

※※2017年7月改訂(第5版)
※2014年4月改訂

貯 法：室温保存
使用期限：外箱、容器に記載あり(使用期間：3年)
取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照

日本標準商品分類番号
871319

	承認番号	薬価収載	販売開始
1%	22100AMX01959	2009年11月	2009年11月
2%	22100AMX01960	2009年11月	2009年11月

緑内障・高眼圧症治療剤<カルテオロール塩酸塩>製剤

カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」

カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」

CARTEOLOL HYDROCHLORIDE OPHTHALMIC SOLUTION 1%/2%「WAKAMOTO」

〔禁忌(次の患者には投与しないこと)〕

1. コントロール不十分な心不全、洞性徐脈、房室ブロック(Ⅱ・Ⅲ度)、心原性ショックのある患者[β -受容体遮断による刺激伝導系抑制作用・心拍出量抑制作用により、これらの症状が増悪するおそれがある。]
2. 気管支喘息、気管支痙攣又はそれらの既往歴のある患者、重篤な慢性閉塞性肺疾患のある患者[β -受容体遮断による気管支平滑筋収縮作用により、これらの症状が増悪するおそれがある。]
3. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

〔組成・性状〕

販売名	カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」	カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」
剤形	点眼剤	
成分・含量(1mL中)	カルテオロール塩酸塩10mgを含有する。 添加物としてホウ酸、ホウ砂を含有する。	カルテオロール塩酸塩20mgを含有する。
pH	6.2~7.2	
浸透圧比	0.9~1.1(生理食塩液に対する比)	
性状	無色澄明の無菌製剤	

〔効能・効果〕

- 緑内障、高眼圧症

〔用法・用量〕

通常、1%製剤を1回1滴、1日2回点眼する。
なお、十分な効果が得られない場合は、2%製剤を用いて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) 肺高血圧による右心不全の患者[心機能を抑制し症状が増悪するおそれがある。]
 - (2) うっ血性心不全の患者[心機能を抑制し症状が増悪するおそれがある。]
 - (3) コントロール不十分な糖尿病の患者[低血糖症状を起こしやすく、かつ症状をマスクしやすいので血糖値に注意すること。]
 - (4) 糖尿病性ケトアシドーシス及び代謝性アシドーシスのある患者[アシドーシスによる心筋収縮力の抑制を増強するおそれがある。]
2. 重要な基本的注意
全身的に吸収され、 β 遮断剤全身投与時と同様の副作用があらわれることがあるので、留意すること。

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
β遮断剤(全身投与)	全身的な β 遮断作用が増強することがあるので、減量するなど注意すること。	相加的に β 遮断作用を増強させる。
交感神経系に対し抑制的に作用する他の薬剤 レセルピン等	過剰の交感神経抑制を来すおそれがあるので、減量するなど注意すること。	相加的に交感神経抑制作用を増強させる。
カルシウム拮抗剤 ベラパミル塩酸塩 ジルチアゼム塩酸塩	徐脈、房室ブロック等の伝導障害、うっ血性心不全等があらわれることがある。併用する場合には用量に注意すること。	相互に作用が増強される。
アドレナリン	類薬(チモロールマレイン酸塩点眼液)でアドレナリンの散瞳作用が助長されたとの報告がある。	アドレナリンの β 作用のみが遮断され、 α 作用が優位になる。

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。(再審査対象外)
全身症状があらわれた場合には投与を中止すること。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

- 1) 喘息発作 喘息発作を誘発することがあるので、咳・呼吸困難等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) 失神 高度な徐脈に伴う失神があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 3) 房室ブロック、洞不全症候群、洞停止等の徐脈性不整脈、うっ血性心不全、冠攣縮性狭心症 房室ブロック、洞不全症候群、洞停止等の徐脈性不整脈、うっ血性心不全、冠攣縮性狭心症があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) 類薬で、眼類天疱瘡、脳虚血、脳血管障害、全身性エリテマトーデスの報告がある。

(2) その他の副作用

	頻度不明
眼	眼刺激症状(しみる感じ、疼痛、灼熱感、かゆみ、乾燥感等)、霧視、異物感、眼脂、結膜炎、眼瞼炎、眼瞼腫脹、羞明感、角膜障害(角膜炎、角膜びまん性混濁、角膜びらん等)、眼瞼発赤、眼底黄斑部の浮腫・混濁 ^(注1) 、視力異常
循環器	徐脈、胸痛、不整脈、動悸、低血圧
呼吸器	呼吸困難、咽喉頭症状(違和感等)、鼻症状(くしゃみ、鼻水、鼻づまり)、咳

	頻度不明
その他	頭痛、不快感、倦怠感、めまい、悪心、味覚異常(苦味等)、皮膚炎、血糖値の低下、発疹、筋肉痛、こわばり(四肢等)、脱力感、抑うつ、重症筋無力症の増悪 ^{注2)}

注1) 無水晶体眼又は眼底に病変のある患者等に長期連用してあらわれることがあるので、定期的に視力測定、眼底検査を行うなど観察を十分に行うこと。

注2) 類薬で発現したとの報告がある。

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ため、注意すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 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。]

(2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、投与する場合は授乳を避けさせること。[動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。]

7. 小児等への投与

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(使用経験がない)。(食事摂取不良等体調不良の状態の患児にカルテオロール塩酸塩点眼液1%・2%を投与した症例で低血糖が報告されている。低血糖症状があらわれた場合には、経口摂取可能な状態では角砂糖、あめ等の糖分の摂取、意識障害、痙攣を伴う場合には、ブドウ糖の静注等を行い、十分に経過観察すること。)

8. 適用上の注意

(1) 投与経路 点眼用にのみ使用すること。

(2) 薬剤交付時 次のことを患者へ指導すること。

- 1) 原則として結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉眼と共に涙嚢部を圧迫すること。
- 2) 点眼するとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- 3) 点眼するとき、液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。

【薬効薬理】

1. 正常眼圧に対する眼圧下降作用(ウサギ)

有色ウサギの正常眼圧に、本剤又は生理食塩液を点眼した結果、本剤は生理食塩液に比して有意な眼圧下降作用を示した¹⁾²⁾。

生物学的同等性試験

本剤及び標準製剤を有色ウサギに点眼後、眼圧値の時間曲線下面積(AUC)を同等性の指標とし、得られた値の平均値の差を90%信頼区間法にて解析を行った。その結果、平均値の差の90%信頼区間が標準製剤の±20%の範囲内であったことから、両製剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	AUC _{0-6hr} (mmHg·hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」	143.3±2.8
標準製剤(点眼液、1%)	140.8±1.7

(Mean±S.E., n=10)

試験物質	AUC _{0-6hr} (mmHg·hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」	152.5±2.0
標準製剤(点眼液、2%)	149.4±1.5

(Mean±S.E., n=10)

2. 水負荷高眼圧モデルに対する作用(ウサギ)

白色ウサギに37℃の水道水を飲水させ誘発した眼圧上昇に対し、本剤は生理食塩液に比して有意な眼圧上昇の抑制作用を示した¹⁾²⁾。

生物学的同等性試験

水負荷後の眼圧値の時間曲線下面積(AUC)を同等性の指標とし、得られた値の平均値の差を90%信頼区間法にて解析を行った。その結果、平均値の差の90%信頼区間が標準製剤の±20%の範囲内であったことから、両製剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	AUC _{0-2hr} (mmHg·hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」	56.4±1.3
標準製剤(点眼液、1%)	56.5±1.0

(Mean±S.E., n=12)

試験物質	AUC _{0-2hr} (mmHg·hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」	54.0±1.0
標準製剤(点眼液、2%)	52.1±1.5

(Mean±S.E., n=12)

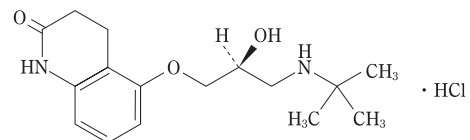
AUCについては被験個体の選択、測定回数・時間などの試験条件によって異なる可能性がある。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名 カルテオロール塩酸塩(Carteolol Hydrochloride)
(JAN)

化学名 5-[(2RS)-3-(1,1-Dimethylethyl)amino-2-hydroxypropyloxy]-3,4-dihydroquinolin-2(1H)-one monohydrochloride

構造式



及び鏡像異性体

分子式 C₁₆H₂₄N₂O₃ · HCl

分子量 328.83

性状 本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。本品は水にやや溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)又は酢酸(100)に極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。本品1.0gを水100mLに溶かした液のpHは5.0～6.0である。本品の水溶液(1→20)は旋光性を示さない。融点：約277℃(分解)。

【取扱い上の注意】

1. 本剤は、フィルターを装着した特殊な容器(NP容器)を使用している。患者には使用方法を指導すること。

2. 安定性試験

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、1%及び2%ともに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³⁾⁴⁾。

【包装】

カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」

5 mL×5本

カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」

5 mL×5本、5 mL×10本

〔主要文献〕

- 1) 岡部 毅 他(わかもと製薬)：カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」の研究報告〔生物学的同等性試験〕(社内資料)
- 2) 岡部 毅 他(わかもと製薬)：カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」の研究報告〔生物学的同等性試験〕(社内資料)
- 3) 鈴木秀一 他(わかもと製薬)：カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」の研究報告〔安定性試験〕(社内資料)
- 4) 鈴木秀一 他(わかもと製薬)：カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」の研究報告〔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ください。

わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション
〒103-8330 東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号
TEL 03-3279-0379
FAX 03-3279-1272

