

貯 法:室温保存

有効期間:3年

## 副腎皮質ホルモン点眼剤

デキサメタゾンメタスルホ安息香酸エステルナトリウム点眼液

D・E・X点眼液 0.02%「ニットー」

D・E・X点眼液 0.05%「ニットー」

D・E・X点眼液 0.1%「ニットー」

D・E・X Ophthalmic Solution 0.02%「NITTO」

D・E・X Ophthalmic Solution 0.05%「NITTO」

D・E・X Ophthalmic Solution 0.1%「NITTO」

	0.02%	0.05%	0.1%
承認番号	30100AMX00043000	30100AMX00042000	30100AMX00044000
販売開始	1994年11月		

## 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	D・E・X点眼液 0.02%「ニットー」	D・E・X点眼液 0.05%「ニットー」	D・E・X点眼液 0.1%「ニットー」
有効成分	1mL中 デキサメタゾンメタ スルホ安息香酸エ ステルナトリウム 0.3mg (デキサメタゾンと して0.2mg)	1mL中 デキサメタゾンメタ スルホ安息香酸エ ステルナトリウム 0.75mg (デキサメタゾンと して0.5mg)	1mL中 デキサメタゾンメタ スルホ安息香酸エ ステルナトリウム 1.5mg (デキサメタゾンと して1mg)
添加剤	氷酢酸、酢酸ナトリウム水和物、クロロブタノール、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、濃グリセリン、ポビドン、pH調節剤		

## 3.2 製剤の性状

販売名	D・E・X点眼液 0.02%「ニットー」	D・E・X点眼液 0.05%「ニットー」	D・E・X点眼液 0.1%「ニットー」
pH	4.0～6.0		
浸透圧比	0.80～1.20(生理食塩水に対する比)		
性状	無色透明の無菌水性点眼剤		

## 4. 効能又は効果

外眼部および前眼部の炎症性疾患の対症療法(眼瞼炎、結膜炎、角膜炎、強膜炎、上強膜炎、前眼部ブドウ膜炎、術後炎症)

## 6. 用法及び用量

通常、1日3～4回、1回1～2滴宛点眼する。なお、症状により適宜増減する。

## 8. 重要な基本的注意

8.1 連用により、数週後から眼内圧亢進、緑内障があらわれることがあるので、定期的に眼内圧検査を実施すること。[11.1.1参照]

## 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 角膜上皮剥離又は角膜潰瘍のある患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。症状が増悪するおそれがある。また、角膜穿孔を生ずるおそれがある。[11.1.3参照]

## 9.1.2 ウイルス性結膜・角膜疾患、結核性眼疾患、真菌性眼疾患又は化膿性眼疾患のある患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。症状が増悪するおそれがある。また、角膜穿孔を生ずるおそれがある。[11.1.3参照]

## 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。長期・頻回投与を避けること。

## 9.7 小児等

特に2歳未満の場合には、慎重に投与すること。小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

## 9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

## 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 緑内障(頻度不明)

連用により、数週後から眼内圧亢進、緑内障があらわれることがある。[8.1参照]

## 11.1.2 角膜ヘルペス、角膜真菌症、緑膿菌感染症(いずれも頻度不明)

角膜ヘルペス、角膜真菌症、緑膿菌感染症等を誘発することがある。

## 11.1.3 穿孔(頻度不明)

角膜ヘルペス、角膜潰瘍又は外傷等に投与した場合には穿孔を生ずることがある。[9.1.1、9.1.2参照]

## 11.1.4 後囊下白内障(頻度不明)

長期投与により、後囊下白内障があらわれることがある。

## 11.2 その他の副作用

	頻度不明
眼	眼刺激
下垂体・副腎皮質系機能 (長期連用した場合)	下垂体・副腎皮質系機能の抑制
その他	創傷治癒の遅延

## 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。
- 患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- 他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔を空けてから点眼すること。
- 遮光して保存すること。

## 16. 薬物動態

## 16.3 分布

白色ウサギに0.1%<sup>3</sup>H-デキサメタゾン懸濁液25μLを点眼し、各眼組織中濃度を測定した。結膜では点眼5分後に最高値5.2μg/gに到達した後、急速に減少し、点眼45分後からは指数関数的に減少した。角膜で

は、点眼5分後に最高値4.07 $\mu\text{g/g}$ に到達した後、指数関数的に減少した。房水では、45分後に最高値0.21 $\mu\text{g/g}$ に到達した後、指数関数的に減少した。また、点眼30分後の各眼組織中濃度は、角膜、強膜等の前眼部・外眼部では比較的高く、硝子体、網脈絡膜等の後眼部では低かった<sup>1)</sup>。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

デキサメタゾン<sup>1)</sup>は合成副腎皮質ホルモンで、天然の糖質コルチコイドと同じ機序により抗炎症作用を発現する<sup>2)</sup>。糖質コルチコイドは受容体に結合して特定の遺伝子の転写を開始あるいは阻害する。その結果、起炎物質の生合成抑制と炎症細胞の遊走抑制により抗炎症作用を現すと考えられる<sup>3)</sup>。

### 18.2 抗炎症作用

- ・デキサメタゾンの抗炎症作用の強さはヒドロコルチゾンの25倍、プレドニゾロンの6倍で、ベタメタゾンとは同程度とされている<sup>4)</sup>。
- ・ウサギの硝子体に抗原(10%牛血清アルブミン0.1mL)を投与することによって惹起したブドウ膜炎に対して0.075%デキサメタゾンメタスルホ安息香酸エステルナトリウム(デキサメタゾンとして0.05%)点眼液を1日1~2回、各2滴点眼して抗炎症効果についてDraize法を参考とした採点基準を用いて検討した。その結果、デキサメタゾン含有点眼液は抗炎症作用を示した<sup>5)</sup>。

### 18.3 抗アレルギー作用

抗血清0.05mLを結膜内注射して感作させたラットに、抗原として20%卵白アルブミン溶液10 $\mu\text{L}$ を点眼することによって惹起した受身アナフィラキシーに対するデキサメタゾンの抑制効果を検討した。0.1%デキサメタゾンを抗原点眼前1, 2, 3, 4, 5時間の計5回点眼したときの抑制率は57.1%であった<sup>6)</sup>。

### 18.4 生物学的同等性試験

#### 18.4.1 抗炎症作用

起炎剤として牛血清アルブミン(BSA)を用いた誘発ブドウ膜炎モデル(ウサギ)およびトウガラシチンキを用いた外眼部急性炎症モデルにおいて、抗炎症作用を本剤0.02%、0.1%とサンテゾーン点眼液0.02%、0.1%及び本剤0.05%とピジュアリン点眼液0.05%の比較を行ったところそれぞれの試験において有意な差は認められず、生物学的同等性が確認された<sup>7)</sup>。

#### 18.4.2 房水中蛋白増加抑制作用

起炎剤としてBSAを用いた誘発ブドウ膜炎モデル(ウサギ)において、房水中蛋白増加に対する抑制作用について、本剤0.02%、0.1%とサンテゾーン点眼液0.02%、0.1%及び本剤0.05%とピジュアリン点眼液0.05%の比較を行った。それぞれの試験において両剤とも前房水中蛋白濃度増加を抑制し、前房水中蛋白増加抑制作用に有意な差は認められず、生物学的同等性が確認された<sup>7)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名:デキサメタゾンメタスルホ安息香酸エステルナトリウム

(Dexamethasone Metasulfobenzoate Sodium)

化学名:Sodium 9-fluoro-11 $\beta$ ,17,21-trihydroxy-16 $\alpha$ -methyl-1,4-pregnadiene-3,20-dione 21-metasulfobenzoate

分子式:C<sub>29</sub>H<sub>32</sub>FNaO<sub>9</sub>S

分子量:598.61

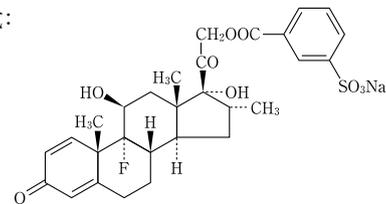
性状:デキサメタゾンメタスルホ安息香酸エステルナトリウムは白色の結晶性の粉末で、においはない。

メタノールに溶けやすく、水又はエタノールに溶けにくく、エーテルにほとんど溶けない。

吸湿性である。

融点:約260 $^{\circ}\text{C}$ (分解)

構造式:



## 20. 取扱い上の注意

外箱開封後は遮光して保存すること。

## 22. 包装

〈D・E・X点眼液0.02%「ニットー」〉

プラスチック点眼容器 5mL×5本、5mL×10本、5mL×50本

〈D・E・X点眼液0.05%「ニットー」〉

プラスチック点眼容器 5mL×5本、5mL×10本、5mL×50本

〈D・E・X点眼液0.1%「ニットー」〉

プラスチック点眼容器 5mL×5本、5mL×10本、5mL×50本

## 23. 主要文献

- 1) Yamauchi, H. et al.: Jpn. J. Ophthalmol. 1975;19:339-347
- 2) 第十八改正日本薬局方解説書(廣川書店). 2021;C3305
- 3) 第十八改正日本薬局方解説書(廣川書店). 2021;C4346
- 4) 高折修二ほか:グッドマン・ギルマン薬理書 第12版(廣川書店). 2013;1560-1568
- 5) 山内秀泰ほか:日本眼科紀要. 1973;24:969-979
- 6) Iso, T. et al.: Ophthalm. Res. 1980;12:9-15
- 7) 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

日東メディック株式会社 おくすり相談窓口

〒104-0031 東京都中央区京橋1-10-7

電話:03-3523-0345

FAX:03-6264-4086

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**日東メディック株式会社**

富山県富山市八尾町保内1-14-1