

** 2009年10月改訂(第7版)

* 2009年8月改訂

貯法: 室温保存

使用期限: 直接の容器、外箱に表示(3年)

日本標準商品分類番号
871312

緑内障、調節性内斜視

重症筋無力症(眼筋型)治療剤

承認番号	(47AM)807
薬価収載	1972年11月
販売開始	1972年8月

* 毒薬

ウブレチド® 点眼液 1%

UBRETID® OPHTHALMIC SOLUTION 1%

ジスチグミン臭化物(Distigmine Bromide)製剤

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

1. 前駆期緑内障の患者〔眼圧上昇を来すおそれがある。〕
2. 脱分極性筋弛緩剤(スキサメトニウム)を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

【組成・性状】

販売名	ウブレチド点眼液 1%
成分・含量	1 mL中(日局)ジスチグミン臭化物10mg
添加物	塩化ナトリウム ベンザルコニウム塩化物液 クエン酸水和物 クエン酸ナトリウム水和物
性状	無色澄明の水性点眼剤 無菌製剤
pH	5.0~6.5
浸透圧比	約1 (生理食塩液に対する比)

【効能又は効果】

緑内障、調節性内斜視、重症筋無力症(眼筋型)

【用法及び用量】

1回1滴を1日1~2回点眼する。

** 【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)閉塞隅角ないし狭隅角緑内障の患者(急性又は慢性うっ血性緑内障)〔眼圧上昇を来すことがあるので観察を十分に行うこと。〕
- (2)気管支喘息の患者〔気管支喘息の症状を悪化させるおそれがある。〕
- (3)消化器の機能亢進状態の患者〔消化管機能を更に亢進させ、症状を悪化させるおそれがある。〕
- (4)胃・十二指腸潰瘍の患者〔消化管機能を亢進させ潰瘍の症状を悪化させるおそれがある。〕
- (5)徐脈・心臓障害のある患者〔心拍数低下、心拍出量低下を起こすおそれがある。〕
- (6)てんかんの患者〔てんかんの症状を悪化させるおそれがある。〕
- (7)パーキンソン症候群の患者〔パーキンソン症候群の症状を悪化させるおそれがある。〕

** 2. 相互作用

** (1)併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
脱分極性筋弛緩剤 スキサメトニウム塩化物水和物 スキサメトニウム注〔AS〕 レラキシン注	脱分極性筋弛緩剤の作用を増強するおそれがある。	1)脱分極性筋弛緩剤はコリンエステラーゼにより代謝されるため、本剤により代謝が阻害されることが考えられる。 2)本剤による直接ニコチン様作用には脱分極性筋弛緩作用がある。

(2)併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
副交感神経抑制剤 アトロピン硫酸塩水和物等	相互に作用を拮抗する。	本剤のムスカリン様作用と拮抗することが考えられる。
コリン作動薬 ベタネコール塩化物等	相互に作用を増強する。	本剤のコリン作用と相加・相乗作用があらわれることが考えられる。
コリンエステラーゼ阻害薬 ドネベジル塩酸塩等	相互に作用を増強する可能性がある。	

3. 副作用

総症例383例中129例(33.7%)に副作用が認められ、主な副作用は流涙43例(11.2%)、結膜炎35例(9.1%)、結膜充血31例(8.1%)、視矇21例(5.5%)、異物感14例(3.7%)、眼圧逆上昇7例(1.8%)であった。

(承認時)

	5%以上	0.1~5%未満	頻度不明
眼	流涙、結膜炎、結膜充血、視矇	眼痛、異物感、眼圧逆上昇、虹彩嚢腫*	
消化器		下痢	腹痛、口渇
皮膚			発疹、皮膚乾燥

*発現した場合は休薬するか、アドレナリン、フェニレフリンの点眼を行う

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、産婦等に対する安全性は確立していない。

6. 小児等への投与

長期連用時に虹彩嚢腫があらわれることがあるので、この場合は休薬するか、アドレナリン、フェニレフリンの点眼を行うこと。

7. 適用上の注意

(1)投与経路

点眼用にのみ使用すること。

(2)投与时

点眼に際しては原則として患者は横臥位をとり、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。

【薬物動態】

(参考)動物における分布¹⁾

³H-ジスチグミン臭化物を白色家兎に点眼した結果、投与後約20分で眼内組織濃度は最高となり、以後0.3~0.45/hrの割合で指数関数的に減少した。

【臨床成績】

疾患別有効率

疾患名	1日投与回数		
	有効率%(有効例/症例数)		
	1回/日	2回/日	計
緑内障	64.3 (45/70)	68.6 (35/51)	66.1 (80/121)
調節性内斜視	56.1 (32/57)	58.0 (51/88)	57.2 (83/145)
重症筋無力症(眼筋型)	100.0 (1/1)	80.0 (12/15)	81.3 (13/16)
計	60.9 (78/128)	63.6 (98/154)	62.4 (176/282)

緑内障における例数は眼数を示し、他は症例数を示す

【包装】

5 mL × 5 本

【主要文献】

- 1) 三島濟一ほか：眼科臨床医報，64(5)，406，1970
- 2) 塚原重雄：臨床眼科，24(2)，291，1970

【文献請求先】

鳥居薬品株式会社 お客様相談室
〒103-8439 東京都中央区日本橋本町3-4-1
TEL 0120-316-834
FAX 03-5203-7335

【薬効薬理】

1. 眼圧に対する作用²⁾

広隅角緑内障患者に本剤の1%液1滴点眼したところ、眼圧は1時間後に下降し始め、12時間後には最低眼圧となり、24時間後までこれが持続され、84時間後でも点眼前の眼圧より低かった。

2. 瞳孔に対する作用

ネコに本剤の1%液を点眼したところ、縮瞳は24時間以上持続し、アトロピンによる散瞳に対しても著明に拮抗した。

3. コリンエステラーゼ阻害作用

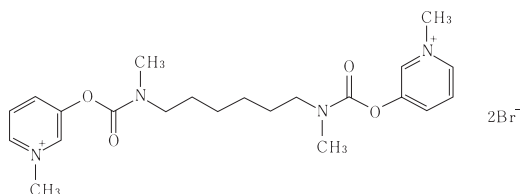
本剤100 μg/kg及びネオスチグミン100~400 μg/kgをラットに1回腹腔内投与したとき、血中コリンエステラーゼ活性はそれぞれ約80%及び30~60%阻害された。

4. アセチルコリン作用の増強

ラットの血涙反応では、対照値のアセチルコリンED₅₀値を1/5に減ずるに要する用量は、本剤で8.6 μg/kg、ネオスチグミンで16.6 μg/kgであった。また、本剤の作用は、投与後2時間で最大となり、少なくとも48時間以上持続した。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



分子式：C₂₂H₃₂Br₂N₄O₄ (576.32)

一般名：ジスチグミン臭化物 Distigmine Bromide (JAN, INN)

化学名：3,3'-[Hexamethylenebis(methyliminocarbonyloxy)] bis(1-methylpyridinium) dibromide

融点：約150℃(分解)

性状：本品は白色の結晶性の粉末である。本品は水に極めて溶けやすく、メタノール、エタノール(95)又は酢酸(100)に溶けやすく、無水酢酸に溶けにくい。本品の水溶液(1→100)のpHは5.0~5.5である。本品はやや吸湿性である。本品は光によって徐々に着色する。

提携

ニコメッド オーストリア社

製造
販売元



鳥居薬品株式会社

東京都中央区日本橋本町3-4-1