

※※2017年10月改訂(第6版)
※2014年4月改訂

貯 法：遮光、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
21900AMX00313	2007年7月	2007年7月

緑内障・高眼圧症治療剤<ニプラジロール>製剤

ニプラジロール点眼液0.25%「わかもと」

NIPRADILOL OPHTHALMIC SOLUTION 0.25% 「WAKAMOTO」

〔禁忌(次の患者には投与しないこと)〕

- 1.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、喘息発作の誘発・増悪がみられるおそれがある。]
- 2.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受容体遮断による陰性変時・変力作用により、これらの症状を増悪させるおそれがある。]
- 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	ニプラジロール点眼液0.25%「わかもと」
剤形	点眼剤
成分・含量(1mL中)	ニプラジロール2.5mgを含有する。 添加物としてホウ酸、ホウ砂、エデト酸ナトリウム水和物、希塩酸を含有する。
pH	6.5~7.5
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[β受容体遮断による陰性変時・変力作用により、症状を増悪させるおそれがある。]
- (2)うっ血性心不全の患者[β受容体遮断による陰性変時・変力作用により、症状を増悪させるおそれがある。]
- (3)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。]
- (4)コントロール不十分な糖尿病の患者[低血糖症状をマスクすることがあるので血糖値に注意すること。]

2.重要な基本的注意

全身的に吸収される可能性があり、β遮断薬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
カテコラミン枯渇剤 レセルピン等	交感神経系に対し過剰の抑制を来すこと があり、低血圧、徐脈を生じ、眩暈、失神、起立性低血圧を 起こすことがある。	カテコラミンの 枯渇を起こす薬 剤は、β遮断作 用を相加的に増 強する可能性が ある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
β遮断薬(全身投与) プロプラノロール塩 酸塩 アテノロール メトプロロール酒石 酸塩	眼圧下降あるいはβ 遮断薬の全身的な作 用が増強されること がある。	作用が相加的に あらわれること がある。
カルシウム拮抗薬 ジルチアゼム塩酸塩 ベラパミル塩酸塩	房室伝導障害、左室 不全、低血圧を起こ すおそれがある。	相互に作用が増 強されることが ある。
アドレナリン	類薬(チモロールマ レイン酸塩点眼液) において散瞳作用が 助長されたとの報告 がある。	機序不明

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)

(1)重大な副作用(頻度不明)

喘息発作を誘発することがある。これらの症状があらわれたときは投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2)重大な副作用(類薬)

類薬で以下の副作用があらわれたとの報告がある。

- 1)眼類天疱瘡
- 2)心ブロック、うっ血性心不全、心停止、洞不全症候群、脳虚血、脳血管障害
- 3)全身性エリテマトーデス
- (3)その他の副作用

	頻度不明
眼	結膜充血、表層角膜炎、角膜びらん、眼瞼炎、眼瞼発赤、眼瞼浮腫、眼刺激症状(しみる感じ、灼熱感)、かゆみ、異物感、疼痛感、眼瞼が重い、かぶれ、流涙、充血、霧視、結膜炎、結膜浮腫、結膜濾胞、虹彩炎、眼乾燥感
眼(無水晶体眼又は眼底に病変のある患者等に長期連用した場合)	眼底黄斑部に浮腫、混濁*
肝臓	ALT(GPT)、LDHの上昇
代謝系	CK(CPK)の上昇
循環器	動悸、胸痛
その他	頭痛、呼吸困難、発疹

*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。

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。また、動物実験で高用量の経口投与により胎児の死亡率増加及び発育抑制、死亡児数の増加、新生児生存率の低下が報告されている。]

(2)本剤投与中は授乳を避けること。〔動物実験で、経口投与で母乳中へ移行することが報告されている。〕

7. 小児等への投与

小児等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)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。
- 4)必ず添付の投薬袋に入れて保存すること。

〔薬物動態〕

生物学的同等性試験

本剤と標準製剤をクロスオーバー法により健康成人男子を対象として1回1滴ずつ両眼に点眼した。最低眼圧値及び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%信頼区間法にて統計解析を行った。その結果、同等性の判定基準80～120%の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

	最低眼圧値 (mmHg)	AUC ₀₋₂₄ (mmHg・hr)
ニプラジロール点眼液 0.25%「わかもと」	12.43±1.14	338.9±33.82
標準製剤 (点眼液、0.25%)	12.32±1.35	336.9±31.03

(Mean±S.D., n=12)

最低眼圧値並びにAUC等のパラメータは、被験者の選択、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。

〔薬効薬理〕

眼圧下降作用

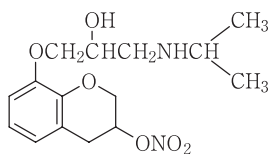
健康成人男子に本剤を1回1滴点眼した結果、眼圧は速やかに低下し、点眼12時間後においても眼圧下降作用が認められた¹⁾。

〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名 ニプラジロール(Nipradilol) (JAN)

化学名 3,4-Dihydro-8-(2-hydroxy-3-isopropylamino)propoxy-3-nitroxy-2H-1-benzopyran

構造式



分子式 C₁₅H₂₂N₂O₆

分子量 326.35

性状 本品は白色～微黄白色の結晶性の粉末である。本品はメタノールにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくく、水に極めて溶けにくい。本品は希塩酸に溶ける。本品は光によって着色する。本品の0.2mol/L塩酸試液溶液(1→20)は旋光性を示さない。

〔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±1℃、相対湿度75±5%、遮光、6ヵ月)の結果、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²⁾。

〔包装〕

ニプラジロール点眼液0.25%「わかもと」

5 mL×5本、5 mL×10本

〔主要文献〕

- 1)上家英之 他(わかもと製薬)：ニプラジロール点眼液0.25%「わかもと」の研究報告〔生物学的同等性試験〕(社内資料)
- 2)和田敬弘 他(わかもと製薬)：ニプラジロール点眼液0.25%「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

※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 2017.10