

点眼薬と添加剤

眼疾患の治療では、主薬を効率よく眼組織に移行させ、全身性の副作用を軽減するために点眼薬が多く用いられます。点眼薬にはさまざまな種類があり、新しい製剤も開発され、治療の選択肢が増えてきています。

一方で点眼薬には、主薬の他に有効性や安全性を確保するためにさまざまな添加剤が配合されており、それらが治療を進める上で重要な役割を担っています。また、添加剤による副作用が問題となる場合があります。点眼薬を使用する際は、主薬の作用・副作用だけでなく、添加剤の影響を把握することが重要となってきます。今回は点眼薬と添加剤、その影響についてまとめました。

○点眼薬の成分

添加剤の種類	役割	主な添加剤
等張化剤	薬液の刺激感などの不快感を軽減するために、できるだけ涙液と同じ浸透圧にする	塩化ナトリウム 塩化カリウム 濃グリセリン など
緩衝剤	安全性や有効性を向上させるため、薬液を最適なpHにする	リン酸 ホウ酸 など
可溶化剤	有効成分が水に溶けにくい場合、用いる	ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 ステアリン酸ポリオキシル40 ポリソルベート80 など
安定化剤	薬液中の薬剤が加水分解や酸化分解されるのを防ぐ	エデト酸ナトリウム水和物 ポリソルベート80 など
粘稠化剤	薬効の持続性や眼内移行性を高める	ポリビニルアルコール メチルセルロース など
防腐剤(保存剤)	使用中における薬液の微生物汚染を防止する	ベンザルコニウム塩化物 メチルパラベン クロロブタノール ソルビン酸 など

点眼薬には有効となる主薬剤のほかに、等張化剤、緩衝剤、可溶化剤、粘稠化剤、防腐剤などが含まれています。

○防腐剤の影響

各種添加剤の中でも、特に防腐剤がしばしば難治性の角膜上皮障害の原因となります。

防腐剤使用

- 利点：静菌・殺菌作用、薬品の保存寿命延長、薬物の浸透性亢進
- 欠点：細胞毒性、アレルギー反応

頻繁に使用される防腐剤 ～ベンザルコニウム塩化物～

利点	<ul style="list-style-type: none"> ・室温でも長期間安定 ・細菌や真菌に広い抗菌作用を持つ ・刺激性がない
欠点	<ul style="list-style-type: none"> ・涙液脂質層を破壊し、角膜上皮細胞に影響を与える

緑膿菌を初めとした菌類への殺菌効果は、塩化ベンザルコニウム>クロロブタノール>パラベン

正常な涙液動態を示す場合、通常の用法・用量の範囲では角膜障害を引き起こさない程度の濃度にしか添加されていません。

しかし、多剤併用や、本人の意思で頻回に点眼した場合、涙液動態の悪いドライアイ患者などでは、眼表面において高濃度で接触することとなり、角膜障害が起こる可能性があります。一般に角膜障害は「濃度×点眼回数×投与日数」に関係があるとされており、症状を軽減させようと点眼の頻度をふやすと、かえって悪化を招くことがあります。

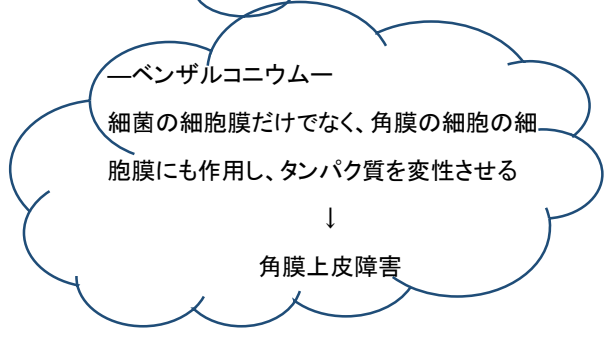
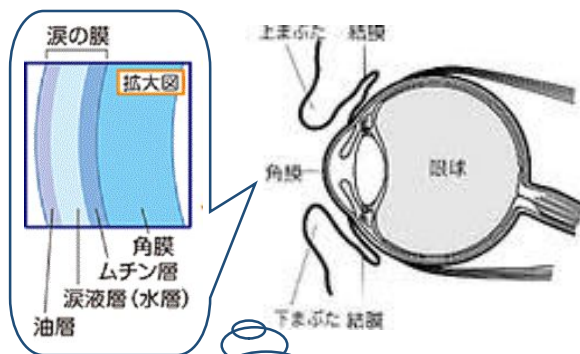
○角膜障害の症状

自覚症状としては、充血・眼痛・霧視（霧がかかったように見える）などがあります。

他覚的には、結膜の充血と乳頭の増殖・浮腫を認め、角膜は下半分を中心にびまん性の点状表層角膜症を呈することが多いとされています。

このような副作用を引き起こさないためにも、用法・用量に従って点眼することが大切です。また、眼から溢れた点眼薬はきれいにふき取りましょう。

○当院採用の点眼薬



分類	製品名	用法・用量	pH	浸透圧比	防腐剤	貯法	その他
緑内障治療薬	PG類	キサラン点眼液0.005% レスキュラ点眼液0.12%	6.5~6.9 5.0~6.5	約1 0.9~1.1	ベンザルコニウム塩化物 ベンザルコニウム塩化物	遮光、2~8℃ 遮光、室温	
	β遮断薬	チモロール点眼液0.5%	6.5~7.5	約1	ベンザルコニウム塩化物	遮光、室温	気管支喘息、又はその既往歴のある患者、気管支痙攣、重篤な慢性閉塞性肺疾患のある患者に禁忌
	副交感神経刺激薬	サンピロ点眼液2%	4.5~5.5	1.1~1.3	クロロブタノール パラオキシ安息香酸プロピル パラオキシ安息香酸メチル	室温	縮瞳が起こるため、使用後は車の運転等に注意
抗アレルギー薬	化学伝達物質遊離抑制薬	インターール点眼液2%	4.0~7.0	—	ベンザルコニウム塩化物	室温	
	ヒスタミンH1受容体拮抗薬	リボスチン点眼液0.025% ザジテン点眼液0.05%	6.0~8.0 4.8~5.8	0.9~1.1 0.7~1.0	ベンザルコニウム塩化物 ベンザルコニウム塩化物	室温 室温	点眼薬でも眠気がでることがあるため、眠気の副作用に注意
角結膜上皮障害治療薬		ヒアレイン点眼液0.1%	6.0~7.0	0.9~1.1	ベンザルコニウム塩化物	室温	
抗菌薬	ニューキノロン系	クラビット点眼液0.5%	6.2~6.8	1.0~1.1	—	遮光、室温	
抗炎症薬	ステロイド薬	リンデロン点眼・点耳・点鼻液0.1%	7.5~8.5	約0.8	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	遮光、室温	点耳、点鼻も可
		点眼・点鼻用リンデロンA液	5.0~7.5	約0.8	パラオキシ安息香酸メチル	遮光、冷所	フラジオマイシン配合。難聴が発現する可能性があるため、点耳は不可
		フルメトロン点眼液0.02%	6.8~7.8	0.9~1.1	ベンザルコニウム塩化物	室温	水性懸濁点眼剤 用事振り混ぜて使用
		フルメトロン点眼液0.1%	6.8~7.8	0.9~1.1	ベンザルコニウム塩化物	室温	水性懸濁点眼剤 用事振り混ぜて使用
	非ステロイド性抗炎症薬	ニフラン点眼液0.1%	7.0~8.0	—	ベンザルコニウム塩化物	室温	
	VB ₂	フラビタン点眼液0.05%	4.5~6.0	—	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	遮光、室温	

分類	製品名	用法・用量	pH	浸透圧比	防腐剤	貯法	その他	
その他	調節機能改善薬 サンコバ点眼液0.02%	1回1～2滴、1日3～5回	5.5～6.5	約1	ベンザルコニウム塩化物	室温	VB ₁₂	
	老人性白内障治療薬 カリーユニ点眼液0.005%	1回1～2滴、1日3～5回	3.4～4.0	0.9～1.2	ベンザルコニウム塩化物	室温	水性懸濁点眼剤 用事振り混ぜて使用	
	人工涙液 ソフトサンティア	1回2～3滴、1日5～6回	7.0～8.0	0.90～1.20	—	室温	第3類医薬品、コンタクトレンズを装着したまま使用可能	
	調節麻痺・散瞳薬	ミドリンP点眼液	散瞳：通常、1回1～2滴を点眼するか、又は1回1滴を3～5分おきに2回 調節麻痺：通常、1回1滴を3～5分おきに2～3回	4.5～5.8	0.9～1.1	ベンザルコニウム塩化物 クロロブタノール	室温	トロピカミド：フェニレフリン塩酸塩=1：1
		ミドリンM点眼液0.4%	診断または治療を目的とする散瞳：1回1～2滴、1日1回 調節麻痺：1回1滴を3～5分おきに2～3回	4.5～5.8	0.9～1.1	ベンザルコニウム塩化物	室温	
	散瞳薬	日点アトロピン点眼液1%	1回1～2滴、1日1～3回	5.0～6.5	約1	ベンザルコニウム塩化物	遮光、室温	
		ネオシネジコワ5%点眼液	1回、1～2滴	4.0～6.0	—	クロロブタノール	遮光、室温	
麻酔薬	ペノキシール点眼液0.4%	1～4滴	4.0～5.0	0.9～1.1	ベンザルコニウム塩化物	室温	表面麻酔	

《参考》

～防腐剤不添加の主な点眼薬～

分類	製品名	用法・用量	pH	浸透圧比	貯法	その他
抗アレルギー薬	化学伝達物質遊離抑制薬 インタール点眼液UD2%	1回1～2滴、1日4回	4.0～7.0	—	室温	一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
	ヒスタミンH1受容体拮抗薬 ザジテン点眼液UD0.05%	1回1～2滴、1日4回	4.8～5.8	0.7～1.0	室温	一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
	カルシニューリン阻害薬 パピロックミニ点眼液0.1%	1回1滴、1日3回	6.5～7.5	1.0～1.1	遮光、室温	シクロスポリン：抗アレルギー剤が効果不十分な場合の春季カタル治療薬 一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
角結膜上皮障害治療薬	ヒアレインミニ点眼液0.3%	1回1滴、1日5～6回	6.0～7.0	0.9～1.1	室温	一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
抗炎症薬	ステロイド薬 ネオ メドロールEE軟膏	1日1～数回	—	—	室温	眼軟膏のみ。 フラジオマイシン3.5mg(力価)+日局 メチルプレドニゾロン 1mg
	非ステロイド性抗炎症薬 インドメロール点眼液0.5%	1回1滴を眼手術前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	—	—	室温	ヒマシ油を用いた油性点眼剤
ドライアイ治療薬	ムチン産生促進剤 ムコスタ点眼液UD2%	1回1滴、1日4回	5.5～6.5	0.9～1.1	室温	一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
抗菌薬	フルオロキノロン系					主成分である抗菌薬が、防腐剤の働きも同時に行う
その他	人工涙液 ソフトサンティア	1回2～3滴、1日5～6回	7.0～8.0	0.90～1.20	室温	第3類医薬品、コンタクトレンズを装着したまま使用可能 開栓後、約10日間で使い切る

～防腐剤にベンザルコニウム塩化物を使用していない主な抗アレルギー点眼薬

分類	製品名	用法・用量	pH	浸透圧比	防腐剤	貯法	その他
化学伝達物質遊離抑制薬	インタール点眼液UD2%	1回1～2滴、1日4回	4.0～7.0	—	—	室温	一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
	エリックス点眼液0.25%	1回1～2滴、1日4回	6.8～7.8	—	ホウ酸 パラオキシ安息香酸プロピル パラオキシ安息香酸メチル	室温	
	ゼペリン点眼液0.1%	1回1～2滴、1日4回	4.5～6.0	0.8～1.3	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	室温	
ヒスタミンH1受容体拮抗薬	ザジテン点眼液UD0.05%	1回1～2滴、1日4回	4.8～5.8	0.7～1.0	—	室温	一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤
カルシニューリン阻害薬	パピロックミニ点眼液0.1%	1回1滴、1日3回	6.5～7.5	1.0～1.1	—	遮光、室温	シクロスポリン：抗アレルギー剤が効果不十分な場合の春季カタル治療薬 一回使い捨ての無菌ディスポーザブルタイプの製剤