

眼にしみる点眼薬としみない点眼薬の違いは？

今回も、ある薬局を訪問していた時にでた質問です。

患者さんから「緑内障の点眼薬でレスキュラ点眼ではしみるが、ミケラン点眼ではしみない」という話を聞いたのを受けて、プロスタグランジン系点眼薬でしめないタイプのものはあるのでしょうか？というような質問でした。

私が病院時代にインターール点眼液は眼にしみるので、しめないリザベン点眼液も採用してもらえないかという医師からの要望がありました。世の中には確かに眼にしみやすいタイプの点眼薬が存在するようです。

一般論になりますが、点眼薬が眼にしみたり、刺激感を与える要因として、pH、生理食塩液との浸透圧比、刺激成分(主薬そのものや添加物)などがあるとされています。

多くの点眼薬では希塩酸や水酸化ナトリウムのようなpH調整剤によって中性領域に調整し、眼にしめないような工夫がされています。

しかし、成分によっては中性領域では溶解しないものもあり、そのためpH領域が酸性もしくはアルカリ性に傾いた状態となる場合もあります。

さらに薬効や安定性を維持するために成分や添加物の濃度が高くなり、結果的に浸透圧比が1以上になる製品もあります。

ただ、同じ目薬を使っても、しみる人もいれば、しめない人もいます。目の炎症や体調など、目薬を使う時の状態によっても、違ってくるため、しみる目薬がよい、悪いと、いちがいに言うことはできません。ただ、目に疾患のある人で、点眼後の痛みがひどい時には、医師に相談をするべきでしょう（この一文は参天製薬HPを参考にしました）。

以上のような一般的な話を基にして今回の事例をみてみます。

涙のpHは7.0～7.4とややアルカリに傾いた中性です。この範囲を逸脱する点眼薬を利用すると眼にしみると感じる人が出てくる可能性があります。

◆第一例◆ レスキュラ点眼液とミケラン点眼液

添付文書からpHの幅や浸透圧比、しみる副作用(刺激感も含む)の頻度を比較してみましょう。

製品名	pH幅	浸透圧比	刺激・しみる副作用頻度
レスキュラ点眼液	5.0～6.5	0.9～1.1	0.1%～5%未満
ミケラン点眼液	6.2～7.2	1	0.1%～5%未満

添付文書だけからは成分そのものがどれだけ眼に刺激感をもたらすかを知ることはできませんが、少なくともpHからみると、レスキュラの方が酸性側に傾いており、人によってはしみる又は刺激を感じる可能性があります。

さらに、プロスタグランジン系の緑内障の点眼薬で同様に比較してみたものが次の表です。

製品名	pH幅	浸透圧比	刺激・しみる副作用頻度
レスキュラ点眼液	5.0 ~6.5	0.9~1.1	0.1%~5%未満
トラバタンズ点眼液	5.7	0.9~1.1	5%未満
タプロス点眼液	5.7~6.3	1.0~1.1	5%以上
キサラタン点眼液	6.5 ~6.9	1	5%未満
ルミガン点眼液	6.9~7.5	1	1%~5%未満

- pHの下限で揃えると上の順番になり pHだけを比べると、レスキュラ点眼液は刺激感が強そうな印象を受けます。
- 生理食塩液に対する浸透圧比では5剤とも同じと言えますから浸透圧比による刺激感の差は無いと考えてよいでしょう。
- 今回は細かい%までは見ずに副作用の表の頻度で分類しましたが、眼への刺激感やしみるという副作用頻度を見ると、第3番目のタプロス点眼液の5%以上が最も高くなっています。涙液 pHに最も近いルミガン点眼液でも頻度的にはレスキュラ点眼液とは変わらないと言えます。pHの違いが刺激感もしくはしみるという副作用に相関的につながるとは言えないのかもしれませんが、これらは、一人の人が5種類の点眼薬を比較した結果ではないので、相関性がないと結論付けるのは尚早かもしれません。

◆第二例◆ インタール点眼液とリザベン点眼液

前例と同じように、添付文書から pHの幅や浸透圧比、しみる副作用(刺激感も含む)の頻度を比較してみましょう

製品名	pH幅	浸透圧比	刺激・しみる副作用頻度
インタール点眼	4.0~7.0	—	0.1%~5%未満
リザベン点眼	7.0~8.0	0.9~1.1	0.1%~5%未満

— ; 添付文書に記載なし

- インタールとリザベンの pHの下限を比較すると実に3.0の違いがあります。この違いがインタール点眼液はしみるという医師側の主張の根拠になっていたのかもしれませんが、副作用の頻度では同じククリに入っていますが・・・

◆点眼薬の刺激類推表◆

上記の要領で、主な点眼薬（ジェネリック薬を除く）について pH幅、浸透圧比、しみる・刺激の副作用頻度、そして防腐剤・保存剤の種類を添付文書からピックアップして下記のようなエクセルの表にまとめてみました。特に pHは下限と上限を別列に設定してエクセルでの集計加工がしやすいようにしました。-印は添付文書に記載がないものになります。

薬効・適応	商品名	一般名	pH下限	pH上限	浸透圧比	しみる・刺激	防腐剤・保存剤
抗アレルギー	アイピナール点眼	イブジラスト	5.5	7.0	1	0.1-5%	ベンザルコニウム
抗アレルギー	アレギザール点眼	ペミロラスト	7.5	8.5	0.7-0.9	0.1-5%	ベンザルコニウム
抗アレルギー	インタール点眼	クロモグリク酸	4.0	7.0	-	0.1-5%	ベンザルコニウム、エデト酸
抗アレルギー	エリックス点眼	アンレキサノクス	6.8	7.8	-	0.1-5%	ホウ酸・ホウ砂、バラベン
抗アレルギー	ケタス点眼	イブジラスト	5.5	7.0	1	0.1-5%	ベンザルコニウム
抗アレルギー	ザジテン点眼	ケトチフェン	4.8	5.8	0.7-1.0	0.1-5%	ベンザルコニウム
抗アレルギー	ゼベリン点眼	アシタザノラスト	4.5	6.0	1	0.1-3%	バラベン、クロプロタノール
抗アレルギー	パタノール点眼	オロパタジン	7.0	-	0.9-1.1	眼痛(0.5-5%)	ベンザルコニウム
抗アレルギー	ペミラスト点眼	ペミロラスト	7.5	8.5	0.7-0.9	0.1-5%	ベンザルコニウム
抗アレルギー	リザベン点眼	トラニラスト	7.0	8.0	0.9-1.1	0.1-5%	ホウ酸・ホウ砂、エデト酸、ベンザルコニウム
抗アレルギー	リボスチン点眼	レボカバステチン	6.0	8.0	0.9-1.1	0.7%	エデト酸、ベンザルコニウム

何か調査の際の参考にしてもらっても良いのですが、最終的判断を下す前に、必ず対象薬剤の添付文書を確認してください。転記ミスもあり得ますので・・・

※エクセル表は別途添付します（一般公開用には添付無し）。