

貯 法：10℃以下保存
有効期間：3年

広範囲抗菌点眼剤

オフロキサシンゲル化点眼液

承認番号	22000AMZ00003000
販売開始	2008年7月

処方箋医薬品[※]

オフロキサシンゲル化点眼液0.3%「わかもと」

OFLOXACIN GEL FORMING OPHTHALMIC SOLUTION「WAKAMOTO」

注)注意－医師等の処方箋により使用すること

®

2. 禁忌 (次の患者には投与しないこと)

- 2.1 本剤の成分及びキノロン系抗菌剤に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分	1mL 中オフロキサシン 3.0mg
添加剤	メチルセルロース、マクロゴール 4000、クエン酸ナトリウム水和物、pH 調節剤

3.2 製剤の性状

性状・剤形	粘性のある微黄色～淡黄色澄明の点眼剤 (無菌製剤)
pH	6.0～7.0
浸透圧比	1.52～1.75

4. 効能又は効果

〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、ミクロコッカス属、モラクセラ属、コリネバクテリウム属、クレブシエラ属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)、シュードモナス属、緑膿菌、バークホルデルリア・セパシア、ステノトロボモナス (ザントモナス)・マルトフィリア、アシネトバクター属、アクネ菌、トラコーマクラミジア (クラミジア・トラコマトリス)

〈適応症〉

眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎 (角膜潰瘍を含む)、眼科周術期の無菌化療法

6. 用法及び用量

通常、1回1滴、1日3回点眼する。なお、症状により適宜増減する。

7. 用法及び用量に関連する注意

〈結膜炎〉

- 7.1 トラコーマクラミジアによる結膜炎の場合には、8週間の投与を目安とし、その後の継続投与については慎重に行うこと。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。
8.2 長期間使用しないこと。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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にのみ投与すること。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

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)

紅斑、発疹、呼吸困難、血圧低下、眼瞼浮腫等の症状が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

	1%未満	頻度不明
眼		びまん性表層角膜炎等の角膜障害、眼瞼炎、結膜炎、眼のそう痒感、眼痛
皮膚	発疹	そう痒、蕁麻疹

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。
- 他の点眼剤を併用の場合には、本剤点眼前に少なくとも10分間の間隔をあけること。
 - 併用の場合にあっては、本剤を最後に点眼すること。やむを得ず本剤を使用した後、他の点眼剤を使用する場合には、十分な間隔をあけること。
 - 本剤は熱応答ゲル製剤のため、室温中に放置するとゲル化することがある。本剤がゲル化した場合は冷蔵庫等で冷却してから点眼すること。
 - 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。
 - 点眼直後に製剤の特徴として、点眼液が熱によりゲル化するため、べたつき等がある。
 - 点眼のとき、液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。
 - 遮光して保存すること。

16. 薬物動態

16.3 分布

16.3.1 結膜嚢内濃度

白色ウサギに本剤を50 μ L点眼したとき、点眼後30分に最高濃度 (平均値 \pm 標準偏差) 413.63 \pm 116.29 μ g/gに達し、その後徐々に減少した。点眼後8時間までオフロキサシンのMIC₉₀ (90%の菌株の発育を阻する最小濃度) である2 μ g/mL以上を維持した¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎 (角膜潰瘍を含む)〉

17.1.1 国内一般臨床試験

外眼部細菌感染症患者87例を対象に、0.3%オフロキサシン眼軟膏を1回 (チューブから圧出した約1cmの長さの量)、1日3回、3日以上 (原則として症状消失後2日まで) 塗布²⁾した結果、有効率^{*}は95.2% (79/83例) で、副作用は認められなかった²⁾。

※眼感染症研究会制定の評価判定基準（1985年）に準拠し評価。

注）本剤の承認された用法及び用量は、通常、1回1滴、1日3回点眼、症状により適宜増減である。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

主な作用機序はDNAジャイレース（トポイソメラーゼⅡ）活性及びトポイソメラーゼⅣ活性の阻害による細菌のDNA合成阻害である³⁾。抗菌作用は殺菌的でMIC濃度で溶菌が認められた⁴⁾。また、本剤はトラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）に対し、その発育環における原始体を破壊することが認められた⁵⁾。

18.2 抗菌作用

オフロキサシンの抗菌スペクトラムは広範囲に及び、本剤はブドウ球菌属、肺炎球菌を含むレンサ球菌属、ミクロコッカス属、コリネバクテリウム属等のグラム陽性菌及び緑膿菌を含むシュードモナス属、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプチウス（コッホ・ウィークス菌）、モラクセラ属、セラチア属、クレブシエラ属、プロテウス属、アシネトバクター属等のグラム陰性菌並びに嫌気性菌であるアクネ菌等の眼感染症の起炎菌に対し、強い抗菌力を示す^{4)、6)、7)} (*in vitro*)。

また、本剤はトラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）に対しても抗菌作用を示し、クラミジアは本剤に対して耐性化しにくいことが認められている^{8)、9)}。

18.3 生物学的同等性試験

ウサギ緑膿菌角膜感染症モデルを用い、片眼には生理食塩液、対側眼に本剤又はタリビッド眼軟膏0.3%を、菌接種4時間後より4時間ごとに1日3回3日間投与し、投与開始から4日目の改善度スコア（外眼部感染症状の採点基準に従い評価）を指標として比較した。その結果、本剤及びタリビッド眼軟膏0.3%の平均値の差の90%信頼区間はタリビッド眼軟膏0.3%の平均値の±20%以内であることから、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁰⁾。

	改善度スコア
オフロキサシゲル化点眼液0.3% 「わかもと」	13.9±0.5
タリビッド眼軟膏0.3%	13.6±0.8

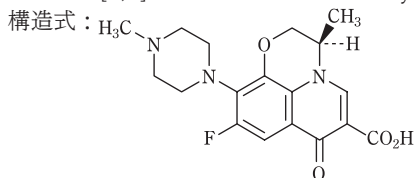
平均値±標準誤差、n=10

改善度スコアのパラメータは、被験個体の選択、症状観察回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：オフロキサシン (Ofloxacin) (JAN)

化学名：(3*R*)-9-Fluoro-3-methyl-10-(4-methylpiperazin-1-yl)-7-oxo-2,3-dihydro-7*H*-pyrido[1,2,3-*de*][1,4]benzoxazine-6-carboxylic acid



及び鏡像異性体

分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄

分子量：361.37

性状：帯微黄白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。酢酸（100）に溶けやすく、水に溶けにくく、アセトニトリル又はエタノール（99.5）に極めて溶けにくい。本品の水酸化ナトリウム試液溶液（1→20）は旋光性を示さない。光によって変色する。融点：約265℃（分解）。

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) 社内資料：結膜嚢内滞留性試験
- 2) 井上慎三 他：あたらしい眼科. 1986；3：742-752
- 3) Kato J, et al. : Cell. 1990；63：393-404
- 4) 西野武志 他：Chemotherapy. 1984；32 (Supp. 1)：62-83
- 5) 三井幸彦 他：日本眼科学会雑誌. 1988；92：973-980
- 6) 三井幸彦 他：眼科臨床医報. 1986；80：1813-1828
- 7) 三井幸彦 他：日本眼科紀要. 1986；37：1115-1140
- 8) 三井幸彦 他：日本眼科学会雑誌. 1986；90：1074-1080
- 9) 三井幸彦 他：日本眼科学会雑誌. 1989；93 臨時増刊号：157
- 10) 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

わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション
〒103-8330 東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号
TEL：03-3279-0379 FAX：03-3279-1272

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **わかもと製薬株式会社**
東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号