

** 2006年12月改訂 (第6版、販売名変更)
* 2005年10月改訂

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

日本標準商品分類番号

871319

** 承認番号	21800AMX10514000
** 薬価収載	2006年12月
販売開始	1987年9月
再審査結果	1994年12月
再評価結果	2004年9月

貯 法 : 気密容器、室温保存
使用期限 : 外箱及びラベルに記載 (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	タリビッド点眼液0.3%
有効成分	オフロキサシン
含量(1 mL中)	3 mg
添加物	塩化ナトリウム、pH調節剤
pH	6.0~7.0
浸透圧比	0.95~1.15
性状	微黄色~淡黄色澄明、無菌水性点眼剤

〔効能・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

〔用法・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・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

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)

1) 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

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	頻度	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

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 : 点眼用にのみ使用すること。
- 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〕

1. 血中濃度¹⁾

健康成人眼に本剤を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 µg/mL、0.034 µg/mLを示し、その後徐々に減少した。

2. 眼内移行²⁾

白内障手術患者に本剤を術前5分毎5回点眼した場合の房水中濃度は、最終点眼後1時間前後に最高値(1.20 µg/mL)を示した。

3. 動物における眼組織内移行

(参考 : 白色家兎、犬)

本剤を正常白色家兎眼に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、その移行量の最高値は角膜、強膜、眼筋、虹彩・毛様体では1時間値が最高でそれぞれ、3.32 µg/g、1.62 µg/g、2.62 µg/g、0.95 µg/gであった。球結膜では15分値が最高で2.95 µg/g、また、前房水では30分値が最高で0.71 µg/mLであった。正常白色家兎眼に1回1滴、5分毎に5回点眼したとき、上記の1回点眼したときと同様に眼組織へ良好な移行が認められ、点眼終了5分後に最高値を示したのは、角膜、強膜、球

結膜、硝子体であり、それぞれの値は、7.78 µg/g、7.66 µg/g、34.98 µg/g、0.95 µg/mLであった。また、眼筋では15分値が18.54 µg/g、虹彩・毛様体では30分値が3.12 µg/g、前房水では1時間値が3.56 µg/mLで最高値を示した²⁾。
 オフロキサシンの光学活性体(ℓ体)であるレボフロキサシン水和物の0.3%点眼液をビーグル犬に1回1滴、1日4回、2週間連続点眼したとき、最終点眼24時間後の眼組織内濃度は、虹彩・毛様体で39.4 µg/g、脈絡膜・網膜色素上皮で12.3 µg/gであり、眼組織のうちメラニン色素を含む組織には高度に分布することが認められた。一方、色素上皮を除く網膜への移行はわずかであった³⁾。

〔臨床成績〕

1. 疾患別臨床効果^{1)~6)}

外眼部感染症を対象に実施した本剤の二重盲検及び封筒法による比較試験を含む臨床試験391症例における各疾患別臨床効果は下表のとおりであった。

疾患名	有効率*(%)[有効以上]
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)

※複数の疾患が合併している場合は各々の疾患に1例として算入

2. 有効菌種別臨床効果^{1)~6)}

上記の391症例における有効菌種別臨床効果は下表のとおりである。

菌 種	有効率*(%)[有効以上]
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)
ミ 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

3. 眼科周術期の無菌化療法に対する効果⁷⁾

眼手術患者367例において周術期の無菌化療法として本剤を使用したところ、全例とも術後感染はみられなかった。

〔薬効薬理〕

1. 作用機序⁸⁾

オフロキサシンは細菌のDNA合成を特異的に阻害すると考えられており、抗菌作用は殺菌的でMIC濃度で溶菌が認められた。

2. 抗菌作用^{5), 6), 8)}

オフロキサシンの抗菌スペクトラムは広範囲に及び、本剤は

*in vitro*でブドウ球菌属、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。

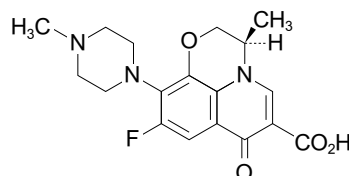
〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名：オフロキサシン (Ofloxacin)

略 号：OFLX

化学名：(3RS)-9-Fluoro-3-methyl-10-(4-methylpiperazin-1-yl)-7-oxo-2,3-dihydro-7H-pyrido[1,2,3-de]-[1,4]benzoxazine-6-carboxylic acid

構造式：



及び鏡像異性体

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)

〔包 装〕

プラスチック点眼容器 5 mL×10本
5 mL×50本

〔主要文献及び文献請求先〕

<主要文献>

- 原 二郎：DE-055点眼液および眼軟膏の臨床第一相追加試験(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)、参天製薬(株)社内資料 [53729]
- 福田正道他：日本眼科紀要 37, 823(1986) [53737]
- 伊吹 肇他：あたらしい眼科 10, 2071(1993) [50828]
- 三井幸彦他：眼科臨床医報 79, 1718(1985) [53723]
- 三井幸彦他：眼科臨床医報 80, 1813(1986) [53724]
- 三井幸彦他：日本眼科紀要 37, 1115(1986) [53725]
- 田村 修他：眼科臨床医報 80, 1104(1986) [53738]
- 西野武志他：Chemotherapy 32(S-1), 62(1984) [53722]

<文献請求先>

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ください。
 参天製薬株式会社 医薬事業部 医薬情報室
 〒533-8651(個別郵便番号) 大阪市東淀川区下新庄3-9-19
 電話 06-6321-7056

*製造販売元

参天製薬株式会社
 大阪市東淀川区下新庄3-9-19

提 携

第一三共株式会社
 Daiichi-Sankyo 東京都中央区日本橋本町3-5-1