

流涙症治療点眼剤

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液

ラクリミン®点眼液0.05%

Lacrimin® ophthalmic solution

Santen

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.1 本剤の成分又は安息香酸エステル(コカインを除く)系局所麻酔剤に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ラクリミン点眼液0.05%
有効成分	1mL中 オキシブプロカイン塩酸塩 0.5mg
添加剤	ポリビニルアルコール(部分けん化物)、ベンザルコニウム塩化物、エデト酸ナトリウム水和物、塩化ナトリウム、pH調節剤

3.2 製剤の性状

販売名	ラクリミン点眼液0.05%
pH	4.0~5.0
浸透圧比	1.0~1.2
性状	無色澄明、無菌水性点眼剤

4. 効能・効果

分泌性流涙症

6. 用法・用量

1日2~5回、1回1~2滴を点眼する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

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のみ投与すること。

9.6 授乳婦

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。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック(頻度不明)

11.2 その他の副作用

	1~5%未満	頻度不明
眼	びらん・混濁・剥離等の角膜障害、眼のそう痒感、眼瞼炎	結膜充血

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物はソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、ソフトコンタクトレンズを装着している場合には、点眼前にレンズを外し、点眼後少なくとも5~10分間の間隔をあけて再装着すること。
- ・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こと。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。

16. 薬物動態

16.3 分布

ウサギ摘出角膜を1%オキシブプロカイン塩酸塩液に3分間浸した後に組織の薬物濃度を測定すると、角膜上皮では70.6mg/100mL、角膜実質では7.55mg/100mLであり、上皮では実質の約10倍の取り込みが認められた。

また、同様にウサギ摘出角膜を1%オキシブプロカイン塩酸塩液に3分間浸した後、1分、15分及び30分放置してから角膜中の薬物濃度を測定すると、1分放置後では21.95mg/100mL、15分放置後では1分値の約1/3の7.39mg/100mLとなり、30分放置後では4.24mg/100mLにまで低下した¹⁾ (*in vitro*)。

16.4 代謝

ヒト血清にオキシブプロカイン塩酸塩を加え37℃でインキュベートすると、N-ジエチルアミノエタノールと3-ブトキシ-4-アミノ安息香酸に速やかに分解された²⁾ (*in vitro*)。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

6施設で実施した二重盲検比較試験において、分泌性流涙症135例に本剤又はプラセボ点眼液を1回1~2滴、1日3~5回、約1ヶ月点眼した結果、本剤の有効率(有効以上)は77.8%(56/72例)であり、危険率0.5%でプラセボ点眼液に対し有意に優れていた。

副作用は認められなかった³⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

結膜及び角膜の知覚麻痺並びに三叉神経反射弓の一過性遮断により涙液分泌を抑制する。

18.2 涙液分泌抑制作用

白色ウサギに本剤を1滴ずつ5分毎に6回連続点眼し、最終点眼2分後に涙液分泌量を毛細管比色法で測定した結果、生理食塩液に比べ、約30%の涙液分泌の抑制が認められた⁴⁾。この涙液分泌抑制作用は表面麻酔剤点眼による結膜及び角膜の知覚麻痺並びに三叉神経反射弓の一過性遮断によるものと考えられる⁵⁾。

18.3 局所知覚麻痺作用

本剤の局所知覚麻痺作用をウサギ角膜反射法により調べた結果、1回点眼ではほとんど知覚麻痺が認められないが、5分毎に連続点眼すると3回目から効果があらわれ、6回連続点眼後では約6分間持続する麻痺効果が認められた⁴⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：オキシブプロカイン塩酸塩(Oxybuprocaine Hydrochloride)

化学名：2-(Diethylamino)ethyl 4-amino-3-butyloxybenzoate monohydrochloride

分子式：C₁₇H₂₈N₂O₃·HCl

分子量：344.88

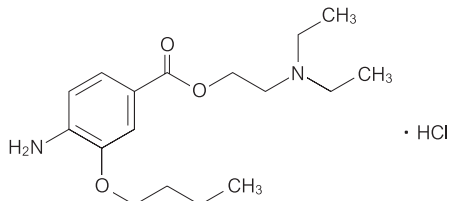
性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は塩辛く、舌を麻痺する。

本品は水に極めて溶けやすく、エタノール(95)又はクロロホルムに溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは5.0~6.0である。

本品は光によって徐々に着色する。

構造式：



22. 包装

プラスチック点眼容器 5mL×10本

23. 主要文献

- 1) Schlegel, H. E. et al. : Arch. Ophthalmol. 1954 ; 51 : 663-670 [50666]
- 2) Iselin, H. et al. : Schweiz. med. Wschr. 1966 ; 96 : 219-222 [50671]
- 3) 生井浩他 : 眼科臨床医報 1973 ; 67 : 758-762 [52287]
- 4) 社内資料 : ラクリミン点眼液の局所麻痺作用および涙液分泌におよぼす影響 [52284]
- 5) 生井浩 : 眼科臨床医報 1969 ; 63 : 403-405 [52285]

24. 文献請求先及び問い合わせ先

参天製薬株式会社 製品情報センター
〒530-8552(個別郵便番号) 大阪市北区大深町4-20
TEL 0120-921-839 06-7664-8624
受付時間 9:00~17:00(土・日・祝日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

参天製薬株式会社
大阪市北区大深町4-20