

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

イオンチャネル開口薬 緑内障・高眼圧症治療剤

イソプロピル ウノプロストン点眼液

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」

ISOPROPYL UNOPROSTONE Ophthalmic Solution [SAWAI]

剤形	無菌水性点眼液
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1 mL中イソプロピル ウノプロストン1.2mg含有
一般名	和名：イソプロピル ウノプロストン(JAN) 洋名：Isopropyl Unoprostone(JAN)
製造販売承認年月日 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：2009年1月8日 薬価基準収載年月日：2009年5月15日 販売開始年月日：2009年5月15日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2023年9月改訂の電子添文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―

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・表現には薬機法の広告規則や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、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を活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。

(2020年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	15
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	15
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	15
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	15
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	15
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	15
6. RMPの概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	15
		7. 相互作用	16
II. 名称に関する項目	2	8. 副作用	16
1. 販売名	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
2. 一般名	2	10. 過量投与	17
3. 構造式又は示性式	2	11. 適用上の注意	17
4. 分子式及び分子量	2	12. その他の注意	17
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	IX. 非臨床試験に関する項目	18
		1. 薬理試験	18
III. 有効成分に関する項目	3	2. 毒性試験	18
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	X. 管理的事項に関する項目	19
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 規制区分	19
		2. 有効期間	19
IV. 製剤に関する項目	4	3. 包装状態での貯法	19
1. 剤形	4	4. 取扱い上の注意	19
2. 製剤の組成	4	5. 患者向け資材	19
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	6. 同一成分・同効薬	19
4. 力価	4	7. 国際誕生年月日	19
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	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
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	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
7. 調製法及び溶解後の安定性	6	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	19
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	11. 再審査期間	19
9. 溶出性	6	12. 投薬期間制限に関する情報	20
10. 容器・包装	6	13. 各種コード	20
11. 別途提供される資材類	6	14. 保険給付上の注意	20
12. その他	6		
		XI. 文献	21
V. 治療に関する項目	7	1. 引用文献	21
1. 効能又は効果	7	2. その他の参考文献	22
2. 効能又は効果に関連する注意	7		
3. 用法及び用量	7	XII. 参考資料	23
4. 用法及び用量に関連する注意	7	1. 主な外国での発売状況	23
5. 臨床成績	7	2. 海外における臨床支援情報	23
VI. 薬効薬理に関する項目	9	XIII. 備考	24
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	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	24
2. 薬理作用	9	2. その他の関連資料	24
VII. 薬物動態に関する項目	12		
1. 血中濃度の推移	12		
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		
10. 特定の背景を有する患者	14		
11. その他	14		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」は、イソプロピル ウノプロストンを含む緑内障・高眼圧症治療剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号
承認	2009年1月
上市	2009年5月

2. 製品の治療学的特性

1) 本剤は、「緑内障、高眼圧症」の効能又は効果を有する。(V. - 1. 参照)

2) 本剤の用法は、「1日2回点眼」である。(V. - 3. 参照)

3) 副作用として、結膜充血、角膜炎等が報告されている。(VIII. - 8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

特になし

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、最適使用ガイドライン等	有無
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

(2024年6月3日時点)

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

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」

2) 洋名

ISOPROPYL UNOPROSTONE Ophthalmic Solution [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

イソプロピル ウノプロストン(JAN)

2) 洋名(命名法)

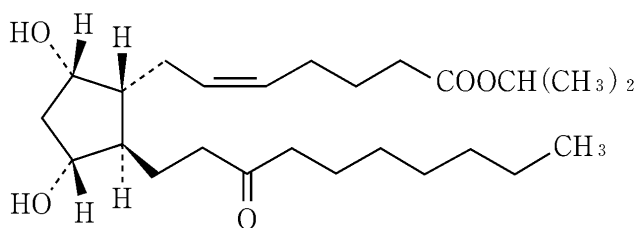
Isopropyl Unoprostone(JAN)

Unoprostone(INN)

3) ステム(stem)

prost : prostaglandin類

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₂₅H₄₄O₅

分子量 : 424.61

5. 化学名(命名法)又は本質

(+)-Isopropyl(Z)-7-[(1R,2R,3R,5S)-3,5-dihydroxy-2-(3-oxodecyl)cyclopentyl]hept-5-enoate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………

1) 外観・性状

無色～微黄色澄明の粘性の液である。

2) 溶解性

アセトニトリル、エタノール(95)、2-プロパノール、酢酸エチル、ジエチルエーテル、1,4-ジオキサン又はヘキサンに極めて溶けやすく、水にほとんど溶けない。

3) 吸湿性

水分：0.3%以下

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：+37～+39°

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>

- 1) 臭素・シクロヘキサン試液による脱色反応
- 2) 紫外可視吸光度測定法
- 3) 赤外吸収スペクトル測定法

<定量法>

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別

無菌水性点眼液

2) 製剤の外観及び性状

性状：無色澄明

3) 識別コード

該当しない

4) 製剤の物性

pH：5.5～7.0

浸透圧比(生理食塩液に対する比)：0.6～0.8

5) その他

該当しない

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 [1 mL中]	イソプロピル ウノプロストン 1.2mg
添加剤	グリセリン、クロルヘキシジングルコン酸塩、トロメタモール、 ホウ酸、モノステアリン酸ポリエチレングリコール、pH調節剤

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当資料なし

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

1) ポリエチレン容器充てん品の安定性(加速試験)¹⁾

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」(ポリエチレン容器に充てんしたもの)について、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保 存 条 件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性 状	無色澄明の無菌水性点眼液であった	同左
確 認 試 験	規格に適合	同左
pH	6.35	6.35
浸 透 圧 比	0.69	0.70
不 溶 性 異 物 検 査	不溶性異物を認めなかった	同左
不 溶 性 微 粒 子 試 験	不溶性微粒子は限度内であり、規格に適合	同左
無 菌 試 験	菌の発育を認めなかった	同左
定 量 試 験※	101.3	95.6

※：表示量に対する含有率(%)

2) ポリエチレン容器充てん品の安定性(長期保存試験)¹⁾

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」(ポリエチレン容器に充てんしたもの)について、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保 存 条 件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 3年
性 状	無色澄明の無菌水性点眼液であった	同左
確 認 試 験	規格に適合	同左
pH	6.37～6.41	6.29～6.33
浸 透 圧 比	0.68～0.72	0.70～0.72
不 溶 性 異 物 検 査	不溶性異物を認めなかった	同左
不 溶 性 微 粒 子 試 験	不溶性微粒子は限度内であり、規格に適合	同左
無 菌 試 験	菌の発育を認めなかった	同左
定 量 試 験※	99.3	95.7

※：表示量に対する含有率(%)

3) 光に対する安定性試験²⁾

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」について、光に対する安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

シュリンクラベル(UVカット)あり

保 存 条 件	イニシャル	総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr
性 状	無色澄明の無菌水性点眼液	同左	同左
pH	6.32	6.33	6.30
浸 透 圧 比	0.70	0.68	0.70
定 量 試 験※	101.0	101.1	97.0

IV. 製剤に関する項目

シュリンクラベル(UVカット)なし

保 存 条 件	イニシャル	総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr
性 状	無色澄明の無菌水性点眼液	同左	同左
pH	6.32	6.33	6.26
浸 透 圧 比	0.70	0.69	0.71
定 量 試 験※	101.0	100.4	97.9

※：表示量に対する含有率(%)

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

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

該当資料なし

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

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

プラスチック点眼容器：5 mL×10本

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

容器：ポリエチレン

中栓：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

1 瓶容量：約 5 mL

1 滴容量：約 26 μ L

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 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

6. 用法及び用量
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

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第Ⅲ相試験(二重盲検比較試験)

全国18施設で原発開放隅角緑内障及び高眼圧症の成人患者を対象に、0.12%イソプロピル ウノプロストン点眼液70例及び0.5%チモロールマレイン酸塩点眼液(対照薬)77例による無作為割付二重盲検比較試験(1回1滴、1日2回12週間)を実施した。その結果、0.12%イソプロピル ウノプロストン点眼液における改善以上^{※1}は91.4%(64/70例)であり、対照薬との非劣性が確認された。なお、やや改善以上^{※2}は98.6%(69/70例)であった。0.12%イソプロピル ウノプロストン点眼液の副作用は、75例中5例(6.7%)に認められ、主な副作用は結膜充血3件であった³⁾。

※1：眼圧のoutflow pressureの下降率20%以上

※2：眼圧のoutflow pressureの下降率10%以上

17.1.2 国内第Ⅲ相試験(長期投与試験)

全国20施設で原発開放隅角緑内障及び高眼圧症の成人患者を対象に、0.12%イソプロピル ウノプロストン点眼液を1回1滴、1日2回52週間点眼した。その結果、改善以上^{※1}は70.8%(34/48例)、やや改善以上^{※2}は83.3%(40/48例)であった。

副作用は、59例中11例(18.6%)に認められ、主な副作用は結膜充血7件であった⁴⁾。

※1：眼圧のoutflow pressureの下降率20%以上

※2：眼圧のoutflow pressureの下降率10%以上

V. 治療に関する項目

17.1.3 国内第Ⅲ相試験(低眼圧緑内障患者に対する試験)

全国1施設で低眼圧緑内障の成人患者を対象に、オープン試験にて、0.12%イソプロピル ウノプロストン点眼液を両眼に1回1滴、1日2回24週間点眼した。その結果、改善以上※¹は75%(9/12例)、やや改善以上※²は83.3%(10/12例)であった。

副作用は、全症例で認められなかった⁵⁾。

※1：眼圧のoutflow pressureの下降率20%以上

※2：眼圧のoutflow pressureの下降率10%以上

17.3 その他

17.3.1 視野への効果

正常眼圧緑内障患者40例、40眼にイソプロピル ウノプロストン点眼液単独10年間点眼を行った。全例視野変化解析で平均偏差(MD)のスロープが有意($p < 5\%$)の視野障害進行眼は9眼(22.5%)であり、残りの31眼(77.5%)において視野障害進行が抑制された。全例におけるMDの年平均進行度は $-0.16 \pm 0.32\text{dB}$ であり、進行9眼においては $-0.56 \pm 0.15\text{dB}$ 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

該当資料なし

(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

該当しない

7) その他

該当資料なし

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……………

プロスタグランジン受容体刺激作用：ラタノプロスト、トラボプロスト、タフルプロスト、
ビマトプロスト⁷⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用……………

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

ウサギ^{8, 9)}、ネコ⁹⁾、健康人^{10, 11)}及び緑内障・高眼圧症患者¹²⁾でのフルオロフトメトリー試験又はトノグラフィー試験において、イソプロピル ウノプロストン点眼液の眼圧下降作用は主経路又は副経路を介する房水流出の促進によることが示唆された。

18.1.1 ウサギ、ネコにおいてイソプロピル ウノプロストン点眼液の点眼後にトノグラフィーにより測定した房水流出率の増加が認められ、ウサギ、サルにおいてイソプロピル ウノプロストン点眼液の眼圧下降作用はピロカルピンにより阻害されないことから、各種正常動物にみられるイソプロピル ウノプロストン点眼液の眼圧下降は、主経路における房水流出抵抗の減少が関与すると考えられる⁹⁾。

18.1.2 健康人を対象としたフルオロフトメトリー試験及びトノグラフィー試験においてイソプロピル ウノプロストン点眼液の眼圧下降作用は主に副経路からの房水流出の促進によると考えられる^{10, 11)}。

18.1.3 緑内障・高眼圧症患者を対象としたフルオロフトメトリー試験においてイソプロピル ウノプロストン点眼液の眼圧下降作用は主経路からの房水流出の促進によると考えられる¹²⁾。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 眼圧下降作用

18.2.1 ウサギ、ネコ、サルにイソプロピル ウノプロストンを点眼した場合、速やかかつ持続的な眼圧下降作用が認められ、ウサギにおいては用量依存的であった¹³⁾。

18.2.2 健康人又は緑内障・高眼圧症患者にイソプロピル ウノプロストン点眼液を点眼した場合、1日2回の点眼で瞳孔径や視力及び血圧や脈拍数に影響を及ぼすことなく眼圧コントロールが得られ、長期点眼においても眼圧が良好に維持されることが認められた^{3, 4, 14~20)}。

18.2.3 緑内障及び高眼圧症患者においてイソプロピル ウノプロストン点眼液と1%ピロカルピン点眼液の眼圧下降効果は相加的であると考えられる²¹⁾。

18.3 眼組織血流に対する作用

18.3.1 ウサギにイソプロピル ウノプロストンを点眼すると脈絡膜組織血流量を増加させることが認められている²²⁾。

18.3.2 健康人にイソプロピル ウノプロストン点眼液を単回点眼すると、網膜中心動脈・短後毛様動脈の最大流速・平均流速・最低流速²³⁾、脈絡膜-網膜NB値(血流速度の指標)²⁴⁾及び視神経乳頭部・後極部網膜の血流^{25, 26)}が増加したと報告されている。また、健康人にイソプロピル ウノプロストン点眼液を7日間又は21日間点眼すると、視神経乳頭及び脈絡膜-網膜NB値が増加したと報告されている^{27, 28)}。

18.3.3 正常眼圧緑内障患者にイソプロピル ウノプロストン点眼液を単回点眼すると、短後毛様動脈の流速²⁹⁾及び視神経乳頭部・後極部網膜の血流^{25, 26)}が増加したと報告されている。また、早期(湖崎分類I・II期)の正常眼圧緑内障患者にイソプロピル ウノプロストン点眼液を6カ月間点眼すると、眼動脈血流速度が増加したと報告されている³⁰⁾。

VI. 薬効薬理に関する項目

18.4 BKチャネル活性化作用

イソプロピル ウノプロストン及びその活性体(脱エステル体)は、ヒト線維柱帯細胞において、BKチャネル(大コンダクタンスカルシウム依存性カリウムチャネル)に対し活性を示すことが報告されている^{31, 32)}。

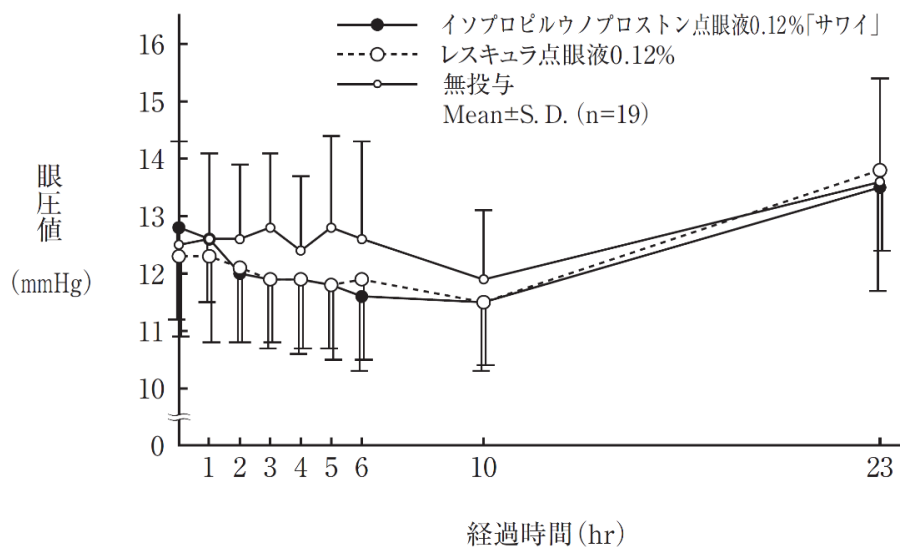
<生物学的同等性試験>^{33, 34)}

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
測定時点	0、1、2、3、4、5、6、10、23hr
休薬期間	7日間
測定方法	非接触眼圧計
試験製剤	イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」
標準製剤	レスキュラ点眼液0.12%

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」とレスキュラ点眼液0.12%を健康成人男子にそれぞれ1滴両目の結膜嚢内に点眼し、無投与群を含む3群(クロスオーバー法)の眼圧値を測定した。各測定時点の眼圧値及び得られたパラメータ(最低眼圧値、眼圧値－時間曲線下面積)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	最低眼圧値 (mmHg)	眼圧値－時間曲線下面積 (mmHg・hr)
イソプロピルウノプロストン 点眼液0.12%「サワイ」	11.0±1.3	280.7±28.3
レスキュラ点眼液0.12%	10.9±0.9	282.9±23.0

(Mean±S.D.)



眼圧値ならびに最低眼圧値、眼圧値－時間曲線下面積のパラメータは、被験者の選択、眼圧の測定回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

ウサギ水負荷高眼圧モデルにおける眼圧下降作用³⁴⁾

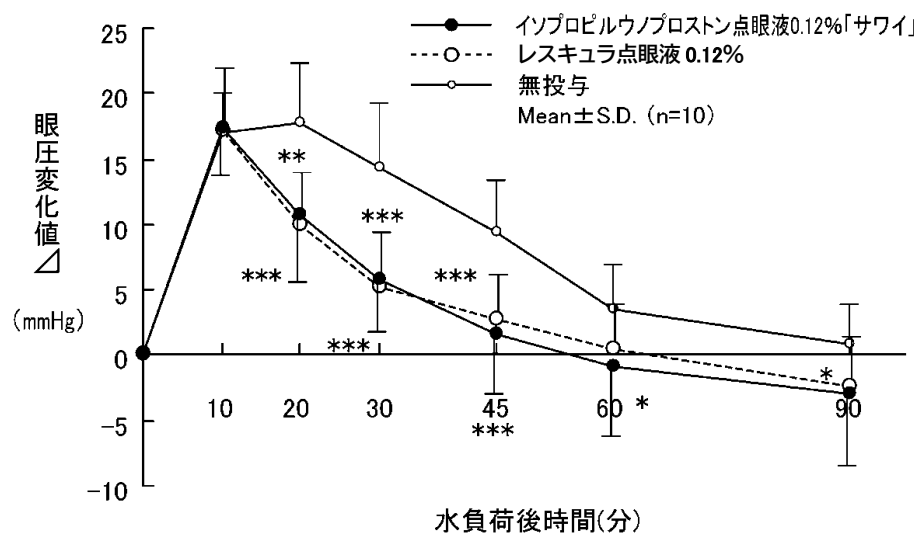
試験製剤	イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」
標準製剤	レスキュラ点眼液0.12%

〈方法〉

ウサギ水負荷高眼圧モデル(雄性、JW)を用いてイソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」及びレスキュラ点眼液0.12%の眼圧下降作用を評価した。イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」又は標準製剤を水負荷前に35 μ L点眼し、その後、水負荷10、20、30、45、60及び90分後の眼圧を測定した。

〈結果〉

イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」点眼群及びレスキュラ点眼液0.12%点眼群は無投与群に比べ、有意な眼圧下降作用を示した。また、両群間に有意差は認められず、両製剤の眼圧下降作用は生物学的に同等であると判断した。



* : $p < 0.05$, ** : $p < 0.01$, *** : $p < 0.001$ vs 無投与 (Studentのt検定)

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
該当資料なし
 - 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
VIII. -6. -5) 参照
 - 3) 乳汁への移行性
VIII. -6. -6) 参照
 - 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
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

VII. 薬物動態に関する項目

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……………
設定されていない

2. 禁忌内容とその理由……………
設定されていない

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 本剤投与中に角膜障害があらわれることがあるので、霧視、異物感、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指導すること。
--

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
 設定されていない

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。生殖毒性試験において器官形成期のラットの高用量群(5 mg/kg/day)、周産期・授乳期のラットの高用量群(1.25mg/kg/day)及び器官形成期のウサギの高用量群(0.3mg/kg/day)で流産の増加傾向がみられた。

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)で乳汁中へ移行することが認められた。
--

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

7) 小児等

9.7 小児等

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。

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

設定されていない

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

設定されていない

2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

		2 %以上	1 ～ 2 %未満	0.1 ～ 1 %未満	頻度不明
眼	結膜	結膜充血		眼脂、結膜浮腫	
	角膜		角膜炎	角膜びらん、角膜点状混濁	
	虹彩				虹彩炎、虹彩色素沈着
	眼瞼			眼瞼発赤、眼瞼炎	眼瞼色素沈着、眼瞼部多毛
	眼刺激			眼痛、一過性眼刺激、灼熱感、異物感、違和感	かゆみ
	その他			霧視	近見視力障害、複視、視力異常(視力低下、暗黒感、一過性青視症等)、一過性近視
その他				頭痛、頭重、頭部圧迫感、口腔内乾燥、鼻閉、舌先のしびれ、悪心、嘔吐、動悸	

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。

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」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
VIII. -6. -5) 参照
 - 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

	規制区分
製剤	該当しない
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

X. -4. 参照

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。

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

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分：レスキュラ点眼液0.12%

同効薬：プロスタグランジン受容体刺激作用

ラタノプロスト、トラボプロスト、タフルプロスト、ビマトプロスト⁷⁾

7. 国際誕生年月日

該当しない

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
2009年1月8日	22100AMX00041000	2009年5月15日	2009年5月15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

X. 管理的事項に関する項目

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

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番号	レセプト電算処理 システム用コード
1319732Q1051	1319732Q1051	119115802	620009591

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献
- 1) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験] イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」
 - 2) 沢井製薬(株) 社内資料[光に対する安定性試験] イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」
 - 3) 東郁郎他：日本眼科紀要，1992；43(12)：1432-1440
 - 4) 東郁郎他：あたらしい眼科，1994；11(9)：1435-1444
 - 5) 藤森千憲他：日本眼科学会雑誌，1993；97(10)：1231-1235
 - 6) 小川一郎他：日本眼科紀要，2006；57(2)：132-138
 - 7) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2024/6/3 アクセス)
 - 8) Sakurai, M. et al. : Jpn. J. Ophthalmol., 1993；37(3)：252-258
 - 9) 吉田祥子他：基礎と臨床，1994；28(12)：3827-3838
 - 10) Sakurai, M. et al. : Jpn. J. Ophthalmol., 1991；35(2)：156-165
 - 11) 手塚ひとみ他：日本眼科学会雑誌，1992；96(4)：496-500
 - 12) Toris, B. et al. : Arch. Ophthalmol., 2004；122：1782-1787
 - 13) 上野隆司他：日本眼科学会雑誌，1992；96(4)：462-468
 - 14) 高瀬正彌他：あたらしい眼科，1992；9(11)：1917-1925
 - 15) 東郁郎他：日本眼科紀要，1992；43(12)：1425-1431
 - 16) 茂木豊他：日本眼科紀要，1993；44(1)：12-18
 - 17) 逸見知弘他：あたらしい眼科，1993；10(12)：2123-2127
 - 18) 新家真他：あたらしい眼科，1993；10(12)：2117-2121
 - 19) 高瀬正彌他：日本眼科学会雑誌，1992；96(10)：1261-1267
 - 20) 高瀬正彌他：あたらしい眼科，1992；9(6)：1055-1059
 - 21) 山本哲也他：日本眼科学会雑誌，1994；98(2)：202-205
 - 22) 杉山哲也他：あたらしい眼科，1992；9(8)：1430-1434
 - 23) 西篤美他：あたらしい眼科，1996；13(9)：1422-1424
 - 24) 小嶋祥太他：日本眼科学会雑誌，1997；101(7)：605-610
 - 25) 木村至他：厚生省特定疾患 網膜脈絡膜・視神経萎縮症調査研究班 平成11年度報告書，2000；238-240
 - 26) Kimura, I. et al. : Jpn. J. Ophthalmol., 2005；49(4)：287-293
 - 27) Tamaki, Y. et al. : J. Ocul. Pharmacol. Ther., 2001；17(6)：517-527
 - 28) Makimoto, Y. et al. : Jpn. J. Ophthalmol., 2002；46：31-35
 - 29) 井戸正史他：あたらしい眼科，1999；16(11)：1577-1579
 - 30) 西村幸英他：あたらしい眼科，1998；15(2)：281-284
 - 31) Thieme, H. et al. : Invest. Ophthalmol. Vis. Sci., 2001；42(13)：3193-3201
 - 32) Cuppoletti, J. et al. : Invest. Ophthalmol. Vis. Sci., 2012；53(9)：5178-5189
 - 33) 竹内譲他：診療と新薬，2009；46(3)：301-305
 - 34) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」

X I. 文献

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
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……………

患者向け資材

・イソプロピルウノプロストン点眼液0.12%「サワイ」を使用される患者さんへ

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

