

眼圧下降剤

ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」

Brinzolamide Ophthalmic Suspension 1%「NITTO」

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋に

より使用すること

ブリンゾラミド懸濁性点眼液

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）

承認番号	23000AMX00395000
薬価収載	2018年6月
販売開始	2018年6月

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- 重篤な腎障害のある患者〔使用経験がない。本剤及びその代謝物は、主に腎より排泄されるため、排泄遅延により副作用があらわれるおそれがある。〕

【組成・性状】

販売名	ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」
有効成分	ブリンゾラミド
含量（1mL中）	10mg
添加物	カルボキシビニルポリマー、チロキサポール、D-マンニトール、塩化ナトリウム、エデト酸ナトリウム水和物、濃ベンザルコニウム塩化物液50、pH調節剤
剤形	水性懸濁点眼剤（無菌製剤）
pH	7.0～8.0
浸透圧比	0.9～1.2
性状	白色～微黄白色の懸濁性点眼剤

【効能・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

【用法・用量】

通常、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には1回1滴、1日3回点眼することができる。

【使用上の注意】

- 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
 - 肝障害のある患者〔使用経験が少なく、安全性は確立していない。〕
 - 角膜障害（角膜内皮細胞の減少等）のある患者〔安全性は確立していない。角膜内皮細胞数の減少により角膜浮腫の発現が増加する可能性がある。〕
- 重要な基本的注意
 - 本剤は点眼後、全身的に吸収されるため、スルホンアミド系薬剤の全身投与時と同様の副作用があらわれるおそれがあるので注意すること。
重篤な副作用や過敏症の兆候があらわれた場合には、投与を中止すること。
 - 急性閉塞隅角緑内障患者に対して本剤を用いる場合には、薬物治療以外に手術療法などを考慮すること。
 - 本剤の点眼後、一時的に目がかすむことがあるので、機械類の操作や自動車等の運転には注意させること。

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
炭酸脱水酵素阻害剤（全身投与）：アセタゾラミド等	炭酸脱水酵素阻害剤の全身的な作用に対して相加的な作用を示す可能性があるため、異常が認められた場合には、投与を中止すること。	作用が相加的にあらわれる可能性がある。
アスピリン（大量投与）	本剤を大量のアスピリンと併用すると、双方又は一方の薬剤の副作用が増強されるおそれがあるため、異常が認められた場合には、投与を中止すること。	アスピリンは炭酸脱水酵素阻害剤の血漿蛋白結合と腎からの排泄を抑制し、炭酸脱水酵素阻害剤は血液のpHを低下させ、サリチル酸の血漿から組織への移行を高める可能性がある。

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。

その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には、投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。

種類\頻度	頻度不明
眼	霧視、眼瞼炎、乾燥感、異物感、充血、眼脂、不快感、眼痛、眼刺激、そう痒感、結膜炎（アレルギー性結膜炎を含む）、疲れ目、眼瞼辺縁痂皮、角膜炎、角膜上皮障害（点状角膜炎、角膜びらん等）、べとつき感、流涙、角結膜炎、複視、角膜浮腫
消化器	下痢、口内乾燥、消化不良、嘔気
皮膚	脱毛、皮膚炎、蕁麻疹、発疹
その他	味覚異常（苦味、味覚倒錯等）、頭痛、鼻炎、胸部痛、めまい、呼吸困難、咽頭炎、うつ病、鼻出血、咳嗽、緊張亢進、腎疼痛、疲労、赤血球数の減少、耳鳴、感覚鈍麻

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

- 動物実験で胎盤を通過することが報告されているので、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。〕
- 動物実験で乳汁中に移行することが報告されているので、授乳中の婦人には授乳を避けさせること。〔授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

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）。

8. 適用上の注意

- (1)投与経路：点眼用のみ使用すること。
- (2)投与时：患者に対し次の点に注意するよう指導すること。
 - 1)使用時、キャップを閉じたままよく振ってからキャップを開けて点眼すること。
 - 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)点眼に際しては、原則として仰臥位をとり、患眼を開瞼して結膜のう内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙のう部を圧迫させた後、開瞼すること。
 - 4)他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも10分以上間隔をあけてから点眼すること。
 - 5)本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物は、ソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、点眼時はコンタクトレンズをはずし、15分以上経過後装用すること。

【薬物動態】

ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」又は標準製剤（点眼剤、1%）を、部分遮蔽、並行群間比較法により原発開放隅角緑内障又は高眼圧症患者の両眼に1回1滴1日2回4週間反復点眼し、眼圧値を測定した試験（生物学的同等性試験¹⁾）にて、治療期4週の赤血球中ブリンゾラミド濃度を測定した結果、両剤に差はみられなかった。

【薬効薬理】

<生物学的同等性試験>¹⁾

ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」又は標準製剤（点眼剤、1%）を、部分遮蔽、並行群間比較法により原発開放隅角緑内障又は高眼圧症患者の両眼に1回1滴1日2回4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4週10時におけるベースライン（ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」：22.1±3.1mmHg、標準製剤（点眼剤、1%）：22.1±3.0mmHg）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±1.5mmHg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）

	ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」 [#]	標準製剤（点眼剤、1%） ^{##}
治療期4週（10時）	18.6±2.7	18.4±2.8
眼圧変化量	-3.4±2.1	-3.7±2.3
投与群間差 [95%信頼区間]	0.255 [-0.640～1.15]	

（平均値±標準偏差、[#]n=44、^{##}n=43）

<作用機序>²⁾

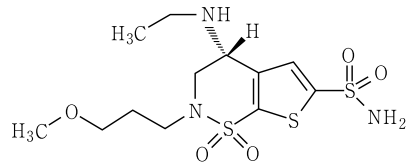
ブリンゾラミドは、Ⅱ型の炭酸脱水酵素を阻害することにより房水産生を抑制する。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ブリンゾラミド (brinzolamide)

化学名：(R)-4-(ethylamino)-3,4-dihydro-2-(3-methoxypropyl)-2H-thieno[3,2,e]-1,2-thiazine-6-sulfonamide 1,1-dioxide

構造式：



分子式：C₁₂H₂₁N₃O₅S₃

分子量：383.51

融点：129.5～132.5℃

性状：ブリンゾラミドは白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

エタノール（99.5）に溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

旋光度[α]_D²⁰：+10～+13°（乾燥物に換算したもの0.2g、

pH2.0のクエン酸・塩酸緩衝液、20mL、100mm）

【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℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「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】

ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」：5mL×5本
5mL×10本

【主要文献】

- 1) 東亜薬品株式会社：ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「ニットー」の生物学的同等性試験（社内資料）
- 2) 杉山正 他：薬局, 56（増刊号）, 485（2005）
- 3) 東亜薬品株式会社：ブリンゾラミド懸濁性点眼液1%「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

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