

※※2021年8月改訂(第3版)
※2021年6月改訂

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

アドレナリン α_2 受容体作動薬
緑内障・高眼圧症治療剤<ブリモニジン酒石酸塩>製剤
処方箋医薬品^注

日本標準商品分類番号
871319

承認番号	薬価収載	販売開始
30300AMX00133	**、*2021年6月	**2021年8月

ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」

BRIMONIDINE TARTRATE OPHTHALMIC SOLUTION 0.1%「WAKAMOTO」

〔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%「わかもと」
成分・含量 (1mL中)	ブリモニジン酒石酸塩1mgを含有 添加物として塩化マグネシウム、ホウ砂、 カルメロースナトリウム、亜塩素酸ナトリウム、 塩化ナトリウム、塩化カリウム、塩化カルシウム 水和物、pH調節剤を含有
性状・剤形	微黄緑～黄緑色澄明の水溶性点眼剤(無菌製剤)
pH	6.7～7.5
浸透圧比	0.9～1.1(生理食塩液に対する比)

〔効能・効果〕

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

<効能・効果に関連する使用上の注意>

プロスタグランジン関連薬や 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(眠気、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)眠気、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。	本剤による交感神経抑制作用により、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

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)

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。

	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、口渇、胃腸障害、悪心、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	疣贅、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。]

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

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) **投与时**：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、患眼を開眼し結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉眼して涙嚢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。
 - 3) 他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上の間隔をあけて点眼すること。

〔薬物動態〕

生物学的同等性試験

ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」は、標準製剤の分析結果に基づき添加剤の種類及び含量(濃度)が標準製剤と同一となるよう処方設計を行ったものであり、pH、粘度、浸透圧などの物理化学的性質が近似することから、生物学的に同等とみなされた。

〔薬効薬理〕

作用機序

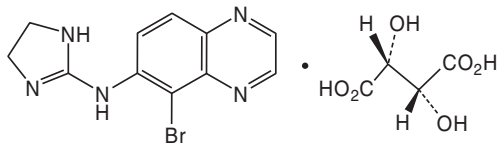
ブリモニジンは、アドレナリン α_2 受容体に作用し、房水産生の抑制及びびどう膜強膜流出路を介した房水流出の促進により眼圧を下降させると考えられている¹⁾。
・高眼圧症患者の片眼に0.2%ブリモニジン酒石酸塩点眼液を点眼した試験(フルオロフォトメトリー法)において、房水産生の抑制及びびどう膜強膜流出路からの房水流出の促進が認められた²⁾。

〔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-1H-imidazol-2-yl)quinoxalin-6-amine mono-(2R,3R)-tartrate

構造式



分子式 $C_{11}H_{10}BrN_5 \cdot C_4H_6O_6$

分子量 442.22

性状 本品は白色～淡黄色の結晶性の粉末または粉末である。水にやや溶けやすく、メタノールに溶けにくく、N-メチルピロリドン及びアセトンにほとんど溶けない。

〔取扱い上の注意〕

1. 使用期限内であっても、開栓後は速やかに使用すること。
2. **安定性試験**
加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、室温保存において3年間安定であることが推測された³⁾。

〔包装〕

ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」
5 mL×5本、5 mL×10本

〔主要文献〕

- 1) Burke, J. et al. : Surv. Ophthalmol., 41 Suppl. 1, S9, 1996.
- 2) Toris, C. B. et al. : Arch. Ophthalmol., 113, 1514, 1995.
- 3) わかもと製薬株式会社 社内資料(安定性試験)

〔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



製造販売元

わかもと製薬株式会社
東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号

©-1 2021.8