

* * 2013年 7月改訂 (第8版)
* 2009年 2月改訂

流涙症治療点眼剤

ラクリミン®点眼液0.05%

Lacrimin® ophthalmic solution 0.05%

オキシプロロカイン塩酸塩点眼液

日本標準商品分類番号	871313
------------	--------

承認番号	21900AMX00023000
薬価収載	2007年 6月
販売開始	1973年 1月
再評価結果	1989年 3月

貯 法：気密容器、室温保存
使用期限：外箱及びラベルに記載（3年）



〔禁忌(次の患者には投与しないこと)〕

本剤の成分又は安息香酸エステル(コカインを除く)系局所麻酔剤に対し過敏症の既往歴のある患者

〔組成・性状〕

販 売 名	ラクリミン点眼液0.05%
有 効 成 分	オキシプロロカイン塩酸塩
含量(1 mL中)	0.5mg
添 加 物	エデト酸ナトリウム水和物、塩化ナトリウム、ベンザルコニウム塩化物、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、pH調節剤
pH	4.0~5.0
浸透圧比	1.0~1.2
性 状	無色澄明、無菌水性点眼剤

〔効能・効果〕

分泌性流涙症

〔用法・用量〕

1日2~5回、1回1~2滴を点眼する。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

角膜障害等の副作用を起こすことがあるので、「用法・用量」を厳守するよう患者に対して注意を与えること。

〔使用上の注意〕

1. 副作用

承認時迄の調査及び副作用調査の総症例1,511例中、副作用が認められたのは19例(1.26%)であった。主な副作用は角膜障害12件(0.79%)、眼瞼炎4件(0.26%)、眼瞼そう痒感4件(0.26%)等であった。(副作用調査時)

1) **重大な副作用**(まれに:0.1%未満、ときに:0.1~5%未満、副詞なし:5%以上又は頻度不明)

ショック：ショックを起こすことがあるので、症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

*2) 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。

頻度種類	頻度不明	0.1~5%未満
過敏症	眼瞼皮膚炎	眼瞼発赤
眼	—	糜爛、混濁、剥離等の角膜障害、結膜充血、そう痒感

2. 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〕

3. 適用上の注意

- 1) 投与経路：点眼用にのみ使用すること。
- 2) 投 与 時：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よう指導すること。

〔薬物動態〕

1. 角膜における薬物動態¹⁾

(参考：ウサギ(*in vitro*))

ウサギ摘出角膜を1%オキシプロロカイン塩酸塩液に3分間浸した後に組織の薬物濃度を測定すると、角膜上皮では70.6mg/100mL、角膜実質では7.55mg/100mLであり、上皮では実質の約10倍の取り込みが認められた。

また、同様にウサギ摘出角膜を1%オキシプロロカイン塩酸塩に3分間浸した後、1分、15分及び30分放置してから角膜(全体)中の薬物濃度を測定すると、1分放置後では21.95mg/100mL、15分放置後では7.39mg/100mL、30分放置後では4.24mg/100mLであった。

2. 血清中での薬物動態²⁾

(参考：ヒト(*in vitro*))

ヒト血清にオキシプロロカイン塩酸塩を加え37℃でインキュベートすると、N-ジエチルアミノエタノールと3-ブトキシ-4-アミノ安息香酸に速やかに分解された。

〔臨床成績〕³⁾

分泌性流涙症の患者72例を対象として6施設で実施した二重盲検法による比較臨床試験において、有効率(有効以上)は77.8%であり、対照群の偽薬に対して危険率0.5%で有意差が認められた。

〔薬効薬理〕

1. 涙液分泌に及ぼす作用

白色ウサギに本剤を1滴ずつ5分毎に6回連続点眼し、最終点眼2分後に涙液分泌量を毛細管比色法で測定すると、生理食塩液に比べ、約30%の涙液分泌の抑制が認められた⁴⁾。この涙液分泌抑制作用は表面麻酔剤点眼による結膜及び角膜の知覚麻痺並びに三叉神経反射弓の一過性遮断によるものと考えられる⁵⁾。

2. 局所知覚麻痺作用¹⁾

本剤の局所知覚麻痺作用をウサギ角膜反射法により調べたところ、1回点眼ではほとんど知覚麻痺が認められないが、5分毎に連続点眼すると3回目から効果があらわれ、6回連続点眼後では約6分間持続する麻痺効果が認められた。

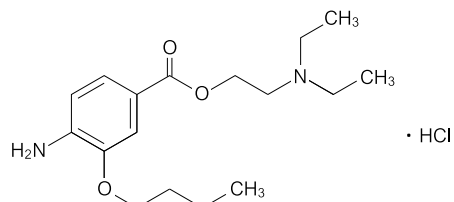
〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名：オキシブプロカイン塩酸塩

(Oxybuprocaine Hydrochloride)

化学名：2-(Diethylamino)ethyl 4-amino-3-butoxybenzoate monohydrochloride

構造式：



分子式：C₁₇H₂₈N₂O₃·HCl

分子量：344.88

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は塩辛く、舌を麻痺する。

本品は水に極めて溶けやすく、エタノール(95)又はクロロホルムに溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは5.0～6.0である。

本品は光によって徐々に着色する。

〔包装〕

プラスチック点眼容器 5 mL×10本

〔主要文献及び文献請求先〕

<主要文献>

- 1) H. E. Schlegel, Jr et al. : Arch. Ophthal., 51, 663(1954) [50666]
- 2) H. Iselin et al. : Schweiz. med. Wschr., 96, 219(1966) [50671]
- 3) 生井 浩他：眼科臨床医報 67, 758(1973) [52287]
- 4) 宇田弘三：ラクリミン点眼液の局所麻痺作用
および涙液分泌におよぼす影響,
参天製薬(株)社内資料 [52284]
- 5) 生井 浩：眼科臨床医報 63, 403(1969) [52285]

<文献請求先・製品に関するお問い合わせ先>

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ください。

参天製薬株式会社 製品情報センター

〒530-8552(個別郵便番号) 大阪市北区大深町4-20

TEL 0120-921-839 06-6321-7056

受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)