※※2017年 2月改訂(第6版)
※2015年 3月改訂

日本標準商品分類番号
871315,871329

合成副腎皮質ホルモン製剤

テイカゾン®点眼・点耳・点鼻液0.1%

TEIKASON Ophthalmic,Otic and Nasal Solution 0.1%

デキサメタゾンリン酸エステルナトリウム点眼・点耳・点鼻液

貯　　法：冷暗所保存、禁凍結
使用期間：2年6ヵ月
使用期限：外箱等に表示

承認番号	21900AMX01472000
薬価収載	2007年12月
販売開始	1984年6月

【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

【原則禁忌(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)】
1. **眼科疾患に使用する場合**
(1) 角膜潰瘍のある患者[角膜潰瘍が増悪するおそれがある。]
(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[免疫抑制作用により、症状が増悪するおそれがある。]
2. **耳鼻科疾患に使用する場合**
(1) 耳又は鼻に結核性又はウイルス性疾患のある患者[免疫抑制作用により、症状が増悪するおそれがある。]
(2) 糖尿病の患者[糖新生促進作用（血糖値上昇）等により、糖尿病が増悪するおそれがある。]

【組成・性状】

販売名	テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1%
剤形	点眼・点耳・点鼻液
有効成分の名称	デキサメタゾンリン酸エステルナトリウム
含量	1mL中にデキサメタゾンリン酸エステルナトリウム1.0mgを含有
添加物	リン酸二水素Na、リン酸水素2Na、塩化Na、エデト酸Na、ベンザルコニウム塩化物
pH	7.4～8.4
浸透圧比	約1
性状	無色澄明の無菌製剤

【効能・効果】

(眼科用)
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)
(耳鼻科用)
外耳・中耳(耳管を含む)又は上気道の炎症性・アレルギー性疾患(外耳炎、中耳炎、アレルギー性鼻炎など)、術後処置

【用法・用量】

(眼科用)
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。
(耳鼻科用)
通常1日1～数回、適量を点耳、点鼻、耳浴、ネブライザー又はタンポンにて使用するか、又は患部に注入する。なお症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. **副作用**
本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) **重大な副作用**(すべて頻度不明)
次のような副作用があらわれることがあるので、症状があらわれた場合には使用を中止し、適切な処置を行うこと。
眼
1) **緑内障**：連用により、数週後から眼内圧亢進、また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。
2) **角膜ヘルペス、角膜真菌症、緑膿菌感染症**
3) **角膜穿孔**：角膜ヘルペス、角膜潰瘍又は外傷等に使用した場合には穿孔を生ずることがある。
4) **後嚢下白内障**：長期使用により、後嚢下白内障があらわれることがある。

耳・鼻
感染症の誘発：耳又は鼻の局所に化膿性の感染症を誘発することがある。

(2) **その他の副作用**
次のような症状又は異常があらわれた場合には、使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症	刺激感
その他	下垂体・副腎皮質系機能抑制（長期使用時)、創傷治癒遅延

2. **高齢者への投与**
一般に高齢者では生理機能が低下しているので、減量するなど注意すること。
3. **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長期・頻回使用を避けること。〔妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。〕
(参考)
妊娠6日目から18日目のウサギの結膜囊内に、0.1%デキサメタゾンリン酸エステルナトリウム液を点眼した結果、腎の減形成、臍ヘルニア、腸の発育不全が認められた[1]。
4. **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。特に2歳未満の場合には慎重に使用すること。

※【薬物動態】

生物学的同等性試験[2]
＜鼻腔からの吸収＞
テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1%及び標準製剤の鼻腔での効果を比較するために家兎(n＝10)鼻腔にネブライザーで投与し、投与後30、60、120、180、240、300、360分後の血中濃度を比較した。得られた結果について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。

時間（min)	血漿中デキサメタゾン濃度(μg／mL) mean±S.E.[n＝10]						
	30	60	120	180	240	300	360
テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1%	0.026 ±0.001	0.041 ±0.001	0.061 ±0.002	0.117 ±0.008	0.062 ±0.004	0.043 ±0.002	0.033 ±0.001
標準製剤	0.028 ±0.001	0.045 ±0.003	0.060 ±0.003	0.115 ±0.008	0.064 ±0.003	0.045 ±0.002	0.033 ±0.001

※【薬効薬理】

1. デキサメタゾンはグルココルチコイドに属し、すぐれた糖質代謝作用を有し、抗炎症・抗リウマチ・抗アレルギー作用を発揮する一方、鉱質代謝作用が比較的弱いことが認められている(ラット及びマウス)。
2. 家兎の病態実験(角膜移植)で、抗炎症作用による移植拒否反応の抑制効果が明らかにされている。
3. **生物学的同等性試験[2)]：**

＜実験的ブドウ膜炎に対する効果＞

ウサギの実験的ブドウ膜炎に対する抗炎症作用を、Draize法に準じた炎症強度の得点法により本剤および標準製剤について比較した。家兎の右眼硝子体中央部に牛血清アルブミンを注入し、テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1％、標準製剤を翌日より30日間、1日2回各2滴点眼する。30日後、再び耳静脈より抗原を注入し、ブドウ膜炎を誘発させ、このとき抗原注入後24時間後の房水蛋白濃度をLowry等の方法で測定した。得られた結果について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。

	房水蛋白濃度(mg／mL) mean±S.E. (n＝5)
テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1％	3.76±0.90
標準製剤	3.81±0.79
対照	64.9±5.8

＜耳組織に対する抗炎症効果＞

①キシレンによる耳介部での急性炎症(マウス)

dd系マウスの尾静脈から0.5％ポンタミンスカイブルー0.1mL／10gを注射し、直後にフェルトを貼り付けたクレンメにキシレンを充分含ませて、右耳を5秒間はさみ30分後に両耳を摘出し漏出色素の吸光度を600nmで測定した。テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1％及び標準製剤を、色素静注1時間前に0.05mL右耳に滴下して充分に濡らし、更にキシレンにて起炎後直ちに同様の方法で投与した。得られた結果について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。

	抽出色素の吸光度 mean±S.E. (n＝10)	抑制率 (％)
テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1％	0.121±0.009	64.2
標準製剤	0.122±0.010	63.9
基剤	0.338±0.031	-

②カラゲニンによる耳介部での血管透過性(モルモット)

Hartley系モルモットの耳介部に2％カラゲニン0.1mLを皮下注射し、2時間後にポンタミンスカイブルー0.5mL／100gを頸静脈に注射し30分後に右耳介部と外耳を摘出し漏出色素の吸光度を600nmで測定した。テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1％及び標準製剤を、カラゲニン惹起直後及び1時間後にネブライザーで5分間右耳介に投与した。得られた結果について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。

	抽出色素の吸光度 mean±S.E. (n＝10)	抑制率 (％)
テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1％	0.304±0.015	36.4
標準製剤	0.311±0.021	34.9
基剤	0.478±0.058	-

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：デキサメタゾンリン酸エステルナトリウム
(Dexamethasone Sodium Phosphate)

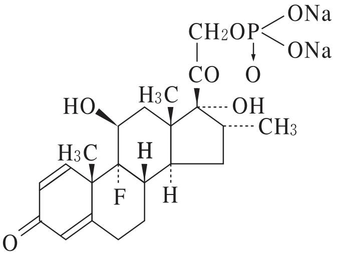
化学名：16α-methyl-9α-fluoroprednisolone 21-phosphate disodium salt

分子式：$C_{22}H_{28}FNa_2O_8P$

分子量：516.40

性　状：白色～微黄色の結晶性の粉末で、においはないか又はわずかにエタノール臭がある。水に溶けやすく、エタノール(95)に極めて溶けにくく、1, 4-ジオキサン、ジエチルエーテル、ジクロロメタン又はクロロホルムにほとんど溶けない。吸湿性である。

構造式：



※【取扱い上の注意】

安定性試験[3)]：最終包装製品を用いた試験(15℃以下)の結果、テイカゾン点眼・点耳・点鼻液0.1％は冷所において2年6ヵ月間安定であることが確認された。

※※【包装】

5mL×20

※【主要文献】

1) Kasirsky, G. et al.：Toxicol. Appl. Pharmacol. 16 (3), 773 (1970)
2) 生物学的同等性試験(テイカ製薬社内資料)
3) 安定性試験(テイカ製薬社内資料)

※【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

テイカ製薬株式会社　学術グループ
〒930-0982　富山市荒川一丁目3番27号
TEL 076-431-1717
FAX 076-431-6707

製造販売元
テイカ製薬株式会社
富山市荒川一丁目3番27号