2025 年 5 月改訂（第 6 版）

日本標準商品分類番号　871319

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

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点眼液

ブリモニジン酒石酸塩点眼液 0.1%「わかもと」

BRIMONIDINE TARTRATE OPHTHALMIC SOLUTION「WAKAMOTO」

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意-医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1mL中ブリモニジン酒石酸塩1mg
一般名	和名：　ブリモニジン酒石酸塩（JAN） 洋名：　Brimonidine Tartrate（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：2021 年 2 月 15 日 薬価基準収載年月日：2021 年 6 月 18 日 販売開始年月日：2021 年 8 月 16 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：https://www.wakamoto-pharm.co.jp/

本ＩＦは 2025 年 4 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。

医薬品インタビューフォーム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，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．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦ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ＩＦを作成・提供するが，ＩＦの原点を踏まえ，医療現場に不足している情報やＩＦ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，ＩＦ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，ＩＦ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，ＩＦ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

ＩＦ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．ＩＦ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ＩＦ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，ＩＦ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
1．開発の経緯 1
2．製品の治療学的特性..... 1
3．製品の製剤学的特性..... 1
4．適正使用に関して周知すべき特性..... 1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項..... 1
6．ＲＭＰの概要 1

II. 名称に関する項目 2
1．販売名 2
2．一般名 2
3．構造式又は示性式..... 2
4．分子式及び分子量..... 2
5．化学名（命名法）又は本質..... 2
6．慣用名、別名、略号、記号番号..... 2

III. 有効成分に関する項目..... 3
1．物理化学的性質..... 3
2．有効成分の各種条件下における安定性..... 3
3．有効成分の確認試験法、定量法..... 3

IV. 製剤に関する項目 4
1．剤形 4
2．製剤の組成 4
3．添付溶解液の組成及び容量..... 4
4．力価 4
5．混入する可能性のある夾雑物..... 4
6．製剤の各種条件下における安定性..... 5
7．調製法及び溶解後の安定性..... 5
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）..... 5
9．溶出性 5
10．容器・包装 5
11．別途提供される資材類..... 6
12．その他 6

V. 治療に関する項目 7
1．効能又は効果 7
2．効能又は効果に関連する注意..... 7
3．用法及び用量 7
4．用法及び用量に関連する注意..... 7
5．臨床成績 7

VI. 薬効薬理に関する項目 10
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群..... 10
2．薬理作用 10

VII. 薬物動態に関する項目..... 11
1．血中濃度の推移..... 11
2．薬物速度論的パラメータ..... 11
3．母集団（ポピュレーション）解析..... 11
4．吸収 11
5．分布 12
6．代謝 12
7．排泄 12
8．トランスポーターに関する情報..... 12
9．透析等による除去率..... 12
10．特定の背景を有する患者 13
11．その他 13

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14
1．警告内容とその理由 14
2．禁忌内容とその理由 14
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 14
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 14
5．重要な基本的注意とその理由 14
6．特定の背景を有する患者に関する注意 14
7．相互作用 15
8．副作用 15
9．臨床検査結果に及ぼす影響 16
10．過量投与 16
11．適用上の注意 17
12．その他の注意 17

IX. 非臨床試験に関する項目 18
1．薬理試験 18
2．毒性試験 18

X. 管理的事項に関する項目..... 19
1．規制区分 19
2．有効期間 19
3．包装状態での貯法 19
4．取扱い上の注意 19
5．患者向け資材 19
6．同一成分・同効薬 19
7．国際誕生年月日 19
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．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．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 19
11．再審査期間 19
12．投薬期間制限に関する情報 19
13．各種コード 19
14．保険給付上の注意 19

XI. 文献 20
1．引用文献 20
2．その他の参考文献 20

XII. 参考資料..... 21
1．主な外国での発売状況 21
2．海外における臨床支援情報 21

XIII. 備考..... 21
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 21
2．その他の関連資料 21

I. 概要に関する項目

１．開発の経緯

ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」は緑内障・高眼圧症治療剤であり、ブリモニジン酒石酸塩がアドレナリンα_2受容体に作用し、房水産生の抑制及びぶ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。

ブリモニジン酒石酸塩の点眼剤としての開発は、1996年に米国にて「開放隅角緑内障又は高眼圧症」を適応症として承認され、本邦では、「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」を効能・効果として、2012年に千寿製薬株式会社が承認を取得している。本剤は後発医薬品として2021年2月に製造販売承認を取得、同年6月に薬価基準収載、同年8月に販売を開始した。

２．製品の治療学的特性

(1) ブリモニジン酒石酸塩は、アドレナリンα_2受容体に作用し、房水産生の抑制及びぶどう膜強膜流出路を介した房水流出促進作用を有する。

（Ⅵ.2.薬理作用の項参照）

(2) ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」は後発医薬品であり、アイファガン点眼液0.1%と生物学的に同等とみなされている。

（Ⅶ.11.その他の項参照）

(3) 重大な副作用として、角膜混濁が報告されている。主な副作用として、点状角膜炎、眼瞼炎（アレルギー性眼瞼炎を含む）、結膜炎（アレルギー性結膜炎を含む）など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

該当しない

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	—

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

ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」

(2) 洋名

BRIMONIDINE TARTRATE OPHTHALMIC SOLUTION 0.1%「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）

ブリモニジン酒石酸塩（JAN）

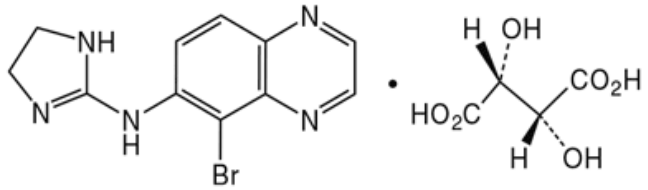
(2) 洋名（命名法）

Brimonidine Tartrate（JAN）

(3) ステム

クロニジン系降圧薬：-onidine

３．構造式又は示性式



４．分子式及び分子量

分子式：$C_{11}H_{10}BrN_5$・$C_4H_6O_6$
分子量：442.22

５．化学名（命名法）又は本質

5-Bromo-*N*- (4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl) quinoxalin-6-amine mono- (2*R*,3*R*) -tartrate

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

１．物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～淡黄色の結晶性の粉末または粉末である。

(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	溶けにくい
N-メチルピロリドン	ほとんど溶けない
アセトン	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

該当資料なし

(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

旋光度〔α〕$^{20}_{D}$：+9.0～+10.5°（乾燥物に換算したもの0.5g、水、50mL、100mm）

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

確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法

（吸収波数：3265cm^{-1}、1730cm^{-1}、1651cm^{-1}、1595cm^{-1}及び1074cm^{-1}付近）

定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：248nm）

カラム：液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲル

移動相：下記の移動相Aと移動相Bの混合比を変えて濃度勾配を制御

移動相A：水1000mLにリン酸二水素二ナトリウム二水和物1.56gを加え、トリエチルアミン1mLを正確に加える。この液にリン酸を加えてpH3.0に調整

移動相B：アセトニトリル／メタノール混液（1：1）

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

微黄緑～黄緑色澄明の水性の液

(3) 識別コード

該当しない

＜参考＞　キャップ：灰色（グレー）　　点眼ボトル：緑色

(4) 製剤の物性

pH：6.7～7.5

浸透圧比：0.9～1.1（生理食塩液に対する比）

(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

有効成分	1mL中ブリモニジン酒石酸塩1mg
添加剤	塩化マグネシウム、ホウ酸、ホウ砂、カルメロースナトリウム、亜塩素酸ナトリウム液、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

(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

６．製剤の各種条件下における安定性

加速試験[1)]、苛酷試験（湿度[2)]、光[3)]）

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40±1℃ 75±5%RH	6 ヵ月	ポリエチレン製点眼容器 （シュリンク有、紙箱、容器正立）	規格内
苛酷試験 （湿度）	40±2℃ 25%RH	6 ヵ月	ポリエチレン製点眼容器 （シュリンク有、容器正立）	規格内
苛酷試験 （光）	成り行き温度・湿度 1000lx（D65 ランプ）	120 万 lx･hr	ポリエチレン製点眼容器 （シュリンクなし、容器横転）	規格内
			ポリエチレン製点眼容器 （シュリンク有、容器横転）	

測定項目：性状、確認試験*、浸透圧比、pH、純度試験（類縁物質、鉄*）、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験、無菌試験*、含量　　＊：加速試験のみ実施

開封後安定性試験（熱[4)]、光[5)]）

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
開封後 安定性試験 （熱）	40±1℃ 75±5％RH 1 滴滴下後、 再度キャップを締める	2 ヵ月	ポリエチレン製点眼容器 （シュリンク有、容器正立）	規格内
開封後 安定性試験 （光）	成り行き温度・湿度 1000lx（D65 ランプ） 1 滴滴下後、 再度キャップを締める	120 万 lx･hr	ポリエチレン製点眼容器 （シュリンク有、容器横転）	規格内

測定項目：性状、浸透圧比、pH、不溶性異物試験、含量

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（物理化学的変化）

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

該当しない

(2) 包装

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、中栓：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

IV．製剤に関する項目

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

1滴：約51～52μL

V．治療に関する項目

１．効能又は効果

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

２．効能又は効果に関連する注意

5．効能又は効果に関連する注意
〈緑内障、高眼圧症〉
5.1　プロスタグランジン関連薬やβ-遮断剤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。［17.1.2 、 17.1.3 参照］
〈チソツマブ　ベドチン（遺伝子組換え）投与に伴う眼障害軽減〉
5.2　チソツマブ　ベドチン（遺伝子組換え）の電子添文を参照すること。

３．用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

通常、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

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

国内第Ⅲ相比較試験（臨床薬理試験）

循環器系又は呼吸器系疾患を有さない高齢者を対象に、0.1％ブリモニジン酒石酸塩点眼液又は0.5％チモロール点眼液を両眼に1回1滴、1日2回4週間点眼した無作為化単遮蔽（評価者遮蔽）並行群間比較試験において、循環器系及び呼吸器系への影響を検討した。その結果、投与4週後の1秒量（$FEV_{1.0}$）は、投与開始日と比較して両群とも低下し、その前後比（投与開始日に対する比）は2時間値において0.1％ブリモニジン酒石酸塩点眼液群と比較して0.5％チモロール点眼液群で統計学的に有意に低下した（P=0.046、t検定）。ほとんどの観察時点で脈拍数は投与開始日と比較して両群とも低下しており、その前後差（投与開始日との差）は0.1％ブリモニジン酒石酸塩点眼液群と比較して0.5％チモロール点眼液群のほとんどの観察時点で統計学的に有意に低下した（P＜0.05、t検定）。また、ほとんどの観察時点で、収縮期及び拡張期血圧は0.1％ブリモニジン酒石酸塩点眼液群でのみ投与開始日と比較して有意に低下した（P＜0.05、t検定）。

0.1％ブリモニジン酒石酸塩点眼液群の副作用は50例中25例（50.0％）に認められ、主な副作用は点状角膜炎6例（12.0％）、眼そう痒症5例（10.0％）、徐脈3例（6.0％）、血圧低下3例（6.0％）、眼精疲労2例（4.0％）、眼の異常感2例（4.0％）、肺機能検査異常2例（4.0％）であった[6)]。

(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

①国内第Ⅲ相比較試験（非劣性試験）

原発開放隅角緑内障（広義）又は高眼圧症患者を対象に、0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液又は0.5%チモロール点眼液を両眼に1回1滴、1日2回4週間点眼した無作為化単遮蔽（評価者遮蔽）並行群間比較試験において、非劣性を検証した。その結果、投与終了時（点眼4週後）の眼圧変化値（0時間値と2時間値の平均値）及び両群間の差とその95%信頼区間は表のとおりであり、95%信頼区間の上限値は非劣性限界値（Δ＝1.2）を上回り、非劣性は検証されなかった。

投与終了時の眼圧変化値（0時間値と2時間値の平均値）

薬剤（例数）	眼圧変化値（mmHg）	差の平均値（mmHg）［95%両側信頼区間］
0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液群（103）	-4.0±2.0	0.7［0.1～1.3］
0.5%チモロール点眼液群（93）	-4.7±2.1	

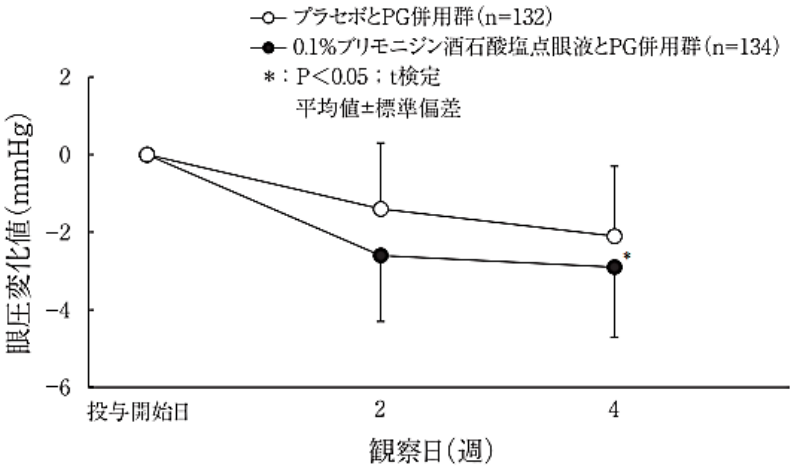
眼圧変化値：平均値±標準偏差

有意水準：片側2.5%、非劣性限界値：Δ＝1.2

0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液群の副作用は109例中20例（18.4%）に認められ、主な副作用は点状角膜炎6例（5.5%）、眼そう痒症3例（2.8%）、結膜充血2例（1.8%）、眼脂2例（1.8%）、眼の異常感2例（1.8%）、眼痛2例（1.8%）であった[7)]。

②国内第Ⅲ相比較試験（優越性試験）

プロスタグランジン関連薬（PG）の治療期間が90日以上で、眼圧値が18.0mmHg以上の原発開放隅角緑内障（広義）又は高眼圧症患者を対象に、0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液又はプラセボを両眼に1回1滴、1日2回、PGと併用して4週間点眼した無作為化二重遮蔽並行群間比較試験において、優越性を検証した。その結果、眼圧変化値（0時間値と2時間値の平均値）は図のとおりであり、投与4週後の眼圧変化値は両群間で統計学的に有意な差を示し、プラセボに対する優越性が検証された（差の平均値：-0.7mmHg、95%両側信頼区間：-1.2～-0.3mmHg、P＝0.0010）。［**Ⅴ.2. 効能又は効果に関連する注意**の項参照］



眼圧変化値（0時間値と2時間値の平均値）の推移

0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液群の副作用は134例中26例（19.4%）で認められ、主な副作用は点状角膜炎10例（7.5%）、眼そう痒症6例（4.5%）、結膜充血2例（1.5%）及び結膜変色2例（1.5%）であった[8)]。

2) 安全性試験

国内第Ⅲ相長期投与試験

原発開放隅角緑内障（広義）又は高眼圧症患者を対象に、0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液単剤又はプロスタグランジン関連薬（PG）と併用して 0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液を両眼に 1 回 1 滴、1 日 2 回最長 52 週間点眼した非対照非遮蔽試験において、長期投与の有効性及び安全性を検討した。その結果、眼圧変化値（0 時間値と 2 時間値の平均値）の推移は表のとおりであり、52 週間を通して安定した眼圧下降作用を示した。［**Ⅴ.2. 効能又は効果に関連する注意**の項参照］

眼圧変化値（0 時間値と 2 時間値の平均値）の推移

薬剤	眼圧変化値（mmHg）		
	12 週間後	28 週間後	52 週間後
単剤群	-4.8±2.5（77）	-4.7±2.8（74）	-4.8±2.7（62）
PG 併用群	-3.1±2.1（45）	-3.3±1.9（41）	-2.7±1.7（34）

（平均値±標準偏差）、（　）：例数

0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液単剤群の副作用は 98 例中 38 例（38.8%）で認められ、主な副作用はアレルギー性結膜炎 18 例（18.4%）、眼瞼炎 9 例（9.2%）、点状角膜炎 7 例（7.1%）、結膜充血 7 例（7.1%）、結膜炎 3 例（3.1%）、接触皮膚炎 3 例（3.1%）、霧視 2 例（2.0%）、アレルギー性眼瞼炎 2 例（2.0%）及び結膜濾胞 2 例（2.0%）であった。また、0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼液と PG の併用群の副作用は 59 例中 31 例（52.5%）で認められ、主な副作用はアレルギー性結膜炎 14 例（23.7%）、眼瞼炎 9 例（15.3%）、結膜充血 5 例（8.5%）、点状角膜炎 3 例（5.1%）、結膜炎 3 例（5.1%）及び頭痛 2 例（3.4%）であった[9)]。

(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

該当しない

(7) その他

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

アプラクロニジン、クロニジン

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

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ぶ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[10)]。

1) 房水産生抑制作用

ウサギの片眼に0.3%ブリモニジン酒石酸塩溶液を単回点眼した試験（フルオロフォトメトリー法）では、点眼1時間後に点眼前に比べて最大43.9%の有意な房水産生の抑制が認められた[11)]。

2) 房水流出促進作用

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ぶどう膜強膜流出路からの房水流出の促進が認められた[12)]（外国人データ）。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

眼圧下降作用

ウサギに0.000015%～0.15%ブリモニジン酒石酸塩溶液を単回点眼した結果、濃度依存的な眼圧下降作用が認められた[13)]。

(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

⑴ 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

⑵ 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人男性に0.15％又は0.2％ブリモニジン酒石酸塩点眼液[注)]（各6例）を両眼に1回1滴、1日2回7日間反復点眼したとき、7日目の血漿中ブリモニジン濃度は0.15％点眼液が点眼後平均1.1時間で最高濃度38.57±11.22pg/mL（平均値±標準偏差）を示し、0.2％点眼液では、平均0.6時間で最高濃度44.25±14.94pg/mLを示した。血漿中濃度は点眼液の濃度に依存して上昇したが、検出された濃度はわずかであり、最終点眼24時間後には定量下限値（2pg/mL）未満であった[14)]。

注）本剤の承認された濃度は0.1％である。

⑶ 中毒域

該当資料なし

⑷ 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

⑴ 解析方法

該当資料なし

⑵ 吸収速度定数

該当資料なし

⑶ 消失速度定数

該当資料なし

⑷ クリアランス

該当資料なし

⑸ 分布容積

該当資料なし

⑹ その他

該当資料なし

３．母集団（ポピュレーション）解析

⑴ 解析方法

該当資料なし

⑵ 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

サルの両眼に0.5％^{14}C-ブリモニジン酒石酸塩点眼液35μLを単回点眼したとき、眼組織内放射能の最高濃度は、虹彩、結膜、角膜、強膜、毛様体、網脈絡膜、房水、水晶体、硝子体の順に高かった。また、1日2回2週間反復点眼したとき、最高濃度は虹彩で最も高く、ついで下結膜、毛様体、網脈絡膜の順であった。虹彩、上強膜、硝子体、毛様体及び網脈絡膜においては、単回点眼時の5～17倍高かった[15)]。

(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

ヒト血漿におけるブリモニジン（0.2～200ng/mL）の蛋白結合率は約 21％であった[16)]（*in vitro*）。

６．代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

ブリモニジンは肝臓で迅速に代謝され、それにはアルデヒドオキシダーゼの関与が示唆されている[17)]。

(2) 代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

本剤は、アイファガン点眼液0.1%の分析結果に基づき添加剤の種類及び含量（濃度）がアイファガン点眼液0.1%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。

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

設定されていない

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 低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の幼児［9.7.2 参照］

３．効能又は効果に関連する注意とその理由

「Ⅴ.2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

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
8.1 全身的に吸収されるため、α_2-作動剤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。
8.2 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。
8.3 本剤の投与により血管新生等を伴う角膜混濁があらわれることがあるので[18)～21)]、患者を定期的に診察し、十分観察すること。また、充血、視力低下、霧視等の自覚症状があらわれた場合には、直ちに受診するよう患者に十分指導すること。［11.1.1 参照］

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 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。
9.1.2 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) 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：経口投与）で乳汁中に移行することが報告されている[22]。

(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、ブリモニジン酒石酸塩点眼液を投与した乳児に無呼吸、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。［2.2 参照］
9.7.3 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[23]。

(8) 高齢者

設定されていない

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
降圧剤	降圧作用を増強する可能性がある。	相加的に降圧作用が増強されると考えられる。
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。	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。

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 角膜混濁（頻度不明）
［8.3 参照］

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	0.1～1%未満	頻度不明
過敏症		接触皮膚炎	丘疹	発疹、紅斑、蕁麻疹
眼	点状角膜炎、眼瞼炎（アレルギー性眼瞼炎を含む）注）、結膜炎（アレルギー性結膜炎を含む）注）	結膜充血、眼そう痒症、眼の異常感	眼瞼紅斑、眼瞼浮腫、マイボーム腺梗塞、結膜浮腫、結膜濾胞、結膜蒼白、結膜出血、乾性角結膜炎、眼脂、眼刺激、眼痛、眼の異物感、霧視、視覚障害、眼精疲労、眼乾燥、流涙増加	眼瞼下垂、眼瞼障害、麦粒腫、角膜炎、角膜びらん、虹彩炎、白内障、硝子体剝離、硝子体浮遊物、視野欠損、視力低下、縮瞳、灼熱感、羞明
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。

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

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- 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。
- 患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- 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。

（解説）

・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

白色ウサギの右眼結膜嚢内にブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」0.1mLを点眼し、その後、1秒間上下眼瞼を閉じて閉眼させた。左眼は対照眼として投与は行わなかった。

投与前、投与後1、24、48及び72時間に左眼を対照として肉眼あるいはポータブルスリットランプを用いて前眼部検査（角膜、虹彩、結膜等）、投与後24時間にフローレス試験紙を用いて角膜異常の有無について検査し、Draizeの判定基準に従って、各観察時の刺激性を評価した。

その結果、全例において、全観察時点で角膜、虹彩及び結膜の異常及び分泌物は認められなかった。Draize法による評価点数の最大値は0であり、眼刺激度の評価区分では「無刺激物」に区分された[24)]。

X．管理的事項に関する項目

１．規制区分

製剤：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
有効成分：該当しない

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：あり（https://www.wakamoto-pharm.co.jp/medical/0095)

６．同一成分・同効薬

先発医薬品名：アイファガン点眼液0.1%

７．国際誕生年月日

1996年9月6日

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
2021年2月15日	30300AMX00133000	2021年6月18日	2021年8月16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。

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
ブリモニジン酒石酸塩点眼液0.1%「わかもと」	1319761Q1074	1319761Q1074	128611301	622861101

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［加速試験］
2）わかもと製薬株式会社　社内資料［苛酷試験（湿度安定性）］
3）わかもと製薬株式会社　社内資料［苛酷試験（光安定性）］
4）わかもと製薬株式会社　社内資料［開封後安定性試験（熱）］
5）わかもと製薬株式会社　社内資料［開封後安定性試験（光）］
6）新家 眞 他：日本眼科学会雑誌. 2012；116：623-634
7）新家 眞 他：日本眼科学会雑誌. 2012；116：955-966
8）第Ⅲ相試験（3-04 試験）（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.7.6.4）
9）新家 眞 他：あたらしい眼科. 2012；29：679-686
10）Burke J, et al.：Surv Ophthalmol. 1996；41（S-1）：S9-S18
11）房水動態に及ぼす影響（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.6.2.2）
12）Toris CB, et al.：Arch Ophthalmol. 1995；113：1514-1517
13）正常眼圧ウサギにおける用量反応性（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.6.2.2）
14）第Ⅰ相試験（1-01 試験）（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.7.6.1）
15）サルにおける単回及び反復点眼投与（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.6.4.4）
16）*In vitro* 血漿タンパク結合（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.6.4.4）
17）Acheampong AA, et al.：Xenobiotica. 1996；26：1035-1055
18）Maruyama Y, et al.：Cornea. 2017；36：1567-1569
19）Tsujinaka A, et al.：Acta Ophthalmol. 2019；97：e948-e949
20）Manabe Y, et al.：Eur J Ophthalmol. 2020；30：NP23-NP25
21）Chikama T, et al.：Ocul Immunol Inflamm. 2023；31：1842-1847
22）排泄（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.6.4.6）
23）第Ⅲ相試験（190342-015試験）［非日本人対象］（アイファガン点眼液0.1％：2012年1月18日承認、申請資料概要2.7.6.27）
24）わかもと製薬株式会社　社内資料［眼粘膜刺激性試験］

２．その他の参考文献

該当資料なし

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

該当資料なし

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) 粉砕

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