

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領 2013 に準拠して作成

広範囲抗菌剤

処方箋医薬品（注意-医師等の処方箋により使用すること）

# オフロキサシンゲル化点眼液0.3%「わかもと」

OFLOXACIN GEL FORMING OPHTHALMIC SOLUTION 0.3%「WAKAMOTO」

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意-医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1mL中にオフロキサシン3.0mgを含有
一般名	和名：オフロキサシン（JAN） 洋名：Ofloxacin（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2008年3月14日 薬価基準収載年月日：2008年7月4日 発売年月日：2008年7月4日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：わかもと製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション TEL：03-3279-0379 FAX：03-3279-1272 医療関係者向けホームページ： <a href="http://www.wakamoto-pharm.co.jp/">http://www.wakamoto-pharm.co.jp/</a>

本IFは 2017 年 8 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

# IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書(以下、添付文書と略す)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

### [IFの様式]

①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」(以下、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IFの発行]

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適應症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### 3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	13
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	13
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	13
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	13
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	13
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	13
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	13
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	14
7. CAS登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	14
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	14
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	14
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	14
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	15
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	15
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	15
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	16
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	16
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	4	2. 毒性試験	16
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	X. 管理的事項に関する項目	17
5. 製剤の各種条件下における安定性	5	1. 規制区分	17
6. 溶解後の安定性	5	2. 有効期間又は使用期限	17
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	3. 貯法・保存条件	17
8. 溶出性	5	4. 薬剤取扱い上の注意点	17
9. 生物学的試験法	5	5. 承認条件等	17
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	5	6. 包装	17
11. 製剤中の有効成分の定量法	6	7. 容器の材質	17
12. 力価	6	8. 同一成分・同効薬	17
13. 混入する可能性のある夾雑物	6	9. 国際誕生年月日	17
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	17
15. 刺激性	6	11. 薬価基準収載年月日	18
16. その他	6	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	18
V. 治療に関する項目	7	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	18
1. 効能又は効果	7	14. 再審査期間	18
2. 用法及び用量	7	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	18
3. 臨床成績	7	16. 各種コード	18
VI. 薬効薬理に関する項目	9	17. 保険給付上の注意	18
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	XI. 文献	19
2. 薬理作用	9	1. 引用文献	19
VII. 薬物動態に関する項目	10	2. その他の参考文献	19
1. 血中濃度の推移・測定法	10	XII. 参考資料	19
2. 薬物速度論的パラメータ	10	1. 主な外国での発売状況	19
3. 吸収	10	2. 海外における臨床支援情報	19
4. 分布	10	XIII. 備考	19
5. 代謝	12	その他の関連資料	19
6. 排泄	12		
7. トランスポーターに関する情報	12		
8. 透析等による除去率	12		

---

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

合成キノロン系抗菌剤であるオフロキサシンは、広範囲の抗菌スペクトルを有し、また眼刺激性が低いことから、眼科領域において各種感染症の治療に用いられている。オフロキサシンの眼科領域における剤形として点眼剤及び眼軟膏剤がある。

眼軟膏剤は、結膜嚢に滞留し、薬剤を徐放するという性質を持っている。この特性から、手術後、就寝時、点眼回数を少なくしたい場合などに使用されている。しかしながら、点入後のべたつき、一過性に起きる霧視や自己点入が難しいという点がある。

弊社では、外眼部滞留性を向上させる方法の一つとして熱応答ゲル基剤を開発した。本基剤は、投与前ではゾル状態であり、点眼剤と同様に容易に投与が可能である。一方、投与された基剤は眼表面温度によりゲル状態となり、結膜嚢内に滞留する。

オフロキサシγγελ化点眼液 0.3%「わかもと」は、この熱応答ゲル基剤を用いた点眼剤である。

本剤は、オフロキサシンを有効成分とする点眼剤であり、オフロキサシン眼軟膏剤と同等の効果が認められ、2008年3月に製造販売承認を取得した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 熱応答ゲル基剤を応用した点眼剤である。
- 2) 眼軟膏剤の剤形追加品（後発医薬品）として承認された製剤である。
- 3) 生物学的同等性試験により、標準剤との同等性が確認されている。  
(「VI. 薬効薬理に関する項目-2.薬理作用」の項 参照)
- 4) 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。(再審査対象外) 重大な副作用（頻度不明）として、ショック、アナフィラキシーが報告されている。  
(「VIII.安全性（使用上の注意等）に関する項目-8.副作用」の項 参照)

---

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

#### (1) 和名

オフロキサシingleル化点眼液0.3%「わかもと」

#### (2) 洋名

OFLOXACIN GEL FORMING OPHTHALMIC SOLUTION 0.3%「WAKAMOTO」

#### (3) 名称の由来

有効成分名、剤形、濃度及び社名

(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号に基づく)

### 2. 一般名

#### (1) 和名(命名法)

オフロキサシン (JAN)

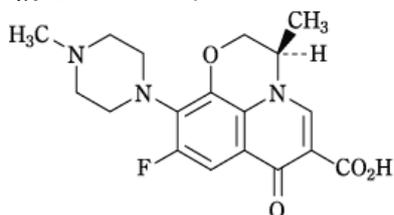
#### (2) 洋名(命名法)

Ofloxacin (JAN)

#### (3) ステム

ナリジクス酸系抗菌薬：-oxacin

### 3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>

分子量：361.37

### 5. 化学名(命名法)

(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

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：OFLX

### 7. CAS登録番号

82419-36-1

---

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・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。

##### (2) 溶解性

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。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 265℃（分解）

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

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。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「オフロキサシン」の確認試験法による

#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方「オフロキサシン」の定量法による

---

## IV. 製剤に関する項目

---

### 1. 剤形

#### (1) 投与経路

点眼

#### (2) 剤形の区別、外観及び性状

剤形の区別：点眼剤

外観及び性状：粘性のある微黄色～淡黄色澄明の液

#### (3) 製剤の物性

該当資料なし

#### (4) 識別コード

キャップの色：淡茶色半透明

キャップ天面：



#### (5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等

pH：6.0～7.0

浸透圧比：1.52～1.75（生理食塩液に対する比）

#### (6) 無菌の有無

無菌製剤である

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分(活性成分)の含量

1mL中にオフロキサシン3.0mgを含有

#### (2) 添加物

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) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

### 4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 5. 製剤の各種条件下における安定性

長期保存試験<sup>1)</sup>、苛酷試験<sup>2,3)</sup>

試験項目：性状、確認試験\*、浸透圧比、粘度、pH、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験\*、無菌試験\*、含量

\*：長期保存試験のみ実施

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	10±1℃、 湿度成り行き、 暗所	36 ヶ月	点眼用プラスチック製 気密容器	規格に適合
苛酷試験	熱 40℃、 湿度成り行き、 暗所	6 ヶ月		3 ヶ月まで規格に適合 (6 ヶ月目で含量が規格外)
	光 10℃、 湿度成り行き、 白色蛍光灯下 3000Lux	120 万 Lux・hr		90 万 Lux・hr まで規格に適合 (120Lux・hr で含量規格外)
			点眼用プラスチック製 気密容器 (ラベルあり)	規格に適合

[開封後の安定性<sup>4,5)</sup>]

試験項目：性状、浸透圧比、粘度、pH、含量、水分透過\*

\*：25℃、60%RHのみ

保存条件	保存期間	保存形態	結果
5℃	2 ヶ月	点眼用プラスチック製 気密容器 (ラベルあり)	規格に適合
25℃、60%RH			
40℃、75%RH			
10℃、 白色蛍光灯下 1000Lux	60 万 Lux・hr	点眼用プラスチック製 気密容器 (ラベルあり)	規格に適合

## 6. 溶解後の安定性

該当しない

## 7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

別資料(配合変化試験)参照

## 8. 溶出性

該当しない

## 9. 生物学的試験法

該当資料なし

## 10. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 呈色反応
- (2) フッ化物の定性反応 (2)
- (3) 紫外可視吸光度測定法 (吸収極大波長：223～227nm、292～296nm)
- (4) 液体クロマトグラフィー

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

12. 力価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

15. 刺激性

Dutch種雄性ウサギを1群5羽を用い、オフロキサシゲル化点眼液0.3%「わかもと」、標準製剤（眼軟膏、0.3%）及び生理食塩液を3時間間隔で左眼に1日4回、13週間投与した（点眼50 $\mu$ L、点入60 $\mu$ L）。その結果、オフロキサシゲル化点眼液0.3%「わかもと」はごく軽度の刺激性を示すが、その程度は弱く、また、標準製剤（眼軟膏、0.3%）と比較してその刺激性は軽微であると判断した<sup>6)</sup>。

16. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 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、マイクロコッカス属、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、バークホルデリア・セパシア、ステノトロホモナス（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・トラコマティス）

#### <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

### 2. 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。

#### <用法・用量に関連する使用上の注意>

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。
2. 長期間使用しないこと。なお、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。
3. 他の点眼剤を併用する場合には、本剤投与前に少なくとも10分間の間隔をあけて投与すること。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ピリドンカルボン酸系抗菌剤

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

作用部位：眼瞼、結膜、角膜、涙嚢

作用機序：細菌のDNAの高次構造を変換するDNA gyraseに作用し、DNAの複製を阻害することにより殺菌的に作用する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

<生物学的同等性試験：実験的角膜感染症に対する治療効果（家兎）<sup>7)</sup>>

対象：白色家兎 20 例（本剤群：10 例、標準製剤（眼軟膏、0.3%）群：10 例）

方法：白色家兎の角膜に傷を作成した後、緑膿菌を点眼し作成した角膜感染症モデルを用い、片眼に本剤又は標準製剤（眼軟膏、0.3%）を、対側眼に生理食塩液を、菌接種日から 1 回 50 $\mu$ L（標準製剤は 60 $\mu$ L）1 日 3 回、3 日間点眼した。

結果：本剤及び標準製剤の改善度スコアは、観察3日まで増加を示し以後はほぼ同値を示した。観察4日目の改善度スコア\*の平均値を90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

\*改善度スコア＝「生理食塩液投与眼の総合スコア」－「本剤又は標準製剤投与眼の総合スコア」

	改善度スコア
オフロキサシンゲル化点眼液 0.3%「わかもと」	13.9 $\pm$ 0.5
標準製剤（眼軟膏剤、0.3%）	13.6 $\pm$ 0.8

（平均値 $\pm$ 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。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

---

## VII. 薬物動態に関する項目

---

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

#### (6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

#### (4) 消失速度定数

該当資料なし

#### (5) クリアランス

該当資料なし

#### (6) 分布容積

該当資料なし

#### (7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

### 3. 吸収

該当資料なし

### 4. 分布

#### (1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

<結膜囊内滞留性試験<sup>8)</sup>>

対象：日本白色種雄性家兎

方法：白色家兎の両眼に、本剤又は標準製剤（眼軟膏、0.3%）を、50 $\mu$ L/眼をまたは50mg/眼（両製剤ともオフロキサシンとして約0.15mg）を点眼または点入投与後、濾紙を用いて経時的に結膜囊内の涙液を採取し、HPLCにて涙液中オフロキサシン濃度を測定した。ファーマコキネティックパラメータは個体ごとに算出した。

結果：本剤及び標準製剤の涙液中オフロキサシン濃度はほぼ同様な推移を示し、また涙液中濃度-時間曲線下面積(AUC<sub>8hr</sub>、AUC <sub>$\infty$</sub> )および消失相半減期(t<sub>1/2</sub>)についても両製剤とも同程度の値を示し、有意差も認められなかった。

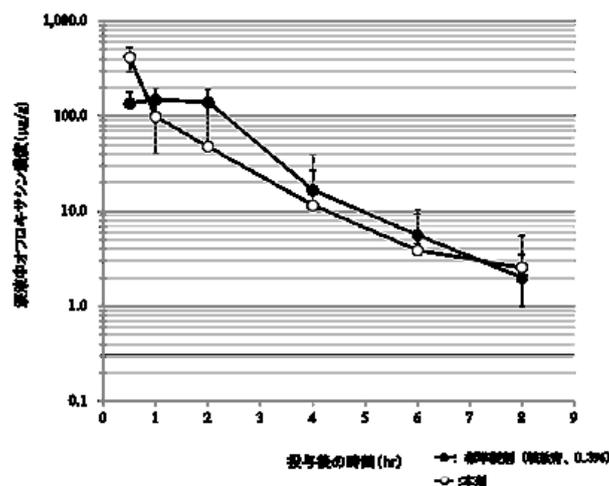


図 結膜囊内涙液中オフロキサシン濃度（平均値±標準偏差、n=10）

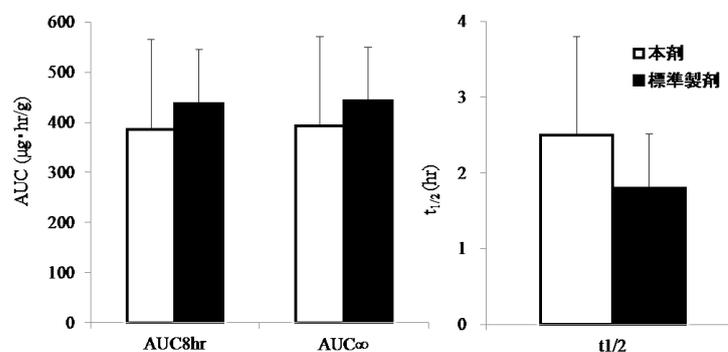


図 ファーマコキネティックパラメータ比較（平均値±標準偏差、n=10）

(Aspin-Welch 検定)

<眼組織内移行性<sup>9)</sup>>

対象：日本白色雄性家兎

方法：白色家兎の片眼に、本剤を1回50 $\mu$ Lを点眼し、5,15,30分及び1,2,3,4,6,8,12時間後に、角膜、房水、結膜、虹彩-毛様体の各組織を摘出し、組織ごとのオフロキサシン濃度を経時的に測定した。(n=5-6)

結果

	角膜	房水	結膜	虹彩・毛様体
Tmax	30min	2h	5min	5min
Cmax( $\mu$ g/g or mL)	19.11	1.84	63.38	4.76
AUC <sub>0-∞</sub> ( $\mu$ g h/g or mL)	39.93	5.25	31.41	6.48
t <sub>1/2</sub> (h)	2.2	1.1	5.1	2.8
k (h <sup>-1</sup> )	(6→12h) 0.321	(3→8h) 0.639	(3→12h) 0.137	(4→12h) 0.246

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

### (2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

### (2) 排泄率

該当資料なし

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 8. 透析等による除去率

該当資料なし

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

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. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

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。
2. 長期間使用しないこと。なお、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。
3. 他の点眼剤を併用する場合には、本剤投与前に少なくとも10分間の間隔をあけて投与すること。

(理由)

- ・ 他の点眼剤との混合により、本剤の眼表面温度でのゲル化が起こらなくなるため。

### 5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (1) 併用の場合にあたっては、本剤を最後に点眼するよう指導すること。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よう指導すること。
- (2) 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、べたつき等があるので、患者に十分説明すること。

(理由)

- (1) 他の点眼剤との混合により、本剤の眼表面温度でのゲル化が起こらなくなるため。
- (2) 点眼前は水溶性であるが、点眼後眼表面温度でゲル化が起こるので、通常の水溶性点眼液に比べると粘性が高い。そのためべたつき等が生じる可能性が高い。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

#### (2) 併用注意とその理由

該当しない

## 8. 副作用

## (1) 副作用の概要

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。(再審査対象外)

## (2) 重大な副作用と初期症状

## 重大な副作用（頻度不明）

## ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、観察を十分に行い、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。

## (3) その他の副作用

副作用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。

	頻度不明
過敏症	発疹、蕁麻疹、そう痒感、眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎
眼	結膜炎（結膜充血・浮腫等）、びまん性表層角膜炎等の角膜障害

## (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

## (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

## (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

## 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

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

## 9. 高齢者への投与

該当しない

## 10. 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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

## 11. 小児等への投与

該当しない

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

- (1) 投与経路 点眼用にのみ使用すること。
- (2) 薬剤交付時 次のことを患者へ指導すること。
  - 1) 原則として結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼と共に涙嚢部を圧迫すること。
  - 2) 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。
  - 3) 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。
  - 4) 必ず添付の投薬袋に入れて保存すること。

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

### 1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

---

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 1. 規制区分

製剤：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）  
有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期間：3年

### 3. 貯法・保存条件

遮光、10℃以下保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

「X. 管理的事項に関する項目-3. 貯法・保存条件」の項 参照

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

- ・「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 -4. 用法及び用量に関連する使用上の注意-3」の項参照
- ・「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目-6. 重要な基本的注意」の項 参照
- ・「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目-14. 適用上の注意」の項 参照
- ・くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

5mL×10本

### 7. 容器の材質

本体：ポリプロピレン  
中栓：ポリエチレン  
キャップ：ポリプロピレン  
ラベル：ポリエチレンテレフタレート

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：タリビッド眼軟膏0.3%、タリビッド点眼液0.3%  
同効薬：レボフロキサシン水和物、ノルフロキサシン、ロメフロキサシン塩酸塩、ガチフロキサシン水和物、トスフロキサシントシル酸塩水和物、モキシフロキサシン塩酸塩

### 9. 国際誕生年月日

不明

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日：2008年3月14日  
承認番号：22000AMZ00003

## 11. 薬価基準収載年月日

2008年7月4日

## 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

## 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

## 14. 再審査期間

該当しない

## 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

## 16. 各種コード

販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準収載 医薬品コード	レセプト電算コード
オフロキサシンゲル化 点眼液0.3%「わかもと」	118293401	1319722Q2011 (1319722Q2020*)	個別：620008240 統一：622619200

\*個別医薬品コード（YJコード）

## 17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品に該当しない。

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) わかもと製薬株式会社 社内資料 [長期保存試験]
- 2) わかもと製薬株式会社 社内資料 [苛酷試験]
- 3) わかもと製薬株式会社 社内資料 [苛酷試験 (光安定性)]
- 4) わかもと製薬株式会社 社内資料 [開封後安定性試験]
- 5) わかもと製薬株式会社 社内資料 [開封後安定性試験 (光安定性)]
- 6) わかもと製薬株式会社 社内資料 [眼刺激性試験]
- 7) わかもと製薬株式会社 社内資料 [生物学的同等性試験]
- 8) わかもと製薬株式会社 社内資料 [結膜囊内滞留性試験]
- 9) Fukaya Y et.al. Journal of ocular pharmacology and therapeutics 22.258-266.(2006)

### 2. その他の参考文献

- ・第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店, p. C-1171、3837 (2016)

---

## XII. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

なし

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

その他の関連資料