

緑内障・高眼圧症治療剤

**** カルテオロール 塩酸塩点眼液 1%「ニットー」**

**** カルテオロール 塩酸塩点眼液 2%「ニットー」**

**** Carteolol Hydrochloride Ophthalmic Solution 1%「NITTO」**

**** Carteolol Hydrochloride Ophthalmic Solution 2%「NITTO」**

* 貯法：室温保存、気密容器(外箱開封後は遮光して保存すること)
 使用期限：3年、外箱等の表示を参照
 (使用期限内であっても開封後は速やかに使用すること。)

カルテオロール塩酸塩点眼液

	1%	2%
** 承認番号	23100AMX00031000	23100AMX00032000
** 薬価収載	2019年6月	
販売開始	1999年7月	

【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

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ため、副作用発現頻度は不明である。

(1) 重大な副作用

- 1) 喘息発作 (頻度不明)：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 (頻度不明)：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 (頻度不明)：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 (頻度不明) の報告がある。

(2) その他の副作用

種類\頻度	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
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)}

****【組成・性状】**

販売名	カルテオロール塩酸塩点眼液1%「ニットー」	カルテオロール塩酸塩点眼液2%「ニットー」
有効成分	日局 カルテオロール塩酸塩	
含量(1mL中)	10mg	20mg
添加物	塩化ナトリウム、リン酸二水素ナトリウム水和物、リン酸水素ナトリウム水和物、濃ベンザルコニウム塩化物液50、pH調節剤	
剤形	水溶性点眼剤(無菌製剤)	
pH	6.2~7.2	
浸透圧比	0.9~1.1	
性状	無色澄明の水溶性点眼剤	

【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。

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ので、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(使用経験が少ない)。[食事摂取不良等体調不良の状態の患児に本剤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

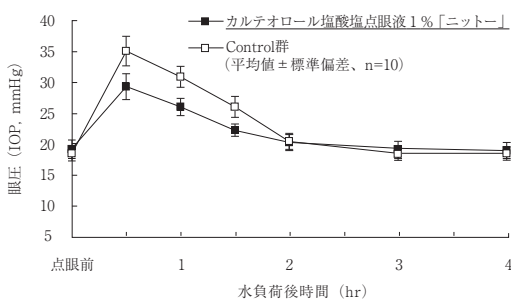
- (1) 投与経路：点眼用のみ使用すること。
- (2) 投与時：
 - 1) 点眼に際して、患者は原則として仰向けの状態になり、患眼を開眼し結膜のう内に点眼し、1～5分間閉眼して涙のう部を圧迫した後開眼すること。
 - 2) 点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。

**【薬効薬理】

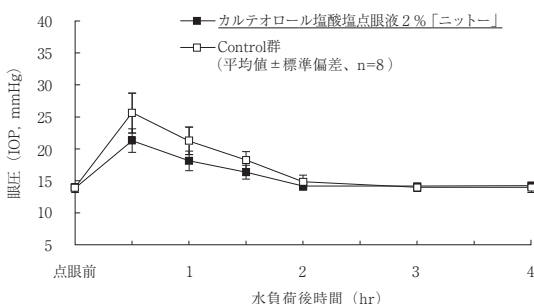
ウサギ水負荷眼圧上昇モデルに対する眼圧上昇抑制作用¹⁾

ウサギ水負荷眼圧上昇モデルに対して、カルテオロール塩酸塩点眼液1%「ニットー」及びカルテオロール塩酸塩点眼液2%「ニットー」を水負荷5分前に100 μ Lずつ点眼し、点眼前、水負荷0.5、1、1.5、2、3及び4時間後に眼圧を測定し、眼圧上昇抑制作用を調べた。その結果、カルテオロール塩酸塩点眼液1%「ニットー」及びカルテオロール塩酸塩点眼液2%「ニットー」では水負荷0.5から1.5時間後においてControl群に対して有意に眼圧を低下させた。

ウサギの水負荷による眼圧上昇に対する作用のグラフ(1%製剤)



ウサギの水負荷による眼圧上昇に対する作用のグラフ(2%製剤)



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

製造販売元

東亜薬品株式会社

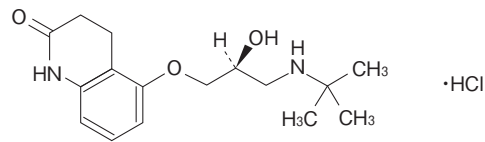
富山県富山市水橋開発277番10

【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)

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：カルテオロール塩酸塩は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

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。

水溶液(1→20)は旋光性を示さない。

融点：約277°C(分解)。

**【取扱い上の注意】

〈安定性試験〉²⁾

最終包装形態を用いた相対比較試験(40°C、75%RH、3ヶ月)の結果、カルテオロール塩酸塩点眼液1%「ニットー」及びカルテオロール塩酸塩点眼液2%「ニットー」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】

カルテオロール塩酸塩点眼液1%「ニットー」：5mL×5本
5mL×10本

カルテオロール塩酸塩点眼液2%「ニットー」：5mL×5本
5mL×10本

**【主要文献】

- 1) 東亜薬品株式会社：カルテオロール塩酸塩点眼液1%「ニットー」、カルテオロール塩酸塩点眼液2%「ニットー」の生物学的同源性試験(社内資料)
- 2) 東亜薬品株式会社：カルテオロール塩酸塩点眼液1%「ニットー」、カルテオロール塩酸塩点眼液2%「ニットー」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 おくすり相談窓口

〒104-0033 東京都中央区新川1-17-24

電話：03-3523-0345

FAX：03-3523-0346