

## 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(1998年9月)に準拠して作成

### 広範囲抗菌点眼剤

処方せん医薬品(注意-医師等の処方せんにより使用すること)

# タリビッド®点眼液0.3%

## Tarivid® ophthalmic solution 0.3%

オフロキサシン点眼液

処方せん医薬品(注意-医師等の処方せんにより使用すること)

# タリビッド®眼軟膏0.3%

## Tarivid® ophthalmic ointment 0.3%

オフロキサシン眼軟膏

剤形	点眼剤
規格・含量	タリビッド点眼液0.3%:1mL中オフロキサシン3mg含有 タリビッド眼軟膏0.3%:1g中オフロキサシン3mg含有
一般名	和名:オフロキサシン(JAN) 洋名:Ofloxacin(JAN)
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造承認年月日:2006年7月21日 薬価基準収載年月日:2006年12月8日 発売年月日:1987年9月3日
開発・製造・輸入・ 発売・提携・販売会社名	製造販売元:参天製薬株式会社 提携:第一三共株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

本IFは2006年12月改訂(タリビッド点眼液0.3%)、2006年12月改訂(タリビッド眼軟膏0.3%)の添付文書の記載に基づき作成した。

## IF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

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとIF記載要領が策定された。

### 2. IFとは

IFは「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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薬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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。

### 3. IFの様式・作成・発行

規格はA4判、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IFは日病薬が策定した「IF記載要領」に従って記載するが、本IF記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはIFが改訂・発行される。

### 4. IFの利用にあたって

IF策定の原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてIFの内容を充実させ、IFの利用性を高めておく必要がある。

MRへのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段にIF作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b>		<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	
1.開発の経緯 -----	1	1.血中濃度の推移・測定法 -----	18
2.製品の特徴及び有用性 -----	1	2.薬物速度論的パラメータ -----	18
<b>II. 名称に関する項目</b>		3.吸収 -----	19
1.販売名 -----	2	4.分布 -----	19
2.一般名 -----	2	5.代謝 -----	22
3.構造式又は示性式 -----	2	6.排泄 -----	23
4.分子式及び分子量 -----	2	7.透析等による除去率 -----	23
5.化学名（命名法） -----	2	<b>VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	
6.慣用名、別名、略号、記号番号 -----	2	1.警告内容とその理由 -----	24
7.CAS 登録番号 -----	2	2.禁忌内容とその理由 -----	24
<b>III. 有効成分に関する項目</b>		3.効能・効果に関連する使用上の注意と その理由 -----	24
1.有効成分の規制区分 -----	3	4.用法・用量に関連する使用上の注意と その理由 -----	24
2.物理化学的性質 -----	3	5.慎重投与内容とその理由 -----	25
3.有効成分の各種条件下における 安定性 -----	4	6.重要な基本的注意とその理由及び 処置方法 -----	25
4.有効成分の確認試験法 -----	4	7.相互作用 -----	25
5.有効成分の定量法 -----	4	8.副作用 -----	25
<b>IV. 製剤に関する項目</b>		9.高齢者への投与 -----	29
1.剤形 -----	5	10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与 -----	29
2.製剤の組成 -----	5	11.小児等への投与 -----	29
3.製剤の各種条件下における安定性 -----	5	12.臨床検査結果に及ぼす影響 -----	30
4.混入する可能性のある夾雑物 -----	5	13.過量投与 -----	30
5.製剤中の有効成分の確認試験法 -----	6	14.適用上及び薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等) -----	30
6.製剤中の有効成分の定量法 -----	6	15.その他の注意 -----	30
7.容器の材質 -----	6	16.その他 -----	30
8.刺激性 -----	6	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	
9.その他 -----	6	1.一般薬理 -----	31
<b>V. 治療に関する項目</b>		2.毒性 -----	31
1.効能又は効果 -----	7	<b>X. 取扱い上の注意等に関する項目</b>	
2.用法及び用量 -----	7	1.有効期間又は使用期限 -----	34
3.臨床成績 -----	8	2.貯法・保存条件 -----	34
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>		3.薬剤取扱い上の注意点 -----	34
1.薬理的に関連ある化合物又は 化合物群 -----	13	4.承認条件 -----	34
2.薬理作用 -----	13	5.包装 -----	34
		6.同一成分・同効薬 -----	34

7.国際誕生年月日 -----	34
8.製造・輸入承認年月日及び承認番号 -----	34
9.薬価基準収載年月日 -----	34
10.効能・効果追加、用法・用量変更追加等 の年月日及びその内容 -----	34
11.再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容 -----	34
12.再審査期間 -----	35
13.長期投与の可否 -----	35
14.厚生労働省薬価基準収載医薬品コード----	36
15.保険給付上の注意-----	36

## X I . 文献

1.引用文献-----	37
2.その他の参考文献-----	38

## X II . 参考資料

1.主な外国での発売状況-----	39
-------------------	----

## X III . 備考

1.その他の関連資料-----	40
-----------------	----

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

オフロキサシン（OFLX）は第一製薬株式会社（現：第一三共株式会社）において新規に合成された、母核にオキサジン環を有することを特徴とする三環性のニューキノロン系抗菌薬である。広い抗菌スペクトルと強い抗菌活性を示す薬剤であることが認められている。

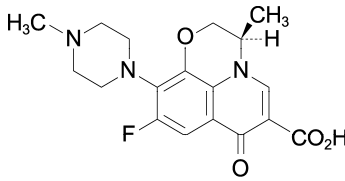
本剤は1987年6月に承認され、その後、眼軟膏の効能効果に有効菌種としてクラミジア・トラコマティスが、適応症としてトラコーマが追加された。6年間の再審査期間を経て、1994年12月再審査結果通知を受け、再審査を終了した。2004年9月抗菌薬再評価結果通知により、効能・効果の改訂が行われた。

2006年12月、タリビッド点眼液、タリビッド眼軟膏は「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について（平成16年6月2日付薬食発第0602009号）」に基づき、それぞれ販売名をタリビッド点眼液0.3%、タリビッド眼軟膏0.3%に変更した。

### 2. 製品の特徴及び有用性

特になし

## Ⅱ．名称に関する項目

1. 販売名	<p>(1) 和名：タリビッド<sup>®</sup>点眼液 0.3% タリビッド<sup>®</sup>眼軟膏 0.3%</p> <p>(2) 洋名：Tarivid<sup>®</sup> ophthalmic solution 0.3% Tarivid<sup>®</sup> ophthalmic ointment 0.3%</p> <p>(3) 名称の由来：Target（標的）の <u>Tar</u> と Vivid（躍動的、きびきびしたの意）の <u>ivid</u> から Tarivid とし、力強く標的臓器に達する薬剤を表現した。</p>
2. 一般名	<p>(1) 和名（命名法）：オフロキサシン（JAN）</p> <p>(2) 洋名（命名法）：Ofloxacin（JAN、INN、USAN）</p>
3. 構造式又は示性式	 <p style="text-align: right;">及び鏡像異性体</p>
4. 分子式及び分子量	<p>分子式：C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub></p> <p>分子量：361.37</p>
5. 化学名（命名法）	<p>(3<i>RS</i>)-9-Fluoro-3-methyl-10-(4-methylpiperazin-1-yl)-7-oxo-2,3-dihydro-7<i>H</i>-pyrido[1,2,3-<i>de</i>][1,4]benzooxazine-6-carboxylic acid</p> <p style="text-align: right;">（IUPAC による）</p>
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	<p>OFLX（日本化学療法学会制定の抗微生物薬略号）</p> <p>DE-055（治験番号）</p>
7. CAS登録番号	82419-36-1

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 有効成分の規制区分

該当しない

#### 2. 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

##### 1) 各種溶媒における溶解度<sup>1)</sup>

溶媒	本品 1g を溶解するの に要する溶媒量 (mL)	日局の溶解性表現
酢酸(100)	5.0	溶けやすい
クロロホルム	$4.5 \times 10$	やや溶けにくい
水	$5.0 \times 10^2$	溶けにくい
アセトン	$6.3 \times 10^2$	溶けにくい
メタノール	$7.1 \times 10^2$	溶けにくい
エタノール	$8.3 \times 10^2$	溶けにくい
無水エタノール	$1.7 \times 10^3$	極めて溶けにくい
酢酸エチル	$2.0 \times 10^3$	極めて溶けにくい
ベンゼン	$5.3 \times 10^3$	極めて溶けにくい

測定温度：20℃

##### 2) 各種 pH の水溶液に対する溶解度<sup>2)</sup>

pH	溶解度 (mg/mL)
5	$117 \pm 1.35$
7	$3.23 \pm 0.03$
9	$22.6 \pm 0.46$

測定温度：25℃、mean±S.D.

##### (3) 吸湿性<sup>1)</sup>

吸湿性はない。

##### (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<sup>1)</sup>

pKa<sub>1</sub>：5.74±0.03（カルボキシル基）

pKa<sub>2</sub>：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

クロロホルム-0.1mol/L リン酸緩衝液（pH7.4）：4.95

n-オクタノール-0.1mol/L リン酸緩衝液（pH7.0）：0.33

(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。  
本品は光によって変色する。

紫外吸収スペクトル<sup>1)</sup>

溶媒	吸収極大波長 nm(ε)
メタノール	228(1.7×10 <sup>4</sup> ), 298.5(3.7×10 <sup>4</sup> ), 326 <sup>sh</sup> (1.3×10 <sup>4</sup> )
0.1mol/L 塩酸	226.5(1.9×10 <sup>4</sup> ), 294(3.3×10 <sup>4</sup> ), 327(1.2×10 <sup>4</sup> )
0.1mol/L 水酸化ナトリウム	230(1.7×10 <sup>4</sup> ), 288.5(2.7×10 <sup>4</sup> ), 332(1.2×10 <sup>4</sup> )

sh : shoulder

3. 有効成分の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果	
長期保存試験	25℃、75%RH	24 ヶ月	無色透明ガラス瓶 密栓	変化なし	
	室温	36 ヶ月			
加速試験	40℃、75%RH	6 ヶ月	ポリエチレン袋	変化なし	
苛酷試験	粉末状態	50℃	2 ヶ月	無色透明ガラス瓶 密栓	変化なし
		25℃、75%RH	30 日	シャーレ、開放	変化なし
		30℃、92%RH	2 ヶ月	ポリエチレン袋	変化なし
		室内散光 (500 lx) 室温	6 ヶ月	無色透明瓶 密栓	表面が帯赤色に着色
				褐色瓶 密栓	変化なし
		日照灯 (2500 lx) 室温	10 日	シャーレ、開放	表面が帯赤色に着色
	水溶液 状態 1mg/mL	40℃	30 日	無色アンプル	変化なし
室内散光 (500 lx) 室温		30 日	無色アンプル	わずかに黄色に着色し、含量 低下、光分解物が認められた。	

4. 有効成分の確認試験法

日局「オフロキサシン」による

5. 有効成分の定量法

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) 投与経路

点眼

#### (2) 剤形の区別、規格及び性状

	タリビッド点眼液 0.3%	タリビッド眼軟膏 0.3%
剤形	水性点眼剤	眼軟膏剤
規格	1mL 中にオフロキサシン 3mg を含有する。	1g 中にオフロキサシン 3mg を含有する。
性状	微黄色～淡黄色澄明の液である。	淡黄色の眼軟膏で、おおいはない。

#### (3) 製剤の物性

タリビッド点眼液 0.3%

pH : 6.0～7.0

浸透圧比 : 0.95～1.15

#### (4) 識別コード

なし

#### (5) 無菌の有無

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

	タリビッド点眼液 0.3%	タリビッド眼軟膏 0.3%
含量	1mL 中にオフロキサシン 3mg を含有する。	1g 中にオフロキサシン 3mg を含有する。

#### (2) 添加物

	タリビッド点眼液 0.3%	タリビッド眼軟膏 0.3%
添加物	塩化ナトリウム(等張化剤)、 pH 調節剤	精製ラノリン(基剤)、 白色ワセリン(基剤)、 流動パラフィン(基剤)

### 3. 製剤の各種条件下における安定性

試験	製剤	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期 保存試験	点眼液	室温	36 ヶ月	最終製品 (箱入り)	変化なし
	眼軟膏				
苛酷試験	点眼液	50℃	7 日間	最終製品 (梱包状態)	変化なし
		25℃、1000 lx	30 万 lx・hr	5mL プラスチック点眼容器 (シュリンクラベルなし、露光)	変化なし
加速試験	点眼液	40℃、75%RH	3 ヶ月	最終製品 (箱入り)	変化なし
	眼軟膏		6 ヶ月	最終製品 (箱入り)	変化なし

### 4. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし



## 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、トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）（下線部はタリビッド眼軟膏 0.3%のみ）

#### <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. 用法及び用量

	タリビッド点眼液 0.3%	タリビッド眼軟膏 0.3%
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。	通常、適量を1日3回塗布する。なお、症状により適宜増減する。

#### <用法・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。なお、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。（下線部はタリビッド眼軟膏 0.3%のみ）

#### <解説>

1. 抗菌剤に共通の適正使用のための注意事項である。細菌性感染症に対して抗菌剤を使用する場合は、起炎菌を同定し、その感受性等を考慮して抗菌剤を選択することが原則である。起炎菌の感受性が低い抗菌剤を投与した場合は臨床効果が十分でないだけでなく、耐性菌を誘導する可能性がある。ところが、臨床現場においては、急性感染症のように起炎菌の同定や感受性の確認の前に治療を開始しなければならないことがしばしばあり、そのような場合には、検出頻度の高い細菌を起炎菌として想定し、抗菌剤の投与を開始することになる。しかし、その場合でも選択した抗菌剤を漫然と継続投与するのではなく、検出した菌の感受性試験結果、および投与している抗菌剤の臨床効果を考慮した上で、投与継続かあるいは変更の決定を行うとともに、これらの所見が十分に改善した時は速やかに投与を終了する必要がある。
2. 細菌性外眼部感染症治療の場合には長期連用の必要はなく、抗菌性点眼剤の一般的な注意事項であることから記載している。

また、トラコーマクラミジアによる結膜炎に関して、OFLXの抗トラコーマクラミジア作用の電顕像観察<sup>3)</sup>では、OFLXはトラコーマクラミジアの発育環で増殖過程にある原始体は崩壊、死滅させたが、成熟した基本小体には形態的变化を認めなかった。従って、トラコーマクラミジアを完全に死滅させるためには、原始体にあるサイクルを考慮して薬剤を投与しなければならないことが考えられ、トラコーマクラミジア感染を治療する場合、一般細菌感染の場合より長期間点眼を必要とすること、また、臨床試験においてトラコーマクラミジアによる結膜炎を治癒させるために約8週間を要する成績<sup>4-8)</sup>を得たことを勧告して、記載した。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床効果

国内で実施された臨床試験の概要は次のとおりである。

##### タリビッド点眼液 0.3%

外眼部感染症患者 391 例を対象に実施された第 2 相臨床試験<sup>9)</sup>、第 3 相臨床試験<sup>10,11)</sup>において、著効率 66.5% (256/391 例)、有効率 96.2% (376/391 例) と本剤の有効性が認められている。

##### 疾患別臨床効果 (承認時社内集計)

疾患名	有効率 (%)
眼瞼炎	100.0 (21/21)
麦粒腫	96.2 (25/26)
涙嚢炎	88.2 (45/51)
結膜炎	97.1 (269/277)
瞼板腺炎	100.0 (14/14)
角膜炎	95.5 (21/22)
角膜潰瘍	92.9 (13/14)

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

##### 初診時検出菌別臨床効果 (承認時社内集計)

菌種	有効率 (%)
ブドウ球菌属	95.9 (258/269)
レンサ球菌属	100.0 (50/50)
肺炎球菌	90.9 (30/33)
腸球菌属	100.0 (4/4)
マイクロコッカス属	93.8 (15/16)
コリネバクテリウム属	96.0 (72/75)
シュードモナス属	95.0 (38/40)
緑膿菌	100.0 (5/5)
バークホルデリア・セパシア	100.0 (9/9)
ステノトロホモナス (ザントモナス) ・ マルトフィリア	100.0 (7/7)
インフルエンザ菌	100.0 (16/16)
ヘモフィルス・エジプトチウス (コッホ・ウィークス菌)	93.8 (15/16)
モラクセラ属	100.0 (19/19)
セラチア属	90.0 (9/10)
クレブシエラ属	75.0 (3/4)
プロテウス属	100.0 (5/5)
アシネトバクター属	100.0 (19/19)
アクネ菌	100.0 (5/5)

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

### タリビッド眼軟膏 0.3%

外眼部感染症患者 126 例を対象に実施された一般臨床試験<sup>4-8,12,13)</sup>において、有効率 96.0% (121/126 例) と本剤の有効性が認められている。

#### 疾患別臨床効果 (承認時社内集計)

疾患名	有効率 (%)
眼瞼炎	100.0 (6/6)
麦粒腫	87.5 (7/8)
涙囊炎	85.7 (6/7)
結膜炎*	96.0 (48/50)
瞼板腺炎	100.0 (1/1)
角膜炎	100.0 (5/5)
角膜潰瘍	100.0 (13/13)
トラコーマクラミジア による結膜炎	97.7 (42/43)**

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

\*トラコーマクラミジアによる結膜炎を除く

\*\*未発表例を含む

#### 初診時検出菌別臨床効果 (承認時社内集計)

菌種	有効率 (%)
ブドウ球菌属	93.1 (54/58)
レンサ球菌属	100.0 (12/12)
肺炎球菌	75.0 (3/4)
腸球菌属	100.0 (2/2)
ミクロコッカス属	100.0 (1/1)
コリネバクテリウム属	100.0 (13/13)
シュードモナス属	100.0 (10/10)
緑膿菌	100.0 (3/3)
バークホルデリア・セパシア	100.0 (1/1)
ステノトロホモナス (ザントモナス)・マルトフィリア	100.0 (4/4)
インフルエンザ菌	100.0 (5/5)
モラクセラ属	100.0 (6/6)
セラチア属	100.0 (1/1)
クレブシエラ属	100.0 (2/2)
プロビデンシア属	100.0 (1/1)
トラコーマクラミジア (クラミジア・トラコマティス)	97.7 (42/43) *

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

\*未発表例を含む

### (2) 臨床薬理試験：忍容性試験

健康成人男性 (n=10) を対象に片眼に 0.3%他眼に 0.5%オフロキサシン点眼液を 1 日 (1 回 2 滴、3 回) または 2 週間 (1 回 2 滴、1 日 5 回 2 週間) 投与した結果、連続投与において 0.3%および 0.5%それぞれ 1 例および 2 例に刺激感、0.5%で異物感が 1 例にみられたが、いずれも軽微であり他覚的異常所見はみられなかった。日本眼感染症学会制定の判定基準により 0.3%および 0.5%は「安全」と判定され、0.5%濃度までの安全性が確認された<sup>14)</sup>。

健康成人男性 (n=6) を対象に両眼に 0.3%オフロキサシン点眼液

(1回1滴、30分毎16回または15分毎32回点眼)、あるいは0.3%オフロキサシン眼軟膏(1回約1cm、30分毎に16回)を頻回投与した結果、眼軟膏で2例に結膜充血および腫脹が認められたが、いずれも軽微であり他覚的異常所見はみられなかった<sup>15)</sup>。

原二郎：眼科臨床医報 79,1712(1985)<sup>14)</sup>

原二郎：DE-055点眼液および眼軟膏の臨床第1相追加試験(頻回点眼による安全性について、特に血中濃度についての検討)社内資料<sup>15)</sup>

注)本剤の承認されている用法・用量は点眼液が1回1滴、1日3回点眼、眼軟膏が適量を1日3回塗布である。

### (3)探索的試験：用量反応探索試験<sup>9)</sup>

外眼部細菌感染症患者(n=286)を対象とし、0.3%および0.5%オフロキサシン点眼液と0.3%マイクロマイシン硫酸塩点眼液を1回2滴、1日4回3~14日間投与し、日本眼感染症学会制定の判定基準に準拠して比較検討した(二重盲検法)。その結果、3群間に有意差が認められ(p=0.0186、累積 $\chi^2$ 検定)、2群間の比較では0.3%オフロキサシン群とマイクロマイシン硫酸塩群の間にのみ有意差が認められた(p=0.0132、累積 $\chi^2$ 検定)。安全性でも各群間に有意差は認められなかった(Fisher直接確立計算法)。このことより臨床至適濃度を0.3%とした。

三井幸彦他：眼科臨床医報 79,1718(1985)<sup>9)</sup>

注)本剤の承認されている用法・用量は1回1滴、1日3回である。

### (4)検証的試験

#### 1)無作為化平行用量反応試験<sup>10)</sup>

外眼部細菌感染症患者(n=448)を対象とし、0.3%オフロキサシン点眼液(1回1滴、1日3回)および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3~14日間投与し、日本眼感染症学会制定の判定基準に準拠して比較検討した(封筒法)。その結果、有効性評価対象例中、有効率はオフロキサシン群93.0%(173/186例)、マイクロマイシン硫酸塩群85.2%(155/182例)であり有意差が認められた(p=0.0050、累積 $\chi^2$ 検定)。安全性評価対象例中、オフロキサシンの副作用は認められず、両群間に有意差は認められなかった(p=0.2192、累積 $\chi^2$ 検定)。このことより用法・用量を1回1滴、1日3回点眼とした。

三井幸彦他：日本眼科紀要 37,1115(1986)<sup>10)</sup>

#### 2)比較試験<sup>11)</sup>

外眼部細菌感染症患者(n=373)を対象とし、0.3%オフロキサシン点眼液および0.3%ジベカシン硫酸塩点眼液を1回2滴、1日4回3~14日間投与し、日本眼感染症学会制定の判定基準に準拠して比較検討した(多施設二重盲検法)。その結果、有効性評価対象例中、有効率はオフロキサシン群99.3%(137/138例)、ジベカシン硫酸塩群94.30%(115/122例)であり有意傾向が認められた(p=0.0555、累積 $\chi^2$ 検定)。安全性評価対象例中、オフロキサシンの副作用は点眼時の軽度な刺激感2例であった。

三井幸彦他：眼科臨床医報 80,1813(1986)<sup>11)</sup>

注)本剤の承認されている用法・用量は1回1滴、1日3回で

ある。

### 3) 安全性試験

該当資料なし

### 4) 患者・病態別試験

#### 眼科周術期の無菌化療法<sup>16)</sup>

眼科手術予定患者 (n=367) を対象とし、0.3%オフロキサシン点眼液を周術期の無菌化療法として投与 (手術前 2 日間 1 日 5 回、手術当日は手術の時刻や種類に応じて適宜点眼、手術直後に 1 回、以降包帯交換時毎) したところ全例術後感染はみられなかった。副作用の発現は認められなかった。

田村修他：眼科臨床医報 80,1104(1986)<sup>16)</sup>

注) 本剤の承認されている用法・用量は 1 回 1 滴、1 日 3 回である。

#### トラコーマクラミジアによる結膜炎<sup>4-8,12)</sup>

トラコーマクラミジアによる結膜炎患者 (n=43、小児 27 例、成人 16 例) を対象とし、0.3%オフロキサシン眼軟膏を 1 日 3~5 回約 2 ヶ月間投与した結果、有効率は 97.7% (42/43 例) であった。確定診断されていない症例も含めた安全性評価対象例中、副作用は軽度の湿疹様皮膚症状 1 件で副作用発現率は 1.6% (1/64 例) であった。

井上須美子他：日本眼科学会雑誌 90,1081(1986)<sup>4)</sup>

塩田洋他：日本眼科学会雑誌 90,1085(1986)<sup>5)</sup>

松村香代子他：日本眼科学会雑誌 90,1090(1986)<sup>6)</sup>

田村修他：日本眼科学会雑誌 90,1094(1986)<sup>7)</sup>

楠島康平他：あたらしい眼科 3,1619(1986)<sup>8)</sup>

青木好喜他：臨床眼科 40,985(1986)<sup>12)</sup>

注) 本剤の承認されている用法・用量は適量を 1 日 3 回塗布である。

#### 外眼部細菌感染症<sup>13)</sup>

外眼部細菌感染症患者 (n=87) を対象とし、0.3%オフロキサシン眼軟膏を 1 回約 1cm、1 日 3 回 3~14 日間を投与し、日本眼感染症学会制定の判定基準に準拠して検討した。その結果、有効性評価対象例中における有効率は 95.2% (79/83 例) であった。副作用の発現は認められなかった。

井上慎三他：あたらしい眼科 3,742(1986)<sup>13)</sup>

### (5) 治療的使用

#### 1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

##### 使用成績調査

##### タリビッド点眼液 0.3%

1987 年 6 月 30 日~1993 年 6 月 29 日に本剤の使用成績調査を実施したところ、全国 781 施設、12,537 例の症例が収集できた。安全性解析対象症例中における副作用発現症例率は 0.32% (40/12,477 例) であった (VIII-8 の項参照)。

##### タリビッド眼軟膏 0.3%

1987 年 6 月 30 日~1993 年 6 月 29 日に本剤の使用成績調査を実施したところ、全国 436 施設、2,227 例の症例が収集できた。安全性

解析対象症例中における副作用発現症例率は 0.59% (13/2,210 例) であった (VIII-8 の項参照)。

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要  
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

2. 薬理作用

(1)作用部位・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）活性およ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>17)</sup>。

抗菌作用は殺菌的で<sup>18-21)</sup>、MIC 濃度において溶菌が認められる<sup>18)</sup>。哺乳動物細胞のトポイソメラーゼ II に対する阻害活性は、細菌の DNA ジャイレース（トポイソメラーゼ II）阻害活性およびトポイソメラーゼIV阻害活性よりはるかに弱いことが認められている<sup>22,23)</sup>。

トポイソメラーゼ II に対する阻害活性 (*in vitro* 試験)

	IC <sub>50</sub> ±SD (μg/mL)			選択性	
	Gyrase ( <i>E.coli</i> KL-16)	TopoIV ( <i>S.aureus</i> FDA209-P)	Topo II (human placenta)	Topo II / Gyrase	Topo II / TopoIV
LVFX	0.39±0.00	2.36±0.41	1854±35	4754	786
OFLX	0.71±0.07	4.17±1.25	2221±48	3129	532

Gyrase : DNA gyrase、TopoIV : TopoisomeraseIV、Topo II : Topoisomerase II  
LVFX : レボフロキサシン  
OFLX : オフロキサシン

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 標準株に対する抗菌力

① グラム陽性菌<sup>19)</sup>

菌 株	MIC (µg/mL)		
	OFLX	NFLX	GM
<i>Staphylococcus aureus</i> FAD209 TJ-1	0.20	0.20	0.05
<i>Staphylococcus aureus</i> TERAJIMA	0.20	0.39	0.10
<i>Streptococcus pyogenes</i> COOK	1.56	3.13	6.25
<i>Bacillus subtilis</i> ATCC 6633*	0.05	0.20	0.05

\*適応外菌種

接種菌量：10<sup>6</sup>CFU/mL

NFLX：ノルフロキサシン、GM：ゲンタマイシン

② グラム陰性菌<sup>19)</sup>

菌 株	MIC (µg/mL)		
	OFLX	NFLX	GM
<i>Escherichia coli</i> NIHJ JC-2*	0.05	0.05	0.39
<i>Escherichia coli</i> K12 C600*	0.05	0.05	3.13
<i>Klebsiella pneumoniae</i> PCI-602	≦0.025	≦0.025	0.20
<i>Salmonella typhimurium</i> II D-971*	0.10	0.05	0.39
<i>Salmonella typhimurium</i> 901*	≦0.025	≦0.025	0.20
<i>Salmonella paratyphi</i> 1015*	≦0.025	≦0.025	0.20
<i>Salmonella enteritidis</i> G14*	≦0.025	≦0.025	0.20
<i>Enterobacter aerogenes</i> ATCC13048*	0.20	0.10	0.78
<i>Enterobacter cloacae</i> 963*	0.10	0.10	0.39
<i>Proteus mirabilis</i> IFO3849	0.20	0.10	0.78
<i>Proteus vulgaris</i> OX-19	0.05	0.05	0.20
<i>Providencia rettgeri</i> IFO3850	0.20	0.10	3.13
<i>Morganella morganii</i> IFO3848	0.05	≦0.025	0.20
<i>Serratia marcescens</i> IAM1184	0.20	0.10	0.20
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> IFO 3445	1.56	1.56	3.13
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> NCTC10490	0.78	0.78	0.78
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> PAO1	0.78	0.20	1.56

\*適応外菌種

接種菌量：10<sup>6</sup>CFU/mL

NFLX：ノルフロキサシン、GM：ゲンタマイシン

③偏性嫌気性菌（グラム陽性菌、グラム陰性菌）<sup>20)</sup>

	菌 株	MIC (μg/mL)	
		OFLX	NFLX
グ ラ ム 陽 性 菌	<i>Streptococcus intermedius</i> GAI1207	3.13	12.5
	<i>Peptococcus magnus</i> ATCC14956*	1.56	12.5
	<i>Peptostreptococcus magnus</i> ATCC29328*	0.39	1.56
	<i>Peptostreptococcus prevotii</i> GAI1667*	0.39	3.13
	<i>Peptostreptococcus asaccharolyticus</i> GAI1754*	6.25	6.25
	<i>Peptostreptococcus asaccharolyticus</i> ATCC18953*	0.78	1.56
	<i>Peptostreptococcus micros</i> GAI1602*	0.20	0.20
	<i>Veillonella parvula</i> GAI2519*	0.39	0.78
	<i>Clostridium perfringens</i> ATCC13123*	1.56	3.13
	<i>Clostridium difficile</i> GAI0569*	12.5	100
	<i>Clostridium difficile</i> GAI0774*	12.5	50
	<i>Clostridium difficile</i> GAI0781*	12.5	50
	<i>Clostridium difficile</i> GAI0858*	12.5	50
グ ラ ム 陰 性 菌	<i>Bacteroides fragilis</i> ATCC25285*	1.56	25
	<i>Bacteroides fragilis</i> GAI0492*	12.5	200
	<i>Bacteroides fragilis</i> GAI1859*	6.25	25
	<i>Bacteroides vulgatus</i> ATCC29327*	3.13	50
	<i>Bacteroides melaninogenicus</i> *		
	<i>ss. melaninogenicus</i> GAI0410*	0.78	6.25
	<i>ss. melaninogenicus</i> GAI0411*	1.56	6.25
	<i>ss. intermedius</i> GAI0416*	0.78	3.13
	<i>Bacteroides asaccharolyticus</i> GAI0413*	1.56	6.25
	<i>Vibrio succinogenes</i> GAI0886*	0.20	0.20
	<i>Fusobacterium varium</i> ATCC8501*	25	100
	<i>Fusobacterium mortiferum</i> GAI0341*	25	100

\*適応外菌種  
接種菌量：10<sup>6</sup>CFU/mL  
NFLX：ノルフロキサシン

④トラコーマクラミジア<sup>24)</sup>

菌 株	OFLX		TC		EM	
	MIC	MLC	MIC	MLC	MIC	MLC
<i>Chlamydia trachomatis</i> serotypeC*	1.0	1.0	0.06	0.06	0.007	0.007
<i>Chlamydia trachomatis</i> serotypeD*	1.0	1.0	0.125	0.125	0.007	0.015

μg/mL  
\*眼軟膏のみ適応菌種  
接種菌量：10<sup>6</sup>CFU/mL  
TC：テトラサイクリン、EM：エリスロマイシン

## 2) 臨床分離株に対する抗菌力

### ① 各種臨床分離株<sup>9-11,13,25)</sup>

調査期間		承認時臨床試験			使用成績調査		
		1984年2月～1986年1月			1989年9月～1992年8月		
菌種		MICの範囲	MIC <sub>80</sub>	株数	MICの範囲	MIC <sub>80</sub>	株数
ブドウ球菌属	黄色ブドウ球菌	<0.1～3.13	0.39	364	0.20～>100	0.78	200
	表皮ブドウ球菌	<0.1～6.25	0.39	811			
	CNS				0.10～>100	0.39	100
レンサ球菌属		<0.1～25	6.25	222* <sup>1</sup>	1.56～25	6.25	160
肺炎球菌		<0.1～12.5	3.13	107			
マイクロコッカス属		<0.1～3.13	1.56	77	0.05～0.39	0.20	40
コリネバクテリウム属		<0.1～50	1.56	417	0.39～>100	1.56	100
シュードモナス属		<0.1～>100	0.78	332* <sup>2</sup>	0.20～100	6.25	80* <sup>4</sup>
緑膿菌		<0.1～3.13	1.56	14			
ヘモフィルス属					≤0.025～0.39	0.05	100
インフルエンザ菌		<0.1～1.56	0.2	49			
ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)		<0.1～0.2	<0.1	59			
モラクセラ属		<0.1～3.13	0.2	49	0.05～3.13	0.39	40
セラチア属		<0.1～0.78	0.39	47	0.05～25	0.20	20
クレブシエラ属		<0.1～1.56	<0.1	25	≤0.025～25	0.10	40
プロテウス属		<0.1～0.78	0.2	31* <sup>3</sup>	≤0.025～0.39	0.10	20* <sup>5</sup>
アシネトバクター属		<0.1～0.78	0.2	78	0.10～25	0.39	60
プロピオニバクテリウム属					0.39～3.13	1.56	40
アクネ菌		<0.1～3.13	1.56	76			

MIC : μg/mL、接種菌量 : 10<sup>6</sup>CFU/mL

\*<sup>1</sup>: *Enterococcus faecalis* 16株含む。

\*<sup>2</sup>: *Burkholderia cepacia* 81株, *Burkholderia pickettii* 4株, *Stenotrophomonas maltophilia* 44株含む。

\*<sup>3</sup>: *Morganella morganii* 13株, *Providencia rettgeri* 2株, *Providencia inconstans* 1株含む。

\*<sup>4</sup>: *Burkholderia cepacia* 20株, *Stenotrophomonas maltophilia* 8株含む。

\*<sup>5</sup>: *Providencia rettgeri* 2株, *Providencia alcalifaciens* 2株, *Providencia stuartii* 2株含む。

### ② トラコーマクラミジア<sup>26)</sup>

MIC	0.025	0.05	0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.13	6.25	12.5	25.0	計
OFLX					5	40						45
CPFX						7	38					45
NFLX										5	40	45
MINO	8	37										45
DOXY	3	37	5									45

μg/mL

McCoy細胞、接種菌量 : 5×10<sup>3</sup>IFU、ヨード染色法

CPFX : シプロフロキサシン、NFLX : ノルフロキサシン、MINO : ミノサイクリン、DOXY : ドキシサイクリン

### 3) 各種細菌に対する MIC と MBC の比較 <sup>27)</sup>

菌種	株数	接種菌量 (CFU/mL)	MIC (µg/mL)		MBC (µg/mL)	
			範囲	90%	範囲	90%
<i>E. coli</i>	50	10 <sup>4</sup>	≦0.05~1.56	0.39	≦0.05~3.13	0.39
		10 <sup>6</sup>	≦0.05~1.56	0.39	≦0.05~3.13	0.39
<i>K. pneumoniae</i>	50	10 <sup>4</sup>	0.10~1.56	0.39	0.10~1.56	0.78
		10 <sup>6</sup>	0.10~1.56	0.78	0.10~1.56	0.78
<i>P. aeruginosa</i>	50	10 <sup>4</sup>	0.10~6.25	1.56	0.10~12.5	1.56
		10 <sup>6</sup>	0.19~12.5	1.56	0.39~12.5	3.13
<i>S. aureus</i>	50	10 <sup>4</sup>	0.19~0.39	0.39	0.19~0.78	0.39
		10 <sup>6</sup>	0.19~0.78	0.39	0.39~1.56	0.78

### 4) Post antibiotic effect (PAE) <sup>28)</sup>

試験管内において、*E. coli* に対して 1 および 4MIC を 3 時間接触させ、その後薬剤を除去した場合の PAE を比較検討した結果、オフロキサシンは、試験管内において *E. coli* に対して PAE を示し、その強さはレボフロキサシン、シプロフロキサシンとほぼ同等であった。

菌 株	薬 剤	濃度 (µg/mL) [×MIC]	PAE (hr)
<i>E. coli</i> E77156*	OFLX	0.10 [1]	0.5
		0.39 [4]	1.5
	LVFX	0.05 [1]	0.7
		0.19 [4]	1.9
	CPFX	0.025 [1]	0.4
		0.10 [4]	1.9
	CAZ	0.10 [1]	0.1
		0.39 [4]	0.2

\*: 適応外菌種  
 接種菌量: 10<sup>4</sup>CFU/mL  
 CPFX: シプロフロキサシン  
 CAZ: セフトアジジム

### 5) 実験的角膜感染モデルにおける効果

外部感染症のうち最も重篤とされる緑膿菌性角膜潰瘍のウサギ感染症モデルを用いて感染予防および治療効果を検討した。予防効果では、菌接種直後 0.1~0.5% オフロキサシン点眼液を 1 回 2 滴、2 時間間隔 1 日 6 回 3 日間点眼した結果、接種 6 日後まで角膜混濁は認められなかった。治療効果では、菌接種 6 時間後より生理食塩液および 0.05、0.3% オフロキサシン点眼液を 1 回 2 滴、2 時間間隔 1 日 6 回 3 日間点眼した結果、対照群では全例角膜潰瘍が発症したが、オフロキサシン群では 0.05% の 1 眼を除いて角膜炎が発症し、そのうち 2 眼を除く 13 眼すべてが 7 日以内で治癒した。また細菌培養では対照群が陰性化しなかったのに対し、オフロキサシン点眼群では点眼開始後全眼陰性となった <sup>29)</sup>。

0.3% オフロキサシン眼軟膏についても点眼液と同様、緑膿菌性角膜潰瘍のウサギ感染症モデルを用いて感染予防および治療効果について 0.3% オフロキサシン点眼液を対照として比較検討した結果、点眼液と同等の予防効果および治療効果のあることが認められた <sup>30)</sup>。

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当しない

#### (2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

#### (3) 通常用量での血中濃度

健康成人男性 (n=6) に 0.3% オフロキサシン点眼液 (1 回 1 滴) および眼軟膏 (1 回約 1.5cm) を両眼に連続投与し、血中濃度を HPLC にて測定した。最高血中濃度は 15 分毎 32 回点眼液群における最終点眼 30 分後 0.025~0.043 $\mu\text{g}/\text{mL}$  であり、眼軟膏群はさらに低い値を示した<sup>15)</sup>。

		最終点眼後	30min	1hr	2hr
点 眼 液	30 分毎 16 回点眼	0.009 0.028	0.009 0.025	0.008 0.024	
	15 分毎 32 回点眼	0.025 0.043	0.022 0.042	0.020 0.037	
眼 軟 膏	30 分毎 16 回点眼	0.007 N.D.	0.009 N.D.	0.009 N.D.	

N.D.: 検出限界未満 (検出限界値 0.007 $\mu\text{g}/\text{mL}$ )、n=2

未熟児、新生児を含めた小児 (n=52) に 0.3% オフロキサシン点眼液を 1 回 1 滴両眼に点眼し、血中濃度を HPLC にて測定した。乳幼児~小児 (生後 2 ヶ月から 14 歳) では、1 名のみ点眼 30 分後 5.7ng/mg であった以外すべて検出限界値 (5.0ng/mL) 未満であった。未熟児および新生児では 39 サンプル中 20 サンプルで 5.0~20.3ng/mL であったが、19 サンプルでは検出限界値 (4.8ng/mL) 未満であった<sup>31)</sup>。

#### (4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 吸収速度定数

点眼では該当資料なし

100mg 食後単回経口投与における薬物力学的パラメータ<sup>32)</sup>

吸収速度定数 ( $\text{hr}^{-1}$ )	消失速度定数 ( $\text{hr}^{-1}$ )	分布容積 (L/kg)	$t_{1/2}$ (hr)	$t_{\text{max}}$ (hr)	$C_{\text{max}}$ ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	$\text{AUC}_{0-24}$ ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )
1.80 $\pm$ 0.77	0.25 $\pm$ 0.05	1.22 $\pm$ 0.14	2.90 $\pm$ 0.53	1.90 $\pm$ 0.23	0.95 $\pm$ 0.17	6.02 $\pm$ 1.05

mean $\pm$ S.D.、n=5

#### (2) バイオアベイラビリティ

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

### 3. 吸収

### 4. 分布

#### (6) 血漿蛋白結合率

< *in vitro* >

<sup>14</sup>C-オフロキサシンの *in vitro* におけるヒト血清蛋白結合率は血清中濃度約 1μg/mL および約 10μg/mL において同様の値を示し、超遠心分離法で約 30%、ゲルろ過法で 0.5~0.6% であった。オフロキサシンと血清蛋白との結合はほとんどが極めて解離しやすい可逆的結合であると考えられた。

該当資料なし

#### (1) 血液-脳関門通過性

< 参考：ラット >

ラットに <sup>14</sup>C-オフロキサシン 20mg/kg を経口投与した時、2 時間後脳では 0.36μg/g or mL が認められた<sup>33)</sup>。

#### (2) 胎児への移行性

点眼では該当資料なし

分娩前の産婦にオフロキサシン 200mg を単回経口投与し、臍帯血および羊水中濃度を測定したところ、良好な移行性が認められた<sup>34,35)</sup>。

投与量	n	時間 (hr)	臍帯血清中濃度(μg/mL)	臍帯血清中濃度 母体血清中濃度	羊水中濃度 (μg/mL)
200mg	8	1~9	0.14~1.03	0.326~0.972	<0.10~2.24
単回経口	11	0.5~7	<0.10~2.25	0.544~0.961	<0.10~39.8

< 参考：ラット >

妊娠 12 日目のラットに <sup>14</sup>C-オフロキサシン 20mg/kg 単回経口投与した時、1 時間後の母体全血液中放射能濃度は 2.437μg/mL であり、その時の胎盤中および胎児中放射能濃度の母体全血液中放射能濃度に対する比は 1.375 および 0.556 であった。胎膜および羊水中放射能濃度の母体全血液中放射能濃度に対する比は 0.907 および 0.309 であった。投与 24 時間後では、母動物の組織および胎児における濃度はすべて著明に低下した。妊娠 19 日目のラットに <sup>14</sup>C-オフロキサシン 20mg/kg 単回経口投与した時、1 時間後の組織内放射能濃度は、乳腺での濃度上昇を除いて妊娠 12 日目のラットと類似し、胎児の濃度は全血液中濃度より低く、胎児への放射能の分布率は投与量の 0.67% と少なかった。投与 24 および 48 時間には母動物の組織および胎児における濃度はすべて著明に低下した。これらより <sup>14</sup>C-オフロキサシンのラットにおける胎盤通過性は低いことが明らかになった<sup>36)</sup>。

妊娠ラットにおける <sup>14</sup>C-オフロキサシン単回経口投与時の組織内濃度

組織	組織中放射能濃度 (μg/g or mL)				
	妊娠 12 日目		妊娠 19 日目		
	1hr	24hr	1hr	24hr	48hr
母体全血	2.437(—)	0.089(—)	3.026(—)	0.069(—)	0.032(—)
乳腺	1.972(0.751)	0.052(0.498)	4.060(1.346)	0.086(1.080)	0.028(0.492)
子宮	5.667(2.520)	0.162(2.016)	5.008(1.581)	0.400(6.294)	0.031(0.654)
卵巣	3.291(1.323)	0.110(1.190)	3.910(1.339)	0.146(2.157)	0.036(1.081)
胎盤	3.442(1.375)	0.088(0.862)	2.575(0.852)	0.111(1.554)	0.017(0.409)
胎膜	2.304(0.907)	0.020(0.236)	3.414(1.087)	0.560(7.953)	0.149(5.867)
胎児	1.470(0.556)	0.036(0.319)	1.199(0.395)	0.107(1.505)	0.027(0.734)
胎児肝	N.T.(N.T.)	N.T.(N.T.)	1.898(0.621)	0.162(2.220)	0.000(0.006)
胎児腎	N.T.(N.T.)	N.T.(N.T.)	1.561(0.513)	0.115(1.612)	0.005(0.086)
羊水	0.784(0.309)	0.031(0.379)	0.297(0.112)	0.312(4.177)	0.041(1.382)

( ) : 母体全血に対する放射能濃度比

N.T. : not tested、n=4

(3) 乳汁中への移行性

点眼では該当資料なし

産褥 3～7 日の産婦 (n=6) にオフロキサシン 200mg を単回経口投与し乳汁中移行を検討した結果、オフロキサシンは乳汁への移行が高いことが明らかとなった<sup>34)</sup>。

投与量	時間(hr)	乳汁中濃度 (μg/mL)
200mg 単回経口	1	0.4
	3	1.5
	6	1.2

n=6

(4) 髄液への移行性

点眼では該当資料なし

中枢神経系の感染がない泌尿器科疾患患者 (n=15) にオフロキサシン 200mg を単回経口投与 3 時間後の髄液中濃度は 0.363μg/mL で血清中濃度に対する比は 0.166 であった<sup>37)</sup>。

(5) その他の組織への移行性

房水内移行<sup>38)</sup>

白内障手術患者 (n=25) に 0.3% オフロキサシン点眼液 1 滴を 5 分毎 5 回点眼し、房水中濃度を測定した結果、点眼終了 30～180 分後の房水中濃度は 0.10～1.20μg/mL で、そのピークは点眼 1 時間前後であった。

< 参考 >

1) 眼組織内移行

単回点眼 (点眼液・ウサギ)<sup>38)</sup>

白色ウサギに 0.3% オフロキサシン点眼液 1 滴を点眼し、各眼組織内濃度を測定した。角膜では点眼 1 時間後、前房水で点眼 30 分後に最高濃度を示した後、経時的に減少し点眼 2 時間後に検出限界以下となった。

白色ウサギにおけるオフロキサシン点眼液単回点眼時の組織内濃度

組織	組織中濃度 (µg/g or mL)								
	5min	15min	30min	1hr	2hr	3hr	4hr	6hr	8hr
角膜	1.40±1.24	1.83±0.85	2.35±1.09	3.32±1.71	1.82±1.58	trace	trace	trace	trace
強膜	0.70±0.34	1.01±0.74	1.31±0.83	1.62±1.11	1.52±0.77	trace	trace	trace	trace
眼球結膜	1.37±0.91	2.95±2.76	1.81±1.04	trace	trace	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
外眼筋	0.48±0.47	2.40±2.19	0.60±0.28	2.62±0.94	0.70±0.47	trace	N.D.	N.D.	N.D.
虹彩・毛様体	0.20±0.19	0.48±0.34	0.30±0.16	0.95±0.06	0.43±0.27	trace	N.D.	N.D.	N.D.
前房水	trace	0.31±0.31	0.71±0.38	0.55±0.35	0.51±0.30	trace	trace	trace	trace
硝子体	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
水晶体	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
網脈絡膜	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
視神経	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
血清	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.

mean±S.D.、N.D.：検出限界未満、n=8

反復点眼（点眼液・ウサギ）<sup>38)</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5回反復点眼し、各眼組織内濃度を測定した。単回点眼よりも組織移行量は多くピークも早期にみられ残留時間が延長する傾向がみられた。

白色ウサギにおけるオフロキサシン点眼液反復点眼時の組織内濃度

組織	組織中濃度 (µg/g or mL)								
	5min	15min	30min	1hr	2hr	3hr	4hr	6hr	8hr
角膜	7.78 ±0.80	7.23 ±3.56	5.18 ±3.22	2.85 ±1.35	1.52 ±0.55	1.05 ±0.44	0.59 ±0.33	trace	trace
強膜	7.66 ±4.88	3.30 ±1.58	3.15 ±1.90	1.41 ±0.95	1.11 ±1.01	0.82 ±0.67	trace	trace	trace
眼球結膜	34.98 ±31.72	21.08 ±21.53	15.41 ±13.26	1.54 ±0.82	0.70 ±0.60	trace	trace	trace	N.D.
外眼筋	9.12 ±6.02	18.54 ±15.93	7.18 ±5.30	1.34 ±0.84	1.10 ±1.32	trace	trace	trace	trace
虹彩・毛様体	2.77 ±1.67	3.08 ±2.09	3.12 ±2.20	1.93 ±0.87	trace	trace	trace	trace	trace
前房水	0.89 ±0.20	1.79 ±0.37	2.63 ±0.96	3.56 ±1.53	2.42 ±1.18	1.22 ±0.49	0.61 ±0.21	0.58 ±0.04	trace
硝子体	0.59 ±0.17	0.46 ±0.31	0.80 ±1.13	0.21 ±0.22	0.11 ±0.14	0.07 ±0.10	trace	trace	trace
水晶体	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
網脈絡膜	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
視神経	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
血清	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.

mean±S.D.、N.D.：検出限界未満、n=8

単回点眼（眼軟膏・ウサギ）<sup>39)</sup>

白色ウサギに 0.3% オフロキサシン眼軟膏 1cm（約 40mg）を投与し、各眼組織内濃度を測定した。点眼液と比較して角膜、房水ではほぼ同等の移行性を示したが、眼球結膜では組織内移行が持続すると考えられた。

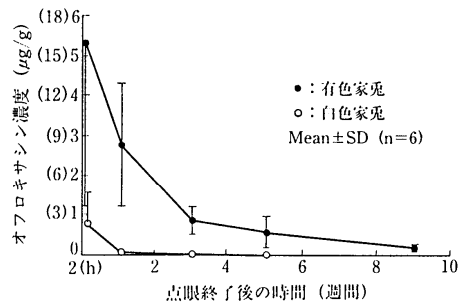
白色ウサギにおけるオフロキサシン眼軟膏単回点眼時の組織内濃度

組織	組織中濃度 (µg/g or mL)						
	5min	30min	1hr	2hr	3hr	6hr	8hr
角膜	1.57±1.18	3.83±1.80	4.87±1.88	1.18±0.36	0.87±0.62	0.38±0.08	0.30±0.06
強膜	1.61±0.77	1.21±0.29	0.91±0.35	0.23±0.14	0.16±0.05	0.21±0.10	0.15±0.05
眼球結膜	9.72±5.35	5.94±2.05	3.57±1.54	0.94±0.56	0.61±0.30	0.69±0.34	0.45±0.37
前房水	N.D.	0.14±0.05	0.69±0.33	0.14±0.08	0.05±0.05	N.D.	N.D.

mean±S.D.、N.D.：検出限界未満、n=8

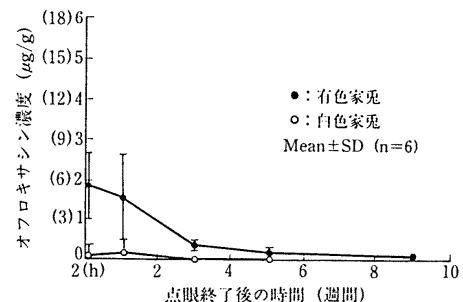
2) メラニン含有眼組織内移行（ウサギ）<sup>40)</sup>

白色および有色ウサギに 0.3% オフロキサシン点眼液を 1 回 1 滴、1 日 3 回 2 週間両眼に投与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。



虹彩・毛様体における眼内動態

( ) 内は有色家兎の補正值。



網脈絡膜における眼内動態

( ) 内は有色家兎の補正值。

ウサギにおけるオフロキサシン点眼液反復点眼時の眼内動態

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

点眼では該当資料なし

健康成人にオフロキサシン 600mg を単回経口投与（非標識オフロキサシンとオフロキサシン-d<sub>3</sub> の等量混合物）し、尿中代謝物について検索した結果、大部分が未変化体として存在し、N-脱メチル体および N-オキシド体と推定される 2 種類の代謝物がわずかに認められた。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当しない

#### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

<参考>

N-脱メチル体の保存標準株に対する抗菌力を未変化体と比較すると腸内細菌および *P.aeruginosa* に対してはほぼ同程度の抗菌力を示し、グラム陽性菌および *P.aeruginosa* を除くブドウ糖非発酵グラム陰性桿菌に対してはやや劣る抗菌力を示した。

#### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

#### (1) 排泄部位

点眼では該当資料なし

健康成人男子にオフロキサシン 100～600mg をそれぞれ単回経口投与した場合、いずれの投与量においても尿中には投与 48 時間後までに投与量の 90%以上が未変化体のまま排泄された。また、糞中にはオフロキサシン 600mg を単回経口投与した場合、投与 48 時間後までに約 3.9%が排泄された<sup>32)</sup>。

#### (2) 排泄率

該当資料なし

#### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 透析等による除去率

#### (1) 腹膜透析

該当資料なし

#### (2) 血液透析

該当資料なし

#### (3) 直接血液灌流

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

該当しない（特に設定されていない）

### 2. 禁忌内容とその理由 （原則禁忌を含む）

〔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

<解説>

動物における maximization test をはじめとする抗原性に関する実験ではオフロキサシン（OFLX）に抗原性は認められていないが、市販後、タリビッド眼軟膏 0.3%・タリビッド点眼液 0.3%でショック、アナフィラキシー様症状、発疹、蕁麻疹、眼瞼炎、眼瞼皮膚炎が報告されているため、本剤の成分による過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。

また、類似の化学構造を有する他のキノロン系抗菌剤による過敏症の既往歴のある患者に本剤を投与した場合、その化学構造から交差過敏を起こす可能性があるため、これらの患者にも投与を避ける必要がある。

### 3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない（特に設定されていない）

### 4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

<用法・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。なお、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。（下線部はタリビッド眼軟膏 0.3%のみ）

<解説>

1. 抗菌剤に共通の適正使用のための注意事項である。細菌性感染症に対して抗菌剤を使用する場合は、起炎菌を同定し、その感受性を考慮して抗菌剤を選択することが原則である。起炎菌の感受性が低い抗菌剤を投与した場合は臨床効果が十分でないだけでなく、耐性菌を誘導する可能性がある。ところが、臨床現場においては、急性感染症のように起炎菌の同定や感受性の確認の前に治療を開始しなければならないことがしばしばあり、そのような場合には、検出頻度の高い細菌を起炎菌として想定し、抗菌剤の投与を開始することになる。しかし、その場合でも選択した抗菌剤を漫然と継続投与するのではなく、検出した菌の感受性試験結果、および投与している抗菌剤の臨床効果を考慮した上で、投与継続かあるいは変更の決定を行うとともに、これらの所見が十分に改善した時は速やかに投与を終了する必要がある。
2. 細菌性外眼部感染症治療の場合には長期連用の必要はなく、抗菌性点眼剤の一般的な注意事項であることから記載している。

また、トラコーマクラミジアによる結膜炎に関して、OFLXの抗トラコーマクラミジア作用の電顕像観察<sup>3)</sup>では、OFLXはトラコーマクラミジアの発育環で増殖過程にある原始体は崩壊、死滅させたが、成熟した基本小体には形態的变化を認めなかった。従って、トラコーマクラミジアを完全に死滅させるためには、原始体にあるサイクルを考慮して薬剤を投与しなければならないことが考えられ、トラコーマクラミジア感染を治療する場合、一般細菌感染の場合より長期間点眼を必要とすること、また、臨床試験においてトラコーマクラミジアによる結膜炎を治癒させるために約8週間を要する成績<sup>4-8)</sup>を得たことを勘案して、記載した。

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない（特に設定されていない）

6. 重要な基本的注意とその理由  
及び処置方法

該当しない（特に設定されていない）

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない（特に設定されていない）

(2) 併用注意とその理由

該当しない（特に設定されていない）

8. 副作用

(1) 副作用の概要

**タリビッド点眼液 0.3%**

承認時迄の調査及び使用成績調査の総症例 13,329 例中、副作用が認められたのは 44 例（0.33%）であった。主な副作用は眼刺激感 11 件（0.08%）、眼瞼そう痒感 8 件（0.06%）、眼瞼炎 6 件（0.05%）、結膜充血 5 件（0.04%）、眼痛 5 件（0.04%）、眼瞼腫脹 5 件（0.04%）等であった。（再審査終了時）

**タリビッド眼軟膏 0.3%**

承認時迄の調査及び使用成績調査の総症例 2,360 例中、副作用が認められたのは 14 例（0.59%）であった。主な副作用は眼瞼そう痒感 3 件（0.13%）、眼瞼腫脹 3 件（0.13%）、眼瞼炎 2 件（0.08%）、結膜充血 2 件（0.08%）、眼痛 2 件（0.08%）、眼瞼発赤 2 件（0.08%）等であった。（再審査終了時）

1) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（まれに：0.1%未満、ときに：0.1～5%未満、副詞なし：5%以上又は頻度不明）

**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

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。

タリビッド点眼液 0.3%

頻度 種類	頻度不明	0.1～5%未 満	0.1%未満
過敏症	発疹、蕁麻疹	—	眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎、そう痒感
眼	結膜炎（結膜充血・浮腫等）	刺激感	びまん性表層角膜炎等の角膜障害

タリビッド眼軟膏 0.3%

頻度 種類	頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症	発疹、蕁麻疹	そう痒感	眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎
眼	結膜炎（結膜充血・浮腫等）、びまん性表層角膜炎等の角膜障害	—	—

処置方法

承認時までの副作用はいずれも軽度から中等度であり、治験薬の投与継続中または投与中止により消失した。

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

タリビッド点眼液 0.3%

時期	承認時 (%)	使用成績調査の累計 (%)	計 (%)
調査症例数	852	12477	13329
副作用発現症例数	4(0.47)	40(0.32)	44(0.33)
副作用発現件数	4	49	53
副作用の種類	副作用発現件数 (%)		
眼瞼そう痒感	—	8(0.06)	8(0.06)
眼瞼発赤	—	3(0.02)	3(0.02)
流涙	—	1(0.01)	1(0.01)
結膜充血	—	5(0.04)	5(0.04)
眼瞼炎	—	6(0.05)	6(0.05)
眼刺激	3(0.35)	8(0.06)	11(0.08)
眼痛	1(0.12)	4(0.03)	5(0.04)
表在性角膜炎(点状・びまん性)	—	4(0.03)	4(0.03)
角膜びらん	—	2(0.02)	2(0.02)
羞明	—	1(0.05)	1(0.04)
霧視	—	1(0.05)	1(0.04)
視力低下	—	1(0.05)	1(0.04)
眼瞼腫脹	—	5(0.04)	5(0.04)

(再審査期間：1987年6月30日～1993年6月29日)

タリビッド眼軟膏 0.3%

時期	承認時 (%)	使用成績調査 の累計(%)	計 (%)
調査症例数	150	2210	2360
副作用発現症例数	1(0.67)	13(0.59)	14(0.59)
副作用発現件数	1	15	16
副作用の種類	副作用発現件数(%)		
眼瞼そう痒感	—	3(0.14)	3(0.13)
顔面湿疹	1(0.67)	—	1(0.04)
眼瞼発赤	—	2(0.09)	2(0.08)
結膜充血	—	2(0.09)	2(0.08)
眼瞼炎	—	2(0.09)	2(0.08)
眼痛	—	2(0.09)	2(0.08)
表在性角膜炎(点状・ びまん性)	—	1(0.05)	1(0.04)
眼瞼腫脹	—	3(0.14)	3(0.13)

(再審査期間：1987年6月30日～1993年6月29日)

臨床検査値異常

該当資料なし

## (3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

背景因子別・副作用の発現頻度一覧表（市販後、2002年3月末現在）

項 目		発疹	蕁麻疹	眼瞼炎等 <sup>*1</sup>	結膜炎等 <sup>*2</sup>	角膜障害 <sup>*3</sup>	
患者背景	製剤	点眼液	19	14	71	49	18
		眼軟膏	1	1	22	6	5
	使用理由	結膜炎	9	9	31	24	5
		角膜障害	3	3	14	8	9
		その他	6	3	40	21	9
		不明・未記載	2	0	8	2	0
	性	男	7	8	26	27	8
		女	13	7	65	25	14
		不明・未記載	0	0	2	3	1
	年齢	7歳未満	5	7	15	2	0
7～15歳未満		0	2	5	3	1	
15～65歳未満		6	2	41	33	11	
65歳以上		6	2	27	13	11	
不明・未記載		3	2	5	4	0	
平均		39.4歳	19.9歳	42.4歳	44.3歳	53.3歳	
合併症	無	14	11	38	27	13	
	有	5	3	19	10	7	
	不明・未記載	1	1	36	18	3	
併用薬	無	1	7	25	18	2	
	有	18	8	68	37	20	
	不明・未記載	1	0	0	0	1	
副作用の発現状況及び経過	重症度	軽度	8	6	26	6	6
		中等度	9	5	21	12	8
		高度	1	1	11	10	4
		重篤	0	0	2	0	2
		不明・未記載	2	3	33	27	3
	副作用発現までの期間	1～3日	11	15	36	26	9
		4～7日	5	0	13	4	1
		8～14日	2	0	8	7	3
		15日～1ヵ月	0	0	5	2	5
		1ヵ月以上	0	0	5	0	2
不明・未記載		2	0	26	16	3	
平均	3.3日	1.5日	10.4日	4.2日	50.5日		
処置	中止	18	13	64	30	19	
	休薬	0	1	3	0	0	
	継続	0	0	0	0	2	
	不明・未記載	2	1	26	25	2	
転帰	回復	12	10	42	19	9	
	軽快	4	3	20	7	8	
	最終観察時未回復	0	0	1	1	3	
	後遺症	0	0	0	0	1	
	不明・未記載	4	2	30	28	2	
副作用発現から回復までの期間	3日以内	6	3	5	10	1	
	4～7日	4	3	10	1	6	
	8～14日	3	2	9	5	4	
	15日～1ヵ月	2	0	4	1	3	
	1ヵ月以上	0	1	3	0	1	
	不明・未記載	1	4	31	9	2	
平均	6.8日	9.1日	12.7日	4.7日	11.9日		

\*1：眼瞼炎、眼瞼皮膚炎、眼瞼発赤、眼瞼腫脹、眼瞼浮腫

\*2：結膜炎、結膜充血、結膜浮腫

\*3：表層角膜炎、角膜上皮障害、角膜炎、角膜びらん

#### (4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

〔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

<解説>

動物における maximization test をはじめとする抗原性に関する実験ではオフロキサシン（OFLX）に抗原性は認められていないが、市販後、タリビッド眼軟膏 0.3%・タリビッド点眼液 0.3%でショック、アナフィラキシー様症状、発疹、蕁麻疹、眼瞼炎、眼瞼皮膚炎が報告されているため、本剤の成分による過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。

また、類似の化学構造を有する他のキノロン系抗菌剤による過敏症の既往歴のある患者に本剤を投与した場合、その化学構造から交差過敏を起こす可能性があるため、これらの患者にも投与を避ける必要がある。

#### 9. 高齢者への投与

該当しない（特に設定されていない）

##### タリビッド点眼液 0.3%

使用成績調査結果では、65歳以上の高齢者の副作用発現率は0.43%（17/3,932例）であり、全体の副作用発現率0.32%（40/12,477例）と同等であった。また、65歳未満の副作用発現率と比較し有意差は認められなかった。

##### タリビッド眼軟膏 0.3%

使用成績調査結果では、65歳以上の高齢者の副作用発現率は0.59%（4/680例）であり、全体の副作用発現率0.59%（13/2,210例）と同等であった。また、65歳未満の副作用発現率と比較し有意差は認められなかった。

#### 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

##### 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〕

<解説>

妊産婦への使用経験が少なく、安全性が確立されていないことから記載した。

<参考>

##### FDA Pregnancy Category : C

使用成績調査結果では、妊婦35例（点眼液24例、眼軟膏11例）において副作用の発現は認められなかった。なお、追跡調査は出来なかった。

#### 11. 小児等への投与

該当しない（特に設定されていない）

##### タリビッド点眼液 0.3%

使用成績調査結果では、15歳未満の小児の副作用発現率は0.19%（4/2,155例）であり、全体の副作用発現率0.32%（40/12,477例）と

同等であった。小児に発現した副作用症状は過敏反応と考えられるもの（眼瞼炎、結膜充血、眼瞼腫脹、そう痒感）であり、小児における使用成績において特に問題となる事項は認められなかった。

#### タリビッド眼軟膏 0.3%

使用成績調査結果では、15歳未満の小児に対する症例数377例中副作用は発現しておらず、小児における使用成績において特に問題となる事項は認められなかった。

#### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない（特に設定されていない）

#### 13. 過量投与

該当しない（特に設定されていない）

#### 14. 適用上及び薬剤交付時の注意 （患者等に留意すべき 必須事項等）

##### 適用上の注意

- 1)投与経路：点眼用にのみ使用すること。
- 2)投与时：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。（点眼液のみ）

##### <解説>

- 1)点眼剤の一般的な適用上の注意であることから記載した。

本剤は点眼剤であるので、その他の投与経路では用いないようにすること。

- 2)薬剤交付時の患者さんへの指導事項を記載した。

点眼のとき、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する恐れがある。薬液の汚染及び二次的な感染を防止するために記載した。

#### 15. その他の注意

該当しない（特に設定されていない）

#### 16. その他

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 一般薬理

マウス、ラット、モルモット、ウサギ、ネコ、イヌを用いて中枢神経系、呼吸循環器系、自律神経系、平滑筋その他に及ぼす影響について検討した結果、臨床上特に問題となる著明な作用は認められなかった<sup>41)</sup>。

### 2. 毒性

#### (1) 単回投与毒性試験<sup>42)</sup>

動物種		LD <sub>50</sub> (mg/kg)		
		経口	静脈内	皮下
マウス	雄	5450	208	>10000
	雌	5290	233	
ラット	雄	3590	273	7070
	雌	3750	276	9000
イヌ		>200	>70	—
サル	雄	500~1000	—	—

#### (2) 反復投与毒性試験

##### 1) 4週間投与（ラット、イヌ、サル）

ラットにおけるオフロキサシンの最大無作用量は、4週間経口投与で90mg/kg/dayであった。270mg/kg/dayでは流涎、軟便、粗毛、体重増加抑制、摂餌量減少、摂水量増加、尿中Na<sup>+</sup>低下が観察された。さらに810mg/kg/dayでは血清AL-P上昇、関節軟骨表層部基質の粗しょう化も認められた<sup>43)</sup>。

イヌにおけるオフロキサシンの最大無作用量は、4週間経口投与で12.5mg/kg/dayであった。50mg/kg/dayでは嘔吐、流涎、自発運動低下などの症状が観察され、病理所見として関節軟骨の水疱およびびらん形成、胸腺の萎縮が認められた。200mg/kg/dayではこれらのほかに脱水性あるいは低栄養性の諸変化が認められ、1例が重篤な脱水症状を示し瀕死状態に陥った<sup>44)</sup>。

サルにおけるオフロキサシンの最大無作用量は、4週間経口投与で20mg/kg/dayであった。20mg/kg/dayでは少数例にごく一過性の下痢が認められたが、全般的には投与による悪影響を示唆する所見は認められなかった。60および180mg/kg/dayでは下痢が頻発し、特に180mg/kg/dayでは下痢症状の著しかった2例が急性胃拡張または電解質平衡の乱れを呈して死亡した。他に各投与群を通じて、本剤による菌交代現象と思われるカンジダ症が散見され、また60および180mg/kg/dayの少数例に肝細胞および核の軽度の腫大が認められた。

##### 2) 26週間投与（ラット）および12ヵ月投与（サル）

ラットにおけるオフロキサシンの最大無作用量は、26週間経口投与で30mg/kg/dayであった。90mg/kg/dayでは流涎、盲腸拡張および大腿骨顆の自然発生病変の増強が認められた。270mg/kg/dayではこれらに加えて軟便、副腎束状帯細胞の脂質の増加が観察された<sup>45)</sup>。

サルに 40mg/kg/day を 12 ヶ月経口投与した結果、一般観察、臨床検査、臓器重量、部検所見を通じて本剤に起因すると考えられる変化は認められず、オフロキサシンの最大無作用量は 40mg/kg/day と考えられた。

### (3) 生殖発生毒性試験<sup>46)</sup>

#### 1) 妊娠前・妊娠初期

ラットを用いた経口投与(10~360mg/kg/day)では雌雄の生殖能力、胎児への影響は認められなかった。

#### 2) 器官形成期

ラットを用いた経口投与(10~810mg/kg/day)では 10mg/kg/day では胎児に対する影響は認められなかったが、90mg/kg/day 以上では胎児の発育抑制が、また 810mg/kg/day では胎児に骨格変異の出現が認められたが、いずれの用量においても催奇形成作用は認められなかった。

ウサギを用いた経口投与(10~160mg/kg/day)では催奇形成作用は認められなかった。

#### 3) 周産期・授乳期

ラットを用いた経口投与(10~360mg/kg/day)では母動物の分娩および出生後の児への影響は認められなかった。

### (4) その他の特殊毒性

#### 1) 抗原性<sup>47)</sup>

モルモットを用いた全身アナフィラキシー反応、同種 PCA 反応、受身血球凝集反応、寒天ゲル内沈降反応、ウサギを用いた異種 PCA 反応、受身血球凝集反応およびマウスを用いた特異的 IgE 抗体産生に関する検討においては抗原性は認められなかった。

#### 2) 変異原性<sup>48)</sup>

*B.subtilis* を用いた rec-assay において陽性の成績が得られたことから DNA 損傷作用が疑われたが、チャイニーズ・ハムスター培養細胞およびヒト末梢血リンパ球を用いた姉妹染色分体交換 (SCE) 試験、ヒト胎児細胞を用いた不定期 DNA 合成 (UDS) 試験ではいずれも陰性の成績が得られ、哺乳動物細胞に対しては DNA 損傷作用を持たないことが明らかとなった。また、*S.typhimurium* および *E.coli* を用いた復帰変異試験、ヒト末梢血リンパ球を用いた *in vitro* および *in vivo* 染色体異常試験、マウス小核試験においても本剤は突然変異誘発作用を示さなかった。

#### 3) 聴器に対する影響

モルモットに 4 週間経口投与し、聴覚検査、聴器の光顕的および走査電顕的検査を行った結果、200mg/kg/day の用量で異常は認められなかった。

#### 4) 皮膚(光)感作性

モルモットを用いたマキシマイゼーション試験において、1%皮内投与および 25%皮膚塗布により感作した場合には陰性であった。

## 6) 眼刺激性

### 点眼液

白色ウサギ (pH6.0~6.6 の 0.3%点眼液を 1 回 1 滴、1 時間間隔 1 日 8 回 7 日間点眼) を用いた試験において、眼科学的検査、走査型電子顕微鏡による角膜上皮細胞最表層の微細構造に変化は認められなかった<sup>49,50)</sup>。

白色ウサギ (0.3%点眼液を 1 回 1 滴、1 日 3 回 3 週間点眼) を用いた試験において、透過型および走査型電子顕微鏡による角膜、結膜、前房隅角、虹彩、水晶体、毛様体および網膜のいずれの組織にも変化は認められなかった<sup>51)</sup>。

白色ウサギ (0.3~0.5%点眼液を 1 回 1 滴、2 時間間隔 1 日 4 回点眼を 1 ヶ月間) を用いた試験において、眼科学的検査、病理組織学的検査、走査型電子顕微鏡による角膜上皮細胞最表層の微細構造に変化は認められなかった<sup>50,52)</sup>。

有色ウサギ (0.3%点眼液を 1 回 1 滴、3 時間間隔 1 日 3 回点眼を 2 週間) を用いた試験において、眼科学的検査、病理組織学的検査に変化は認められなかった。

イヌ (0.3%点眼液を 1 回 1 滴、3 時間間隔 1 日 3 回点眼を週 5 日 12 ヶ月間) を用いた試験において、眼科学的検査、病理組織学的検査に変化は認められなかった<sup>53)</sup>。

白色ウサギにおけるオフロキサシン点眼液の強制劣化製剤 (0.3%点眼液、40°C75%6 ヶ月保存品に 30 万 lx・hr 照射) を 1 回 1 滴、30 分間隔 1 日 10 回点眼した試験において、眼科学的検査に変化は認められなかった。

### 眼軟膏

イヌ (0.3%眼軟膏を 1 回約 40mg、1 時間間隔 1 日 10 回投与) を用いた試験において、眼科学的検査に変化は認められなかった。また、オフロキサシン眼軟膏の強制劣化製剤 (0.3%眼軟膏、40°C75%10 ヶ月保存品に 6 時間 UV 照射) でも同様に変化は認められなかった<sup>54)</sup>。

イヌ (0.3%眼軟膏を 1 回約 40mg、3 時間間隔 1 日 3 回投与を 3 ヶ月間) を用いた試験において、眼科学的検査、病理組織学的検査に変化は認められなかった<sup>55)</sup>。

## X. 取扱い上の注意等に関する項目

- | 1. 有効期間又は使用期限                   | 使用期限：3年   |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
|---------------------------------|---|---------------|--------------------------------|---------------|----------------|---------------|------------|------------|------------------|---------------|--|------------------|------|----------|------------|--------------|----------|--------------|
| 2. 貯法・保存条件                      | 気密容器、室温保存   |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 3. 薬剤取扱い上の注意点                   | 処方せん医薬品（注意－医師等の処方せんにより使用すること）   |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 4. 承認条件                         | 該当しない   |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 5. 包装                           | <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <tr> <td style="width: 50%;">タリビッド点眼液 0.3%</td> <td>プラスチック点眼容器：5mL×10本、<br/>5mL×50本</td> </tr> <tr> <td>タリビッド眼軟膏 0.3%</td> <td>3.5g チューブ入×10本</td> </tr> </table>  | タリビッド点眼液 0.3% | プラスチック点眼容器：5mL×10本、<br>5mL×50本 | タリビッド眼軟膏 0.3% | 3.5g チューブ入×10本 |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| タリビッド点眼液 0.3%                   | プラスチック点眼容器：5mL×10本、<br>5mL×50本  |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| タリビッド眼軟膏 0.3%                   | 3.5g チューブ入×10本  |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 6. 同一成分・同効薬                     | <p>同一成分薬：タリビッド錠 100mg、タリビッド耳科用液 0.3%</p> <p>同効薬：レボフロキサシン水和物</p>   |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 7. 国際誕生年月日                      | 1985年4月16日  |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号             | <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th colspan="2"></th> <th style="text-align: center;">製造承認年月日</th> <th style="text-align: center;">承認番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td colspan="2">タリビッド点眼液 0.3%</td> <td rowspan="2" style="text-align: center;">2006年7月21日</td> <td style="text-align: center;">21800AMX10514000</td> </tr> <tr> <td colspan="2">タリビッド眼軟膏 0.3%</td> <td style="text-align: center;">21800AMX10516000</td> </tr> <tr> <td rowspan="2" style="text-align: center;">旧販売名</td> <td style="text-align: center;">タリビッド点眼液</td> <td rowspan="2" style="text-align: center;">1987年6月30日</td> <td style="text-align: center;">(62AM)第1011号</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">タリビッド眼軟膏</td> <td style="text-align: center;">(62AM)第1012号</td> </tr> </tbody> </table> |               |                                | 製造承認年月日       | 承認番号           | タリビッド点眼液 0.3% |            | 2006年7月21日 | 21800AMX10514000 | タリビッド眼軟膏 0.3% |  | 21800AMX10516000 | 旧販売名 | タリビッド点眼液 | 1987年6月30日 | (62AM)第1011号 | タリビッド眼軟膏 | (62AM)第1012号 |
|                                 |   | 製造承認年月日       | 承認番号                           |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| タリビッド点眼液 0.3%                   |   | 2006年7月21日    | 21800AMX10514000               |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| タリビッド眼軟膏 0.3%                   |   |               | 21800AMX10516000               |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 旧販売名                            | タリビッド点眼液  | 1987年6月30日    | (62AM)第1011号                   |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
|                                 | タリビッド眼軟膏  |               | (62AM)第1012号                   |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 9. 薬価基準収載年月日                    | <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <tbody> <tr> <td style="width: 50%;">タリビッド点眼液 0.3%</td> <td rowspan="2" style="text-align: center;">2006年12月8日</td> </tr> <tr> <td>タリビッド眼軟膏 0.3%</td> </tr> <tr> <td rowspan="2" style="text-align: center;">旧販売名</td> <td style="text-align: center;">タリビッド点眼液</td> <td rowspan="2" style="text-align: center;">1987年8月28日</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">タリビッド眼軟膏</td> </tr> </tbody> </table>  | タリビッド点眼液 0.3% | 2006年12月8日                     | タリビッド眼軟膏 0.3% | 旧販売名           | タリビッド点眼液      | 1987年8月28日 | タリビッド眼軟膏   |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| タリビッド点眼液 0.3%                   | 2006年12月8日  |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| タリビッド眼軟膏 0.3%                   |   |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 旧販売名                            | タリビッド点眼液  | 1987年8月28日    |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
|                                 | タリビッド眼軟膏  |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 10. 効能・効果追加、用法用量変更追加等の年月日及びその内容 | <p>1989年6月1日 効能追加（タリビッド眼軟膏 0.3%）</p> <p>適応菌種：クラミジア・トラコマティス</p> <p>適応症：トラコーマ</p>   |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |
| 11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容      | <p>1994年12月7日（再審査結果通知 薬発第1053号）</p> <p>薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない（効能・効果、用法・用量等、承認内容に変更はない）。</p>  |               |                                |               |                |               |            |            |                  |               |  |                  |      |          |            |              |          |              |

2004年9月30日（抗菌薬再評価結果通知 薬食発第0930002号）

<適応菌種名、適応疾患名の読替え：タリビッド点眼液0.3%>

変更前	変更後
<p>〔効能・効果〕                      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、ミクロコッカス属、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>〔効能・効果〕                      &lt;適応菌種&gt;                      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                      &lt;適応症&gt;                      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>

<適応菌種名、適応疾患名の読替え：タリビッド眼軟膏0.3%>

変更前	変更後
<p>〔効能・効果〕                      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、ミクロコッカス属、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）、クラミジア・トラコマティ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、トラコーマ</p>	<p>〔効能・効果〕                      &lt;適応菌種&gt;                      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、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）                      &lt;適応症&gt;                      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>

12. 再審査期間

1987年6月30日～1993年6月29日（終了）

13. 長期投与の可否

本剤は厚生労働省告示第97号（平成20年3月19日付）「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

14. 厚生労働省薬価基準収載  
医薬品コード

タリビッド点眼液 0.3%	1319722Q1163
タリビッド眼軟膏 0.3%	1319722M1056

15. 保険給付上の注意

特になし

## X I . 文 献

### 1. 引用文献

1. 諸井黎明他：化学療法領域 5,1517(1989)【57813】
2. ニューキノロン剤 (Levofloxacin, Ofloxacin, Norfloxacin, Lomefloxacin) の溶解度 3 社内資料【50977】
3. 三井幸彦他：日本眼科学会雑誌 92,973(1988)【53727】
4. 井上須美子：日本眼科学会雑誌 90,108(1986)【53731】
5. 塩田洋他：日本眼科学会雑誌 90,1085(1986)【53732】
6. 松村香代子他：日本眼科学会雑誌 90,1090(1986)【53733】
7. 田村修他：日本眼科学会雑誌 90,1094(1986)【53775】
8. 楠島康平他：あたらしい眼科 3,1619(1986)【53777】
9. 三井幸彦他：眼科臨床医報 79,1718(1985)【53723】
10. 三井幸彦他：日本眼科紀要 37,1115(1986)【53725】
11. 三井幸彦他：眼科臨床医報 80,1813(1986)【53724】
12. 青木功喜他：臨床眼科 40,985(1986)【53776】
13. 井上慎三他：あたらしい眼科 3,742(1986)【53730】
14. 原二郎：眼科臨床医報 79,1712(1985)【53768】
15. 原二郎：DE-055 点眼液および眼軟膏の臨床第 1 相追加試験（頻回点眼による安全性について、特に血中濃度についての検討）社内資料【53729】
16. 田村修他：眼科臨床医報 80,1104(1986)【53738】
17. Kato J. et al. : Cell 63,393(1990)【57803】
18. 西野武志他：日本化学療法学会雑誌 32,62(1984)【53722】
19. 佐藤謙一他：CHEMOTHERAPY 32(S-1),1(1984)【53741】
20. 賀川和宣他：CHEMOTHERAPY 32(S-1),52(1984)【53743】
21. 五島嵯智子他：日本化学療法学会雑誌 32,22(1984)【53742】
22. Hoshino K. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 35,309(1991)【50862】
23. Akasaka T. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 42,1284(1998)【57802】
24. 三井幸彦他：日本眼科学会雑誌 90,1074(1986)【53726】
25. 出口浩一他：Jpn. J. Antibiot. 46,349(1993)【53765】
26. Nagayama A. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 32,1735(1988)【57811】
27. Sato K. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 22,548(1982)【57810】
28. Tanaka M. et al. : Arzneim.-Forsch. Drug Res. 39,750(1989)【50864】
29. 泰野寛他：眼科臨床医報 79,1553(1985)【53744】
30. 中村聡他：緑膿菌性角膜潰瘍に対する DE-055(ofloxacin)眼軟膏の予防および治療効果に関する実験的研究－DE-055 点眼液との比較－社内資料【53745】
31. 松村香代子他：臨床眼科 45,1265(1991)【53762】
32. 一原規方他：CHEMOTHERAPY 32(S-1),118(1984)【53938】
33. 岡崎治他：CHEMOTHERAPY 32(S-1),1185(1984)【53940】
34. 松田静治他：CHEMOTHERAPY 32(S-1),900(1984)【53941】
35. 山元貴雄他：CHEMOTHERAPY 32(S-1),944(1984)【53942】

36. 津村光義他：基礎と臨床 19,5723(1985)【53912】
37. 川原和也：CHEMOTHERAPY 38,461(1990)【57812】
38. 福田正道他：日本眼科紀要 37,823(1986)【53737】
39. 植村攻他：Ofloxacin 眼軟膏の家兎眼組織内移行 社内資料【53736】
40. 三井幸彦他：あたらしい眼科 10,83(1993)【53812】
41. 小島浩他：日本化学療法学会雑誌 32,1148(1984)【53746】
42. 大野広志他：日本化学療法学会雑誌 32,1084(1984)【53734】
43. 小野寺威他：日本化学療法学会雑誌 32,1091(1984)【53747】
44. 野村護他：日本化学療法学会雑誌 32,1105(1984)【53748】
45. 加藤道幸他：日本化学療法学会雑誌 32,1122(1984)【53749】
46. Takayama S.：Arzneim.-Forsch. Drug Res. 36,1244(1986)【53883】
47. 高見光孝他：日本化学療法学会雑誌 32,1171(1984)【53750】
48. 島田弘康他：日本化学療法学会雑誌 32,1162(1984)【53751】
49. 山内秀泰他：日本眼科紀要 36,2138(1985)【53772】
50. 山本義為他：日本眼科紀要 36,2116(1985)【53771】
51. 瀬川雄三他：眼科臨床医報 79,2278(1985)【53740】
52. 山内秀泰他：日本眼科紀要 36,2302(1985)【53739】
53. 澤健治郎他：あたらしい眼科 10,1733(1993)【53820】
54. 疋田光史：0.3% Ofloxacin 眼軟膏および 0.3% Ofloxacin 眼軟膏保存品のイヌにおける眼刺激性試験 社内資料【53735】
55. 澤健治郎他：あたらしい眼科 10,1035(1993)【53818】

## 2. その他の参考文献

第十五改正日本薬局方解説書

## X II . 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

2009年11月現在

#### タリビッド点眼液 0.3%

国名	販売名	会社名	発売年	規格	効能・効果	用法・用量
中国	Tarivid	参天製薬（中国）有限公司	1989年	3mg/mL ×5mL	日本と同じ	日本と同じ
香港		Hong Kong Medical Supplies Ltd.	1990年			
韓国		Taejoon Pharm. Co., Ltd.	1992年		日本（再評価前）と同じ	* <sup>1</sup>
	Je Il Pharmaceutical Co., Ltd.					
フィリピン	Inoflox	United Laboratories Inc.	1996年		日本と同じ	日本と同じ
台湾	Oflovid	大明産業股份有限公司	1998年			
ベトナム		DKSH Vietnam Co., Ltd.	1999年			
インドネシア	Tarivid	PT. Ferron Par Pharmaceuticals	2003年	* <sup>2</sup>		

#### タリビッド眼軟膏 0.3%

国名	販売名	会社名	発売年	規格	効能・効果	用法・用量
中国	Tarivid	参天製薬（中国）有限公司	1989年	3mg/g ×3.5g	日本と同じ	日本と同じ
香港		Hong Kong Medical Supplies Ltd.	1990年			
韓国		Taejoon Pharm. Co., Ltd.	1993年		日本（再評価前）と同じ	* <sup>1</sup>
台湾	Oflovid	大明産業股份有限公司	1998年			
ベトナム		DKSH Vietnam Co., Ltd.	1999年		日本と同じ	

\*<sup>1</sup>：術後感染症に関する投与方法併記

\*<sup>2</sup>：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、涙嚢炎、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎、角膜潰瘍

\*<sup>3</sup>：細菌性結膜炎の場合下記を推奨する。

1日目と2日目：1回1、2滴を2～4時間毎に患眼に点眼する。

3日目から7日目：1回1、2滴を1日4回点眼する。

細菌性角膜潰瘍の場合下記を推奨する。

1日目と2日目：1回1、2滴を、起床中30分毎、及び就寝後おおよそ4時間後と6時間後に患眼に点眼する。

3日目から7～9日目：1回1、2滴を起床中1時間毎に点眼する。

7～9日目から治療終了まで：1回1、2滴を1日4回点眼する。

### X Ⅲ. 備考

#### 1. その他の関連資料