

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 2013 に準拠して作成

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 LA点眼液1%「わかもと」

カルテオロール塩酸塩 LA点眼液2%「わかもと」

CARTEOLOL HYDROCHLORIDE LA OPHTHALMIC SOLUTION 1%/2% WAKAMOTO

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	カルテオロール塩酸塩LA点眼液1%「わかもと」 ：1mL中にカルテオロール塩酸塩10mgを含有 カルテオロール塩酸塩LA点眼液2%「わかもと」 ：1mL中にカルテオロール塩酸塩20mgを含有
一般名	和名：カルテオロール塩酸塩 (JAN) 洋名：Carteolol Hydrochloride (JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2013年 8月 15日 薬価基準収載年月日：2013年 12月 13日 発売年月日：2013年 12月 13日
開発・製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元：わかもと製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション TEL：03-3279-0379 FAX：03-3279-1272 医療関係者向けホームページ：http://www.wakamoto-pharm.co.jp/

本IFは2017年10月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

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、添付文書と略す)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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」(以下、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適應症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	13
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	13
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	13
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	13
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	13
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	13
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	14
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	15
7. CAS登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	15
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	15
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	16
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	16
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	16
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	16
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	17
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	17
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	5	2. 毒性試験	17
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	X. 管理的事項に関する項目	18
5. 製剤の各種条件下における安定性	5	1. 規制区分	18
6. 溶解後の安定性	5	2. 有効期間又は使用期限	18
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	3. 貯法・保存条件	18
8. 溶出性	5	4. 薬剤取扱い上の注意点	18
9. 生物学的試験法	5	5. 承認条件等	18
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	5	6. 包装	18
11. 製剤中の有効成分の定量法	5	7. 容器の材質	18
12. 力価	6	8. 同一成分・同効薬	18
13. 混入する可能性のある夾雑物	6	9. 国際誕生年月日	19
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
15. 刺激性	6	11. 薬価基準収載年月日	19
16. その他	6	12. 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	19
V. 治療に関する項目	7	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
1. 効能又は効果	7	14. 再審査期間	19
2. 用法及び用量	7	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
3. 臨床成績	7	16. 各種コード	19
VI. 薬効薬理に関する項目	8	17. 保険給付上の注意	19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	8	XI. 文献	20
2. 薬理作用	8	1. 引用文献	20
VII. 薬物動態に関する項目	10	2. その他の参考文献	20
1. 血中濃度の推移・測定法	10	XII. 参考資料	20
2. 薬物速度論的パラメータ	10	1. 主な外国での発売状況	20
3. 吸収	11	2. 海外における臨床支援情報	20
4. 分布	11	XIII. 備考	20
5. 代謝	11	その他の関連資料	20
6. 排泄	12		
7. トランスポーターに関する情報	12		
8. 透析等による除去率	12		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

一般に緑内障は年齢とともに徐々に進行し、しかも失われた視野は元に戻らないため、生涯にわたり継続的に眼圧をコントロールする必要があります¹⁾。このため、薬剤の選択では、眼圧下降効果及び安全性が重要です。また、点眼薬の使用感が患者のアドヒアランス不良につながる可能性があります。アドヒアランス不良は、緑内障が進行する重要な要因の一つであることから¹⁾、忍容性の良い持続性点眼液が求められてきました。

弊社では、点眼剤の添加剤として汎用されているホウ酸、マンニトールに着目し、粘性を上げることなく、薬剤の眼表面での滞留性を向上させ、眼内移行量を増加させる製剤処方を見出し、1日1回点眼製剤を開発致しました。

本剤はβ遮断作用を有するカルテオロール塩酸塩を有効成分とする1日1回点眼の点眼剤であり、2013年8月に製造承認を取得し、2013年12月の販売に至りました。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) カルテオロール塩酸塩を有効成分とし、ホウ酸とマンニトールを用いた1日1回点眼の持続性点眼液です。
- (2) 生物学的同等性試験により、標準製剤との同等性が確認されています。
(VI. 薬効薬理に関する項目-2. 薬理作用 (2) 薬効を裏付ける試験成績の項 参照)
- (3) ベンザルコニウム塩化物濃度は0.001%です。
- (4) 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ません。(再審査対象外) カルテオロール塩酸塩持続性点眼液の重大な副作用(頻度不明)として喘息発作、失神、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、冠攣縮性狭心症の報告があります。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ります。(「VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目-8. 副作用」の項 参照)

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

カルテオロール塩酸塩LA点眼液1%「わかもと」

カルテオロール塩酸塩LA点眼液2%「わかもと」

(2) 洋名

CARTEOLOL HYDROCHLORIDE LA OPHTHALMIC SOLUTION 1% 「WAKAMOTO」

CARTEOLOL HYDROCHLORIDE LA OPHTHALMIC SOLUTION 2% 「WAKAMOTO」

(3) 名称の由来

有効成分名、剤形、濃度及び社名

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

カルテオロール塩酸塩 (JAN)

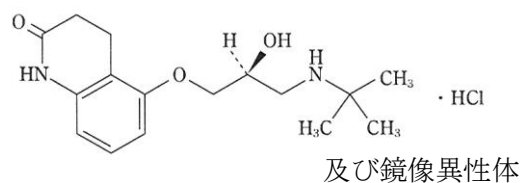
(2) 洋名(命名法)

Carteolol Hydrochloride (JAN)

(3) ステム

β-アドレナリン受容体拮抗薬 - olol

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₆H₂₄N₂O₃ · HCl

分子量：328.83

5. 化学名(命名法)

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：塩酸カルテオロール

7. CAS登録番号

51781-21-6

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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はほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：約277℃ (分解)

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

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。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「カルテオロール塩酸塩」の確認試験法による

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「カルテオロール塩酸塩」の定量法による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

点眼

(2) 剤形の区別、外観及び性状

剤形の区別：点眼剤

外観及び性状：無色澄明の無菌製剤

(3) 製剤の物性

該当資料なし

(4) 識別コード

カルテオロール塩酸塩LA点眼液1%「わかもと」

キャップの色：クリーム色

キャップ天面：

カルテオロール塩酸塩LA点眼液2%「わかもと」

キャップの色：抹茶色

キャップ天面：

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等

pH：6.8～7.4

浸透圧比：0.9～1.1（生理食塩液に対する比）

(6) 無菌の有無

無菌製剤である。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 1% 「わかもと」：1mL 中にカルテオロール塩酸塩 10mg を含有

カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 2% 「わかもと」：1mL 中にカルテオロール塩酸塩 20mg を含有

(2) 添加物

ホウ酸、D-マンニトール、ベンザルコニウム塩化物、pH調節剤

(3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

[加速試験^{2),3)}]

試験項目：含量、性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌

保存条件	保存期間	保存形態	結果
40±1℃、75±5%RH	6 ヶ月	ポリエチレン製点眼容器 (シュリンクラベルなし)	規格に適合

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

別資料参照

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

(1) 紫外可視吸光度測定法 (吸収極大波長：214～218nm及び250～254nm)

(2) 薄層クロマトグラフィー

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

12. カ価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

15. 刺激性

眼刺激性試験⁴⁾

白色ウサギ6羽にカルテオロール塩酸塩LA点眼液2%「わかもと」、生理食塩液を1回50 μ L、30分間隔で10回点眼し、初回点眼後、最終点眼1時間後及び点眼翌日に、前眼部障害度をDraizeらの判断基準に従って観察した結果、カルテオロール塩酸塩LA点眼液2%「わかもと」、生理食塩液ともに障害性は認められなかった。

16. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

緑内障、高眼圧症

2. 用法及び用量

通常、1%製剤を1回1滴、1日1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1回点眼する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

他の点眼剤を併用する場合には、本剤投与前に少なくとも10分間の間隔をあけて投与すること。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

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

チモロールマレイン酸塩、ベタキソロール塩酸塩、ニプラジロール、レボブノロール塩酸塩等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：眼組織

作用機序：アドレナリンβ受容体の非選択的遮断薬である。

眼圧下降作用は主として房水産生の抑制によるものとされている。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 眼圧下降作用

健康成人男子に、本剤の1%又は2%を1回1滴点眼した結果、点眼前に比して有意な眼圧下降が認められた^{5,6)}。

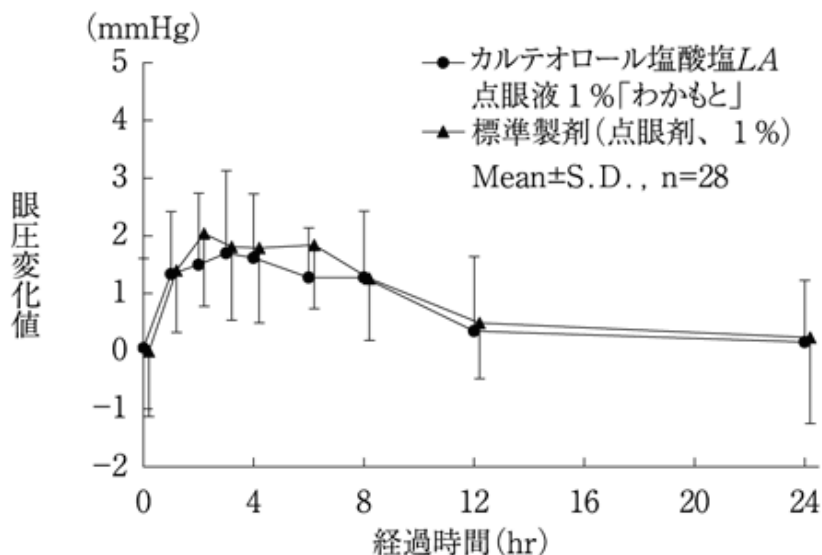
2) 生物学的同等性試験

本剤と標準製剤を健常成人男子に1日1回両眼の結膜囊内に点眼し、2群（クロスオーバー法）の眼圧値を測定した。点眼前後における眼圧最大変化値（ ΔP_{\max} ）及び眼圧変化値 - 時間曲線下面積（ ΔAUC_{0-24hr} ）を同等性の指標とし、得られた対数値の平均値の差を90%信頼区間法にて解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された^{5,6)}。

正常眼圧に対する作用：カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 1% 「わかもと」

	ΔP_{\max} (mmHg)	ΔAUC_{0-24h} (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 1% 「わかもと」	2.84±0.87	21.04±12.01
標準製剤(点眼剤、1%)	2.97±0.91	24.25±12.66

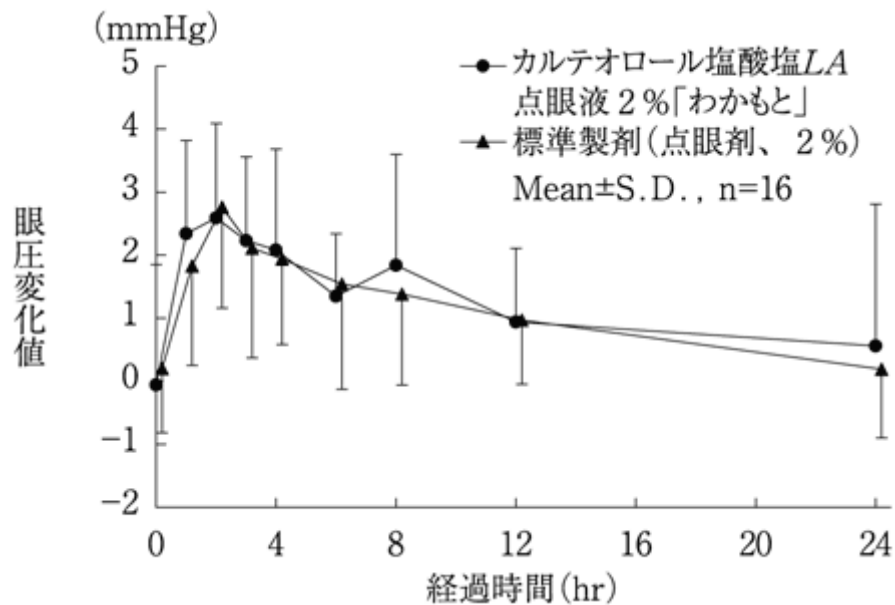
(Mean±S.D., n=28)



正常眼圧に対する作用：カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 2% 「わかもと」

	ΔP_{\max} (mmHg)	ΔAUC_{0-24h} (mmHg · hr)
カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 2% 「わかもと」	3.49±1.59	31.90±25.37
標準製剤(点眼剤、2%)	3.33±1.41	28.35±17.66

(Mean±S.D., n=16)



ΔP_{\max} 並びに ΔAUC のパラメータは、被験者の選択、眼圧測定回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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

5. 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 (CYP450等) の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

[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、これらの症状が憎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、これらの症状が憎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. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

<用法・用量に関連する使用上の注意>

他の点眼剤を併用する場合には、本剤投与前に少なくとも10分間の間隔をあけて投与すること。

5. 慎重投与内容とその理由

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憎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憎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。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (1) 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。
- (2) 併用の場合に当たっては、本剤を最後に点眼するよう指導すること。やむを得ず本剤を使用した後、他の点眼剤を使用する場合には、十分な間隔をあけるよう指導すること。

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

該当しない

(2) 併用注意とその理由

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。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

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。**

(3) 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
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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

[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

9. 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。

10. 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。]

11. 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%(1日2回点眼)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。)

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

- | |
|---|
| <p>(1) 投与経路 点眼用にのみ使用すること。</p> <p>(2) 薬剤交付時 次のことを患者へ指導すること。</p> <p>1) 原則として結膜囊内に点眼し、1～5 分間閉瞼と共に涙嚢部を圧迫すること。</p> <p>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。</p> <p>3) 点眼のとき、液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。</p> |
|---|

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

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」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

眼刺激性⁴⁾

白色ウサギ6羽にカルテオロール塩酸塩LA点眼液2%「わかもと」、生理食塩液を1回50 μ L、30分間隔で10回点眼し、初回点眼後、最終点眼1時間後及び点眼翌日に、前眼部障害度をDraizeらの判断基準に従って観察した結果、カルテオロール塩酸塩LA点眼液2%「わかもと」、生理食塩液ともに障害性は認められなかった。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない
有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期間：3年

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

(2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

- ・「Ⅷ. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目-14. 適用上の注意」の項 参照
- ・くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 1% 「わかもと」：2.5mL×5 本

カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 2% 「わかもと」：2.5mL×5 本、2.5mL×10 本

7. 容器の材質

ボ ト ル：ポリエチレン

中 栓：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

ラ ベ ル：ポリエチレンテレフタレート

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ミケラン点眼液 1%、ミケラン点眼液 2%、ミケラン LA 点眼液 1%、
ミケラン LA 点眼液 2%

同 効 薬：チモロールマレイン酸塩、ベタキソロール塩酸塩等

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 1%「わかもと」	2013 年 8 月 15 日	22500AMX01617
カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 2%「わかもと」	2013 年 8 月 15 日	22500AMX01618

11. 薬価基準収載年月日

2013年12月13日

12. 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

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT（9桁）番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 1%「わかもと」	122820501	1319701Q3032	622282001
カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 2%「わかもと」	122821201	1319701Q4039	622282101

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 日本緑内障学会緑内障診療ガイドライン作成委員会：
緑内障診療ガイドライン（第3版）. 日眼会誌116, 3-46, 2012
- 2) わかもと製薬株式会社 社内資料 [カルテオロール塩酸塩LA点眼液1% 「わかもと」 加速試験]
- 3) わかもと製薬株式会社 社内資料 [カルテオロール塩酸塩LA点眼液2% 「わかもと」 加速試験]
- 4) わかもと製薬株式会社 社内資料 [眼刺激性試験]
- 5) わかもと製薬株式会社 社内資料 [カルテオロール塩酸塩LA点眼液1% 「わかもと」 生物学的同等性試験]
- 6) わかもと製薬株式会社 社内資料 [カルテオロール塩酸塩LA点眼液2% 「わかもと」 生物学的同等性試験]

2. その他の参考文献

- ・第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店, p. C-1301 (2016)

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料