

貯 法：室温保存
有効期間：2年

抗真菌剤
ピマリシン点眼液
処方箋医薬品^(注)

ピマリシン点眼液5%「センジュ」[®]

PIMARICIN OPHTHALMIC SUSPENSION 5%

(注)注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 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

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ピマリシン点眼液5%「センジュ」
有効成分	1mL中 ピマリシン50mg(力価)
添加剤	リン酸二水素ナトリウム水和物、エデト酸ナトリウム水和物、ベンザルコニウム塩化物、等張化剤、pH調節剤

3.2 製剤の性状

販売名	ピマリシン点眼液5%「センジュ」
性状	振り混ぜるとき、微黄乳白色～淡黄乳白色の無菌水性懸濁性点眼剤
pH	6.5～7.5

4. 効能又は効果

角膜真菌症

6. 用法及び用量

用時よく振り混ぜた後、通常1回1～2滴、1日6～8回点眼する。なお、症状により適宜回数を増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

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。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

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。

11.2 その他の副作用

	1～5%未満	頻度不明
眼	眼瞼炎	結膜充血、刺激感、角膜びらん、そう痒感、眼の異物感

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。
・使用時、キャップを閉じたままよく振ってからキャップを開けて点眼すること。

・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。
・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。

15. その他の注意

15.2 非臨床試験に基づく情報

動物実験(ウサギ)で5%及び10%ピマリシン点眼液を頻回使用することにより、結膜浮腫、角膜混濁、角膜上皮障害があらわれるとの報告がある。

16. 薬物動態

16.3 分布

ウサギの正常眼及び角膜上皮剝離眼に本剤50 μ Lを点眼した試験では、投与後0.5、1、6、10、16時間の角膜、結膜、強膜及び外眼筋への分布及び濃度推移は次のとおりであった。

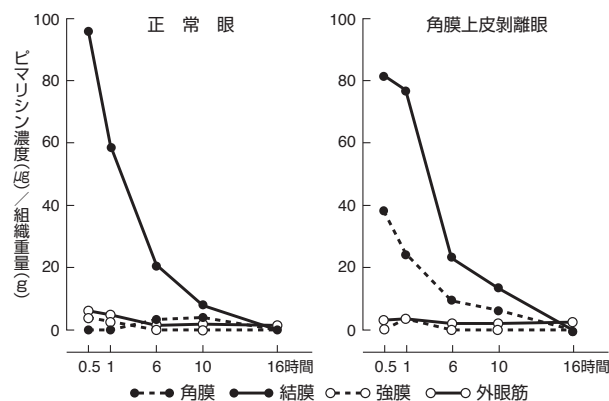


図 点眼による眼組織内濃度の推移(ウサギ)

正常眼では主に結膜に分布し、投与後0.5時間に最高値を示した。角膜、強膜及び外眼筋についてはわずかな分布がみられた。角膜上皮剝離眼では、主に結膜及び角膜に分布し、いずれも投与後0.5時間に最高値を示した。強膜及び外眼筋についてはわずかな分布がみられた。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第Ⅲ相一般臨床試験

角膜真菌症患者に5%ピマリシン点眼液を1日5～8回(症状に応じ、担当医が適宜増減可能)^(注)点眼したところ、有効率84.6%(11/13例)であった。

副作用は22例中1例(4.5%)に認められ、眼瞼炎であった。

(注)承認された用法及び用量は「用時よく振り混ぜた後、通常1回1～2滴、1日6～8回点眼する。なお、症状により適宜回数を増減する。」である。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

真菌の細胞膜に存在するエルゴステロールと結合することにより、真菌細胞のエンドサイトーシスを阻害し、抗真菌作用を示すと考えられている⁽¹⁾⁽²⁾。

18.2 各種真菌に対する抗真菌作用

ピマリシンはアスペルギルス属菌、カンジダ属菌等の病原真菌及びフザリウム属菌等の植物病原菌に対して抗真菌作用を示した³⁾⁴⁾ (*in vitro*)。

18.3 眼科臨床分離菌に対する抗真菌作用

ピマリシンは角膜真菌症患者から分離されたアスペルギルス属菌、フザリウム属菌等に対して抗真菌作用を示した⁵⁾ (*in vitro*)。

18.4 実験的角膜真菌症に対する作用

ウサギ角膜へのフザリウム・ソラニ菌接種による実験的角膜真菌症に対して、本剤を菌接種当日は接種3及び6時間後の2回、菌接種翌日からは、1日4回、21日間点眼した試験では、症状の抑制が認められている。

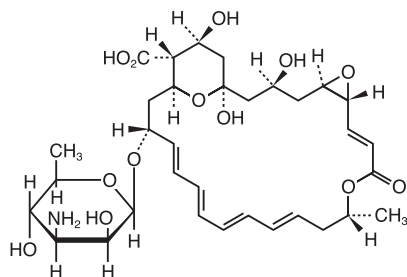
19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：ピマリシン(Pimaricin)〔JAN〕

略号：PMR

化学名：(1*R**,3*S**,5*R**,7*R**,8*E*,12*R**,14*E*,16*E*,18*E*,20*E*,22*R**,24*S**,25*R**,26*S**)-22-(3-Amino-3,6-dideoxy-β-D-mannopyranosyloxy)-1,3,26-trihydroxy-12-methyl-10-oxo-6,11,28-trioxatricyclo[22.3.1.0⁵⁷]octacosan-8,14,16,18,20-pentaene-25-carboxylic acid

構造式：



分子式：C₃₃H₄₇NO₁₃

分子量：665.73

性状：ピマリシンは白色～黄白色の結晶性の粉末である。
メタノール又は酢酸(100)に溶けにくく、水又はエタノール(99.5)にほとんど溶けない。

22. 包装

プラスチック点眼容器 5mL×1

23. 主要文献

- 1) Welscher YM, et al. : J Biol Chem, 2008 ; 283 : 6393-6401
- 2) Leeuwen MR, et al. : J Appl Microbiol, 2009 ; 106 : 1908-1918
- 3) Struyk AP, et al. : Antibiot Annu, 1957-1958 ; 5 : 878-885
- 4) 正古良夫 : J Antibiot Ser B, 1966 ; 19 : 28-30
- 5) 三井幸彦 他 : 日本眼科学会雑誌, 1982 ; 86 : 2213-2223

24. 文献請求先及び問い合わせ先

千寿製薬株式会社 カスタマーサポート室
〒541-0048 大阪市中央区瓦町三丁目1番9号
TEL 0120-069-618 FAX 06-6201-0577
受付時間 9:00~17:30 (土、日、祝日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

千寿製薬株式会社
大阪市中央区瓦町三丁目1番9号

26.2 販売

武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号