2024年5月改訂（第8版）

日本標準商品分類番号　871319

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2018（2019年更新版）に準拠して作成

広範囲抗菌点眼剤
オフロキサシンゲル化点眼液

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」

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中オフロキサシン3.0mg
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・ 販売開始年月日	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 販売開始年月日：2008年7月4日
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：https://www.wakamoto-pharm.co.jp/

本ＩＦは2023年9月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

（2020年４月改訂）

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、ＭＲ）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、ＩＦと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第２小委員会がＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第３小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領2008以降、ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、ＩＦ記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索の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ＩＦを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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ＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。ＩＦは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、ＩＦを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目 1
1．開発の経緯 1
2．製品の治療学的特性 1
3．製品の製剤学的特性 1
4．適正使用に関して周知すべき特性 1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項 1
6．ＲＭＰの概要 2

II. 名称に関する項目 3
1．販売名 3
2．一般名 3
3．構造式又は示性式 3
4．分子式及び分子量 3
5．化学名（命名法）又は本質 3
6．慣用名、別名、略号、記号番号 3

III. 有効成分に関する項目 4
1．物理化学的性質 4
2．有効成分の各種条件下における安定性 4
3．有効成分の確認試験法、定量法 4

IV. 製剤に関する項目 5
1．剤形 5
2．製剤の組成 5
3．添付溶解液の組成及び容量 5
4．力価 5
5．混入する可能性のある夾雑物 5
6．製剤の各種条件下における安定性 6
7．調製法及び溶解後の安定性 6
8．他剤との配合変化（物理化学的変化） 6
9．溶出性 6
10．容器・包装 6
11．別途提供される資材類 7
12．その他 7

V. 治療に関する項目 8
1．効能又は効果 8
2．効能又は効果に関連する注意 8
3．用法及び用量 8
4．用法及び用量に関連する注意 8
5．臨床成績 8

VI. 薬効薬理に関する項目 10
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 10
2．薬理作用 10

VII. 薬物動態に関する項目 11
1．血中濃度の推移 11
2．薬物速度論的パラメータ 11
3．母集団（ポピュレーション）解析 11
4．吸収 11
5．分布 11
6．代謝 13
7．排泄 13
8．トランスポーターに関する情報 14
9．透析等による除去率 14
10．特定の背景を有する患者 14
11．その他 14

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 15
1．警告内容とその理由 15
2．禁忌内容とその理由 15
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 15
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 15
5．重要な基本的注意とその理由 15
6．特定の背景を有する患者に関する注意 15
7．相互作用 16
8．副作用 16
9．臨床検査結果に及ぼす影響 16
10．過量投与 16
11．適用上の注意 16
12．その他の注意 17

IX. 非臨床試験に関する項目 18
1．薬理試験 18
2．毒性試験 18

X. 管理的事項に関する項目 19
1．規制区分 19
2．有効期間 19
3．包装状態での貯法 19
4．取扱い上の注意 19
5．患者向け資材 19
6．同一成分・同効薬 19
7．国際誕生年月日 19
8．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 19
9．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 19
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 19
11．再審査期間 19
12．投薬期間制限に関する情報 19
13．各種コード 20
14．保険給付上の注意 20

XI. 文献 21
1．引用文献 21
2．その他の参考文献 21

XII. 参考資料 21
1．主な外国での発売状況 21
2．海外における臨床支援情報 21

XIII. 備考 21
1．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 21
2．その他の関連資料 22

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。

オフロキサシンゲル化点眼液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、7月に薬価基準収載され発売に至った。

２．製品の治療学的特性

(1) オフロキサシンの作用機序は、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。

（Ⅵ.2.(1)作用部位・作用機序 の項 参照）

(2) タリビッド眼軟膏0.3％の剤形追加品として承認された製剤で、生物学的同等性試験により、タリビッド眼軟膏0.3％との同等性が確認されている。

（Ⅵ.2.(2)薬効を裏付ける試験成績 の項　参照）

(3) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーがあらわれることがある。

（Ⅷ.8.(1)重大な副作用と初期症状 の項 参照）

３．製品の製剤学的特性

(1) 熱応答ゲル基剤を応用した点眼液である。

(2) 可逆的な熱応答ゲル基剤であり、眼表面温度でゲル化し、10℃以下でゾル化する。

４．適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材，最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1)承認条件

該当しない

(2)流通・使用上の制限事項

該当しない

６．ＲＭＰの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

１．販売名

(1) 和名

オフロキサシンゲル化点眼液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）

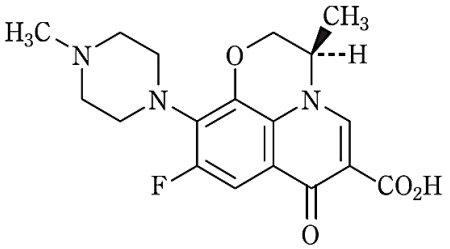
(2) 洋名（命名法）

Ofloxacin（JAN）

(3) ステム

ナリジクス酸系抗菌薬：-oxacin、-floxacin

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：$C_{18}H_{20}FN_3O_4$

分子量：361.37

５．化学名（命名法）又は本質

(3*RS*)-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

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

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
酢酸（100）	溶けやすい
水	溶けにくい
アセトニトリル	極めて溶けにくい
エタノール（99.5）	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

pKa_1：5.74±0.03（カルボキシル基）

pKa_2：7.90±0.05（ピペラジンの 4 位の窒素）

（測定法：電位差滴定法）

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

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。

２．有効成分の各種条件下における安定性

光によって変色する。

３．有効成分の確認試験法、定量法

日本薬局方「オフロキサシン」の確認試験法及び定量法による

確認試験：(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

定量法：電位差滴定法

IV．製剤に関する項目

１．剤形

(1) 剤形の区別

点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

粘性のある微黄色～淡黄色澄明の液

(3) 識別コード

キャップの色：淡茶色

キャップ天面：

(4) 製剤の物性

pH：6.0～7.0

浸透圧比：1.52～1.75

(5) その他

無菌製剤である。

２．製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

３．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

４．力価

該当しない

５．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

６．製剤の各種条件下における安定性

長期保存試験[1)]、苛酷試験（熱安定性）[2)]、苛酷試験（光安定性）[3)]

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	10±1℃、暗所	36 ヵ月	ポリプロピレン製点眼容器	規格内
苛酷試験（熱安定性）	40℃、暗所	6 ヵ月	ポリプロピレン製点眼容器	3 ヵ月まで規格内（6 ヵ月目で含量が規格外）
苛酷試験（光安定性）	10℃ 白色蛍光灯 3000lx	120 万 lx・hr	ポリプロピレン製点眼容器	90 万 lx・hr まで規格内（120 万 lx・hr で含量規格外）
			ポリプロピレン製点眼容器（シュリンク有）	規格内

測定項目：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

開封後の安定性試験[4,5)]

保存条件	保存期間	保存形態	結果
5℃	2 ヵ月	ポリプロピレン製点眼容器（シュリンク有）	規格内
25℃、60%RH			
40℃、75%RH			
10℃、白色蛍光灯下 1000lx	60 万 lx･hr	ポリプロピレン製点眼容器（シュリンク有）	規格内

測定項目：性状、浸透圧比、粘度、pH、含量、水分透過**

**：25℃、60%RH のみ

７．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

９．溶出性

該当しない

10．容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

プラスチック点眼容器：5mL×10本

(3) 予備容量

該当しない

(4) 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

11．別途提供される資材類

該当資料なし

12．その他

1滴：約45μL

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、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．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

３．用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

４．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。

５．臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈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）〉

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[注)]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[6)]。

※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回点眼する。なお、症状により適宜増減する。」である。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

１. 薬理学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化合物

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

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：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[7]。抗菌作用は殺菌的でMIC濃度で溶菌が認められた[8]。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[9]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1）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[8]、[10]、[11]（*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[12]、[13]。

2）生物学的同等性試験

ウサギ緑膿菌角膜感染症モデル（n＝10）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[14]。

	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±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。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

３．母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

４．吸収

該当資料なし

５．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

＜結膜嚢内滞留性試験[15)]＞

対象：日本白色種雄性家兎（n=10）

方法：白色家兎の両眼に、本剤又はタリビッド眼軟膏 0.3%を、50μL/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嚢内の涙液を採取し、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：本剤投与群は点眼後30分に最高濃度413.63±116.29μg/g（平均値±標準偏差）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MIC_{90}（90%の菌株の発育を阻止する最小濃度）である2μg/mL以上を維持した。

本剤及びタリビッド眼軟膏 0.3%投与群の結膜嚢内涙液中オフロキサシン濃度は、涙液中濃度－時間曲線下面積（AUC_{8hr}、AUC_{∞}）及び消失相半減期（$t_{1/2}$）において同程度の値を示し有意差も認められなかったことから、両製剤の結膜嚢内滞留性は同程度であると考えられた。

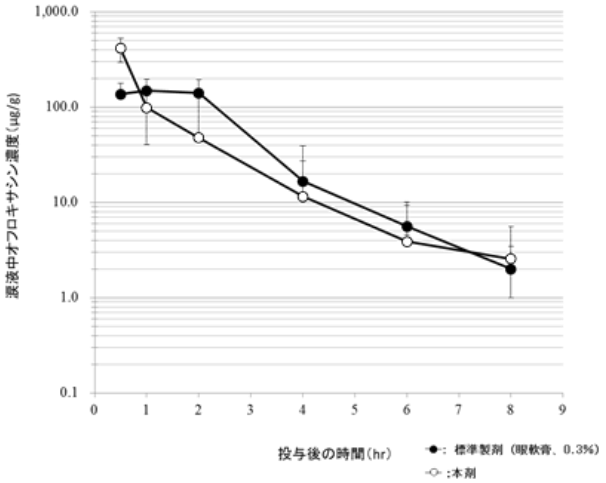


図　結膜嚢内涙液中オフロキサシン濃度（平均値±標準偏差、n=10）

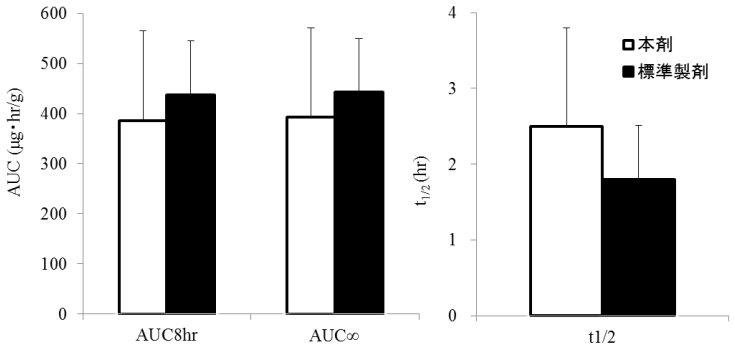


図　ファーマコキネティックパラメータの比較（平均値±標準偏差、n=10）

＜眼組織内移行性試験[16)]＞

対象：日本白色雄性家兎（n=5-6）

方法：白色家兎の片眼に、本剤を 1 回 50μL 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。

結果

	角膜	房水	結膜	虹彩・毛様体
T_{max}	30min	2h	5min	5min
C_{max}（μg/g or mL）	19.11	1.84	63.38	4.76
$AUC_{0-\infty}$（μg h/g or mL）	39.93	5.25	31.41	6.48
$t_{1/2}$（h）	2.2	1.1	5.1	2.8
k（h^{-1}）	（6→12h） 0.321	（3→8h） 0.639	（3→12h） 0.137	（4→12h） 0.246

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

６．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（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

７．排泄

該当資料なし

８．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

９．透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

設定されていない

２．禁忌内容とその理由

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．効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

４．用法及び用量に関連する注意とその理由

〈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。

５．重要な基本的注意とその理由

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。

６．特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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。

(6) 授乳婦

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。

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

設定されていない

7．相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8．副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

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。

(2) その他の副作用

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

9．臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10．過量投与

設定されていない

11．適用上の注意

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。
- 併用の場合にあたっては、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。

（解説）

・複数の点眼剤を短い間隔で点眼すると、初めに点眼した薬剤が後から点眼した薬剤によって結膜嚢から流され、薬剤の有効性が低下する可能性がある。
・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。
・室温では点眼液の粘性が上がり点眼しにくくなるため、室温に置いた場合は冷蔵庫で冷やし液状に戻してから点眼するよう指導すること。
・容器の先端が直接目に触れると、眼脂や雑菌等により薬液が汚染される可能性がある。
・閉瞼及び涙嚢部の圧迫を行うことにより、薬液の鼻涙管への流出による鼻粘膜からの吸収を防ぎ、全身性の副作用発現の可能性を軽減するとともに、治療効果を高めるためである。
・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。
・液が眼瞼皮膚等についたままにしておくと、皮膚に吸収されて感作される可能性がある。
・遮光保存が必要な製剤であり、品質を保つため。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項 参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

眼刺激性試験

雄性ウサギ（n=5）の左眼に、オフロキサシンゲル化点眼液0.3%「わかもと」、タリビッド眼軟膏0.3%及び生理食塩液を3時間間隔で1日4回、13週間投与した（点眼50μL、点入60μL）。その結果、オフロキサシンゲル化点眼液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、タリビッド眼軟膏0.3%と比較してその刺激性は軽微であると判断した[17)]。

(7) 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

有効期間：3年

３．包装状態での貯法

10℃以下保存

４．取扱い上の注意

20．取扱い上の注意
外箱開封後は遮光して保存すること。

５．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：患者指導箋（https://www.wakamoto-pharm.co.jp/medical/0011）

６．同一成分・同効薬

先発医薬品名：タリビッド眼軟膏0.3％

７．国際誕生年月日

不明

８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
2008年3月14日	22000AMZ00003000	2008年7月4日	2008年7月4日

９．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

10．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

11．再審査期間

該当しない

12．投薬期間制限に関する情報

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。

X. 管理的事項に関する項目

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJコード）	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
オフロキサシンゲル化点眼液0.3%「わかもと」	1319722Q2011	1319722Q2020	118293401	個別：620008240 統一：622619200

14. 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（熱安定性）］
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［開封後の安定性試験（熱安定性）］
5）わかもと製薬株式会社 社内資料［開封後の安定性試験（光安定性）］
6）井上慎三 他：あたらしい眼科. 1986；3：742-752
7）Kato J, et al.：Cell. 1990；63：393-404
8）西野武志 他：Chemotherapy. 1984；32（Supp. 1）：62-83
9）三井幸彦 他：日本眼科学会雑誌. 1988；92：973-980
10）三井幸彦 他：眼科臨床医報. 1986；80：1813-1828
11）三井幸彦 他：日本眼科紀要. 1986；37：1115-1140
12）三井幸彦 他：日本眼科学会雑誌. 1986；90：1074-1080
13）三井幸彦 他：日本眼科学会雑誌. 1989；93 臨時増刊号：157
14）わかもと製薬株式会社 社内資料［生物学的同等性試験］
15）わかもと製薬株式会社 社内資料［結膜嚢内滞留性試験］
16）Fukaya Y et.al.：Journal of ocular pharmacology and therapeutics. 2006；22：258-266
17）わかもと製薬株式会社 社内資料［眼刺激性試験］

２．その他の参考文献

・日本薬局方医薬品情報（JP DI）．じほう．2016
・第十八改正日本薬局方 解説書．廣川書店．2021

XII. 参考資料

１．主な外国での発売状況

該当しない

２．海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

１．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉砕

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

２．その他の関連資料

該当資料なし