

\* 2013年7月改訂 (第7版)

\* 2009年9月改訂

## 緑内障治療点眼剤

劇薬

# \* サンピロ®点眼液0.5%

劇薬

# \* サンピロ®点眼液1%

劇薬

# \* サンピロ®点眼液2%

日本標準商品分類番号

871312

劇薬

# \* サンピロ®点眼液3%

劇薬

# \* サンピロ®点眼液4%

## Sanpilo® ophthalmic solution

ピロカルピン塩酸塩点眼液

	サンピロ点眼液0.5%	サンピロ点眼液1%	サンピロ点眼液2%	サンピロ点眼液3%	サンピロ点眼液4%
* 承認番号	22100AMX00528000	22100AMX00527000	22100AMX00529000	22100AMX00530000	22100AMX00531000
* 薬価収載	2009年9月				
販売開始	1967年2月	1967年2月	1967年2月	1970年2月	1970年2月
再評価結果	1977年7月				

貯 法：気密容器、室温保存  
使用期限：外箱及びラベルに記載（3年）

### 〔禁忌(次の患者には投与しないこと)〕

虹彩炎の患者[縮瞳により虹彩の癒着を起こす可能性があり、また炎症を悪化させるおそれがある]

### 〔組成・性状〕

販 売 名	サンピロ点眼液0.5%	サンピロ点眼液1%	サンピロ点眼液2%	サンピロ点眼液3%	サンピロ点眼液4%
有効成分	ピロカルピン塩酸塩				
含量(1mL中)	5 mg	10mg	20mg	30mg	40mg
添 加 物	クロロブタノール、酢酸ナトリウム水和物、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸メチル、ホウ酸、ホウ砂、pH調節剤				
pH	4.5~5.5				4.4~5.4
浸透圧比	1.2~1.4	1.1~1.3	1.3~1.5		
性 状	無色澄明、無菌水性点眼剤				

### 〔効能・効果〕

緑内障、診断または治療を目的とする縮瞳

### 〔用法・用量〕

ピロカルピン塩酸塩として、通常0.5~4%液を1日3~5回、1回1~2滴宛点眼する。

### 〔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) 気管支喘息の患者[気管支収縮作用により喘息発作を強めるおそれがある]
- 2) 網膜剥離の危険のある患者[縮瞳により網膜剥離を起こすおそれがある]

#### 2. 重要な基本的注意

縮瞳(暗黒感)又は調節痙攣が起こるので、本剤投与中の患者には、縮瞳(暗黒感)又は調節痙攣が回復するまで自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意すること。

#### 3. 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。

1) 重大な副作用(まれに:0.1%未満、ときに:0.1~5%未満、副詞なし:5%以上又は頻度不明)

**眼類天疱瘡**: 眼類天疱瘡(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ので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

#### 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。

なお、全身症状があらわれた場合には投与を中止し、アトロピン硫酸塩水和物の投与等適切な処置を講ずること。

種類	頻度	頻度不明
過敏症	眼瞼炎	
眼	白内障、結膜充血、そう痒感、刺激感、眼痛、霧視、暗黒感	
消化器	下痢、悪心・嘔吐	
その他	頭痛、発汗、流涎	

#### 4. 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。

#### 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。[子宮筋の収縮を起こす可能性がある]

#### 6. 適用上の注意

- 1) 投与経路：点眼用にのみ使用すること。
- 2) 投 与 時：
  - (1) 点眼に際しては原則として患者は仰臥位をとり、患眼を開瞼させ、結膜嚢内に点眼し、1~5分間閉瞼し、涙嚢部を圧迫させた後開瞼する。
  - (2) 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よう指導すること。

#### 7. その他

本剤の使用により、錯乱、記憶障害等の精神症状があらわれたとの報告がある。

## 〔薬物動態〕

### 1. 房水中濃度<sup>1)</sup>

(外国人)

白内障の摘出術施行中の患者において、2%ピロカルピン塩酸塩を2滴点眼した後に房水を採取し、房水中のピロカルピン塩酸塩濃度を測定した。点眼してから房水を採取するまでの時間はほとんどの症例において点眼6～26分後に行われ、どの測定時点においても濃度は5 $\mu$ g/mLを超えることはなく、検討した71眼における平均濃度は1.67 $\mu$ g/mLであった。なお、この値より推定されたピロカルピン塩酸塩の房水中への平均移行率は約0.03%であった。

### 2. 適用部位における代謝<sup>2)</sup>

(参考：ウサギ)

ウサギにピロカルピンを点眼すると、角膜でエステラーゼによる加水分解を受け、pilocarpic acidへと代謝されるが、有色ウサギではこの代謝速度が白色ウサギに比べ10<sup>2</sup>倍近く速い。

## 〔薬効薬理〕

### 1. 作用機序<sup>3)</sup>

ピロカルピンは点眼により速やかに眼内に移行し、副交感神経支配の瞳孔括約筋に直接作用してこれを収縮させ、縮瞳する。また、毛様体筋を収縮させることにより線維柱帯が広がり、房水流出が促進され、眼圧が下降する。ピロカルピンのこの作用は副交感神経遮断薬(アトロピン等)により拮抗される。

### 2. 縮瞳作用

緑内障患者にピロカルピンを点眼すると、約8分後より縮瞳が始まり、おおむね1時間で瞳孔径は最小となり、この状態は数時間続いた<sup>4)</sup>。

また、健康成人(外国人)に1%ピロカルピン塩酸塩を1滴点眼すると、おおむね10分後より縮瞳が始まり、30分以内に瞳孔径は最小となり、点眼前の状態に戻るまで6時間以上を要した<sup>5)</sup>。

### 3. 眼圧下降作用

緑内障患者にピロカルピンを点眼すると、眼圧は30分以内に軽度の一過性上昇を示した後、下降し、3時間前後で最低となった。眼圧下降度は、眼圧の高いものほど大きかった。また、ピロカルピン点眼後に房水流出率の有意な増加が認められた<sup>6)</sup>。

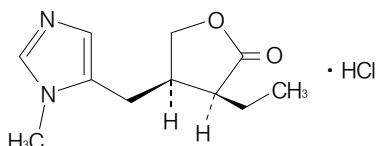
健康人もしくは緑内障患者(外国人)にピロカルピンを1日4回、数日間点眼すると、全症例に眼圧の低下が認められ、眼圧下降率は正常眼で平均21%(範囲：8～38%)、緑内障眼で平均24%(範囲：12～40%)であり、いずれも点眼前の眼圧が高いほど、眼圧下降度は大きかった。また、ほとんどの症例において、ピロカルピン点眼後に眼圧日内変動幅の減少と房水流出率の増加が認められた<sup>6)</sup>。

## 〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名：ピロカルピン塩酸塩 (Pilocarpine Hydrochloride)

化学名：(3S, 4R)-3-Ethyl-4-(1-methyl-1H-imidazol-5-ylmethyl)-4, 5-dihydrofuran-2(3H)-one monohydrochloride

構造式：



分子式：C<sub>11</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>·HCl

分子量：244.72

性状：本品は無色の結晶又は白色の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。

本品は酢酸(100)に極めて溶けやすく、水、メタノール又はエタノール(95)に溶けやすく、無水酢酸にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは3.5～4.5である。

本品は吸湿性である。

本品は光によって変化する。

## 〔包装〕

プラスチック点眼容器 5 mL×10本

## 〔主要文献及び文献請求先〕

### ＜主要文献＞

- 1) D. L. Krohn et al. : Am. J. Ophthalm., **87**, 50 (1979) [53581]
- 2) V. H-L. Lee et al. : Invest. Ophthalm. Vis. Sci., **19**, 210 (1980) [53589]
- 3) W. H. Havener : Ocular Pharmacology, p. 206 (1970) [53591]
- 4) 景山万里子 : 臨床眼科 **12**, 877 (1958) [53583]
- 5) O. Lowenstein et al. : Arch. Ophthalm., **50**, 311 (1953) [53578]
- 6) A. E. Krill et al. : Am. J. Ophthalm., **57**, 34 (1964) [53582]

### ＜文献請求先・製品に関するお問い合わせ先＞

参天製薬株式会社 医薬事業部 医薬情報室  
〒533-8651(個別郵便番号) 大阪市東淀川区下新庄3-9-19  
TEL 0120-921-839 06-6321-7056  
受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

製造販売元 参天製薬株式会社  
\*\* 大阪市北区大深町4-20