

広範囲抗菌点眼剤

ファルキサシン[®]点眼液0.3%

PHARXACIN Ophthalmic Solution 0.3%

(オフロキサシン点眼液)

規制区分：処方箋医薬品
注意-医師等の処方箋
により使用すること
貯法：室温保存
使用期限：外箱及びラベルに記載

承認番号	21300AMZ00162
薬価収載	2001年7月
販売開始	2002年12月
再評価結果	2004年9月

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	ファルキサシン点眼液0.3%
成分・含量	1mL中 オフロキサシン 3mg
添加物	塩化Na、塩酸、水酸化Na
容量	5mL
色調・剤形	微黄色～淡黄色澄明・無菌水性点眼剤
pH	6.0～7.0
浸透圧比	0.95～1.15(生理食塩液に対する比)
識別コード	PH010

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、プロピデンシア属、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、ステプトロホモナス(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

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

ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明):ショック、アナフィラキシー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。

	頻度不明
過敏症	発疹、蕁麻疹、眼瞼炎(眼瞼発赤・浮腫等)、眼瞼皮膚炎、痒痒感
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

[参考]

眼組織内移行(ウサギ)¹⁾

ファルキサシン点眼液0.3%及び標準製剤(点眼剤、0.3%)各50 μ L(オフロキサシンとして0.15mg)をウサギ眼結膜嚢内に点眼した後、経時的に房水中のオフロキサシン濃度を測定した。その結果、いずれの製剤においても点眼15分後より眼房水中にオフロキサシンが検出され、1時間後に最高値が認められた。両製剤間には、いずれの採取時間においても有意差は認められず、ウサギ眼房水中への良好な薬物移行が確認された。

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ILING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.生物学的同等性試験²⁾

(1)実験的角膜感染症に対する治療効果

緑膿菌を接種したウサギの実験的角膜感染症に対して、ファルキサシン点眼液0.3%、標準製剤及び対照群として点眼液基剤各50 μ Lを菌接種後6時間後から2時間ごとに1日6回、3日間点眼し、角膜混濁の度合い(スコア)を指標として感染症に対する治療効果を比較検討した。本剤、標準製剤及び対照群について得られたスコアの平均値及び標準偏差を算出し、Kruskal-WallisのH検定(有意な場合Tukey法による多重比較検定)により統計解析を実施した。その結果、

対照群においては、平均スコアは菌接種後から徐々に増加し、2日目以降は角膜混濁が角膜全体に増加する変化が全眼に認められたが、本剤及び標準製剤のスコアは対照群と比較して有意な低値を示し、また両製剤間におけるスコアの推移は同様で有意差は認められず、生物学的な同等性が確認された。

(2) 緑膿菌分離試験

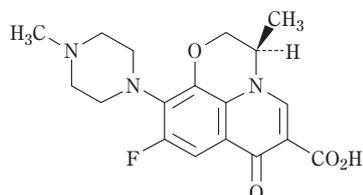
前項の角膜感染症に対する治療効果の観察終了後、角膜を摘出し緑膿菌の分離試験を行い、陽性及び陰性数を算出し、Fisherの直接確率計算法により統計解析を実施した。その結果、対照群10眼全てが陽性を示したのに対して、本剤及び標準製剤は10眼中1眼のみが陽性であり、対照群との間に有意差が認められたことから、優れた抗菌効果が認められ、両製剤の生物学的な同等性が確認された。

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)

化学名：(3*RS*)-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：



及び鏡像異性体

分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄

分子量：361.37

融点：約265°C (分解)

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。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。水酸化ナトリウム試液溶液(1→20)は旋光性を示さない。光によって変色する。

取扱い上の注意

*安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(25°C、相対湿度60%、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ファルキサシン点眼液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確認された。

包装

5mL × 10本

主要文献

- 1) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：ファルキサシン点眼液0.3%の生物学的同等性試験に関する資料(眼組織内移行)
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：ファルキサシン点眼液0.3%の生物学的同等性試験に関する資料(実験的角膜感染症に対する治療効果)
- 3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：ファルキサシン点眼液0.3%の安定性試験に関する資料

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。

興和株式会社 医薬事業部 医薬学術部

〒103-8433 東京都中央区日本橋本町3-4-14

製品情報お問い合わせ先

興和株式会社 医薬事業部 くすり相談センター

電話 0120-508-514

03-3279-7587

受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

発売元 興和株式会社 東京都中央区日本橋本町三丁目4-14

販売元 興和創薬株式会社 東京都中央区日本橋本町三丁目4-14

製造販売元 キョーリンリメディオ株式会社 富山県南砺市井波885番地