

広範囲抗菌点眼剤

オーハラキシ点眼液0.3%

OHARAXIN[®]OPHTHALMIC SOLUTION 0.3%

処方せん医薬品^{注)}

(オフロキサシン点眼液)

承認番号	21300AMZ00289000
薬価収載年月	2001年7月
販売開始年月	2001年10月
再評価結果年月	2004年9月

貯法	室温保存、気密容器
使用期限	外箱及びラベルに表示(3年)

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

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

*【組成・性状】

販売名	オーハラキシ点眼液0.3%
有効成分の名称	日局オフロキサシン
1mL中含量	3mg
添加物	塩化ナトリウム、塩酸、水酸化ナトリウム、精製水
pH	6.0~7.0
浸透圧比	0.95~1.15
色調・性状	微黄色~淡黄色澄明、無菌水性点眼剤
識別コード	OH-300

【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)、シユードモナス属、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

〈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

【用法及び用量】

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。

〈用法及び用量に関連する使用上の注意〉

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。
2. 長期間使用しないこと。

【使用上の注意】

1. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

ショック、アナフィラキシー様症状：ショック、アナフィラキシー様症状を起こすことがあるので、観察を十分に行い、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

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。

種類	副作用の頻度
	頻度不明
過敏症	眼瞼炎(眼瞼発赤・浮腫等)、眼瞼皮膚炎、痒痒感、発疹、蕁麻疹
眼	刺激感、びまん性表層角膜炎等の角膜障害、結膜炎(結膜充血・浮腫等)

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にのみ投与すること。[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

点眼用により使用すること。

(2) 投与時

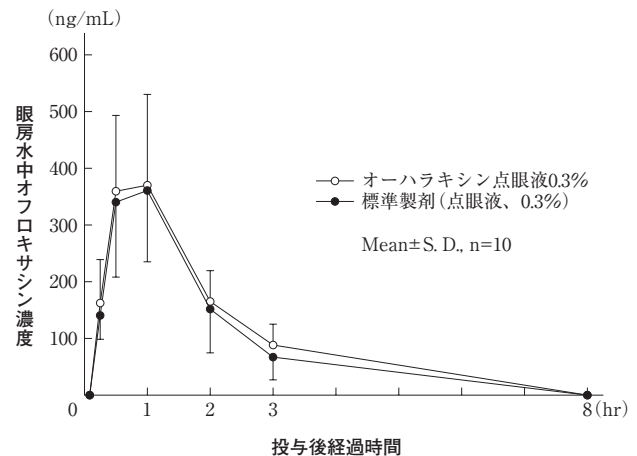
薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意するよう指導すること。

*【薬物動態】

(参考)

動物における眼組織内移行

オーハラキシ点眼液0.3%と対照となるオフロキサシン点眼液を、それぞれ50 μ 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、得られた眼房水中オフロキサシン濃度について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。



オーハラキシ点眼液0.3%点眼後のウサギ眼房水中オフロキサシン濃度

*【薬効薬理】

1. 作用機序

オフロキサシンは細菌のDNA合成に関与するDNA-gyraseのスーパーコイル活性を阻害することにより、細菌のDNA合成を特異的に阻害し、殺菌作用を示すと考えられている²⁾。

2. 抗菌作用

オフロキサシンは幅広い抗菌スペクトルを示し、好気性のグラム陽性菌・陰性菌のみならず一部の偏性嫌気性菌、さらには*Legionella*, *Mycoplasma*, *Chlamydia*に対しても優れた抗菌力を示す。また、本剤と近縁の抗菌剤であるNalidixic acid, Pipemidic acid, Norfloxacinとの抗菌作用を比較すると、比較薬剤のいずれよりも、強い抗菌力を示す。眼感染症からの臨床分離株に対する本剤の抗菌力は、全菌種において強い活性を示し、現在、抗生物質点眼剤の領域ではアミノ配糖体系抗生物質が主流であるが、このアミノ配糖体系（ミクロノマイシン、ジベカシン、トブラシン）やβ-ラクタム系（スルベニシリン）抗生物質より優れた抗菌力を示すとともに、これらの抗生物質に対して耐性を示すブドウ球菌属に対しても有効である。また、本剤に対する自然耐性菌の出現頻度は低く、自然突然変異株の出現頻度とほぼ同程度である²⁾。

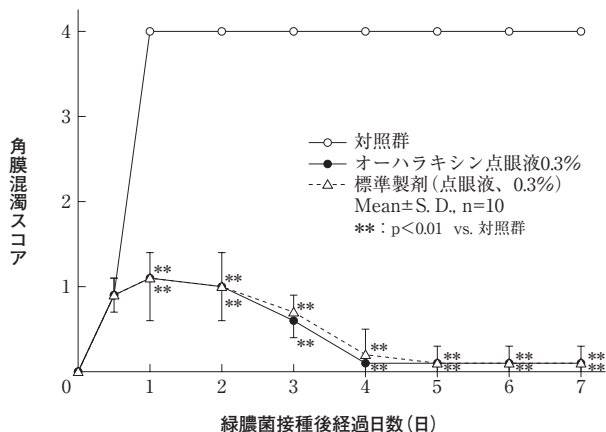
緑膿菌角膜感染症に対する治療効果

ウサギの眼球角膜表面に円形の創を作成し、角膜を混濁させる量の緑膿菌を接種した。菌接種6時間後よりオーハラキシン点眼液0.3%と対照となるオフロキサシン点眼液の50μL（オフロキサシン0.15mg）を2時間ごとに1日6回、3日間点眼して、角膜混濁度を対照群（基剤点眼）と比較した²⁾。

（治療効果）

1. 角膜の混濁に対して、両点眼液は有意な抑制作用を示し、両薬剤とも緑膿菌角膜感染症に優れた治療効果を示し、また両薬剤間で効力に差は見られなかった。
2. 両点眼液は接種した緑膿菌を有意に減少し、優れた抗菌効果を認め、両薬剤間で効力に差は見られなかった。

ウサギ緑膿菌角膜感染症に対する治療効果



角膜混濁のスコア

- 0：角膜混濁がない。
- 0.5：角膜混濁がない軽度の浮腫。
- 1：角膜混濁が直径6mmより小さい。
- 2：角膜混濁が直径6mmに及ぶ。
- 3：角膜混濁が直径6mmより大きい。
- 4：角膜混濁が角膜全体に及ぶ。

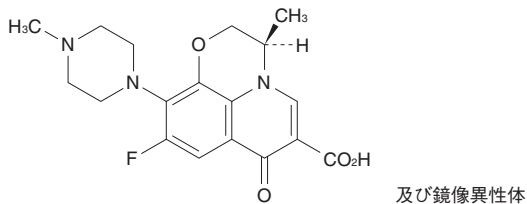
*【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オフロキサシン [Ofloxacin (JAN, INN)]

略号：OFLX

化学名：(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

構造式：



分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄

分子量：361.37

性状：本品は帯微黄白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。本品は酢酸（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。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。本品は光によって変色する。融点：約265℃（分解）

*【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、オーハラキシン点眼液0.3%は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された²⁾。

【包装】

プラスチック点眼容器 5mL×10本

**【主要文献】

- 1) 大原薬品工業株式会社 社内資料：眼組織内移行動態試験(1999年)
- 2) メディカルレビュー社：時の新薬、7巻、p.25(1987)
- 3) 大原薬品工業株式会社 社内資料：実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果(1999年)
- 4) 大原薬品工業株式会社 社内資料：安定性試験(2000年)

**【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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下さい。

日本アルコン株式会社 メディカル統括部 学術情報部

〒107-0052 東京都港区赤坂2-17-7

電話 03-3588-3221

FAX 03-3588-3229

受付時間 9:00～17:30（土、日、祝日、社休日を除く）

販売元
Alcon 日本アルコン株式会社
JAPAN 東京都港区赤坂2-17-7

製造販売元
大原薬品工業株式会社
滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121-15