

貯法：10℃以下保存
有効期間：3年

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%「ニットー」

Diclofenac Na Ophthalmic Solution 0.1%[NITTO]

| | |
|------|------------------|
| 承認番号 | 30100AMX00149000 |
| 販売開始 | 1997年7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 | ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」 |
| 有効成分 | 1mL中 ジクロフェナクナトリウム 1mg |
| 添加剤 | ホウ酸、ホウ砂、クロロブタノール、ポビドンK25、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油60、イプシロン-アミノカプロン酸、pH調節剤 |

3.2 製剤の性状

| | |
|------|-------------------------|
| 販売名 | ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」 |
| pH | 6.0～7.5 |
| 浸透圧比 | 0.95～1.35 |
| 性状 | 無色～微黄色澄明な無臭の水性点眼剤（無菌製剤） |

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分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・遮光して保存すること。

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⁾。

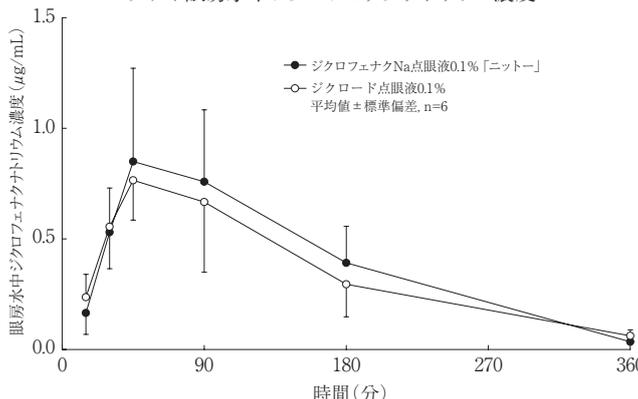
16.8 その他

16.8.1 生物学的同等性試験

ウサギにおけるジクロフェナクナトリウムの眼房水内移行

ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」とジクロード点眼液0.1%について、ウサギ眼に点眼投与後、経時的に眼房水中ジクロフェナクナトリウム濃度を測定した。その結果、両剤ともに点眼後45分で最高濃度を示し、以後、経時的に漸減した。両剤間での眼房水中ジクロフェナクナトリウム濃度に有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された³⁾。

ウサギ眼房水中ジクロフェナクナトリウム濃度



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は解析対象22例から103例の6試験（合計266例）で検討され、その有効以上又は改善率50%以上とされた割合は41.7%（43/103）～90%（26/29）^{4)～8)}で、術中・術後合併症の防止に対する有効性は解析対象22例から103例の4試験（合計211例）で検討され、その有効率は73.0%（46/63）～82.6%（19/23）であった^{4)～6)}。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

プロスタグランジン生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⁹⁾。

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_{2α}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_{2α}の生合成を有意に抑制した¹⁰⁾。

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¹⁰⁾。

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¹¹⁾。

18.4.2 カラゲニン結膜浮腫に対する抑制作用

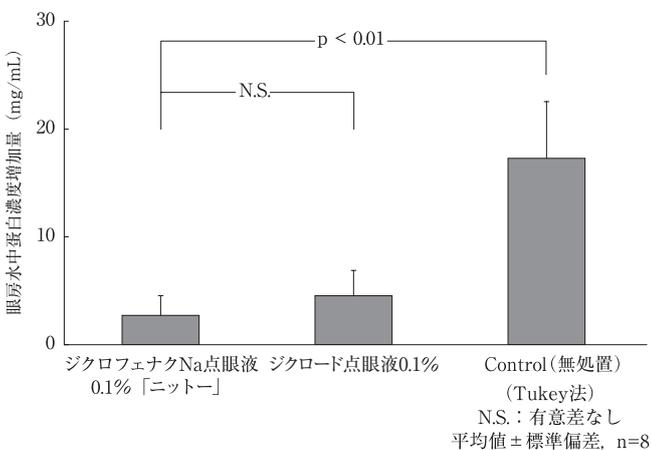
ラットでの1%カラゲニン結膜下注入による結膜浮腫において、0.1%ジクロフェナクナトリウム点眼液は生理食塩液に比べて浮腫の発生を有意に抑制した¹²⁾。

18.5 生物学的同等性試験

18.5.1 プロスタグランジン生合成阻害作用

ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」とジクロード点眼液0.1%について、ウサギ眼における前房穿刺及びアラキドン酸点眼刺激による眼房水中プロスタグランジン生成に対する抑制作用を指標として試験を実施し、抗炎症作用を比較した。その結果、両剤とも前房穿刺及びアラキドン酸点眼刺激によるプロスタグランジン生成を著明に抑制し、両剤間では有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された³⁾。

前房穿刺によるウサギ眼房水中蛋白増加抑制作用（点眼後45分）

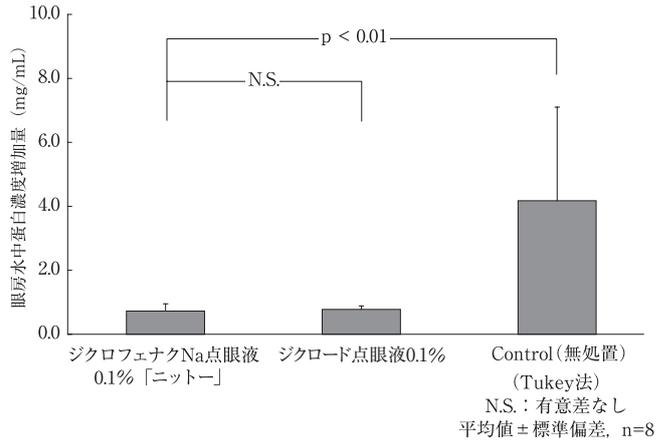


18.5.2 眼房水蛋白増加抑制作用

ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」とジクロード点眼液0.1%について、ウサギ眼における前房穿刺及びアラキドン酸点眼刺激による眼房水中蛋白増加に対する抑制作用を指標として試験を実施し、抗炎症作用を比較した。その結果、前房穿刺刺激では、両剤とも点眼後45分で最大の蛋白増加抑制作用を示し、アラキドン酸

点眼刺激では、両剤ともControl（無処置）に対し有意に蛋白増加を抑制した。また、両剤間では有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された³⁾。

アラキドン酸点眼によるウサギ眼房水中蛋白増加抑制作用

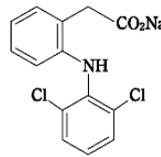


19. 有効成分に関する理化学的知見

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

構造式：



分子式：C₁₄H₁₀Cl₂NNaO₂

分子量：318.13

性状：ジクロフェナクナトリウムは白色～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。

*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

プラスチック点眼容器：5mL×10本

23. 主要文献

- 1) 百瀬皓ほか：眼科臨床医報。1984；78（4）：585-591
- 2) 阿形光治ほか：日本眼科学会雑誌。1984；88（6）：991-996
- 3) 社内資料：ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」の生物学的同等性試験
- 4) 三宅謙作ほか：あたらしい眼科。1989；6（3）：449-460
- 5) 清水公也ほか：あたらしい眼科。1987；4（4）：577-585
- 6) 増田寛治郎ほか：眼科臨床医報。1986；80（8）：1545-1563
- 7) 小林千博ほか：眼科臨床医報。1984；78（3）：388-392
- 8) 大久保彰ほか：眼科臨床医報。1986；80（12）：2556-2560
- 9) 第十八改正日本薬局方解説書（廣川書店）。2021；C2173
- 10) 枝浪謙一ほか：薬理と治療。1987；15（11）：4741-4748
- 11) 阿形光治ほか：日本眼科学会雑誌。1983；87（1）：19-28
- 12) 阿形光治ほか：日本眼科紀要。1984；35（3）：604-612

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

東亜薬品株式会社

富山県富山市水橋開発277番10

26.2 発売元

日東ダイワック株式会社

富山県富山市八尾町保内1-14-1