

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
オフロキサシン点眼液

オフロキサシン点眼液0.3%「ニットー」

Ofloxacin Ophthalmic Solution 0.3% [NITTO]

剤形	水性点眼剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品 ^{注)} 注)注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1mL中 日局 オフロキサシン 3mg 含有
一般名	和名:オフロキサシン(JAN) 洋名:Ofloxacin(JAN、INN)
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:2019年7月24日(販売名変更) 薬価基準収載年月日:2019年12月13日(販売名変更) 販売開始年月日:2001年7月30日
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元:東亜薬品株式会社 発売元:日東メディック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日東メディック株式会社 おくすり相談窓口 TEL:03-3523-0345 FAX:03-6264-4086 医療関係者向けホームページ https://www.nittomedic.co.jp/info/

本IFは2023年9月改訂の電子添文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。

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て、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I F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、I F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	8. トランスポーターに関する情報	12
1. 開発の経緯	1	9. 透析等による除去率	12
2. 製品の治療学的特性	1	10. 特定の背景を有する患者	12
3. 製品の製剤学的特性	1	11. その他	12
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	14
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	14
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	14
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	14
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14
2. 一般名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	14
3. 構造式又は示性式	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	14
5. 化学名(命名法)又は本質	2	8. 副作用	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
III. 有効成分に関する項目	3	10. 過量投与	15
1. 物理化学的性質	3	11. 適用上の注意	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	12. その他の注意	15
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	IX. 非臨床試験に関する項目	16
IV. 製剤に関する項目	4	1. 薬理試験	16
1. 剤形	4	2. 毒性試験	16
2. 製剤の組成	4	X. 管理的事項に関する項目	17
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	1. 規制区分	17
4. 力価	4	2. 有効期間	17
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	3. 包装状態での貯法	17
6. 製剤の各種条件下における安定性	4	4. 取扱い上の注意	17
7. 調製法及び溶解後の安定性	4	5. 患者向け資料	17
8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	5	6. 同一成分・同効薬	17
9. 溶出性	5	7. 国際誕生年月日	17
10. 容器・包装	5	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	17
11. 別途提供される資料類	5	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	17
12. その他	5	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	17
V. 治療に関する項目	6	11. 再審査期間	18
1. 効能又は効果	6	12. 投薬期間制限に関する情報	18
2. 効能又は効果に関連する注意	6	13. 各種コード	18
3. 用法及び用量	6	14. 保険給付上の注意	18
4. 用法及び用量に関連する注意	6	XI. 文献	19
5. 臨床成績	6	1. 引用文献	19
VI. 薬効薬理に関する項目	10	2. その他の参考文献	19
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	10	XII. 参考資料	20
2. 薬理作用	10	1. 主な外国での発売状況	20
VII. 薬物動態に関する項目	11	2. 海外における臨床支援情報	20
1. 血中濃度の推移	11	XIII. 備考	21
2. 薬物速度論的パラメータ	11	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
3. 母集団(ポピュレーション)解析	11	2. その他の関連資料	21
4. 吸収	11		
5. 分布	11		
6. 代謝	12		
7. 排泄	12		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オフロキサシンは、分子内にフッ素原子を有しオキサジン環を母核とするニューキノロン系抗菌薬であり、広範囲な抗菌スペクトルと抗菌活性を示す。

本剤はオフロキサシンを 0.3% 含有する抗菌製剤であり、後発医薬品として、規格及び試験方法を設定、加速試験を実施し、2001 年 3 月に製造販売承認を取得し、2001 年 7 月に発売に至った。

なお、2019 年 7 月に『オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」』として販売名変更の製造販売承認を取得し、同年 12 月に薬価収載された。

2. 製品の治療学的特性

(1) グラム陽性菌から緑膿菌を含むグラム陰性菌まで幅広く抗菌スペクトラムを有する。

(2) 眼科周術期の無菌化療法に有効である。

(3) オフロキサシン点眼液の重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーを起こすことがあると報告がある(15 頁参照)。

3. 製品の製剤学的特性

(1) 5 分の 2 回転程度で開閉できる点眼容器である。

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

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」

(2) 洋名

Ofloxacin Ophthalmic Solution 0.3%「NITTO」

(3) 名称の由来

有効成分の一般名による

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

オフロキサシン(JAN)

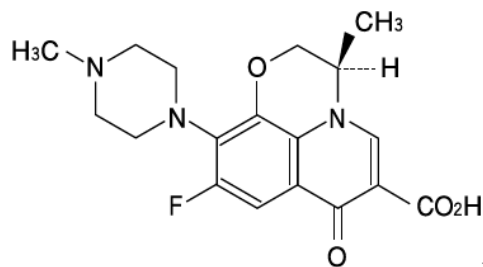
(2) 洋名(命名法)

Ofloxacin(JAN、INN)

(3) ステム

ナリジクス酸誘導体系抗菌剤: -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: C₁₈H₂₀FN₃O₄

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 (IUPAC)

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

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°C(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、定量法

確認試験法:日局「オフロキサシン」による。

定量法:日局「オフロキサシン」による。

IV. 製剤に関する項目

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

水性点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

微黄色～淡黄色澄明、無菌水性点眼剤

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH:6.0～7.0

浸透圧比:0.95～1.15

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量および添加剤

販売名	オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」
有効成分	1mL 中 日局 オフロキサシン 3mg
添加剤	塩化ナトリウム、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

オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」において、各種条件下における安定性は以下であった¹⁾。

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40℃ 75%RH	6 箇月	ポリエチレン容器 紙箱包装	変化なし ^{※1}
長期保存試験	25℃ 60%RH	36 箇月	ポリエチレン容器 紙箱包装	変化なし ^{※1}

※1 試験項目:性状、確認試験、pH、浸透圧比、不溶性異物、無菌、含量

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(物理化学的变化)

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×5本、5mL×10本、5mL×50本

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

容器:ポリエチレン

中 栓:ポリエチレン

キャップ:ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

投薬袋、「X. 5. 患者向け資材」を参照すること。

12. 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、ステントロホモナス(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

〈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

設定されていない

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)〉

1. 国内第Ⅱ相試験

外眼部細菌感染症患者 286 例を対象に、0.3%、0.5%オフロキサシン点眼液(1回2滴、1日4回)^{注1)}又は0.3%マイクロマイシン硫酸塩点眼液(1回2滴、1日4回)を原則3日以上(症状消失後2日まで。ただし、原則として2週間を超えない)点眼した結果、累積有効率(有効以上^{*})は0.3%オフロキサシン点眼液群98.5%(66/67例)、0.5%オフロキサシン点眼液群97.5%(79/81例)、0.3%マイクロマイシン硫酸塩点眼液群89.6%(69/77例)であり、0.3%オフロキサシン点眼液群は0.3%マイクロマイシン硫酸塩点眼液群と比較し、有意に優れた臨床効果が認められた。また、0.3%オフロキサシン点眼液群の疾患別及び有効菌種別臨床効果は表1及び表2のとおりであった。

0.3%オフロキサシン点眼液群において副作用は94例中2例(2.1%)に認められ、主な副作用はしみるであった²⁾。

※眼感染症研究会制定基準(1982年)に従い評価。

注1)本剤が承認されている濃度は0.3%、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。

表 1 疾患別臨床効果

疾患名	有効率※(%) [有効以上]
眼瞼炎	100.0(3/3)
涙嚢炎	100.0(3/3)
麦粒腫	100.0(4/4)
結膜炎	98.2(55/56)
瞼板腺炎	100.0(2/2)
角膜炎	100.0(3/3)

※複数の疾患を合併している場合は各々の疾患に 1 例として算入

表 2 有効菌種別臨床効果

菌種	有効率※(%) [有効以上]
ブドウ球菌属	100.0(41/41)
レンサ球菌属	100.0(5/5)
肺炎球菌	100.0(4/4)
ミクロコッカス属	100.0(1/1)
モラクセラ属	100.0(1/1)
コリネバクテリウム属	100.0(11/11)
クレブシエラ属	0.0(0/1)
セラチア属	100.0(2/2)
プロテウス属	100.0(1/1)
ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)	100.0(4/4)
シュードモナス属	100.0(9/9)
緑膿菌	100.0(2/2)
バークホルデリア・セパシア	100.0(6/6)
アシネトバクター属	100.0(2/2)

※複数の菌種が検出された場合は各々の菌種に 1 例として算入

2. 国内第Ⅲ相試験

外眼部細菌感染症患者 373 例を対象に、0.3%オフロキサシン点眼液(1回2滴、1日4回)^{注2)}又は0.3%ジベカシン点眼液(1回2滴、1日4回)を原則3日以上(症状消失後2日まで。ただし、原則として2週間を超えない)点眼した結果、0.3%オフロキサシン点眼液群の累積有効率(有効以上※)は99.3%(137/138例)であり、0.3%ジベカシン点眼液群の94.3%(115/122例)と比較し、臨床効果が優れている傾向が認められた。また、0.3%オフロキサシン点眼液群の疾患別及び有効菌種別臨床効果は表3及び表4のとおりであった。

0.3%オフロキサシン点眼液群において副作用は178例中2例(1.1%)に認められ、いずれもしみるであった³⁾。

※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2)本剤が承認されている用法及び用量は、通常1回1滴、1日3回点眼、症状により適宜増減である。

V. 治療に関する項目

表 3 疾患別臨床効果

疾患名	有効率※(%) [有効以上]
眼瞼炎	100.0(9/9)
涙嚢炎	100.0(13/13)
麦粒腫	100.0(12/12)
結膜炎	99.0(101/102)
瞼板腺炎	100.0(5/5)
角膜炎	100.0(4/4)

※複数の疾患を合併している場合は各々の疾患に 1 例として算入

表 4 有効菌種別臨床効果

菌種	有効率※(%) [有効以上]
ブドウ球菌属	98.7(78/79)
レンサ球菌属	100.0(18/18)
肺炎球菌	100.0(11/11)
ミクロコッカス属	100.0(3/3)
モラクセラ属	100.0(8/8)
コリネバクテリウム属	100.0(29/29)
セラチア属	100.0(6/6)
プロテウス属	100.0(2/2)
インフルエンザ菌	100.0(8/8)
ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)	100.0(5/5)
シュードモナス属	100.0(16/16)
アシネトバクター属	100.0(8/8)
アクネ菌	100.0(2/2)

※複数の菌種が検出された場合は各々の菌種に 1 例として算入

3. 国内第Ⅲ相試験

外眼部細菌感染症患者 448 例を対象に、0.3%オフロキサシン点眼液(1 回 1 滴、1 日 3 回)又は 0.3%マイクロマイシン硫酸塩点眼液(1 回 2 滴、1 日 4 回)を原則 3 日以上(症状消失後 2 日まで。ただし、原則として 2 週間を超えない)点眼した結果、0.3%オフロキサシン点眼液群の累積有効率(有効以上※)は 93.0%(173/186 例)であり、0.3%マイクロマイシン硫酸塩点眼液群の 85.2%(155/182 例)と比較し、有意に優れた臨床効果が認められた。また、0.3%オフロキサシン点眼液群の疾患別及び有効菌種別臨床効果は表 5 及び表 6 のとおりであった。

0.3%オフロキサシン点眼液群 186 例に副作用は認められなかった⁴⁾。

※眼感染症研究会制定の評価判定基準(1985 年)に準拠し評価。

表 5 疾患別臨床効果

疾患名	有効率※(%) [有効以上]
眼瞼炎	100.0(9/9)
涙嚢炎	82.9(29/35)
麦粒腫	90.0(9/10)
結膜炎	95.0(113/119)
瞼板腺炎	100.0(7/7)
角膜炎(角膜潰瘍を含む)	93.1(27/29)

※複数の疾患を合併している場合は各々の疾患に 1 例として算入

表 6 有効菌種別臨床効果

菌種	有効率※(%) [有効以上]
ブドウ球菌属	92.6(112/121)
レンサ球菌属	100.0(15/15)
肺炎球菌	83.3(15/18)
マイクロコッカス属	90.0(9/10)
モラクセラ属	100.0(5/5)
コリネバクテリウム属	85.0(17/20)
クレブシエラ属	100.0(3/3)
セラチア属	100.0(1/1)
プロテウス属	100.0(1/1)
インフルエンザ菌	100.0(8/8)
ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)	85.7(6/7)
シュードモナス属	84.6(11/13)
緑膿菌	100.0(3/3)
バークホルデリア・セパシア	100.0(2/2)
アシネトバクター属	100.0(6/6)
アクネ菌	100.0(3/3)

※複数の菌種が検出された場合は各々の菌種に1例として算入

〈眼科周術期の無菌化療法〉

4. 国内一般臨床試験

眼手術患者 367 例を対象に、0.3%オフロキサシン点眼液を 1 日 5 回^{注3)}、手術前 2 日間点眼した結果、全例とも術後感染はみられなかった。

副作用は認められなかった⁵⁾。

注 3)本剤が承認されている用法及び用量は、1 回 1 滴、1 日 3 回点眼、症状により適宜増減である。

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化合物

注意：関連のある化合物の効能・効果は最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

抗菌作用は殺菌的で MIC 濃度で溶菌が認められた⁹⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

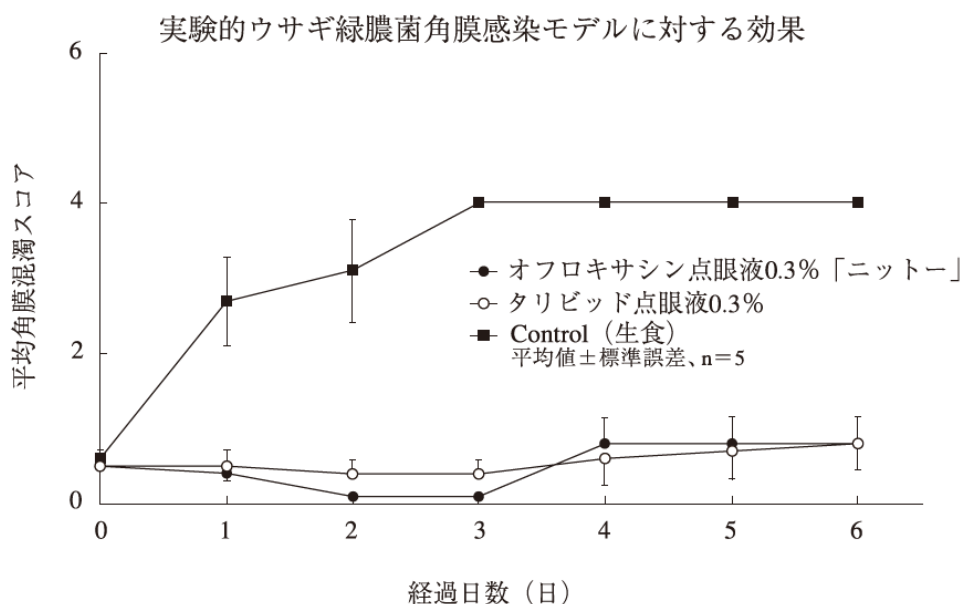
1. 抗菌作用

オフロキサシンの抗菌スペクトラムは広範囲に及び、オフロキサシン点眼液はブドウ球菌属、肺炎球菌を含むレンサ球菌属、マイクロコッカス属、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^{2),4),6)} (*in vitro*)。

2. 生物学的同等性試験

ウサギ緑膿菌角膜感染モデルに対する効果

オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」とタリビッド点眼液 0.3%について、実験的ウサギ緑膿菌角膜感染モデルに対する治癒効果の比較を行った。その結果、両剤とも優れた治癒効果を示し、また、両剤の治癒効果に有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された⁷⁾。



(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

- ・白内障手術患者(25例)に0.3%オフロキサシン点眼液1回1滴を術前5分毎5回点眼したとき、房水中濃度は最終点眼後1時間前後に最高値(1.20 μ g/mL)を示した⁸⁾。
- ・白色ウサギに0.3%オフロキサシン点眼液を1回1滴点眼したとき、角膜、球結膜、眼筋、強膜、虹彩・毛様体及び房水に良好な移行を認めた。その移行量は角膜、強膜、眼筋、虹彩・毛様体において点眼終了1時間後に最高値を示し、それぞれの値は3.32 μ g/g、1.62 μ g/g、2.62 μ g/g、0.95 μ g/gであった。

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

また球結膜では 15 分後に 2.95 $\mu\text{g/g}$ 、前房水では 30 分後に 0.71 $\mu\text{g/mL}$ とそれぞれ最高値を示した⁸⁾。

- 白色ウサギに 0.3% オフロキサシン点眼液を 1 回 1 滴、5 分毎に 5 回点眼したとき、上記の 1 回点眼した場合と同様に眼組織へ良好な移行が認められた。その移行量は角膜、強膜、球結膜において点眼終了 5 分後に最高値を示し、それぞれの値は、7.78 $\mu\text{g/g}$ 、7.66 $\mu\text{g/g}$ 、34.98 $\mu\text{g/g}$ であった。また眼筋では 15 分後に 18.54 $\mu\text{g/g}$ 、虹彩・毛様体、硝子体では 30 分後にそれぞれ 3.12 $\mu\text{g/g}$ 、0.80 $\mu\text{g/mL}$ 、前房水では 1 時間後に 3.56 $\mu\text{g/mL}$ と最高値を示した⁸⁾。
- 白色及び有色ウサギに 0.3% オフロキサシン点眼液を 1 回 1 滴、1 日 3 回 2 週間両眼に点眼し眼内動態を比較したメラニン含有組織である虹彩・毛様体、網脈絡膜における濃度差がみられた。メラニン含有していない組織では房水中濃度を除いて白色と有色ウサギの間に組織内濃度の動態に大きな差は認められなかった⁹⁾。

(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

生物学的同等性試験

ウサギにおける眼組織内移行

オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」とタリビッド点眼液 0.3% について、ウサギに点眼して眼房水及び角膜中オフロキサシン濃度を測定したところ、両剤の点眼 30 分後及び点眼 1 時間後それぞれの眼房水中オフロキサシン濃度及び角膜中オフロキサシン濃度に有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された⁷⁾。

VII. 薬物動態に関する項目

	眼房水中オフロキサシン濃度 ($\mu\text{g/mL}$)		角膜中オフロキサシン濃度 ($\mu\text{g/g}$)	
	30 分後	1 時間後	30 分後	1 時間後
オフロキサシン点眼液 0.3% 「ニットー」	0.39 \pm 0.08	0.57 \pm 0.08	6.36 \pm 1.00	4.63 \pm 0.50
タリビッド点眼液 0.3%	0.35 \pm 0.08	0.55 \pm 0.07	6.50 \pm 1.28	5.02 \pm 0.63

(平均値 \pm 標準誤差、n=10)

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

設定されていない

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	眼刺激、眼痛	びまん性表層角膜炎等の角膜障害、眼瞼炎、結膜炎、目のそう痒感
皮膚		そう痒、発疹、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。

- ・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。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・遮光して保存すること。

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」を参照すること。

(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(ウサギ)

オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」をウサギの右眼瞼結膜囊に、生理食塩液を左眼瞼結膜囊に 1 回 50 μ L をそれぞれ 30 分間隔で 15 回投与し、最終点眼後 1、3、24、48、72、96 及び 168 時間に眼刺激性の判定を行った。その結果、最終点眼後 168 時間まで眼反応はみられず、岡本らの眼刺激評価基準において、「實際上無刺激、クラス 1」に分類された¹⁰⁾。

(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: オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」、処方箋医薬品^{注)}

注) 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

室温保存

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. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド: 無

くすりのしおり: 有

その他の患者向け資料: 無

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬: タリビッド点眼液 0.3%

同 効 薬: ノルフロキサシン、ロメフロキサシン、レボフロキサシン、トスフロキサシン、ガチフロキサシン、モキシフロキサシン

7. 国際誕生年月日

1985 年 4 月 16 日

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

販売名	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
旧販売名 オフロキシ点眼液 0.3%	2001 年 3 月 14 日	21300AMZ00206000	2001 年 7 月 6 日	2001 年 7 月 30 日
販売名変更 オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」	2019 年 7 月 24 日 (代替新規承認)	30100AMX00147000	2019 年 12 月 13 日	2019 年 12 月 13 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

再評価結果公表年月日: 2004 年 9 月 30 日

内容: 製造(輸入)承認事項の一部を変更すれば薬事法第 14 条第 2 項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しない。

X. 管理的事項に関する項目

	再評価前の承認内容	再評価結果
効能・効果	<p>オフロキサシン感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、マイクロコッカス属、コリネバクテリウム属、ブランハメラ・カタラリス、シュードモナス属、緑膿菌、ヘモフィルス属 [インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプティウス (コッホ・ウィークス菌)]、モラクセラ属 (モラー・アクセンフェルド菌)、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、嫌気性菌 (プロピオニバクテリウム・アクネス) による下記感染症 眼瞼炎、麦粒腫、涙嚢炎、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎、角膜潰瘍、術後感染症</p>	<p><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 <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</p>

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、療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等 (平成 18 年厚生労働省告示第 107 号) の一部を改正した平成 20 年厚生労働省告示第 97 号 (平成 20 年 3 月 19 日付) の「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

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
オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」	1319722Q1015	1319722Q1287	113967901	621396701

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬における後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 社内資料:オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」の安定性試験
- 2) 三井幸彦ほか:眼科臨床医報. 1985;79(9):1718-1736
- 3) 三井幸彦ほか:眼科臨床医報. 1986;80(9):1813-1828
- 4) 三井幸彦ほか:日本眼科紀要. 1986;37(7):1115-1140
- 5) 田村修ほか:眼科臨床医報. 1986;80(6):1104-1116
- 6) 西野武志ほか:Chemotherapy. 1984;32(Supp. 1):62-82
- 7) 社内資料:オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」の生物学的同等性試験
- 8) 福田正道ほか:日本眼科紀要. 1986;37(5):823-828
- 9) 三井幸彦ほか:あたらしい眼科. 1993;10(1):83-86
- 10) 社内資料:オフロキサシン点眼液 0.3%「ニットー」の眼刺激性試験

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

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

本項の情報に関する注意:本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし

