

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2021.12.03 第2版（2019.04.24 初版）

有効成分	カルテオロール塩酸塩					
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「ニッター」	東亜薬品			
	2	カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「ニッテン」	ニッテン			
	3	カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「わかもと」	わかもと製薬			
	4	カルテオロール塩酸塩PF点眼液 1%「日点」	日本点眼薬研究所			
	5	カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「ニッター」	東亜薬品			
	6	カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「ニッテン」	ニッテン			
	7	カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「わかもと」	わかもと製薬			
	8	カルテオロール塩酸塩PF点眼液 2%「日点」	日本点眼薬研究所			
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	ミケラン点眼液 1%	大塚製薬			
	②	ミケラン点眼液 2%	大塚製薬			
効能・効果	http://www.bbdb.jp					
用法・用量	http://www.bbdb.jp					
添加物	http://www.bbdb.jp					
解離定数 ¹⁾	pKa=9.74					
溶解度 ¹⁾	水にやや溶けやすい。 水 29mL（試料 1g を溶解するのに要する溶媒の量）〔測定温度：20℃〕					
原薬の安定性 ¹⁾	水	なし				
	液性(pH)	なし				
	光	試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結 果
		苛酷試験 光	直射日光下	開 放	6 箇月	わずかに着色したが分解物は認められなかった。 変化なし
キセノンランプ照射	300 時間					
測定項目：性状、確認試験、分解物、乾燥減量、含量等						
その他	試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結 果	
	長期保存試験	室 温	密 閉	30 箇月	変化なし	
	加速試験		開 放			
	苛酷試験	温度	40℃			密 閉
		湿度	50℃			
湿度		37℃ 75% RH 37℃ 91% RH	開 放			
測定項目：性状、確認試験、分解物、乾燥減量、含量等						
膜透過性	なし					
BCS・Biowaiver option	なし					
薬効分類	131 眼科用剤					
規格単位	1% 1mL 2% 1mL					

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	BE	品質 再評価	純度	検査
1	カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「ニットー」	東亜薬品	○+	記載 対象 外		○*
2	カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「ニッテン」	ニッテン	○+			○*
3	カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「わかもと」	わかもと製薬	○+			○
4	カルテオロール塩酸塩PF点眼液 1%「日点」	日本点眼薬研究所	○+			○*
5	カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「ニットー」	東亜薬品	○+			○*
6	カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「ニッテン」	ニッテン	○+			○*
7	カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「わかもと」	わかもと製薬	○+			○
8	カルテオロール塩酸塩PF点眼液 2%「日点」	日本点眼薬研究所	○+			○*

注)「BE」は、生物学的同等性 (BE) 試験結果を示し、○印がついているものは本情報集にデータを掲載している。○印の右に+印がついているものは動物試験のデータ。【3~5 ページ】

注)「品質再評価」は品質再評価結果通知が発出されている品目を示す。品質再評価は、内用固形製剤の溶出性を溶出試験で確認したものであり、外用剤は検討対象外である。【6 ページ】

注)「純度」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での純度試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である (上記表中の番号は、本情報集に掲載された純度試験結果中の番号と対応している。)。全品目で空欄となっている場合は、純度試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【7 ページ】

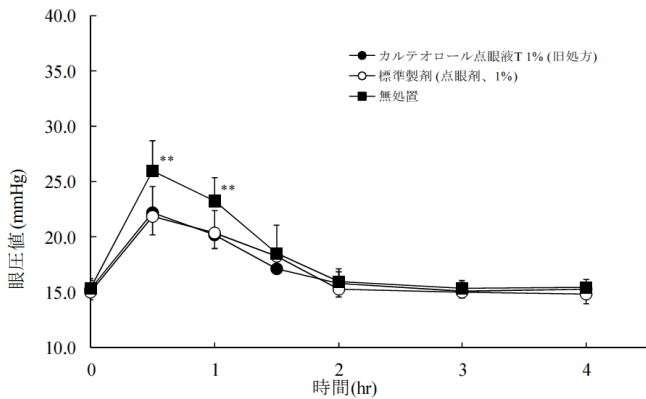
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【8 ページ】

* : 旧販売名で記載

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1 <参考>

標準製剤 v. s. 旧処方製剤

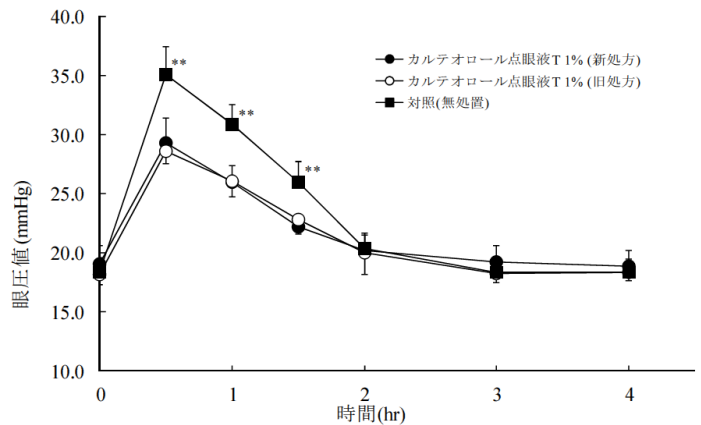


眼圧値推移(ウサギの水負荷眼圧上昇モデルに対する作用)

平均値±標準偏差, n=8

Dunnett 型多重比較検定, ** p<0.01 (vs.旧処方群)

旧処方製剤 v. s. 新処方製剤



眼圧値推移(ウサギの水負荷眼圧上昇モデルに対する作用)

平均値±標準偏差, n=10

Tukey 多重比較検定, ** p<0.01 (vs. 対照(無処置))

(社内資料より)

2 <参考>

家兔正常眼圧に対する効果

家兔の正常眼圧を用いて、カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「ニッテン」と標準製剤について、眼圧下降効果を比較した結果、有意差は認められず、生物学的に同等であると判断された。(t 検定)

家兔実験的高眼圧に対する効果

家兔のカフェイン負荷による実験的高眼圧を用いて、カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「ニッテン」と標準製剤について、眼圧上昇抑制・下降効果を比較した結果、有意差は認められず、生物学的に同等であると判断された。(t 検定)

3 <参考>

カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「わかもと」

正常眼圧に対する眼圧下降作用 (ウサギ)

本剤及び標準製剤を有色ウサギに点眼後、眼圧値の時間曲線下面積 (AUC) を同等性の指標とし、得られた値の平均値の差を 90%信頼区間法にて解析を行った。その結果、平均値の差の 90%信頼区間が標準製剤の±20%の範囲内であったことから、両製剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	AUC _{0-6hr} (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「わかもと」	143.3±2.8
標準製剤 (点眼液、1%)	140.8±1.7

(Mean±S.E., n=10)

水負荷高眼圧モデルに対する作用 (ウサギ) 水負荷後の眼圧値の時間曲線下面積 (AUC) を同等性の指標とし、得られた値の平均値の差を 90%信頼区間法にて解析を行った。その結果、平均値の差の 90%信頼区間が標準製剤の±20%の範囲内であったことから、両製剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	AUC _{0-2hr} (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩点眼液 1%「わかもと」	56.4±1.3
標準製剤 (点眼液、1%)	56.5±1.0

(Mean±S.E., n=12)

4 <参考>

家兔正常眼に対する効果

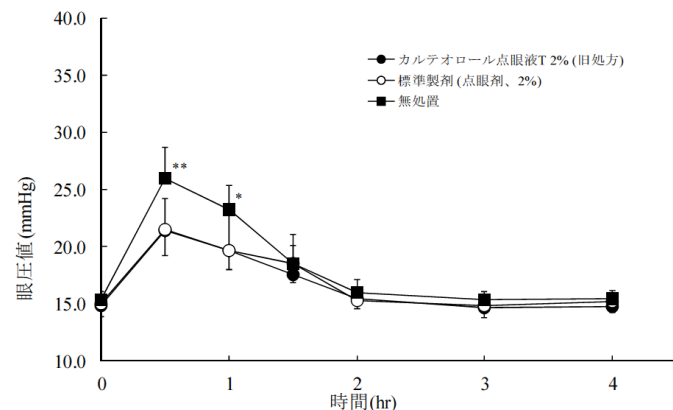
家兔の正常眼を用いて、カルテオロール塩酸塩 PF 点眼液 1%「日点」と標準製剤について、眼圧下降効果を比較した結果、有意差は認められず、生物学的に同等であると判断された。(Tukey の多重比較)

家兔実験的高眼圧眼に対する効果

家兔のカフェイン負荷による実験的高眼圧眼を用いて、カルテオロール塩酸塩 PF 点眼液 1%「日点」と標準製剤について、眼圧上昇抑制・下降効果を比較した結果、有意差は認められず、生物学的に同等であると判断された。(Tukey の多重比較)

5<参考>

標準製剤 v. s. 旧処方製剤

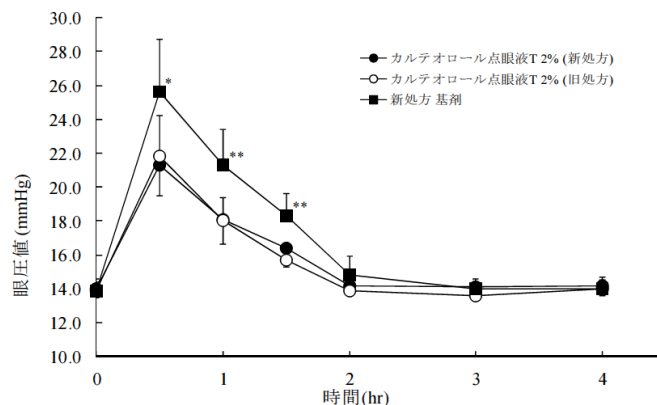


眼圧値推移(ウサギの水負荷眼圧上昇モデルに対する作用)

平均値±標準偏差, n=8

Dunnett 型多重比較検定, ** p<0.01, *<0.05(vs.旧処方群)

旧処方製剤 v. s. 新処方製剤



眼圧値推移(ウサギの水負荷眼圧上昇モデルに対する作用)

平均値±標準偏差, n=8

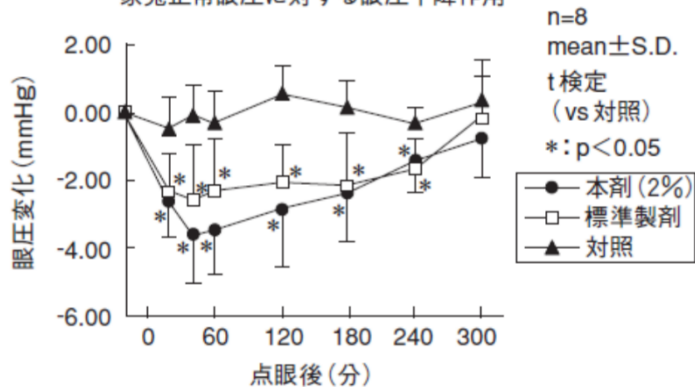
Dunnett 型多重比較検定, ** p<0.01, *<0.05(vs.旧処方群)

(社内資料より)

6 <参考>

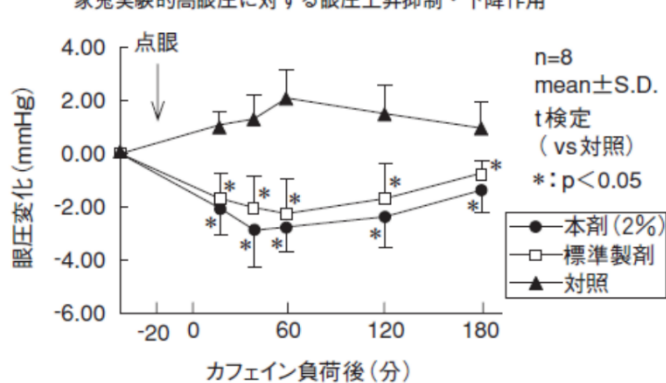
カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「ニッテン」

家兔正常眼圧に対する眼圧下降作用



n=8
mean±S.D.
t検定
(vs 対照)
*: p<0.05

家兔実験的高眼圧に対する眼圧上昇抑制・下降作用



n=8
mean±S.D.
t検定
(vs 対照)
*: p<0.05

(インタビューフォームより)

7 <参考>

カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「わかもと」

正常眼圧に対する眼圧下降作用（ウサギ）

本剤及び標準製剤を有色ウサギに点眼後、眼圧値の時間曲線下面積（AUC）を同等性の指標とし、得られた値の平均値の差を 90%信頼区間法にて解析を行った。その結果、平均値の差の 90%信頼区間が標準製剤の±20%の範囲内であったことから、両製剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	AUC _{0-6hr} (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩 点眼液 2%「わかもと」	152.5±2.0
標準製剤（点眼液、2%）	149.4±1.5

(Mean±S.E., n=10)

水負荷高眼圧モデルに対する作用（ウサギ）

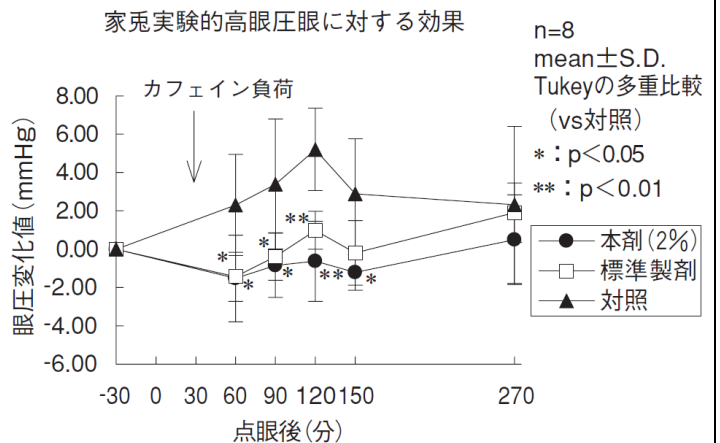
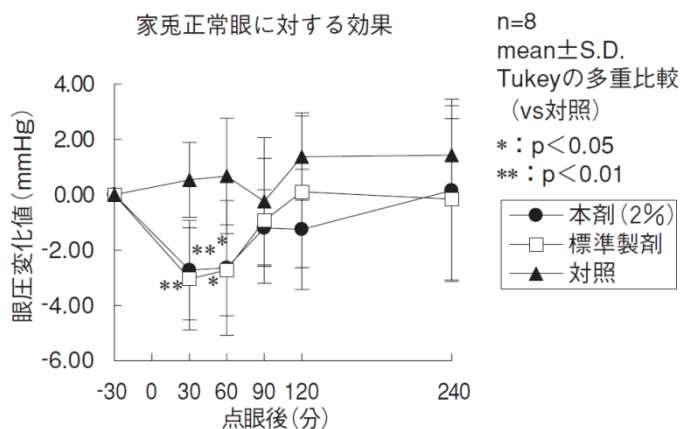
水負荷後の眼圧値の時間曲線下面積（AUC）を同等性の指標とし、得られた値の平均値の差を 90%信頼区間法にて解析を行った。その結果、平均値の差の 90%信頼区間が標準製剤の±20%の範囲内であったことから、両製剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	AUC _{0-2hr} (mmHg・hr)
カルテオロール塩酸塩 点眼液 2%「わかもと」	54.0±1.0
標準製剤（点眼液、2%）	52.1±1.5

(Mean±S.E., n=12)

8 <参考>

カルテオロール塩酸塩 PF 点眼液 2%「日点」



【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】

記載対象外

【純度試験結果（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】

なし

【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】²⁾

平成 28 年度（定量・力価試験） 適

【分析法（純度試験）】

なし

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) ミケラン点眼液 1%/2% (製造販売元: 大塚製薬株式会社) 医薬品インタビューフォーム (2017年4月改訂、第11版)
- 2) 平成28年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書 (平成30年6月、厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課)