

## 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 2018（2019年更新版）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点眼液

カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」

カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」

CARTEOLOL HYDROCHLORIDE OPHTHALMIC SOLUTION「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点眼液1%「わかもと」 ：1mL中カルテオロール塩酸塩10mg カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」 ：1mL中カルテオロール塩酸塩20mg
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・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2009年7月13日 薬価基準収載年月日：2009年11月13日 販売開始年月日：2009年11月13日
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： <a href="https://www.wakamoto-pharm.co.jp/">https://www.wakamoto-pharm.co.jp/</a>

本IFは2023年6月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

## 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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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利用者自らが内容を充実させ、I F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、I Fが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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

I Fを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いただきたい。I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目次

I. 概要に関する項目	1	10. 特定の背景を有する患者	13
1. 開発の経緯	1	11. その他	13
2. 製品の治療学的特性	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
3. 製品の製剤学的特性	1	1. 警告内容とその理由	14
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	2. 禁忌内容とその理由	14
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	14
6. RMPの概要	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14
II. 名称に関する項目	3	5. 重要な基本的注意とその理由	14
1. 販売名	3	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14
2. 一般名	3	7. 相互作用	15
3. 構造式又は示性式	3	8. 副作用	15
4. 分子式及び分子量	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
5. 化学名（命名法）又は本質	3	10. 過量投与	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	11. 適用上の注意	16
III. 有効成分に関する項目	4	12. その他の注意	17
1. 物理化学的性質	4	IX. 非臨床試験に関する項目	18
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	1. 薬理試験	18
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	2. 毒性試験	18
IV. 製剤に関する項目	5	X. 管理的事項に関する項目	19
1. 剤形	5	1. 規制区分	19
2. 製剤の組成	5	2. 有効期間	19
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	3. 包装状態での貯法	19
4. 力価	5	4. 取扱い上の注意	19
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	5. 患者向け資材	19
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	6. 同一成分・同効薬	19
7. 調製法及び溶解後の安定性	6	7. 国際誕生年月日	19
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	6	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	19
9. 溶出性	6	9. 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
10. 容器・包装	6	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	19
11. 別途提供される資材類	7	11. 再審査期間	19
12. その他	7	12. 投薬期間制限に関する情報	19
V. 治療に関する項目	8	13. 各種コード	20
1. 効能又は効果	8	14. 保険給付上の注意	20
2. 効能又は効果に関連する注意	8	XI. 文献	21
3. 用法及び用量	8	1. 引用文献	21
4. 用法及び用量に関連する注意	8	2. その他の参考文献	21
5. 臨床成績	8	XII. 参考資料	22
VI. 薬効薬理に関する項目	10	1. 主な外国での発売状況	22
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10	2. 海外における臨床支援情報	22
2. 薬理作用	10	XIII. 備考	22
VII. 薬物動態に関する項目	12	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	22
1. 血中濃度の推移	12	2. その他の関連資料	22
2. 薬物速度論的パラメータ	12		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	12		
4. 吸収	13		
5. 分布	13		
6. 代謝	13		
7. 排泄	13		
8. トランスポーターに関する情報	13		
9. 透析等による除去率	13		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

緑内障の治療では、点眼薬が長期間使用され、作用機序の異なる緑内障治療点眼薬を併用することも多く、角膜に対する影響が少ない点眼薬が望まれている。また、近年ベンザルコニウム塩化物等防腐剤の角膜・涙液系に対する影響が注目を集めており、防腐剤濃度の低い点眼薬や防腐剤無添加の点眼薬が望まれている。

そこで弊社では、ニプロ株式会社と共同で、汎用されている点眼ボトルと同程度のサイズで、滴下が容易な無菌点眼容器の開発に着手し、NP容器 (None-Preservative Multi-dose Container) を開発した。本剤は、有効成分として $\beta$ 遮断作用を有するカルテオロール塩酸塩、容器にNP容器を採用することで、ベンザルコニウム塩化物無添加の緑内障治療薬として開発された点眼剤である。後発医薬品として2009年7月に製造販売承認を取得し、2009年11月の発売に至った。

### 2. 製品の治療学的特性

(1) 内因性交感神経刺激様作用 (ISA) を有する非選択性 $\beta$ 遮断薬の点眼剤である。

(VI. 2. 薬理作用 の項 参照)

(2) カルテオロール塩酸塩点眼液の重大な副作用 (いずれも頻度不明) 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、眼類天疱瘡、脳虚血、脳血管障害、全身性エリテマトーデスがあらわれることがある。

(VIII. 8. 副作用 の項 参照)

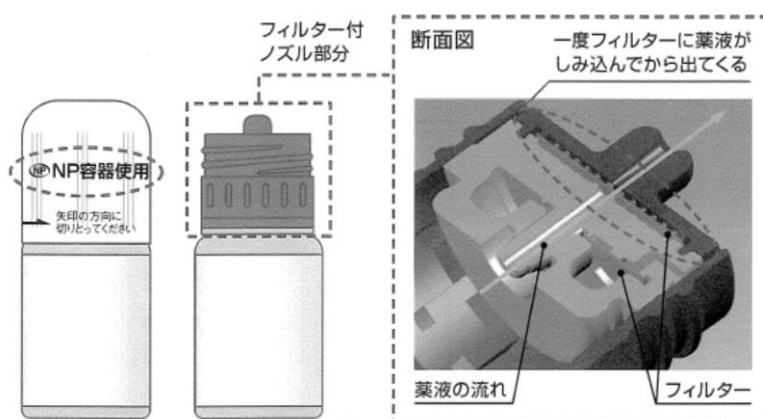
### 3. 製品の製剤学的特性

(1) 防腐剤 (ベンザルコニウム塩化物等) を使用していない。

(IV. 2. 製剤の組成 の項 参照)

(2) マルチドーズ型の点眼容器であるNP容器 (None-Preservative Multi-dose Container) を使用している。

(特許取得)



NP容器は、キャップ、フィルター付ノズルから構成されている。ノズル内側のフィルターにより、外部からの細菌、真菌などの侵入を防ぎ、防腐剤を使用することなく薬液の無菌性を保つ。

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

I. 概要に関する項目

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

---

## 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点眼液1%「わかもと」

カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」

## (2) 洋名

CARTEOLOL HYDROCHLORIDE OPHTHALMIC SOLUTION 1% 「WAKAMOTO」

CARTEOLOL HYDROCHLORIDE OPHTHALMIC SOLUTION 2% 「WAKAMOTO」

## (3) 名称の由来

有効成分名、剤形、濃度及び社名

(平成17年9月22日付け薬食審査発第0922001号に基づく)

## 2. 一般名

## (1) 和名(命名法)

カルテオロール塩酸塩 (JAN)

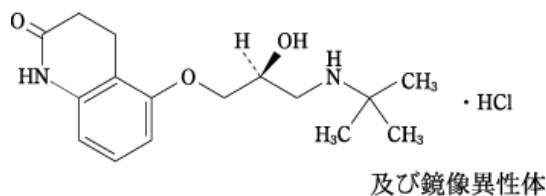
## (2) 洋名(命名法)

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：C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub> · HCl

分子量：328.83

## 5. 化学名(命名法)又は本質

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

該当しない

### III. 有効成分に関する項目

---

## 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

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
水	やや溶けやすい
メタノール	やや溶けにくい
エタノール (95)	極めて溶けにくい
酢酸 (100)	極めて溶けにくい
ジエチルエーテル	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、定量法

日本薬局方「カルテオロール塩酸塩」の確認試験法、定量法による  
確認試験

(1) ライネック塩試液を加えるとき、淡赤色の沈殿を生じる。

(2) 紫外可視吸光度測定法

(3) 赤外吸収スペクトル 塩化カリウム錠剤法

(4) 塩化物の呈色反応を呈する

定量法

電位差滴定法



---

## IV. 製剤に関する項目

---

## 1. 剤形



## (1) 剤形の区別

点眼剤

## (2) 製剤の外観及び性状

無色澄明の水性の液

## (3) 識別コード

販売名	カルテオロール塩酸塩点眼液1% 「わかもと」	カルテオロール塩酸塩点眼液2% 「わかもと」
キャップの色	淡赤色	濃赤色
キャップ天面		

## (4) 製剤の物性

pH：6.2～7.2

浸透圧比：0.9～1.1

## (5) その他

無菌製剤である。

## 2. 製剤の組成

## (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	カルテオロール塩酸塩点眼液1% 「わかもと」	カルテオロール塩酸塩点眼液2% 「わかもと」
有効成分	1mL中カルテオロール塩酸塩10mg	1mL中カルテオロール塩酸塩20mg
添加剤	ホウ酸、ホウ砂	

## (2) 電解質等の濃度

該当しない

## (3) 熱量

該当しない

## 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

## 4. 力価

該当しない

## 5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

#### IV. 製剤に関する項目

##### 6. 製剤の各種条件下における安定性

カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「わかもと」

[長期保存試験<sup>1)</sup>、加速試験<sup>2)</sup>、苛酷試験（光）<sup>3)</sup>]

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25±2℃、60±5%RH	36 ヶ月	最終包装	規格内
加速試験	40±1℃、75±5%RH	6 ヶ月	ポリプロピレン製点眼容器 (シュリンクなし)	規格内
苛酷試験 (光)	25℃、 白色蛍光灯 3000lx	120 万 lx・hr	ポリプロピレン製点眼容器 (シュリンク有)	規格内

試験項目：性状、確認試験\*、浸透圧比、pH、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験\*、無菌試験\*、  
含量 \*：長期保存試験、加速試験のみ実施

カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「わかもと」

[長期保存試験<sup>1)</sup>、加速試験<sup>4)</sup>、苛酷試験（光）<sup>5)</sup>]

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25±2℃、60±5%RH	36 ヶ月	最終包装	規格内
加速試験	40±1℃、75±5%RH	6 ヶ月	ポリプロピレン製点眼容器 (シュリンクなし)	規格内
苛酷試験 (光)	25℃、 白色蛍光灯 3000lx または近紫外蛍光灯	120 万 lx・hr、 120 万 lx・hr 及び 200W・h/m <sup>2</sup>	ポリプロピレン製点眼容器 (シュリンク有)	規格内

試験項目：性状、確認試験\*、浸透圧比、pH、不溶性異物試験\*、不溶性微粒子試験\*、無菌試験\*、  
含量 \*：長期保存試験、加速試験のみ実施

##### 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

##### 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

##### 9. 溶出性

該当しない

##### 10. 容器・包装

###### (1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

本剤は、フィルターを装着した特殊な容器（NP容器）を使用しているため、患者には使用方法を  
指導すること。（Ⅷ. 11. 適用上の注意 の項 参照）

###### (2) 包装

カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」 プラスチック点眼容器：5mL×5本  
カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」 プラスチック点眼容器：5mL×5本、5mL×10本

###### (3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ボトル：ポリプロピレン

中栓：ポリプロピレン

キャップ：ポリエチレン

ラベル：ポリエチレンテレフタレート

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」 1滴：約33 $\mu$ L

---

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 効能又は効果

緑内障、高眼圧症

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

通常、1%製剤を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は、2%製剤を用いて1回1滴、1日2回点眼する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

正常眼圧緑内障患者22例を対象にカルテオロール塩酸塩2%点眼液1日2回18ヵ月間点眼群（10例）と無治療経過観察群（12例）でのハンフリー視野計による視野測定値を比較検討した。その結果、カルテオロール塩酸塩点眼群は無治療経過観察群に比較し視野の指標であるMean deviation（MD）及びCorrected pattern standard deviation（CPSD）の悪化を有意に抑制した<sup>6)</sup>。

##### 2) 安全性試験

該当資料なし

#### (5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

## 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

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 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：カルテオロール塩酸塩は内因性交感神経刺激様作用を有するβ受容体遮断薬である<sup>7)</sup>。

健康成人におけるフルオロフォトメトリー試験の結果、並びに緑内障及び高眼圧症患者におけるトノグラフィー試験の結果から、カルテオロール塩酸塩は房水産生の抑制により眼圧を下降させるものと推察されている<sup>8),9)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 眼圧下降作用

①ウサギにカルテオロール塩酸塩0.25～2%液を点眼した場合、用量依存的で持続的な眼圧下降が認められた<sup>10)</sup>。

②ウサギの水負荷眼圧上昇試験において、カルテオロール塩酸塩0.1～2%液点眼により眼圧上昇の有意な抑制が認められた<sup>10)</sup>。

③ビーグル犬にカルテオロール塩酸塩1～4%液を1回0.1mL、1日2回、連続8週間点眼しても眼圧下降作用の減弱は認められなかった<sup>10)</sup>。

##### 2) 眼底血流増加作用

健康成人にカルテオロール塩酸塩2%点眼液を30μL、1回点眼し、レーザースペックル法により測定したところ、視神経乳頭末梢血流量の定量指標であるnormalized blur (NB) 値の増加が認められた<sup>11)</sup>。また、健康成人にカルテオロール塩酸塩2%点眼液を30μL、1日2回、連続21日間点眼し、レーザースペックル法により測定したところ、視神経乳頭末梢血流量の定量指標であるnormalized blur (NB) 値の増加が認められた<sup>12)</sup>。

##### 3) 生物学的同等性試験

###### ①正常眼圧に対する眼圧下降作用

正常眼圧の有色ウサギに本剤及びミケラン点眼液を点眼し、眼圧下降作用について眼圧値の時間曲線下面積 (AUC<sub>0-6hr</sub>) を同等性の指標として比較検討した。得られた値の平均値の差を90%信頼区間法にて解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された<sup>13),14)</sup>。

〈1%製剤〉

	AUC <sub>0-6hr</sub> (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」	143.3±2.8
ミケラン点眼液1%	140.8±1.7

(平均値±標準誤差、n=10)

〈2%製剤〉

	AUC <sub>0-6hr</sub> (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」	152.5±2.0
ミケラン点眼液2%	149.4±1.5

(平均値±標準誤差、n=10)

## ②水負荷眼圧上昇に対する作用

水負荷により眼圧上昇を誘発させた白色ウサギに本剤及びミケラン点眼液を点眼し、眼圧下降作用について眼圧値の時間曲線下面積（AUC<sub>0-2hr</sub>）を同等性の指標として比較検討した。得られた値の平均値の差を90%信頼区間法にて解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された<sup>13),14)</sup>。

## 〈1%製剤〉

	AUC <sub>0-2hr</sub> (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液1%「わかもと」	56.4±1.3
ミケラン点眼液1%	56.5±1.0

(平均値±標準誤差、n=12)

## 〈2%製剤〉

	AUC <sub>0-2hr</sub> (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液2%「わかもと」	54.0±1.0
ミケラン点眼液2%	52.1±1.5

(平均値±標準誤差、n=12)

AUC については被験個体の選択、測定回数・時間など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

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 1) 単回点眼

カルテオロール塩酸塩2%点眼液を健康成人（11例）の両眼に20 $\mu$ Lずつ単回点眼した時の血漿中カルテオロール濃度は投与後15分に最高値1.33ng/mLを示し、減衰期の消失半減期は13.8時間であった<sup>15)</sup>。

##### 2) 反復点眼

カルテオロール塩酸塩2%点眼液を原発開放隅角緑内障又は高眼圧症の患者（両眼に1滴、1日2回、12例）に8週間反復点眼した時の血漿中カルテオロール濃度（平均値 $\pm$ 標準偏差）は、3.198 $\pm$ 1.500ng/mL（点眼2時間後）であった<sup>16)</sup>。

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし

#### (4) クリアランス

該当資料なし

#### (5) 分布容積

該当資料なし

#### (6) その他

該当資料なし

### 3. 母集団（ポピュレーション）解析

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) パラメータ変動要因

該当資料なし



4. 吸収

該当資料なし

5. 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

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 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(CYP等)の分子種、寄与率

カルテオロールは、ヒト肝ミクロゾームチトクロームP450の分子種のうち、主としてCYP2D6により代謝される<sup>17)</sup> (*in vitro*)。

(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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

カルテオロール塩酸塩2%点眼液を健康成人の両眼に1滴ずつ点眼した時、点眼後24時間までに点眼量の約16%がカルテオロールとして尿中に排泄され、この時のカルテオロール尿中排泄速度の半減期は約5時間であった<sup>18)</sup>。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

#### 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 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  
[これらの症状が増悪するおそれがある。] [11.1.1 参照]

2.3 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）又は心原性ショックのある患者  
[これらの症状が増悪するおそれがある。] [11.1.3 参照]

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

全身的に吸収され、 $\beta$ 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。

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### (1) 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1.1 肺高血圧による右心不全の患者

心機能を抑制し症状が増悪するおそれがある。 [11.1.3 参照]

##### 9.1.2 うっ血性心不全の患者

心機能を抑制し症状が増悪するおそれがある。 [11.1.3 参照]

##### 9.1.3 コントロール不十分な糖尿病の患者

血糖値に注意すること。低血糖症状を起こしやすく、かつ症状をマスクすることがある。

##### 9.1.4 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。

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

#### (5) 妊婦

##### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。

## (6) 授乳婦

## 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。

## (7) 小児等

## 9.7 小児等

9.7.1 小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 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。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%を投与した症例で低血糖が報告されている。

## (8) 高齢者

## 9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

## 7. 相互作用

## (1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

## (2) 併用注意とその理由

## 10.2 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
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

## 11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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。

## (1) 重大な副作用と初期症状

## 11.1 重大な副作用

## 11.1.1 喘息発作（頻度不明）

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。 [2.2 参照]

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

11.1.2 失神（頻度不明）  
 高度な徐脈に伴う失神があらわれることがある。

11.1.3 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（いずれも頻度不明）  
 $\beta$ -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、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。[2.3、9.1.1、9.1.2 参照]

11.1.4 眼類天疱瘡（頻度不明）  
 結膜充血、角膜上皮障害、乾性角結膜炎、結膜萎縮、睫毛内反、眼瞼眼球癒着等があらわれることがある。

11.1.5 脳虚血、脳血管障害（いずれも頻度不明）

11.1.6 全身性エリテマトーデス（頻度不明）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	5%以上	0.1~5%未満	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）、視力異常、眼瞼発赤	眼底黄斑部の浮腫・混濁 <sup>注1)</sup>
循環器		徐脈	低血圧、不整脈、動悸、胸痛
呼吸器		呼吸困難	鼻症状（くしゃみ、鼻水、鼻づまり）、咳、咽喉頭症状（違和感等）
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、発疹	血糖値の低下、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。  
 注) 副作用の項に記載の頻度は、原則としてミケラン点眼液1%・2%とミケランLA点眼液1%・2%のうち、発現頻度の高い方の値に基づく。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

<p>14. 適用上の注意</p> <p>14.1 薬剤交付時の注意</p> <p>患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・本剤は、フィルターを装着した特殊な容器を使用しているため、使用方法を指導すること。</li> <li>・薬液汚染防止のため、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。</li> <li>・患眼を開眼して結膜嚢内に点眼し、1~5分間閉眼して涙嚢部を圧迫させた後、開眼すること。</li> <li>・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。</li> </ul>
---

(解説)

- ・本剤に使用している容器のノズル内部にはフィルターを装着している。フィルターは外部からの細菌、真菌などの侵入を防ぐ役割がある。これら容器の仕組みや注意点などを患者に伝え、本剤の取扱いへの理解を深める。
- (X.5. 患者向け資材 の項 参照)

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

- ・容器の先端が直接目に触れると、眼脂や雑菌等により薬液が汚染される可能性がある。
- ・閉瞼及び涙嚢部の圧迫を行うことにより、薬液の鼻涙管への流出による鼻粘膜からの吸収を防ぎ、全身性の副作用発現の可能性を軽減するとともに、治療効果を高めるためである。
- ・複数の点眼剤を短い間隔で点眼すると、初めに点眼した薬剤が後から点眼した薬剤によって結膜嚢から流され、薬剤の有効性が低下する可能性がある。

### 12. その他の注意

#### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

#### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## 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」の項 参照

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

#### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

#### (7) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製剤：該当しない（処方箋医薬品以外の医薬品である）

有効成分：劇薬

### 2. 有効期間

有効期間：3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材：NP容器をお使いになる方へ お取扱い上の注意

([https://www.wakamoto-pharm.co.jp/upd/pdf/0000000762\\_1.pdf](https://www.wakamoto-pharm.co.jp/upd/pdf/0000000762_1.pdf))

### 6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：ミケラン点眼液1%、ミケラン点眼液2%

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始年月日
カルテオロール塩酸塩 点眼液1%「わかもと」	2009年7月13日	22100AMX01959000	2009年11月13日	2009年11月13日
カルテオロール塩酸塩 点眼液2%「わかもと」	2009年7月13日	22100AMX01960000	2009年11月13日	2009年11月13日

### 9. 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

### 10. 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

### 11. 再審査期間

該当しない

### 12. 投薬期間制限に関する情報

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。

X. 管理的事項に関する項目

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
カルテオロール塩酸塩 点眼液1%「わかもと」	1319701Q1013	1319701Q1099	119297101	個別：621929701 統一：622771000
カルテオロール塩酸塩 点眼液2%「わかもと」	1319701Q2095	1319701Q2095	119298801	621929801

14. 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) わかもと製薬株式会社 社内資料 [長期保存試験]
- 2) わかもと製薬株式会社 社内資料 [1% 加速試験]
- 3) わかもと製薬株式会社 社内資料 [1% 苛酷試験 (光安定性)]
- 4) わかもと製薬株式会社 社内資料 [2% 加速試験]
- 5) わかもと製薬株式会社 社内資料 [2% 苛酷試験 (光安定性)]
- 6) 前田秀高 他：日本眼科学会雑誌. 1997 ; 101 : 227-231
- 7) Yabuuchi Y, et al. : Jpn J Pharmacol. 1974 ; 24 : 853-861
- 8) 新家 真 他：日本眼科学会雑誌. 1980 ; 84 : 2085-2091
- 9) 松生俊和 他：眼科臨床医報. 1983 ; 77 : 1654-1657
- 10) 渡辺耕三 他：応用薬理. 1983 ; 26 : 1-8
- 11) 玉置泰裕 他：日本眼科学会雑誌. 1996 ; 100 : 55-62
- 12) Tamaki Y, et al. : Curr Eye Res. 1997 ; 16 : 1102-1110
- 13) わかもと製薬株式会社 社内資料 [1% 生物学的同等性試験]
- 14) わかもと製薬株式会社 社内資料 [2% 生物学的同等性試験]
- 15) Ishii Y, et al. : J Clin Pharmacol. 2002 ; 42 : 1020-1026
- 16) 川瀬和秀 他：日本眼科学会雑誌. 2010 ; 114 : 976-982
- 17) Kudo S, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 1997 ; 52 : 479-485
- 18) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店, 2021 ; C1386-C1390

### 2. その他の参考文献

- ・第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021

## 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

該当しない

---

## XIII. 備考

---

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし