

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

眼科用表面麻酔剤
オキシブプロカイン塩酸塩点眼液**オキシブプロカイン**塩酸塩点眼液0.4%「ニットー」
Oxybuprocaine Hydrochloride Ophthalmic Solution 0.4%「NITTO」

剤形	水性点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL中 日局 オキシブプロカイン塩酸塩 4mg含有
一般名	和名:オキシブプロカイン塩酸塩(JAN) 洋名:Oxybuprocaine Hydrochloride(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:2013年2月15日 薬価基準収載年月日:2013年6月21日 販売開始年月日:2013年6月21日
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元: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7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	11
1. 開発の経緯	1	9. 透析等による除去率	11
2. 製品の治療学的特性	1	10. 特定の背景を有する患者	11
3. 製品の製剤学的特性	1	11. その他	11
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	12
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	12
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	12
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	12
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	12
2. 一般名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	12
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	12
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	12
5. 化学名(命名法)又は本質	2	8. 副作用	13
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	13
III. 有効成分に関する項目	3	10. 過量投与	13
1. 物理化学的性質	3	11. 適用上の注意	13
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	13
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	14
IV. 製剤に関する項目	4	1. 薬理試験	14
1. 剤形	4	2. 毒性試験	14
2. 製剤の組成	4	X. 管理的事項に関する項目	15
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	1. 規制区分	15
4. 力価	4	2. 有効期間	15
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	3. 包装状態での貯法	15
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	15
7. 調製法及び溶解後の安定性	4	5. 患者向け資料	15
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	15
9. 溶出性	6	7. 国際誕生年月日	15
10. 容器・包装	6	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	15
11. 別途提供される資料類	6	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	15
12. その他	7	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	15
V. 治療に関する項目	8	11. 再審査期間	15
1. 効能又は効果	8	12. 投薬期間制限に関する情報	15
2. 効能又は効果に関連する注意	8	13. 各種コード	16
3. 用法及び用量	8	14. 保険給付上の注意	16
4. 用法及び用量に関連する注意	8	XI. 文献	17
5. 臨床成績	8	1. 引用文献	17
VI. 薬効薬理に関する項目	9	2. その他の参考文献	17
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	9	XII. 参考資料	18
2. 薬理作用	9	1. 主な外国での発売状況	18
VII. 薬物動態に関する項目	10	2. 海外における臨床支援情報	18
1. 血中濃度の推移	10	XIII. 備考	19
2. 薬物速度論的パラメータ	10	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	19
3. 母集団(ポピュレーション)解析	10	2. その他の関連資料	19
4. 吸収	10		
5. 分布	10		
6. 代謝	11		
7. 排泄	11		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液0.4%「ニットー」は局所表面麻酔剤であり、神経細胞膜のNa⁺チャンネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制し、知覚神経の求心性伝導を抑制する。本剤は後発医薬品として規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2013年2月に承認を取得し、2013年6月に発売に至った。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 眼科領域における表面麻酔剤として使用される。
- (2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーが報告されている(13頁参照)。

3. 製品の製剤学的特性

特になし

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料、 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料	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

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」

(2) 洋名

Oxybuprocaine Hydrochloride Ophthalmic Solution 0.4%「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)

オキシブプロカイン塩酸塩(JAN)

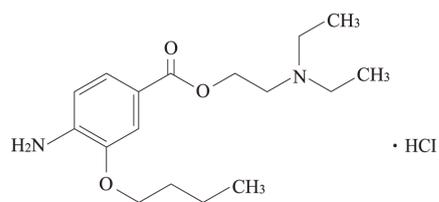
(2) 洋名(命名法)

Oxybuprocaine Hydrochloride(JAN)

(3) ステム

局所麻酔薬: -caine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: $C_{17}H_{28}N_2O_3 \cdot HCl$

分子量: 344.88

5. 化学名(命名法)又は本質

2-(Diethylamino)ethyl 4-amino-3-butyloxybenzoate monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

塩酸オキシブプロカイン、塩酸ベノキシネート

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

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。光によって徐々に着色する。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点:158~162℃

(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

pH:オキシブプロカイン塩酸塩 1.0g を水 10mL に溶かした液の pH は 5.0~6.0 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に着色する。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法:日局「オキシブプロカイン塩酸塩」による。

定量法:日局「オキシブプロカイン塩酸塩」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

無色～わずかに黄褐色澄明の無菌水性点眼剤

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH:4.0～5.0

浸透圧比:0.9～1.1

(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	オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」
有効成分	1mL 中 日局 オキシブプロカイン塩酸塩 4mg
添加剤	塩化ナトリウム、エデト酸ナトリウム水和物、ベンザルコニウム塩化物、ヒプロメロース、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

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「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 ラベル及び紙箱なし	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 ラベルあり、紙箱包装	変化なし ^{※1}

※1 試験項目:性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌、定量法

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)

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」において、併用または配合が予想される点眼剤との配合変化は以下であった²⁾。

【試験方法】

1)検体

試験検体:オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」

配合点眼剤:ミドリン P 点眼液、キシロカイン点眼液 4%、スコピズル眼科用液、フルオレサイト静注 500mg、PA・ヨード点眼・洗眼液、イソジン液 10%、フラビタン点眼液 0.05%、クラビット点眼液 0.5%、クラビット点眼液 1.5%、ベガモックス点眼液 0.5%、ガチフロ点眼液 0.3%、トスフロ点眼液 0.3%、タリビッド点眼液 0.3%、ジクロード点眼液 0.1%、ブロナック点眼液 0.1%、ネバナック懸濁性点眼液 0.1%、レボフロキサシン点眼液 0.5%「TOA」、オフロキシ点眼液 0.3%、ジクロフェナック点眼液 0.1%、FAD 点眼液 0.05%「ニットー」

2)測定ポイント及び試験項目

測定ポイント	試験項目
配合直後	外観、pH、浸透圧
15 分後	外観
30 分後	外観
1 時間後	外観、pH、浸透圧

3)試験方法

あらかじめ各点眼剤単独の外観、pH 及び浸透圧の測定を実施した。ただし、懸濁性点眼剤の場合は、顕微鏡写真を撮影した。

ガラス製小試験管に試験検体 2mL を分注し、配合点眼剤 2mL を加え、ミキサーで約 10 秒間混合し試料とした。配合直後及び室温で 15 分、30 分、1 時間静置後の外観を観察した。配合直後及び 1 時間後の試料については、pH 及び浸透圧の測定を実施した。(n=1)

また、懸濁性点眼剤及び外観変化がみられたものについては配合 1 時間後に直ちに顕微鏡写真を撮影した。

【試験結果】

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」における他剤との配合変化を確認するため、20 製剤について配合変化試験を実施した。その結果、ジクロード点眼液 0.1%は配合直後に白濁し、ブロナック点眼液 0.1%は配合直後に黄濁した。その他の配合点眼剤においては、本品との配合変化は認められなかった。

IV. 製剤に関する項目

No	配合点眼剤	外観					pH			浸透圧 (mOsm)			顕微鏡写真	備考
		配合前	配合直後	15分後	30分後	1時間後	配合前	配合直後	1時間後	配合前	配合直後	1時間後		
1	ミドリンP点眼液	無色澄明	—	—	—	—	5.58	5.59	5.60	268	283	286	NA	NA
2	キシロカイン点眼液 4%	無色澄明	—	—	—	—	6.43	6.30	6.30	296	303	305	NA	NA
3	スコピゾル眼科用液	無色澄明	—	—	—	—	7.43	7.59	7.59	438	380	375	NA	NA
4	フルオレサイト静注 500mg	黄赤色澄明	—	—	—	—	9.21	8.55	8.53	712	501	494	NA	NA
5	PA・ヨード点眼・洗眼液*	赤紫色澄明	—	—	—	—	5.15	4.58	4.17	239	267	268	澄明	NA
6	インジン液 10%	黒褐色澄明	—	—	—	—	4.60	4.47	4.29	224	262	259	澄明	NA
7	ブラビタン点眼液 0.05%	黄色澄明	—	—	—	—	5.89	5.76	5.76	280	291	292	NA	NA
8	クラビット点眼液 0.5%	微黄色澄明	—	—	—	—	6.54	6.39	6.42	305	300	300	NA	NA
9	クラビット点眼液 1.5%	微黄色澄明	—	—	—	—	6.57	6.51	6.51	283	289	291	NA	NA
10	ベガモックス点眼液 0.5%	淡黄色澄明	—	—	—	—	6.71	6.54	6.56	282	289	290	NA	NA
11	ガチフロ点眼液 0.3%	微黄色澄明	—	—	—	—	5.92	5.74	5.75	277	286	287	NA	NA
12	トスフロ点眼液 0.3%	無色澄明	—	—	—	—	5.19	4.03	4.04	287	293	294	NA	NA
13	タリビッド点眼液 0.3%	微黄色澄明	—	—	—	—	6.51	6.32	6.31	301	299	300	NA	NA
14	ジクロード点眼液 0.1%	無色澄明	+	+	+	+	7.35	7.51	7.51	321	319	325	球状	白濁
15	ブロナック点眼液 0.1%	黄色澄明	+	+	+	+	8.27	8.27	8.26	302	318	318	球状	黄濁
16	ネバナック懸濁性点眼液 0.1%	淡黄色混濁	—	—	—	—	7.28	7.23	7.23	297	302	304	球状	NA
17	レボフロキサシン点眼液 0.5%「TOA」	微黄色澄明	—	—	—	—	6.50	6.42	6.42	305	300	302	NA	NA
18	オフロキシ点眼液 0.3%	微黄色澄明	—	—	—	—	6.50	6.31	6.30	311	303	304	NA	NA
19	ジクロフェナック点眼液 0.1%	無色澄明	—	—	—	—	7.02	7.14	7.14	341	323	328	NA	NA
20	FAD点眼液 0.05%「ニットー」	黄色澄明	—	—	—	—	6.37	6.26	6.26	178	239	240	NA	NA

+ : 外観変化あり、— : 外観変化なし、NA : データなし

※PA・ヨード点眼・洗眼液について、添付文書の[用法・用量]の記載に従い、精製水で4倍に希釈して用いた。

配合相手製剤は、2013年4月時点の製品名および処方内容によるものであり、変更に留意すること。

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

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

該当しない

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

眼科領域における表面麻酔

2. 効能又は効果に関連する注意

5.効能又は効果に関連する注意

鎮痛のみの目的に使用しないこと。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

通常成人では1～4滴を点眼する。
なお、年齢、体質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

国内臨床試験

白内障囊外摘出術、虹彩切除術、切裂術、水晶体囊虹彩切開術等の諸種内眼手術施行例 22 例を対象に、局所麻酔剤として 0.4%オキシブプロカイン塩酸塩点眼液を 2 分おきに 6～7 滴点眼し、血管収縮剤として 1000 倍アドレナリン液を併用して内眼手術を行った結果、十分無痛に手術を行うことができた。

副作用は認められなかった³⁾。

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

プロカイン塩酸塩、テトラカイン塩酸塩等のアミノ安息香酸エステル系化合物

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

神経細胞膜の Na⁺チャネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制するという局所麻酔薬共通の作用により、知覚神経の求心性伝導を抑制する⁴⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1. 麻酔作用

1) 麻酔効果の発現及び持続時間

健康人 5 例 10 眼に 0.4% オキシブプロカイン塩酸塩点眼液を 1 滴点眼し、Frey の角膜知覚測定法に従い 3g/mm² の圧迫力をもつ毛髪で角膜中央部を圧迫したときの角膜知覚消失を基準として麻酔効果を判定した。その結果、0.4% オキシブプロカイン塩酸塩点眼液の麻酔効果発現時間は平均 16 秒、麻酔持続時間は平均 13 分 51 秒であった⁵⁾。

2) 表面麻酔強度

ウサギ角膜麻酔法においてオキシブプロカイン塩酸塩の表面麻酔強度はコカインの約 20 倍であった⁶⁾。

2. 生物学的同等性試験

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」とベノキシール点眼液 0.4%について麻酔効果を比較するため、ウサギの角膜刺激による瞬目反射を指標として試験を実施した。両製剤をウサギに点眼し、点眼直後から瞬目反射が消失するまでの時間（麻酔開始時間）及び瞬目反射が消失してから瞬目反射が回復するまでの時間（麻酔持続時間）を測定した。その結果、両製剤間で麻酔開始時間及び麻酔持続時間に統計学的な有意差は認められず、両製剤の生物学的同等性が確認された⁷⁾。

	麻酔開始時間 (秒)	麻酔持続時間 (分)
オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」	15 ± 8	52 ± 11
ベノキシール点眼液 0.4%	15 ± 5	52 ± 12

(平均値 ± 標準偏差、n=20)

(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

ウサギ摘出角膜を 1%オキシブプ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%オキシブプロカイン塩酸塩液に 3 分間浸した後、1 分、15 分及び 30 分放置してから角膜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 1 分値の約 1/3 の 7.39mg/100mL となり、30 分放置後では 4.24mg/100mL にまで低下した⁸⁾(*in vitro*)。

(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

ヒト血清にオキシプロカイン塩酸塩を加え 37°C 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⁹⁾(*in vitro*)。

(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

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

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

設定されていない

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、使用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

使用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

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

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)

悪心、顔面蒼白、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

	頻度不明
過敏症	過敏症状
眼	角膜びらん

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 薬剤投与時の注意

- ・角膜障害等の副作用をおこすことがあるので、頻回に使用しないこと。
- ・本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物はソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、ソフトコンタクトレンズを装着している場合には、点眼前にレンズを外し、点眼後少なくとも5～10分間の間隔をあけて再装着すること。
- ・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。
- ・鎮痛等を目的とした使用を防止するため、患者には渡さないこと。

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)

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」又はベノキシール点眼液 0.4%をウサギの右下眼瞼結膜嚢に、生理食塩液を左下眼瞼結膜嚢に 1 回 100 μ L をそれぞれ 2 分間隔で 6 回連続点眼し、最終点眼後 1、24、48、72 及び 96 時間に眼刺激性の判定を行った。その結果、オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」及びベノキシール点眼液 0.4%は Kay & Calandra の眼刺激評価基準において、「無刺激、クラス 0」に分類され、眼刺激性に差はみられなかった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: 該当しない
有効成分: オキシブプロカイン塩酸塩 劇薬

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

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド: 無
くすりのしおり: 無
その他の患者向け資材: 無

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬: ベノキシール点眼液 0.4%、ネオベノール点眼液 0.4%、ラクリミン点眼液 0.05%
同 効 薬: リドカイン塩酸塩

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

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
オキシブプロカイン 塩酸塩点眼液 0.4% 「ニットー」	2013 年 2 月 15 日	22500AMX00032000	2013 年 6 月 21 日	2013 年 6 月 21 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、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。

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
オキシブプロカイン 塩酸塩点眼液 0.4% 「ニットー」	1313700Q2097	1313700Q2097	122095701	622209501

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に該当しない。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 社内資料:オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」の安定性試験
- 2) 社内資料:オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」の配合変化試験
- 3) 亀井俊郎:日本眼科学会雑誌. 1964;68:151-153
- 4) 第十八改正日本薬局方解説書:廣川書店. 2021:C1222-1223
- 5) 岡村治彦:日本眼科学会雑誌. 1962;66:557-562
- 6) Büchi,J.et al.:Helv.Chim.Acta.1951;34:1002-1013
- 7) 社内資料:オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「ニットー」の生物学的同等性試験
- 8) Schlegel,H.E.et al.:Arch.Ophthalmol.1954;51:663-670
- 9) Iselin,H.et al.:Schweiz.med.Wschr.1966;96:219-222
- 10) 社内資料:オキシブプロカイン塩酸塩点眼液 0.4%「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

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

