

## 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

屈折能検査点眼剤

シクロペントラート塩酸塩点眼液

**サイプレジン<sup>®</sup>1%点眼液**

**Cyplegin<sup>®</sup> ophthalmic solution**

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL 中シクロペントラート塩酸塩 10mg 含有
一般名	和名：シクロペントラート塩酸塩（JAN） 洋名：Cyclopentolate Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造承認年月日：1971年9月23日 薬価基準収載年月日：1974年3月1日 販売開始年月日：1972年4月1日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：参天製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	参天製薬株式会社 製品情報センター TEL：0120-921-839 06-7664-8624 受付時間：9時～17時（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.santen.co.jp/medical-channel/">https://www.santen.co.jp/medical-channel/</a>

本IFは2021年12月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。

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。

## 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・臨床適応するとともに、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。

# 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	5
12. その他	5
V. 治療に関する項目	6
1. 効能又は効果	6
2. 効能又は効果に関連する注意	6
3. 用法及び用量	6
4. 用法及び用量に関連する注意	6
5. 臨床成績	6
VI. 薬効薬理に関する項目	8
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	8
2. 薬理作用	8
VII. 薬物動態に関する項目	9
1. 血中濃度の推移	9
2. 薬物速度論的パラメータ	9
3. 母集団（ポピュレーション）解析	9
4. 吸収	9

5. 分布 .....	9
6. 代謝 .....	10
7. 排泄 .....	10
8. トランスポーターに関する情報 .....	10
9. 透析等による除去率 .....	10
10. 特定の背景を有する患者 .....	10
11. その他 .....	10
<b>VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 .....</b>	<b>11</b>
1. 警告内容とその理由 .....	11
2. 禁忌内容とその理由 .....	11
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 .....	11
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 .....	11
5. 重要な基本的注意とその理由 .....	11
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....	11
7. 相互作用 .....	13
8. 副作用 .....	13
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	14
10. 過量投与 .....	14
11. 適用上の注意 .....	14
12. その他の注意 .....	14
<b>IX. 非臨床試験に関する項目 .....</b>	<b>15</b>
1. 薬理試験 .....	15
2. 毒性試験 .....	15
<b>X. 管理的事項に関する項目 .....</b>	<b>17</b>
1. 規制区分 .....	17
2. 有効期間 .....	17
3. 包装状態での貯法 .....	17
4. 取扱い上の注意 .....	17
5. 患者向け資材 .....	17
6. 同一成分・同効薬 .....	17
7. 国際誕生年月日 .....	17
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 .....	17
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 .....	17
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 .....	18
11. 再審査期間 .....	18
12. 投薬期間制限に関する情報 .....	18
13. 各種コード .....	18
14. 保険給付上の注意 .....	18
<b>XI. 文献 .....</b>	<b>19</b>
1. 引用文献 .....	19
2. その他の参考文献 .....	19
<b>XII. 参考資料 .....</b>	<b>20</b>
1. 主な外国での発売状況 .....	20
2. 海外における臨床支援情報 .....	20
<b>XIII. 備考 .....</b>	<b>22</b>
1. 調剤・服薬指導に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 .....	22
2. その他の関連資料 .....	22

# 略 語 表

なし(個別に各項目において解説する。)

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

シクロペントラート塩酸塩は1951年にTreves、Testa により合成された副交感神経遮断薬の一つで、Ehrenberg らによって1952年にその薬理作用が研究され、アトロピンと同等の調節麻痺効果を有し、持続時間はホマトロピンやアトロピンより短く、米国において毒性の少ないShorter-acting 副交感神経遮断薬であることが明らかにされ、検査用の調節麻痺及び散瞳を目的とする点眼液として発売され世界的にも高く評価された。

日本では1968年よりその1%点眼液が調節麻痺、散瞳等の目的のために用いられるようになった。

本剤は1971年9月に承認され、翌年4月に発売に至り、1977年7月に再評価を終了している。

## 2. 製品の治療学的特性

特になし

## 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料、 最適使用推進ガイドライン等	有 無	タイトル, 参照先
RMP	無	該当資料なし
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	該当資料なし
最適使用推進ガイドライン	無	該当資料なし
保険適用上の留意事項通知	無	該当資料なし

## 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

サイプレジン®1%点眼液

(2) 洋名

Cyplegin® 1% ophthalmic solution

(3) 名称の由来

cycloplegia(調節麻痺)から、全体の語感を重視して命名した。

### 2. 一般名

(1) 和名(命名法)

シクロペントラート塩酸塩(JAN)

(2) 洋名(命名法)

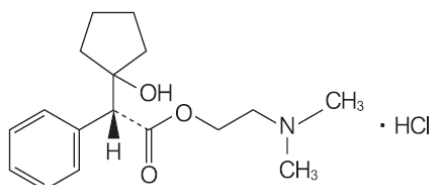
Cyclopentolate Hydrochloride(JAN, USAN)

cyclopentolate(INN)

(3) ステム

不明

### 3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

### 4. 分子式及び分子量

分子式:  $C_{17}H_{25}NO_3 \cdot HCl$

分子量: 327.85

### 5. 化学名(命名法)又は本質

2-(Dimethylamino)ethyl (2*RS*)-2-(1-hydroxycyclopentyl)phenylacetate monohydrochloride (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

塩酸シクロペントラート

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末で、においはないか、又は特異なにおいがある。

##### (2) 溶解性

溶媒	日局の溶解性表現
水	極めて溶けやすい
エタノール(95)	溶けやすい
酢酸(100)	溶けやすい
クロロホルム	溶けやすい
無水酢酸	やや溶けにくい
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: 135~138℃

##### (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0.20gを水20mLに溶かした液のpHは4.5~5.5である。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25~30℃	36ヵ月	二重にしたポリエチレンバック (内側:透明、外側:黒色)に 入れ、厚紙製ドラムに保管	規格内

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### <確認試験法>

日局「シクロペントラート塩酸塩」による

##### <定量法>

日局「シクロペントラート塩酸塩」による

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

(1) 剤形の区分

点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

無色澄明、無菌水性点眼剤

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH: 3.0～4.5

浸透圧比: 0.9～1.1

(5) その他

特になし

### 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	サイブレジン 1%点眼液
有効成分	1mL 中シクロペントラート塩酸塩 10mg
添加剤	ホウ酸、塩化カリウム、ベンザルコニウム塩化物、エデト酸ナトリウム水和物、クロロブタノール、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

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃/40%RH	36ヵ月	最終製品(箱入り)	規格内 <sup>※1</sup>
苛酷試験	25℃	120万lx・hr	点眼容器(ラベル有り、箱なし)	規格内 <sup>※2</sup>
加速試験	40℃/25%RH以下	6ヵ月	最終製品(箱入り)	規格内 <sup>※1</sup>

※1 測定項目:性状、確認試験、pH、浸透圧比、不溶性異物、不溶性微粒子、含量、無菌

※2 測定項目:性状、pH、浸透圧比、含量(旧容器による試験結果を引用、現容器は旧容器に比べ光を透過しにくい)

## 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

該当しない

(2)包装

プラスチック点眼容器:10mL

(3)予備容量

該当しない

(4)容器の材質

点眼容器:(本体)ポリプロピレン (中栓)ポリエチレン、キャップ:ポリエチレン、ラベル:ポリエチレン、シュリンク包装:ポリスチレン

## 11. 別途提供される資材類

特になし

## 12. その他

特になし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

診断または治療を目的とする散瞳と調節麻痺。

### 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日1回1滴宛点眼、または1滴点眼後5～10分して更に1滴を点眼する。

#### (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

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

##### 国内一般臨床試験（屈折検査のための調節麻痺効果）

視力障害及び内斜視を主訴とする小児（3～15歳）127例における本剤2回点眼と、アトロピン1日3回5日間点眼との屈折度の差（[アトロピン点眼時の屈折度]－[本剤点眼時の屈折度]）は－0.5～＋1.5Dの間に分布し、差が1D以内のものが90%以上とばらつきが少なく、平均ではアトロピンの方が＋0.45D遠視側に出た。副作用は点眼時にしみるが認められた<sup>1)</sup>。

また、遠視、遠視性弱視及び調節性内斜視の小児（生後9ヵ月～13歳）44例に、本剤1回点眼後と追加点眼<sup>注)</sup>して散瞳（対光反射消失、瞳孔径6.0mm以上）を確認後に屈折検査を行った結果、特に乳幼児（4歳以下）では散瞳状態を目安にして屈折検査を行う方が確実であることが示唆された。副作用は一過性の顔面発赤1例のみであった<sup>2)</sup>。

注) 本剤の承認された用法・用量は、通常、1日1回1滴宛点眼、または1滴点眼後5～10分して更に1滴を点眼である。

(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

実施していない

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

特になし

## 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

副交感神経遮断薬

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

作用部位：瞳孔括約筋、毛様体筋

作用機序：本剤は、副交感神経においてアセチルコリンを拮抗的に阻害し、瞳孔括約筋の弛緩による散瞳、及び毛様体筋の弛緩による調節麻痺を発現させる。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 調節麻痺作用

高度の屈折異常のない18～47歳の健康人12例に、本剤を5分間隔で1滴ずつ2回点眼し、調節幅を経時的に観察したとき、点眼後調節麻痺は急速に進み、30分後には10例、45分後には全例が2.5D以下の残存調節幅を示した。また、この状態は2時間後まで続き、3～4時間後より回復に向かい、10～24時間でほぼ点眼前の調節力に戻った<sup>3)</sup>。

##### 2) 散瞳作用

調節麻痺作用を検討した上記の12例において瞳孔径の経時的測定も行った。瞳孔は点眼後15分以内に散瞳し始め、25分～3時間、平均1時間35分で最高に達するが、散瞳からの回復は調節力の回復よりも遅れてみられ、8～24時間後より回復に向かい、完全な回復には48～72時間を要した<sup>3)</sup>。

また、虹彩毛様体に異常なく、緑内障の徴候のない6例(16～33歳)に本剤を5分間隔で2回点眼し、経時的に瞳孔径を測定すると、点眼45分後から1時間後に瞳孔径は7mmとなり散瞳が得られ、24時間後にも軽度散瞳が残り、72時間後にほぼ正常な瞳孔径となった<sup>4)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

VI.2.(2) の項参照

## 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  
該当しない
- (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  
特になし

### 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

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

特になし

## 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

#### 2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.1 緑内障及び狭隅角や前房が浅いなどの眼圧上昇の素因のある患者[急性閉塞隅角緑内障の発作を起こすおそれがある。]

〈解説〉

2.1 本剤は副交感神経遮断薬であり、副交感神経終末においてアセチルコリンと競合的に拮抗して神経伝達を遮断し、瞳孔括約筋を弛緩させることにより散瞳を生じ、また毛様体筋の緊張を抑制し調節麻痺を示す。閉塞隅角緑内障、狭隅角や前房が浅いなどの眼圧上昇の素因のある患者に本剤を投与すると、瞳孔括約筋、毛様体筋の弛緩によって隅角が閉塞し、シュレム管からの房水流出が妨げられて眼圧上昇を引き起こす。とくに散瞳が持続すると急性閉塞隅角緑内障の発作を起こすおそれがあるので、これらの患者には投与しないこと。また、開放隅角緑内障の患者でも毛様体筋の弛緩による房水流出抵抗の増加により、眼圧が上昇する場合がありますので、投与しないこと。

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

### 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

8.1 本剤の点眼後、散瞳又は調節麻痺が起こるので、その症状が回復するまで機械類の操作や自動車等の運転には従事させないよう注意すること。また、サングラスを着用する等太陽光や強い光を直接見ないよう指導すること。

〈解説〉

8.1 本剤は副交感神経遮断薬であり、副交感神経終末においてアセチルコリンと競合的に拮抗して神経伝達を遮断し、瞳孔括約筋を弛緩させることにより散瞳を生じ、また毛様体筋の緊張を抑制し調節麻痺を示す。投与後機械類の操作や自動車等の運転を行うと、散瞳又は調節麻痺により事故等を引き起こすおそれがあることから記載した。本剤投与後、物がぼやけて見えたり、普段よりまぶしく感じられる場合は、症状が回復するまで危険を伴う操作を行わないよう指導すること。また、サングラスを着用するなど太陽光や強い光を直接見ないよう指導すること。

[1996年4月より記載、2021年12月一部改訂]

### 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診断又は治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。

〈解説〉

妊産婦への使用経験が少なく、安全性が十分検討されていないことから記載した。妊婦又は妊娠している可能性のある女性には診断又は治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与を検討すること。

[2021年12月より記載]

〈参考〉 X II.2 海外における臨床支援情報の項参照

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

診断又は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。

〈解説〉

授乳中の女性への使用経験が少なく、安全性が十分検討されていないことから記載した。

[2021年12月より記載]

〈参考〉 X II.2 海外における臨床支援情報の項参照

(7) 小児等

9.7 小児等

9.7.1 全身の副作用が起こりやすく、痙攣等があらわれることがある。

9.7.2 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

〈解説〉

9.7.1 シクロペントラート塩酸塩などの三級アミンムスカリン受容体拮抗薬は、結膜囊から血中への吸収は極めて少ないものの、鼻涙管を通して吸収の良好な粘膜表面に達して全身に影響を及ぼすことがある。特に小児で全身性の副作用が起こりやすいとされていることから記載した。小児に投与する場合は観察を十分に行い、慎重に投与すること。

なお、全身性の副作用を防ぐ方法として、点眼後目からあふれた液を直ちに拭き取る、点眼後 1～5 分間閉眼し、涙嚢部を圧迫することが望ましいとされている。

[1999年6月より記載、2015年7月一部改訂、2021年12月一部改訂]

9.7.2 小児等を対象とした臨床試験を実施していないことから記載した。また小児等への使用経験が少なく、安全性が十分検討されていない。

[2021年12月より記載]

〈参考〉 X II.2 海外における臨床支援情報の項参照

(8) 高齢者

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

〈解説〉

高齢者は腎機能、肝機能等の生理機能が低下していることが多く、医薬品の副作用が発現しやすい傾向にあり、一般的に医薬品の投与にあたっては常に十分な注意が必要である。

本剤は、高齢者に投与した場合の安全性が十分検討されていないことから、一般的な注意として記載した。

[1994年3月薬安第30号(H4.4.1)により記載]

## 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

	頻度不明
過敏症	過敏症状
眼	眼圧上昇、点眼直後の熱感、一過性の結膜充血
循環器	頻脈
精神神経系	一過性の幻覚、運動失調、情動錯乱、痙攣
消化器	口渇
その他	顔面潮紅

#### 〈解説〉

医師からの自発報告、海外の副作用報告に基づいて記載した。また、本剤は使用成績調査等の発現頻度が明確となる調査を実施していないため、発現頻度は不明とした。

1992年4月以降、国内で報告された副作用発現件数は以下の通り(2022年9月22日現在)。

#### 過敏症

過敏症状(眼瞼炎):2件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

#### 眼

眼圧上昇:0件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

点眼直後の熱感(眼部熱感):1件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

結膜充血(眼充血):12件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

#### 循環器

頻脈:5件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

#### 精神神経系<sup>5,6)</sup>

幻覚:15件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

運動失調:6件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

情動錯乱(錯乱状態):13件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

痙攣(てんかん、てんかん重積状態):11件

[2015年7月より記載]

#### 消化器

口渇:4件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

#### その他

顔面潮紅(ほてり):9件

[1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂]

痙攣の症例概要はXⅢ.備考の項参照

## 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。

- ・本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物はソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、ソフトコンタクトレンズを装着している場合には、点眼前にレンズを外し、点眼後少なくとも5～10分間の間隔をあけて再装着すること。
- ・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。
- ・本剤を再投与する場合は、10～30分の間隔をおいて慎重に投与すること。
- ・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〉

- ・ソフトコンタクトレンズはベンザルコニウム塩化物等の点眼液の成分を吸着しやすい材質であり、レンズに吸着したベンザルコニウム塩化物が角膜障害を起こす可能性があることから、本剤点眼前にレンズを外し、涙液中のベンザルコニウム塩化物濃度が十分に低下した後にレンズを再装着するよう指導すること。

〔2021年12月より記載〕

- ・点眼剤の一般的な適用上の注意であることから記載した。点眼のとき、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するおそれがある。薬液の汚染及び二次的な感染を防止するために記載した。

〔1999年6月より記載〕

- ・点眼液は鼻涙管を經由して鼻咽頭粘膜から全身へ吸収されることがある。閉眼及び涙嚢部を圧迫して全身吸収を抑制することにより、全身性の副作用を防ぎ、また治療効果を高めるために記載した。

〔1977年7月より記載〕

- ・本剤は屈折能検査薬であり、効果発現が早い、確実な調節麻痺効果を有する、検査に十分な作用の持続性を持つ等の特徴を有しているが、効果発現までの時間や効果の程度は患者個々に差がみられる。また、投与量が増えると全身性の副作用を起こす危険性が高くなる。従って、本剤を再投与する場合は十分な投与間隔において患者の状態をよく観察した上で慎重に行うこと。

〔1976年5月より記載、1977年7月再評価による改訂〕

- ・他の点眼剤と併用する場合の一般的な適用上の注意であることから記載した。併用時の間隔が不十分な場合、先に点眼した薬剤が後から点眼した薬剤によって洗い流されてしまう。他の点眼剤と併用する場合には、相互に影響を与えないよう少なくとも5分以上の間隔をあけて点眼するよう指導すること。

〔2021年12月より記載〕

## 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) 非臨床使用に基づく情報

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

モルモット摘出心房標本において、シクロペントラート塩酸塩  $10^{-6}M$  は心房収縮力、拍動数に影響を与えなかったが、アセチルコリン  $10^{-7}M$  の収縮力減少作用及び拍動数減少作用を完全に抑制した。また、モルモット摘出回腸標本において、シクロペントラート塩酸塩はアセチルコリンによる収縮反応を抑制したが、本作用はアトロピンの約 1/14 であった<sup>7)</sup>。

#### (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<sup>8)</sup>

動物種	性	LD <sub>50</sub> (mg/kg)			
		経口	皮下	腹腔内	静脈内
マウス	雄	1199	292	218	63
	雌	960	495	218	72
ラット	雄	>4000	2400	309	—
	雌	>4000	2235	308	—

#### (2) 反復投与毒性試験<sup>9)</sup>

ラットにシクロペントラート塩酸塩 0.2～60mg/kg を1ヵ月間、腹腔内に投与したところ、雌雄とも体重の増加抑制は認められなかった。

尿検査・血液検査・病理組織検査において、無処置群及び溶解液投与群と比較して有意差は認められなかった。また、ラットにシクロペントラート塩酸塩 0.2～30mg/kg を3ヵ月間腹腔内に投与したところ、30mg/kg投与の雄ラットに軽度の体重増加抑制がみられた。尿検査・血液検査・病理組織検査において、無処置群及び溶解液投与群と比較して有意差は認められなかった。

#### (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<sup>10)</sup>

マウス及びラットに妊娠7日目から13日目までの7日間、シクロペントラート塩酸塩 30mg/kg 及び 0.3mg/kg を毎日1回腹腔内に注射し、妊娠末期の胎仔に及ぼす影響を調べた。対照には溶解液を用いた。

ラットではシクロペントラート塩酸塩は母体及び胎仔に対して影響は認められなかった。マウスでは吸収胎仔数はシクロペントラート塩酸塩投与群、対照群の順に多く、無処置群に比して有意な差を認め、生仔の平均体重(雌)はシクロペントラート塩酸塩投与群および対照群で軽度減少した。また、上後頭骨化骨不全、胸骨格不对称がシクロペントラート塩酸塩投与群で有意に増加した。

(6) 局所刺激性試験<sup>11)</sup>

0.5～6%シクロペントラート塩酸塩点眼液を白色ウサギに1回点眼し、眼粘膜刺激性を Draize 法により検討したところ、6%液点眼後、全例閉眼し、1例は結膜の軽い充血が30分間持続したが、2%以下の濃度ではほとんど症状が認められなかった。

(7) その他の特殊毒性

溶血性、組織障害性<sup>11)</sup>

0.5%、1%及び2%シクロペントラート塩酸塩点眼液の局所刺激作用が検索された。ラットの脊部に、0.5～2%シクロペントラート塩酸塩点眼液と対照液を1回皮下注射し、5日間観察した結果、肉眼的には、1%と2%液投与ラットの皮下組織に軽度の出血斑を認めたほかは特に明らかな変化は認められなかった。組織学的には、1%液と2%液を注射した数例で皮下組織及び筋層に軽度の出血、毛細血管の拡張、脂肪滴を貪食した好中球と単球の浸潤が認められた。

0.5%液ではほとんど変化はなかった。

マウスに0.5～2%シクロペントラート塩酸塩点眼液を腹腔内に投与したが、いずれも肉眼的、組織学的に特に異常は認められなかった。

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤 : 該当しない

有効成分 : 該当しない

### 2. 有効期間

3年(安定性試験結果に基づく)

### 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 : 服薬指導箋 (<https://www.santen.co.jp/medical-channel/tools/shizai/?from=glonavi>)

### 6. 同一成分・同効薬

本剤は先発医薬品であり、一物二名称の製品はない。

### 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

承認年月日 : 1971年9月23日

承認番号 : 14600AMZ02015000

薬価基準収載年月日 : 1974年3月1日

販売開始年月日 : 1972年4月1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

1977年7月6日（再評価結果通知 薬発第659号）

総合評価判定において、「有用性が認められているもの」と判定された。

各適応（効能又は効果）に対する評価判定において、「『診断または治療を目的とする散瞳と調節麻痺』は有効であることが実証されているもの」と判定された。

〈効能・効果、用法・用量の変更〉

変更前	変更後
<用法・用量> 1日1回1～2滴点眼する。または1滴点眼5分後さらに1滴点眼する。	<用法・用量> 通常、1日1回1滴宛点眼、または1滴点眼後5～10分して更に1滴を点眼する。
<効能・効果> 調節麻痺。毛様筋麻痺。散瞳。	<効能・効果> 診断または治療を目的とする散瞳と調節麻痺。

## 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(9桁)番号	レセプト電算処理システム用コード
1311701Q1031	1311701Q1031	101960501	661310066

## 14. 保険給付上の注意

設定されていない

## X I . 文献

### 1. 引用文献

- 1) 久保田伸枝 1 他:眼科 1974;16:419-423 [51016]
- 2) 本田実千雄他:眼科臨床医報 1983;77:66-70 [51045]
- 3) 岩田脩他:臨床眼科 1968;22:1542-1551 [51013]
- 4) 長谷川栄一他:臨床眼科 1971;25:1462-1468 [51015]
- 5) 島川真知子:眼科臨床医報 1980;74:62-66 [51018]
- 6) 松波智恵子他:眼科臨床医報 1983;77:1595-1597 [51048]
- 7) 社内資料:Cyclopentolate Hydrochloride の cholinergic Blocking Action について [51014]
- 8) 社内資料:塩酸シクロペントレートの急性毒性試験 [51019]
- 9) 社内資料:サイクロジールの毒性試験 [51020]
- 10) 社内資料:Cyclogyl のラットおよびマウスの催奇形性試験 [51023]
- 11) 社内資料:塩酸シクロペントレートの局所刺激作用 [51021]

### 2. その他の参考文献

日本薬局方解説書

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない(発売していない)

### 2. 海外における臨床支援情報

#### ・妊娠に関する海外情報(FDA、オーストラリア分類)

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書、オーストラリア分類とは異なる。

#### 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診断又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

診断又は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。

#### 米国の添付文書 (2022年9月)†

##### Pregnancy:

Animal reproduction studies have not been conducted with cyclopentolate. It is also not known whether cyclopentolate can cause fetal harm when administered to a pregnant woman or can affect reproduction capacity. Cyclopentolate should be administered to a pregnant woman only if clearly needed.

FDA: Pregnancy Category	記載なし (2022年9月)†
オーストラリア分類	B2 (2023年10月)*

†: Cyclopentolate Hydrochloride Ophthalmic Solution, USP 1%

\* Prescribing medicines in pregnancy database より引用

〈参考: 分類の概要〉

オーストラリア分類 (The Australian categorisation system for prescribing medicines in pregnancy.)

**Category B2:** Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

#### ・小児等に関する記載

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.7 小児等」の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書および英国の SPC とは異なる。

#### 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

##### 9.7 小児等

9.7.1 全身の副作用が起こりやすく、痙攣等があらわれることがある。

9.7.2 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

米国の添付文書（2022年9月）<sup>†</sup>

Pediatric Use

Use of cyclopentolate has been associated with psychotic reactions and behavioral disturbances in pediatric patients. Increased susceptibility to cyclopentolate has been reported in infants, young children, and in children with spastic paralysis or brain damage. These disturbances include ataxia, incoherent speech, restlessness, hallucinations, hyperactivity, seizures, disorientation as to time and place, and failure to recognize people. Feeding intolerance and necrotizing enterocolitis (in preterm infants) may follow ophthalmic use of this product in infants. It is recommended that feeding be withheld for four (4) hours after examination. Observe infants closely for at least 30 minutes (see WARNINGS).

<sup>†</sup>: Cyclopentolate Hydrochloride Ophthalmic Solution, USP 1%

英国の SmPC（2022年9月）\*

4.2 Posology and method of administration

(i) Refraction / Fundoscopy

Children 6-16 years:

One drop of 1 % solution instilled into the eye, repeated after 15 minutes if necessary, approximately 40 minutes before examination.

Children under 6 years:

One or two drops of 1 % solution instilled into the eye, repeated after 15 minutes if necessary, approximately 40 minutes before examination.

(ii) For Uveitis, Iritis and Iridocyclitis:

Children:

At the discretion of the physician

Do not use during the first three months of life due to possible association between the cycloplegia produced and the development of amblyopia and also the increased risks of systemic toxicity in neonates.

Cycloplegia following administration is quick in onset and short-lived. Maximal cycloplegia is achieved within 15 - 45 minutes of instillation and lasts on average about 20 minutes. Recovery normally takes place in about 4 hours, but very occasionally some effect persists for up to 24 hours.

Mydriasis is produced very rapidly and an average pupil diameter of 7 mm is usually reached 15 - 30 minutes after instillation of one drop of 0.5 % solution. Complete recovery from the mydriatic effect generally occurs spontaneously in not more than 20 hours.

\*: Mydrilate 1.0% Eye Drops

### XIII. 備考

#### 1. 調剤・服薬指導に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

該当資料なし

#### 2. その他の関連資料

◎その他の副作用の症例の概要

##### 【痙攣】

No.	患者		1日投与量 投与期間	副作用	
	性・ 年齢	使用理由 (合併症)		経過及び処置	
1	女・ 3歳	眼科検査 (未熟児網膜 症、熱性けい れん)	両眼 1回1滴 2回 1日間	<b>けいれん</b> 投与開始日： (投与中止日)	本剤両眼1滴ずつ点眼。 初回点眼5分後 本剤両眼1滴ずつ点眼。(2回目) 初回点眼約1時間後 診察。 検査終了後、帰宅途中の車内で強直性けいれん、眼球上 転、失禁の発現。けいれんは5～6分続いた。 初回点眼1時間15分後 救急外来受診。到着時には上肢のピクつきがあったが、安 静にて回復。意識もはっきりとしてきていた。発熱やバイタル の異常はなし。 経過を見るため一泊入院。 中止翌日： 退院。 中止3日後： 脳波測定。両側前頭部に鋭波の疑い。 中止17日後： 神経内科受診。脳波で両側前頭部に鋭波。複雑型熱性け いれん、部分てんかんの疑いで投薬開始。
併用薬：なし					

2	女・ 12歳	眼科検査 (近視)	両眼 1回1滴 2回 1日間	<p><b>けいれん発作</b></p> <p>投与開始日： 近医眼科医院で屈折力検査のため本剤を両眼に1滴ずつ点眼。 (投与中止日) 初回点眼5分後 本剤を両眼に1滴ずつ点眼(2回目)。 初回点眼約30分後 同院待合いで全身性けいれんが出現。すぐに診察室に入り 血圧測定。意識存在下に右口角が下がった後より意識減 損し、顔面から右半身ついで全身に強直性間代性けいれん が出現。 血圧 収縮期159mmHg/拡張期87mmHg 初回点眼約35分後 けいれんは消失したが右手の力が入りにくい様子だった。 初回点眼約40分後 血圧 収縮期139mmHg/拡張期87mmHg 初回点眼約1時間後 小児科に救急搬入。 頭部単純CT: 異常なし 入院の上、輸液を開始し再発作がおきないか観察した。精 査を行い、明らかな異常を認めなかった。 中止翌日： 全身状態に問題ないことを確認して退院となった。回復。 頭部単純MRI: 異常なし 頭部単純MRA: 異常なし 脳波検査(覚醒から睡眠): 異常なし 心電図: 異常なし 心臓超音波検査: 異常なし</p>
併用薬: なし				