

ナタマイシン含有医薬品に関する情報

- 1 ピマリシン 5%点眼液「センジュ」 添付文書
- 2 ピマリシン 1%眼軟膏「センジュ」 添付文書

承認番号	(60EM)第1622号
薬価収載	1985年12月
販売開始	1985年12月
再審査結果	1992年12月

貯 法：室温保存

※使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること(使用期限内であっても、開封後は速やかに使用すること)。

抗真菌剤

要指示医薬品[※]

ピマリシン5%点眼液「センジュ」 PIMARICIN 5% OPHTHALMIC SUSPENSION「SENJU」

ピマリシン点眼液 (略号：PMR)

注)注意—医師等の処方せん・指示により使用すること。

【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

【組成・性状】**

成分・含量 (1mL中)	ピマリシン50mg (力価)
**添加物 (1mL中)	エデト酸ナトリウム1mg 塩化ベンザルコニウム0.05mg 結晶リン酸二水素ナトリウム、塩化ナトリウム、水酸化ナトリウム、塩酸
剤 形	懸濁点眼剤
色	振り混ぜるとき、微黄乳白色～淡黄乳白色
pH	6.5～7.5
その他	無菌製剤

【効能・効果】

角膜真菌症

【用法・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。

【使用上の注意】

1. 副作用

承認時及び使用成績調査での総症例160例中37例(23.13%)に副作用が認められた。

主な副作用は、結膜充血15件(9.38%)、刺激感15件(9.38%)、眼瞼炎9件(5.63%)、角膜糜爛5件(3.13%)、痒痒感3件(1.88%)であった(再審査終了時)。

以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

	5%以上	0.1～5%未満
眼	結膜充血、刺激感、眼瞼炎	角膜糜爛、痒痒感

2. 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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

3. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

4. 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：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。

5. その他の注意

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。

【薬物動態】

(参 考)

眼内移行(ウサギ)

ウサギにピマリシン5%点眼液「センジュ」0.05mLを、正常眼及び角膜上皮剥離眼に点眼した試験では、30分、1、6、10、16時間後の外眼部各組織への分布及び時間的推移は次のとおりである。

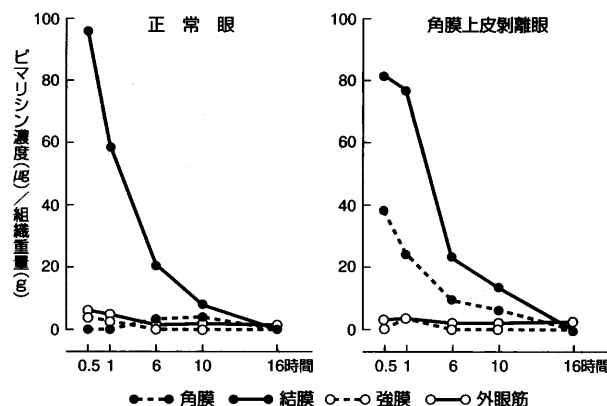


図 点眼による眼組織内濃度の推移(ウサギ)

正常眼においては、点眼30分後に結膜に大量の分布がみられた。一方、角膜上皮剥離眼では結膜及び角膜に大量の分布がみられた。時間的推移については、角膜では正常眼で6時間後及び10時間後にわずかの分布がみられるが、角膜上皮剥離眼では点眼30分後に最高値を示し、以降漸次減少した。結膜では、正常眼、角膜上皮剥離眼とも点眼30分後に最高値を示し、以降漸次減少した。強膜、外眼筋については正常眼及び角膜上皮剥離眼ともにわずかの移行量がみられた。

【臨床成績】

角膜真菌症13例についての臨床試験では、11例〔有効率(有効以上)84.6%〕に臨床効果が認められた。

【薬効薬理】

1. 各種真菌に対する抗菌作用^{1,2)}

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抗菌力を示す(*in vitro*)。

2. 眼科臨床分離菌に対する抗菌作用³⁾

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抗菌力を示す(*in vitro*)。

3. 実験的角膜真菌症に対する作用

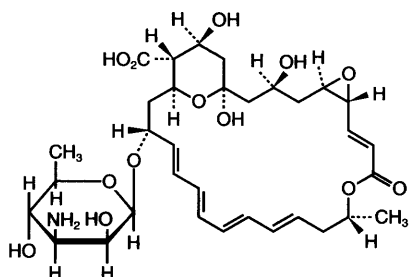
ウサギ角膜へのフザリウム・ソラニ菌接種による実験的角膜真菌症に対して、菌接種翌日よりピマリシン5%点眼液「センジュ」を1回1滴、1時間ごとに1日9回、21日間点眼した試験では、角膜真菌症の進行は抑制されている。

【有効成分に関する理化学的知見】**

一般名：ピマリシン(Pimaricin)〔JAN〕

** 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[22.3.1.0^{5,7}]octacos-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。

【包装】

5mL×1

【主要文献】

- 1) Struyk, A. P. et al. : Antibiotics Annual, 878, 1957.
- 2) 正古良夫 : J. Antibiotics, Ser. B., 19, 28, 1966.
- 3) 三井幸彦他 : 日本眼科学会雑誌, 86, 2213, 1982.

【文献請求先】

千寿製薬株式会社 学術情報部

〒541-0046 大阪市中央区平野町二丁目5番8号

(本剤は、Yamanouchi Europe B. V., Leiderdorp, the Netherlandsの許諾に基づき製造)

製造 千寿製薬株式会社
大阪市中央区平野町二丁目5番8号

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

＊2002年1月改訂（第2版）
1998年8月改訂

貯 法：室温保存

＊使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること（使用期限内であっても、開封後は速やかに使用すること）。

日本標準商品分類番号	871317
承認番号	(2EM)第8号
薬価収載	1990年4月
販売開始	1990年5月
再審査結果	1996年3月

抗真菌剤
要指示医薬品^{注)} **ピマリシン1%眼軟膏「センジュ」**
PIMARICIN 1% OPHTHALMIC OINTMENT「SENJU」
ピマリシン眼軟膏（略号：PMR）

注)注意—医師等の処方せん・指示により使用すること。

【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

【組成・性状】

成分・含量 (1g中)	ピマリシン10mg（力価）
添加物	流動パラフィン、白色ワセリン
剤形	眼軟膏
色	微黄色～淡黄色
その他	無菌製剤

【効能・効果】

角膜真菌症

【用法・用量】

通常、1回適量を1日4～5回塗布する。なお、症状により適宜回数を増減する。

【使用上の注意】

1. 副作用

承認時及び使用成績調査での総症例101例中7例(6.93%)に副作用が認められた。
主な副作用は、結膜充血3件(2.97%)であった(再審査終了時)。
以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

	0.1～5%未満
眼	結膜充血

2. 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。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

3. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

4. 適用上の注意

投与経路：点眼用により使用すること。

5. その他の注意

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。

【薬物動態】

(参 考)

眼内移行(ウサギ)

ウサギにピマリシン1%眼軟膏「センジュ」100mgを、正常眼及び角膜上皮剥離眼に点眼した試験では、角膜では正常眼においてほとんど移行が認められていないが、上皮剥離眼において移行が認められており、移行量は点眼2時間後に最高値を示した。また、結膜では正常眼及び角膜上皮剥離眼ともに移行が認められ、点眼1時間後に最高値を示した。

【臨床成績】

角膜真菌症19例についての臨床試験では、16例〔有効率(有効以上)84.2%〕に臨床効果が認められた。

【薬効薬理】

1. 各種真菌に対する抗菌作用^{1,2)}

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抗菌力を示す(*in vitro*)。

2. 眼科臨床分離菌に対する抗菌作用³⁾

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抗菌力を示す(*in vitro*)。

3. 実験的角膜真菌症に対する作用

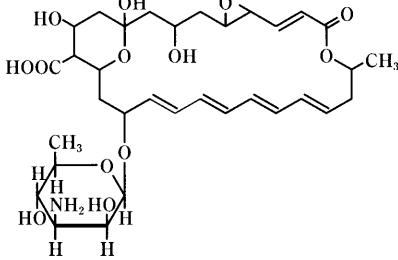
ウサギ角膜へのフザリウム・ソラニ菌接種による実験的角膜真菌症に対して、ピマリシン1%眼軟膏「センジュ」を菌接種当日は接種3及び6時間後の2回、菌接種翌日からは、1日4回、21日間点眼した試験では、症状の抑制が認められている。

【有効成分に関する理化学的知見】*

一般名：ピマリシン(Pimaricin)〔JAN〕

化学名：Stereoisomer of 22-[(3-amino-3,6-dideoxy-β-D-mannopyranosyl)oxy]-1,3,26-trihydroxy-12-methyl-10-oxo-6,11,28-trioxatricyclo[22.3.1.0^{5,7}]octacos-8,14,16,18,20-pentaene-25-carboxylic acid

構造式：



分子式： $C_{33}H_{47}NO_{13}$

分子量：665.74

＊性 状：ピマリシンは、白色～黄白色の結晶性の粉末である。
酢酸(100)又はメタノールに溶けにくく、水、エタノール
又はエーテルにほとんど溶けない。

【包 装】

5g×1

【主要文献】

- 1) Struyk, A. P. et al. : Antibiotics Annual, 878, 1957.
- 2) 正古良夫：J. Antibiotics, Ser. B., **19**, 28, 1966.
- 3) 三井幸彦他：日本眼科学会雑誌, **86**, 2213, 1982.

【文献請求先】

千寿製薬株式会社 学術情報部

〒541-0046 大阪市中央区平野町二丁目5番8号

(本剤は、Yamanouchi Europe B.V., Leiderdorp, the Netherlands
の許諾に基づき製造)

製造 千 寿 製 薬 株 式 会 社
大阪市中央区平野町二丁目5番8号

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