

アドレナリン α_2 受容体作動薬

緑内障・高眼圧症治療剤

処方箋医薬品

注意—医師等の処方箋に
より使用すること

ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」

Brimonidine Tartrate Ophthalmic Solution 0.1%「NIT」

貯 法:室温保存、気密容器

使用期限:外箱及びラベルに表示(3年)

(使用期限内であっても、開封後は速やかに使用すること。)

ブリモニジン酒石酸塩点眼液

承認番号	30300AMX00141000
葉価収載	葉価基準未収載
販売開始	

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
(2) 低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の幼児(「小児等への投与」の項参照)

【組成・性状】

販売名	ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」
有効成分	ブリモニジン酒石酸塩
含量(1mL中)	1mg
添加物	塩化カルシウム水和物、塩化マグネシウム、ホウ酸、ホウ砂、ヒプロメロース、20%塩酸ポリヘキサニド液、塩化ナトリウム、塩化カリウム、pH調節剤
剤形	水性点眼剤(無菌製剤)
pH	6.7~7.5
浸透圧比	0.9~1.1
性状	微黄緑~黄緑色澄明の無菌水性点眼剤

【效能・効果】

次の疾患で、他の緑内障治療薬が効果不十分又は使用できない場合:
緑内障、高眼圧症

<效能・効果に関連する使用上の注意>

プロstagランジン関連薬や β 遮断薬等の他の緑内障治療で効果不十分又は副作用等で使用できない場合に本剤の使用を検討すること。

【用法・用量】

通常、1回1滴、1日2回点眼する。

【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)

- (1) 脳血管障害、起立性低血圧のある患者[血圧低下により、症状が悪化するおそれがある。]
(2) 心血管系疾患のある患者[血圧及び脈拍数の変動により、症状が悪化するおそれがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1) 全身的に吸収されるため、アドレナリン α_2 受容体作動薬の全身投与時と同様の副作用(眼気、めまい、徐脈、低血圧等)があらわれることがあるので留意すること。
(2) 眼気、めまい、霧視等を起こすことがあるので、本剤投与中の患者には、自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事する場合は注意させること。

3. 相互作用

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
降圧剤	降圧作用を増強する可能性がある。	本剤による交感神経抑制作用により、相加的に降圧作用が増強されると考えられる。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
中枢神経抑制剤 バルビツール酸 誘導体 オピオイド系鎮痛剤 鎮静剤 麻酔剤等 アルコール	鎮静作用を増強する可能性がある。	本剤による交感神經抑制作用により、相加的に鎮静作用が増強されると考えられる。
モノアミン酸化酵素阻害剤	血圧変動に影響する可能性がある。	ノルアドレナリンの代謝及び再取り込みに影響すると考えられる。

4. 副作用

生物学的同等性試験において、副作用は57例中3例(5.3%)6件に認められた。副作用は、眼瞼紅斑、結膜充血、結膜出血及び頭痛が各1例(1.8%)であった¹⁾。

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ため、副作用発現頻度は不明である。

副作用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。

種類\頻度	頻度不明
過敏症	接触性皮膚炎、丘疹、発疹、紅斑、蕁麻疹
眼	点状角膜炎、結膜炎(アレルギー性結膜炎を含む) ^{注)} 、眼瞼炎(アレルギー性眼瞼炎を含む) ^{注)} 、眼瞼紅斑、眼瞼浮腫、マイボーム腺梗塞、結膜充血、結膜浮腫、結膜濾胞、結膜蒼白、結膜出血、乾性角結膜炎、眼脂、眼そう痒症、眼刺激、眼痛、眼の異常感、眼の異物感、霧視、視覚障害、眼精疲労、眼乾燥、流涙増加、眼瞼障害、麦粒腫、角膜炎、角膜びらん、虹彩炎、白内障、硝子体剥離、硝子体浮遊物、視野欠損、視力低下、縮瞳、灼熱感、羞明、角膜混濁
循環器	徐脈、頻脈、低血圧、高血圧、動悸
呼吸器	鼻刺激感、咳嗽、呼吸困難、気管支炎、咽頭炎、鼻炎、副鼻腔炎、鼻乾燥
精神神経系	浮動性めまい、回転性めまい、頭痛、耳鳴、傾眠、不眠症、うつ病、失神
消化器	口内乾燥、口渴、胃腸障害、恶心、味覚異常
感染症	インフルエンザ症候群、感冒、呼吸器感染
その他	疣瘍、貧血、血中ビリルビン増加、血中ブドウ糖増加、血中トリグリセリド増加、血中尿酸増加、無力症、疲労、高コレステロール血症、気分不良

注)長期投与において、アレルギー性結膜炎・眼瞼炎の発現頻度が高くなる傾向が認められている。

5. 妊婦・産婦・授乳婦等への投与

(1) 妊婦

妊娠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。]

(2) 授乳婦

授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。
[動物実験(ラット:経口投与)で乳汁中に移行することが報告されている。]

6. 小児等への投与

- (1) 低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(国内における使用経験がない)。
- (2) 低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の幼児には投与しないこと。[外国での市販後において、乳児に無呼吸、徐脈、昏睡、低血圧、低体温、筋緊張低下、嗜眠、蒼白、呼吸抑制及び傾眠があらわれたとの報告がある。]
- (3) 外国での臨床試験において、0.2%ブリモニジン酒石酸塩点眼液を1日3回投与した場合2~7歳の幼児及び小児に高頻度(25~83%)で傾眠が認められている。

7. 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:**患者に対し次の点に注意するよう指導すること。
 - 1) 点眼に際して、患者は原則として仰向けの状態になり、患眼を開瞼し結膜囊内に点眼し、1~5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫した後開瞼すること。
 - 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。
 - 3) 他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分間以上の間隔をあけて点眼すること。

【薬効薬理】

＜生物学的同等性試験＞¹⁾

原発開放隅角緑内障(広義)又は高眼圧症患者において、ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」又は標準製剤(アイファガン点眼液0.1%)を、部分遮蔽、並行群間比較法により、両眼に1日2回、1回1滴、2週間反復点眼し、眼圧値を測定した。得られたパラメータ(治療期(2時間値)におけるベースラインからの眼圧変化量)について95%信頼区間法にて統計解析を行った結果、同等の許容域土1.2mmHgの範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

眼圧値の比較(mmHg)

	ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」 [#]	標準製剤(アイファガン点眼液0.1%) ^{##}
ベースライン	20.72±1.77	20.60±1.82
治療期(2時間値) (投与開始後1週及び2週の平均値)	16.70±1.78	16.66±2.17
眼圧変化量	-4.03±1.78	-3.93±1.91
製剤間差 [95%信頼区間]	-0.07 [-0.52~0.37]	

(平均値±標準偏差、[#]n=105、^{##}n=97)

＜作用機序＞²⁾

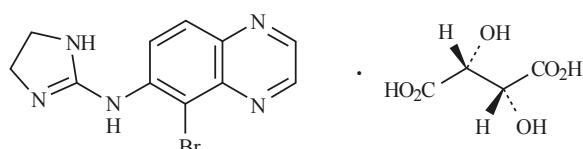
ブリモニジンは神経-効果器接合部の前膜に発現するアドレナリン α_2 受容体に作用して眼圧下降効果を示すことが示唆されている。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名:ブリモニジン酒石酸塩 (Brimonidine Tartrate)

化学名:5-Bromo-N-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)quinoxalin-6-amine mono-(2*R*, 3*R*)-tartrate

構造式:



分子式:C₁₁H₁₀BrN₅·C₄H₆O₆

分子量:442.22

性状:ブリモニジン酒石酸塩は白色～淡黄色の粉末である。

水にやや溶けやすく、エタノール(99.5)にほとんど溶けない。

旋光度[α]_D²⁰:+9.0~+10.5°(乾燥後、0.50g、水、50mL、100mm)

発売元

日東メディック株式会社
富山県富山市八尾町保内1-14-1

【取扱い上の注意】

＜安定性試験＞³⁾

最終包装形態を用いた加速試験(40°C、相対湿度75%、6ヶ月)の結果、ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」は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。

【包装】

ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」: 5mL×5本
5mL×10本

【主要文献】

- 1) 東亜薬品株式会社:ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」の生物学的同等性試験(社内資料)
- 2) Burke J, et al : Ann N Y Acad Sci, 763, 78-95 (1995)
- 3) 東亜薬品株式会社:ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「NIT」の安定性試験(社内資料)

【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下さい。

日東メディック株式会社 おぐすり相談窓口

〒104-0033 東京都中央区新川1-17-24

電話:03-3523-0345

FAX:03-3523-0346