

貯法：10℃以下保存
有効期間：3年

| | |
|------|------------------|
| 承認番号 | 23000AMX00898000 |
| 販売開始 | 1999年7月 |

非ステロイド性抗炎症剤
ジクロフェナクナトリウム点眼液

ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニッテン」

Diclofenac Sodium Ophthalmic Solution

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)
2.1 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 | ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニッテン」 |
| 有効成分 | 1mL中 日局 ジクロフェナクナトリウム 1mg |
| 添加剤 | ホウ酸、トロメタモール、ポリオキシエチレンヒマシ油、ソルビン酸、エデト酸ナトリウム水和物 |

3.2 製剤の性状

| | |
|------|-----------------------------------|
| 販売名 | ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニッテン」 |
| pH | 6.7~7.7 |
| 浸透圧比 | 0.9~1.2 |
| 性状 | 無色~微黄色澄明、わずかに乳白光を発することもある、無菌水性点眼剤 |

4. 効能又は効果

白内障手術時における下記症状の防止
術後の炎症症状、術中・術後合併症

6. 用法及び用量

通常、眼手術前4回(3時間前、2時間前、1時間前、30分前)、眼手術後1日3回、1回1滴点眼する。

8. 重要な基本的注意

眼の感染症を不顕性化するおそれがあるので、観察を十分に行い、感染を起こした場合は投与を中止すること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 点状表層角膜炎のある患者

角膜びらん、さらに角膜潰瘍、角膜穿孔へと進行するおそれがある。[11.1.2 参照]

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

蕁麻疹、血管浮腫、呼吸困難等があらわれることがある。

11.1.2 角膜潰瘍、角膜穿孔(いずれも頻度不明)

角膜びらん等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。[9.1.1 参照]

11.2 その他の副作用

| | 0.1~1%未満 | 0.1%未満 |
|---|-----------------|----------------|
| 眼 | びまん性表層角膜炎、角膜びらん | 一過性の疼痛、痒痒感、乾燥感 |

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。
・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分間閉眼して涙液部を圧迫させた後、開眼すること。
- ・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

15.1 臨床使用に基づく情報

海外の添付文書において、以下の記載がある。

- ・非ステロイド性抗炎症薬は、血小板凝集の阻害作用を持つため、眼手術時に眼組織における出血時間を延長させる可能性がある。
- ・アセチルサリチル酸、フェニル酢酸誘導体、その他非ステロイド性抗炎症薬と交叉感受性をもつ可能性があるため、これらの薬剤に過敏な患者には本剤の投与に際して注意が必要である。

16. 薬物動態

16.3 分布

16.3.1 眼前房水中移行

白内障など眼内手術患者に0.1%ジクロフェナクナトリウム点眼液を1回1滴点眼後、手術時の前房水中ジクロフェナクナトリウム濃度を測定した。得られた実測値から薬動学的解析を行い、ヒト眼房水中移行のパラメータを求め、手術前4回(3、2、1、0.5時間前)点眼における前房水中移行モデル曲線を作成した結果、手術前において約0.13ng/ μ Lの濃度が得られた¹⁾。

16.3.2 眼組織内移行

家兎眼に0.1%¹⁴C-ジクロフェナクナトリウム点眼液50 μ Lを単回点眼し、経時的に各眼組織内放射能濃度を測定した結果、外眼部組織では20分、前眼部組織では40~60分で最高値に達した²⁾。

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Ⅱ、Ⅲ相試験

白内障手術患者を対象とした二重盲検比較試験を含む臨床試験の結果、術後の炎症症状の防止に対する有効性評価対象症例313例における有効率は58.1%(182/313)で^{3)~7)}、術中・術後合併症の防止に対する有効性評価対象症例211例における有効率は75.8%(160/211)であった^{3)~5)}。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

プロスタグランジン生合成の律速酵素であるシクロオキシゲナーゼ(COX)を阻害し、プロスタグランジンの生合成を抑制することにより、抗炎症作用を現す⁸⁾。

18.2 プロスタグランジン生合成抑制作用

家兎眼での前房穿刺による機械的刺激又はアラキドン酸点眼による化学的刺激によって起こる房水中のプロスタグランジンE₂、F_{2 α} の増加に対して、0.1%ジクロフェナクナトリウム点眼液は基剤に比べてプロスタグランジンE₂、F_{2 α} の生合成を有意に抑制した⁹⁾。

18.3 房水蛋白増加抑制作用

家兎眼での前房穿刺又はアラキドン酸点眼による刺激によって起こる房水中の蛋白増加に対して、0.1%ジクロフェナクナトリウム点眼液は基剤に比べて房水蛋白の増加を有意に抑制した⁹⁾。

18.4 抗炎症作用

18.4.1 実験的ブドウ膜炎に対する抑制作用

感作家兎硝子体への抗原注入によるブドウ膜炎において、0.1%ジクロフェナクナトリウム点眼液は生理食塩液に比べてブドウ膜炎の発症を有意に抑制した¹⁰⁾。

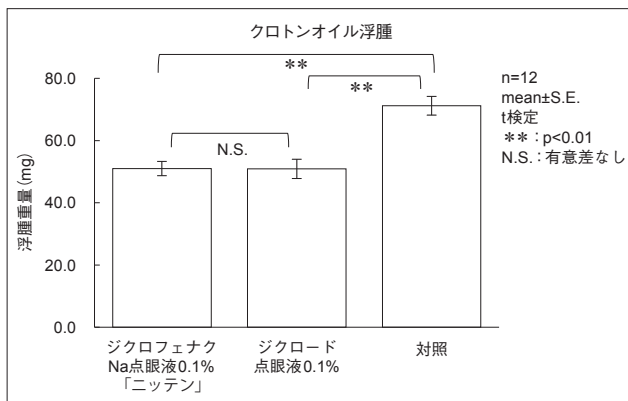
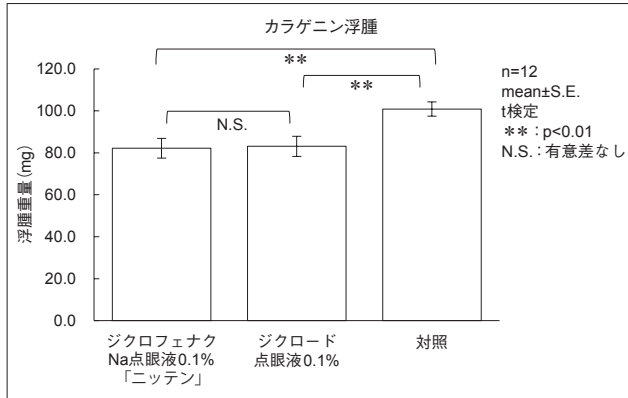
18.4.2 カラゲニン結膜浮腫に対する抑制作用

ラットでの1%カラゲニン結膜下注入による結膜浮腫において、0.1%ジクロフェナクナトリウム点眼液は生理食塩液に比べて浮腫の発生を有意に抑制した¹¹⁾。

18.5 生物学的同等性試験

18.5.1 ラット実験的眼急性炎症に対する効果

ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニッテン」とジクロード点眼液0.1%の効果カラゲニン及びクロトンオイルによるラット実験的眼急性炎症モデルを用いて、浮腫重量を指標として比較した結果、いずれも両剤に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)¹²⁾。



19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：ジクロフェナクナトリウム (Diclofenac Sodium)

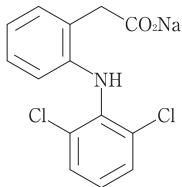
化学名：Monosodium 2-(2,6-dichlorophenylamino)phenylacetate

分子式：C₁₄H₁₀Cl₂NNaO₂

分子量：318.13

性状：白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。メタノール又はエタノール(95)に溶けやすく、水又は酢酸(100)にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。吸湿性である。

構造式：



22. 包装

プラスチック点眼容器 5mL×10本

23. 主要文献

- 1) 百瀬皓 他：眼科臨床医報. 1984；78：585-591
- 2) 阿形光治 他：日本眼科学会雑誌. 1984；88：991-996
- 3) 三宅謙作 他：あたらしい眼科. 1989；6：449-460
- 4) 清水公也 他：あたらしい眼科. 1987；4：577-585
- 5) 増田寛治郎 他：眼科臨床医報. 1986；80：1545-1563
- 6) 小林千博 他：眼科臨床医報. 1984；78：388-392
- 7) 大久保彰 他：眼科臨床医報. 1986；80：2556-2560
- 8) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店. 2021；C2173-C2178
- 9) 枝浪謙一 他：薬理と治療. 1987；15：4741-4748
- 10) 阿形光治 他：日本眼科学会雑誌. 1983；87：19-28
- 11) 阿形光治 他：日本眼科紀要. 1984；35：604-612

12) 社内資料：生物学的同等性試験

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

ロートニッテンファーマ株式会社
名古屋市南区桜本町40番地の2

26.2 販売元

 日本ジェネリック株式会社
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号