認めなかった。主要臓器の重量を測定したところ、5、25mg/kg 投与群で副腎重量の増加傾向がみられた。また、5mg/kg 投与群に肝臓の脆弱化、25mg/kg 投与群に脾臓の萎縮及び副腎の肥大が認められた。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

1) マウスに 2.5、5、12.5、25mg/kg/日、ラットに 5、12.5、25mg/kg/日を経口投与したところ、薬物に起因すると考えられる催奇形作用は認められなかった¹⁰⁾。

2) マウスに 2.5、5、12.5、25mg/kg/日を経口投与したところ、12.5、25mg/kg/日投与群において、胎児死亡率は高率であり、内臓異常として水腎症が認められた。

また、ラットに 5、12.5、25mg/kg/日を経口投与したところ、25mg/kg/日投与群において、胎児死亡率は高率であった。

(6) 局所刺激性試験

覚醒家兎の結膜のうに 0.1%溶液 2 滴を滴下した場合、血管収縮による粘膜の蒼白化はみられたが、局所的炎症、角膜の変化、局所麻酔作用などの徴候は認められなかった⁶⁾。

(7) 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：トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」 劇薬
有効成分：トラマゾリン塩酸塩 劇薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

開栓後は汚染に注意すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無し、くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同効薬：ナファゾリン硝酸塩、テトラヒトロゾリン塩酸塩など

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 トーク点鼻液	1965年9月30日	14000AZZ05437	1965年12月1日	1968年3月21日
販売名変更 トーク点鼻液 0.118%	2007年8月31日 (販売名変更による)	21900AMX01215	2007年12月2日 (販売名変更による)	
販売名変更 トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」	2010年5月24日 (販売名変更による)	22200AMX00350	2010年11月19日 (販売名変更による)	

注) 不明箇所は空欄とした。

9. 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

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知年月日：1981年8月7日（第一次評価）

内容：各適応（効能又は効果）に対する評価判定
有効であることが推定できるもの
諸種疾患による鼻充血・うっ血

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省 薬価基準収載 医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算 処理システム用 コード
トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」	1324702Q1042	1324702Q1042	120224301	622022401

14. 保険給付上の注意

該当しない

1. 引用文献

- 1) 社内資料：トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」開栓後の安定性
- 2) 社内資料：トラマゾリン点鼻液 0.118%「AFP」希釈後安定性の試験結果
- 3) Jo De Mey, et al.:Circ Res. 1981 ; 48(6 Pt 1): 875-884
- 4) Lauger, S. Z. : Pharmacol.Rev. 1980 ; 32(4) : 337-362
- 5) 久保村雅夫：耳鼻と臨床. 1964 ; 10(4) : 256-260
- 6) Engelhorn, R. et al.:Arzneimittelforschung. 1962 ; 12 : 971-975
- 7) 林 五朗 他：日本薬理学雑誌. 1965 ; 61 : 479-489
- 8) 宮崎 和 他：耳鼻咽喉科展望. 1967 ; 10(補 3) : 230-234
- 9) Mujic, M. et al : Arch. Int. Pharmacodyn. 1965 ; 155(2) : 432
- 10) 中山良夫 他：日本薬理学雑誌. 1965 ; 61 : 490

2. その他の参考文献

日本薬局方外医薬品規格 2002, じほう

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

海外では発売されていない（2023年6月時点）

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし