

# 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<br>オフロキサシン点眼液        |
| 処方箋医薬品                        |
| <b>オフロキサシン</b> 点眼液0.3%「日点」    |
| Ofloxacin Ophthalmic Solution |

|                                 |                                                                                                                                                              |
|---------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 剤形                              | 水性点眼剤                                                                                                                                                        |
| 製剤の規制区分                         | 処方箋医薬品<br>(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                                                                                                                                         |
| 一般名                             | 和名：オフロキサシン (JAN)<br>洋名：Ofloxacin (JAN)                                                                                                                       |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載<br>・販売開始年月日 | 製造販売承認年月日：2018 年 7 月 9 日 (販売名変更による)<br>薬価基準収載年月日：2018 年 12 月 14 日 (販売名変更による)<br>販売開始年月日：2001 年 8 月 31 日                                                      |
| 製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名           | 販売元：ロートニッテン株式会社<br>製造販売元：大興製薬株式会社                                                                                                                            |
| 医薬情報担当者の連絡先                     |                                                                                                                                                              |
| 問い合わせ窓口                         | ロートニッテン株式会社 医薬情報問合せ窓口<br>TEL 0120(691)910 FAX 052(823)9115<br>医療関係者向けホームページ<br><a href="https://www.rohto-nitten.co.jp/">https://www.rohto-nitten.co.jp/</a> |

本 IF は 2026 年 4 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂しました。

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 －

### 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「X II. 参考資料」、「X III. 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 を活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。

(2020 年 4 月改訂)

## 目 次

### I. 概要に関する項目

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 ..... 1

### II. 名称に関する項目

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

### III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 ..... 3
2. 有効成分の各種条件下  
における安定性 ..... 3
3. 有効成分の確認試験法、定量法 ..... 3

### IV. 製剤に関する項目

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

### V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 ..... 6
2. 効能又は効果に関連する注意 ..... 6
3. 用法及び用量 ..... 6
4. 用法及び用量に関連する注意 ..... 6
5. 臨床成績 ..... 6

### 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 ..... 11
2. 薬理作用 ..... 11

### VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移 ..... 13
2. 薬物速度論的パラメータ ..... 13
3. 母集団（ポピュレーション）解析 .. 13
4. 吸収 ..... 13
5. 分布 ..... 13
6. 代謝 ..... 14
7. 排泄 ..... 14
8. トランスポーターに関する  
情報 ..... 15
9. 透析等による除去率 ..... 15
10. 特定の背景を有する患者 ..... 15
11. その他 ..... 15

### 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 ..... 16
2. 禁忌内容とその理由 ..... 16
3. 効能又は効果に関連する  
注意とその理由 ..... 16
4. 用法及び用量に関連する  
注意とその理由 ..... 16
5. 重要な基本的注意とその理由 ..... 16
6. 特定の背景を有する患者に関する  
注意 ..... 16
7. 相互作用 ..... 17
8. 副作用 ..... 17
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 ..... 17
10. 過量投与 ..... 17
11. 適用上の注意 ..... 17
12. その他の注意 ..... 18

## IX. 非臨床試験に関する項目

- 1. 薬理試験 ..... 19
- 2. 毒性試験 ..... 19

## X. 管理的事項に関する項目

- 1. 規制区分 ..... 20
- 2. 有効期間 ..... 20
- 3. 包装状態での貯法 ..... 20
- 4. 取扱い上の注意 ..... 20
- 5. 患者向け資材 ..... 20
- 6. 同一成分・同効薬 ..... 20
- 7. 国際誕生年月日 ..... 20
- 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 ..... 20
- 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 ..... 20

- 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び  
その内容 ..... 21
- 11. 再審査期間 ..... 21
- 12. 投薬期間制限に関する情報 ..... 21
- 13. 各種コード ..... 21
- 14. 保険給付上の注意 ..... 21

## X I. 文献

- 1. 引用文献 ..... 22
- 2. その他の参考文献 ..... 22

## X II. 参考資料

- 1. 主な外国での発売状況 ..... 23
- 2. 海外における臨床支援情報 ..... 23

## X III. 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 ..... 24
- 2. その他の関連資料 ..... 24

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

オフロキサシンはニューキノロン系合成抗菌薬である。  
本剤はオフロキサシンを有効成分とする広範囲抗菌点眼剤である。  
マロメール点眼液0.3%の販売名で規格及び試験方法を設定し、生物学的同等性試験（薬力学的試験）、加速試験を行い、後発医薬品として2001年3月に承認を取得、2001年8月に販売開始した。  
また、2018年7月にオフロキサシン点眼液0.3%「日点」の販売名で再承認を取得し、2018年12月に薬価収載となった。

### 2. 製品の治療学的特性

#### (1) 有効性

ニューキノロン系合成抗菌薬であり、グラム陽性菌やグラム陰性菌に対して、広い抗菌スペクトルを示す。

#### (2) 安全性

オフロキサシン点眼液の重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーが報告されている。

### 3. 製品の製剤学的特性

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、<br>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

### 1. 販売名

#### (1) 和名

オフロキサシン点眼液 0.3% 「日点」

#### (2) 洋名

Ofloxacin Ophthalmic Solution

#### (3) 名称の由来

特になし

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

オフロキサシン (JAN)

#### (2) 洋名 (命名法)

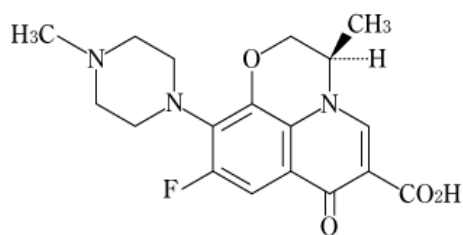
Ofloxacin (JAN)

#### (3) ステム

ナリジクス酸系抗菌薬: -oxacin

### 3. 構造式又は示性式

構造式



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*R*S)-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<sup>1)</sup>

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<sup>1)</sup>

| 溶 媒         | 日本薬局方の表現 |
|-------------|----------|
| 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<sup>2)</sup>

吸湿性なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点<sup>1)</sup>

融点：約 265℃（分解）

##### (5) 酸塩基解離定数<sup>2)</sup>

$pK_{a1}=5.74\pm0.03$ （カルボキシル基）、

$pK_{a2}=7.90\pm0.05$ （ピペラジンの4位の窒素）（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<sup>1)</sup>

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<sup>1)</sup>。

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### (1) 確認試験法

日局「オフロキサシン」による

##### (2) 定量法

日局「オフロキサシン」による



#### 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 : 6.5 ～ 7.5  
浸透圧比 : 0.95 ～ 1.15
- (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  
有効成分の含量 : 1mL 中 オフロキサシンを 3mg 含有  
添加剤 : 塩化カリウム、塩化カルシウム水和物、  
塩化ナトリウム、ホウ酸、ホウ砂
- (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

加速試験<sup>3)</sup>

試験条件：5mL プラスチック製点眼容器（青色）、40℃、75%RH

3 ロット、n=3 で試験を実施

|                     | 開始時        | 1 ヶ月後      | 3 ヶ月後      | 6 ヶ月後       |
|---------------------|------------|------------|------------|-------------|
| 性状<br>(微黄色～淡黄色澄明の液) | 微黄色澄明の液    | 微黄色澄明の液    | 微黄色澄明の液    | 微黄色澄明の液     |
| pH<br>(6.5～7.5)     | 6.9        | 6.9～7.0    | 6.9～7.0    | 6.9         |
| 浸透圧比<br>(0.95～1.15) | 1.07       | －          | －          | 1.12～1.13   |
| 含量(%)※              | 98.8～100.3 | 98.6～101.5 | 99.8～100.3 | 100.1～100.9 |

※表示量に対する割合

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

|          | 容器     | 中栓     | キャップ   |
|----------|--------|--------|--------|
| プラスチック容器 | ポリエチレン | ポリエチレン | ポリエチレン |

11. 別途提供される資材類

投薬袋

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、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）、シェードモナス属、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、涙囊炎、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

該当しない

#### （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、涙囊炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）〉

〔国内第Ⅱ相試験〕<sup>4)</sup>

外眼部細菌感染症患者286例を対象に、0.3%オフロキサシン点眼液、0.5%オフロキサシン点眼液（1回2滴、1日4回）<sup>注1)</sup>又は0.3%ミクロノ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%マイクロノ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%マイクロノ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。

※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・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)    |
| 涙囊炎  | 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)    |
| マイクロコッカス属                     | 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<br>（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

〔国内第Ⅲ相試験①〕<sup>5)</sup>

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）<sup>注2)</sup>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。

※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・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)    |
| 涙囊炎  | 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<br>（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

〔国内第Ⅲ相試験②〕<sup>6)</sup>

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%ミクロノ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%ミクロノ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。

※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〉

〔国内一般臨床試験〕<sup>7)</sup>

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<sup>注3)</sup>、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。

注3) 本剤が承認されている用法・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

キノロン系抗菌薬

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：眼組織

作用機序：主な作用機序は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<sup>8,9)</sup>。抗菌作用は殺菌的でMIC濃度で溶菌が認められた<sup>10)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

[抗菌作用]<sup>4, 6, 10)</sup>

オフロキサシンの抗菌スペクトラムは広範囲に及び、0.3%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、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（*in vitro*）。

[生物学的同等性試験]

ウサギ実験的細菌性角膜感染症に対する治療効果<sup>11)</sup>

角膜表層に創を作製し、菌液を接種したウサギ眼球に各被験薬剤をそれぞれ50  $\mu$ L、2時間ごとに1日6回、3日間点眼し、角膜の混濁を感染の指標として、8日間経過を観察して治療効果を調べた。また、角膜表層に滅菌綿棒を接触させ、それを培養してコロニー面積を計測した。菌株は緑膿菌（IID strain No. 1210）を用いた。

各群の各測定時点における角膜所見及びコロニー面積を表に示した。

オフロキサシン点眼液0.3%「日点」（以下、本剤）およびタリビッド点眼液0.3%は対照との間に有意な治療効果を認め、本剤とタリビッド点眼液0.3%の間に有意差は認められず、生物学的同等性が認められた。（Tukeyの多重比較）



表 1：ウサギ緑膿菌角膜感染症における角膜所見（順位変換値）

|                   | 菌接種後経過日数 |      |      |      |      |      |      |      |
|-------------------|----------|------|------|------|------|------|------|------|
|                   | 0        | 1    | 2    | 3    | 4    | 5    | 6    | 7    |
| 本剤                | 16.5     | 15.0 | 9.9  | 9.9  | 11.0 | 10.5 | 9.8  | 9.5  |
| タリビッド<br>点眼液 0.3% | 16.5     | 15.2 | 11.2 | 11.2 | 10.1 | 10.5 | 11.2 | 11.6 |
| 対照                | 13.5     | 16.4 | 25.5 | 25.5 | 25.5 | 25.5 | 25.5 | 25.5 |

表 2：ウサギ緑膿菌角膜感染症におけるコロニー面積（cm<sup>2</sup>）

|                  | 菌接種後経過日数 |      |      |      |
|------------------|----------|------|------|------|
|                  | 0        | 2    | 4    | 7    |
| 本剤               | 11.82    | 0.01 | 0.02 | 0.26 |
| タリビッド<br>点眼液0.3% | 11.43    | 0.01 | 0.03 | 0.23 |
| 対照               | 10.28    | 6.87 | 6.30 | 6.75 |

（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<sup>2)</sup>

健康成人男性（4例）の両眼に0.3%オフロキサシン点眼液を1回1滴30分毎16回又は15分毎32回点眼したとき、最終点眼後30分の血中濃度はそれぞれ0.019  $\mu\text{g/mL}$ 、0.034  $\mu\text{g/mL}$ を示し、その後徐々に減少した。

#### (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（ $1.20 \mu\text{g/mL}$ ）を示した<sup>12)</sup>。
- ・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 $3.32 \mu\text{g/g}$ 、 $1.62 \mu\text{g/g}$ 、 $2.62 \mu\text{g/g}$ 、 $0.95 \mu\text{g/g}$ であった。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<sup>12)</sup>。
- ・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<sup>12)</sup>。
- ・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とき、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。メラニンを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<sup>13)</sup>。

(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

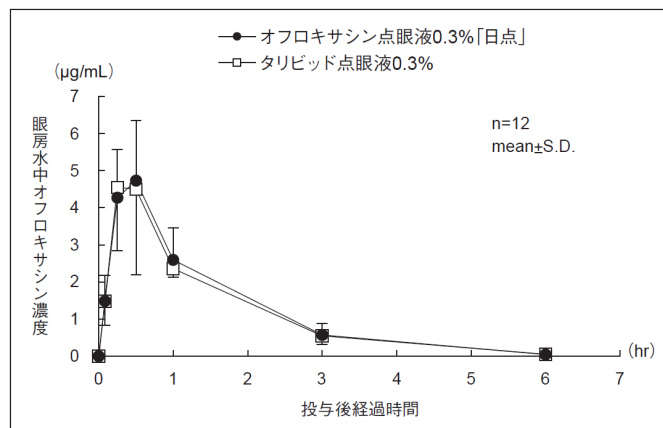
10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

〔生物学的同等性試験〕<sup>14)</sup>

オフロキサシン点眼液 0.3%「日点」とタリビッド点眼液 0.3%を、それぞれ 50  $\mu$ L (オフロキサシンとして、0.15mg) ウサギの眼結膜嚢内に点眼して眼房水中オフロキサシン濃度を測定したところ、各測定時点の濃度に有意差は認められなかったことから両剤の生物学的同等性が確認された (t 検定)。



## 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          | <div style="border: 1px solid red; padding: 5px;"> <p>2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）</p> <p>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</p> </div>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| 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      | <div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>8. 重要な基本的注意</p> <p>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。</p> <p>8.2 長期間使用しないこと。</p> </div>                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
| 6. 特定の背景を有する患者に関する注意  | <p>（1）合併症・既往歴等のある患者<br/>設定されていない</p> <p>（2）腎機能障害患者<br/>設定されていない</p> <p>（3）肝機能障害患者<br/>設定されていない</p> <p>（4）生殖能を有する者<br/>設定されていない</p> <p>（5）妊婦</p> <div style="border: 1px solid black; padding: 5px; margin-top: 5px;"> <p>9.5 妊婦</p> <p>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。</p> </div> <p>（6）授乳婦</p> <div style="border: 1px solid black; padding: 5px; margin-top: 5px;"> <p>9.6 授乳婦</p> <p>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。</p> </div> <p>（7）小児等<br/>設定されていない</p> |

<

## 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<sup>15)</sup>

白色家兎の結膜嚢内にオフロキサシン点眼液0.3%「日点」0.1mLを1回点眼したところ、眼粘膜に対して刺激性は認められなかった。

#### (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<br>注意－医師等の処方箋により使用すること<br>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                                   | <div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <b>20. 取扱い上の注意</b><br/>           外箱開封後は、遮光して保存すること。         </div>                                                                                          |
| 5. 患者向け資材                                    | 患者向医薬品ガイド：無<br>くすりのしおり：有<br>その他の患者向け資材：無                                                                                                                                                                          |
| 6. 同一成分・同効薬                                  | 同一成分：タリビッド点眼液0.3%（参天製薬）<br>同 効 薬：ガチフロキサシン、トスフロキサシン、ノルフロキサシン、<br>モキシフロキサシン、レボフロキサシン、ロメフロキサシ<br>ン（塩、水和物は省略）                                                                                                         |
| 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<br>承認番号、薬価基準収載<br>年月日、販売開始年月日 | 製造販売承認年月日：2018 年 7 月 9 日（販売名変更による）<br>承認番号：23000AMX00533000<br>薬価基準収載年月日：2018 年 12 月 14 日（販売名変更による）<br>販 売 開 始 年 月：2001 年 8 月 31 日<br>[注] 旧販売名：マロメール点眼液 0.3%<br>承認年月日：2001 年 3 月 15 日<br>経過措置期間終了：2019 年 9 月 30 日 |
| 9. 効能又は効果追加、用法<br>及び用量変更追加等の<br>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

2004 年 9 月 30 日（抗菌薬再評価結果通知）

| 変更後                                                                                                                                                                                                                                                                                               | 変更前                                                                                                                                                                                                                                                           |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>〈適応菌種〉</p> <p>本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌属、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）、シュードモナス属、緑膿菌、バークホルデリア・セバシア、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</p> <p>〈適応症〉</p> <p>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> | <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</p> <p>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> |

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名：オフロキサシン点眼液 0.3%「日点」

| 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | 個別医薬品コード<br>(YJ コード) | HOT(9 桁)<br>番号 | レセプト電算処理<br>システム用コード |
|-----------------------|----------------------|----------------|----------------------|
| 1319722Q1015          | 1319722Q1279         | 113972301      | 621397201            |

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品に該当しない。

## X I . 文 献

### 1. 引用文献

- 1) 第十八改正日本薬局方解説書, 2021 (廣川書店)
- 2) 日本薬局方医薬品情報 (JPDI) 2021 (じほう)
- 3) 大興製薬株式会社 社内資料〔安定性試験〕
- 4) 三井幸彦 他: 眼科臨床医報. 1985 ; 79 : 1718-1736
- 5) 三井幸彦 他: 眼科臨床医報. 1986 ; 80 : 1813-1828
- 6) 三井幸彦 他: 日本眼科紀要. 1986 ; 37 : 1115-1140
- 7) 田村修 他: 眼科臨床医報. 1986 ; 80 : 1104-1116
- 8) Kato J, et al. : Cell. 1990 ; 63 : 393-404
- 9) Blanche F, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1996 ; 40 : 2714-2720
- 10) 西野武志 他: Chemotherapy. 1984 ; 32 (Supp. 1) : 62-82
- 11) 大興製薬株式会社 社内資料〔生物学的同等性試験Ⅱ〕
- 12) 福田正道 他: 日本眼科紀要. 1986 ; 37 : 823-828
- 13) 三井幸彦 他: あたらしい眼科. 1993 ; 10 : 83-86
- 14) 大興製薬株式会社 社内資料〔生物学的同等性試験Ⅰ〕
- 15) 大興製薬株式会社 社内資料〔眼刺激性試験〕

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 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

該当しない

### 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) 粉碎  
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

N00405