

※※2019年2月改訂(第3版)
※2018年12月改訂

貯法：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

プロスタマイド誘導体
緑内障・高眼圧症治療剤<ビマトプロスト>製剤
処方箋医薬品[※]

ビマトプロスト点眼液0.03%「わかもと」

BIMATOPROST OPHTHALMIC SOLUTION 0.03%「WAKAMOTO」

日本標準商品分類番号
871319

承認番号	薬価収載	販売開始
23000AMX00651	***2018年12月	***2018年12月

【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

【組成・性状】

販売名	ビマトプロスト点眼液0.03%「わかもと」
成分・含量 (1mL中)	ビマトプロスト0.3mgを含有 添加物としてリン酸水素ナトリウム水和物、クエン酸水和物、塩化ナトリウム、ベンザルコニウム塩化物液、pH調節剤を含有
性状・剤形	無色澄明の水性点眼剤(無菌製剤)
pH	6.9~7.5
浸透圧比	0.9~1.1(生理食塩液に対する比)

【効能・効果】

○緑内障、高眼圧症

【用法・用量】

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>

頻回投与により眼圧下降作用が減弱する可能性がある
ので、1日1回を超えて投与しないこと。

【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)無水晶体眼又は眼内レンズ挿入眼の患者[嚢胞様黄斑浮腫を含む黄斑浮腫、及びそれに伴う視力低下を起こすとの報告がある。]
- (2)眼内炎(虹彩炎、ぶどう膜炎)のある患者[類薬で眼圧上昇がみられたとの報告がある。]
- (3)ヘルペスウイルスが潜在している可能性のある患者[角膜ヘルペスが再発したとの報告がある。]
- (4)妊婦、産婦、授乳婦等(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

(1)本剤の投与により、虹彩や眼瞼への色素沈着(メラニンの増加)による色調変化、あるいは眼周囲の多毛化があらわれることがある。これらは投与の継続により徐々に進行し、投与中止により停止する。眼瞼色調変化及び眼周囲の多毛化については、投与中止後徐々に消失、あるいは軽減する可能性があるが、虹彩色調変化については投与中止後も消失しないことが報告されている。混合色虹彩の患者では虹彩の色調変化は明確に認められるが、暗褐色の単色虹彩の患者(日本人に多い)においても変化が認められている。特に片眼投与の場合、左右眼で虹彩の色調に差が生じる可能性がある。これらの症状については、長期的な情報が十分に得られていないので、患者を定期的に診察し、十分観察すること。投与に際しては、これらの症状について患者に十分説明し、また、眼瞼色調変

化、眼周囲の多毛化の予防あるいは軽減のため、投与の際に液が眼瞼皮膚等についた場合には、よくふき取るか、洗顔するよう患者を指導すること。

- (2)本剤投与中に角膜上皮障害(点状表層角膜炎、糸状角膜炎、角膜びらん)があらわれることがあるので、しみる、そう痒感、眼痛等の自覚症状が持続する場合には、直ちに受診するよう患者に十分に指導すること。
- (3)本剤を閉塞隅角緑内障に投与する場合は、使用経験がないことから慎重に投与することが望ましい。
- (4)本剤の点眼後、一時的に霧視があらわれることがあるため、症状が回復するまで機械類の操作や自動車等の運転には従事させないように指導すること。

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
プロスタグランジン系点眼剤 ラタノプロスト含有点眼剤	眼圧上昇がみられたとの報告がある ¹⁾ 。	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)

虹彩色素沈着：虹彩色素沈着があらわれることがあるため、患者を定期的に診察し、虹彩色素沈着があらわれた場合には臨床状態に応じて投与を中止すること。(「重要な基本的注意」の項参照)

(2)その他の副作用

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
眼	結膜充血、眼そう痒症、眼瞼色素沈着、角膜びらん、睫毛の異常(睫毛が長く、太く、濃くなる等)、眼瞼の多毛症、結膜炎、結膜浮腫、結膜出血、眼瞼浮腫、眼瞼紅斑、眼瞼そう痒症、眼瞼障害、眼脂、点状角膜炎、眼刺激、霧視、眼の異常感(違和感、べとつき感等)、くぼんだ眼 [※] 、結膜色素沈着、眼瞼炎、眼瞼下垂、涙液分泌低下、霰粒腫、マイボーム腺梗塞、糸状角膜炎、角膜血管新生、虹彩炎、眼乾燥、眼の灼熱感、眼痛、羞明、白内障、眼精疲労、視力低下、視覚障害、眼球運動失調、眼圧上昇、ぶどう膜炎、黄斑浮腫、乾性角結膜炎、流涙
循環器	狭心症発作、高血圧
消化器	胃不快感
呼吸器	咳嗽
その他	尿潜血、CK増加、口唇疱疹、浮動性めまい、頭痛、胸痛、耳鳴、白血球数増加、ALT(GPT)増加、 γ -GTP増加

注)「その他の注意」の項参照

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

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

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。動物実験では、妊娠マウスに0.3mg/kg/日以上を経口投与した場合に、流産及び早産が認められ、妊娠・授乳ラットに0.3mg/kg/日以上を経口投与した場合に、胎児毒性(胎児死亡等)が認められた。なお、これら所見が発現した際の親動物における曝露量(AUC)はヒト点眼時の68倍以上であった。〕

(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。〔動物試験(ラット：静脈内投与)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) 点眼したときに液が眼瞼皮膚等についた場合は、すぐにふき取るか、洗顔すること。
- 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分間以上の間隔をあけて点眼すること。
- 4) バンザルコニウム塩化物によりコンタクトレンズを変色させることがあるので、コンタクトレンズを装着している場合は、点眼前に一旦レンズを外し、点眼15分以上経過後に再装着すること。

9. その他の注意

投与前後で精密に眼瞼の状態を比較した場合、「くぼんだ眼」が高頻度で認められるとの報告がある²⁾。

〔薬物動態〕

生物学的同等性試験

ビマトプロスト点眼液0.03%「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〕

1. 眼圧下降作用

隅角レーザー照射により高眼圧を誘発したサルに0.001～0.1%ビマトプロスト点眼液を単回点眼したとき、濃度依存的な眼圧下降作用が認められた³⁾。

2. 作用機序

ビマトプロストは房水流出の促進を補助的なブドウ膜強膜流出路を介して起こし、眼内圧を低下させると考えられている⁴⁾。

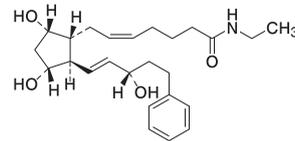
サルに0.01%ビマトプロスト点眼液を1日2回5日間反復点眼したとき、ぶどう膜強膜流出路からの房水排出量を基剤点眼群と比較して有意に増加させた(フルオレセイントレーサ法)⁵⁾。

〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名 ビマトプロスト(Bimatoprost)

化学名 (5Z)-7-[(1R,2R,3R,5S)-3,5-Dihydroxy-2-[(1E,3S)-3-hydroxy-5-phenylpent-1-en-1-yl]cyclopentyl]-N-ethylhept-5-enamide

構造式



分子式 $C_{25}H_{47}NO_3$

分子量 415.57

性状 本品は白色の結晶性の粉末である。

〔取扱い上の注意〕

1. 使用期限内であっても、開封後は速やかに使用すること。

2. 安定性試験

加速試験(40±1℃、相対湿度75±5%、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⁶⁾。

〔包装〕

ビマトプロスト点眼液0.03%「わかもと」

2.5mL×5本、2.5mL×10本

〔主要文献〕

- 1) Herndon, L. W. et al. : Arch. Ophthalmol., **120**(6), 847, 2002
- 2) Aihara, M. et al. : Jpn. J. Ophthalmol., **55**(6), 600, 2011
- 3) Woodward, D. F. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., **305**(2), 772, 2003
- 4) 高折修二 他監訳：グッドマン・ギルマン薬理書 第11版, 2204, 廣川書店(2007)
- 5) Woodward, D. F. et al. : J. Ophthalmol., **2010**, 926192, 2010
- 6) 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 2019.2