

眼科用表面麻酔剤

オキシブプロカイン塩酸塩点眼液

オキシブプロカイン塩酸塩ミニ点眼液0.4%「参天」

Oxybuprocaine Hydrochloride Mini ophthalmic solution「Santen」

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	オキシブプロカイン塩酸塩ミニ点眼液0.4% 「参天」
有効成分	1mL中 オキシブプロカイン塩酸塩 4mg
添加剤	塩化ナトリウム、ポリビニルアルコール(部分 けん化物)、pH調節剤

3.2 製剤の性状

販売名	オキシブプロカイン塩酸塩ミニ点眼液0.4% 「参天」
pH	4.0~5.0
浸透圧比	0.9~1.1
性状	無色~わずかに黄褐色澄明、無菌水性点眼剤

4. 効能・効果

眼科領域における表面麻酔

5. 効能・効果に関連する注意

鎮痛のみの目的に使用しないこと。

6. 用法・用量

通常成人では1~4滴を点眼する。

なお、年齢、体質により適宜増減する。

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、使用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。

9.6 授乳婦

使用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。

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

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、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

悪心、顔面蒼白、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。

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	過敏症状
眼	角膜びらん

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

- ・開封時の容器破片除去のため、使用の際は、最初の1~2滴は点眼せずに捨てること。
- ・角膜障害等の副作用をおこすことがあるので、頻回に使用しないこと。
- ・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。
- ・鎮痛等を目的とした使用を防止するため、患者には渡さないこと。
- ・保存剤を含有しないため、開封後は1回きりの使用とし、残液は廃棄すること。

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°C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

白内障囊外摘出術、虹彩切除術、切裂術、水晶体囊虹彩切開術等の諸種内眼手術施行例22例を対象に、局所麻酔剤として0.4%オキシブプロカイン塩酸塩点眼液を2分おきに6~7滴点

眼し、血管収縮剤として1000倍アドレナリン液を併用して内眼手術を行った結果、十分無痛に手術を行うことができた。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神経における神経インパルスの発生と伝導を可逆的に抑制し、一過性に遮断する。

18.2 麻酔作用

18.2.1 麻酔効果の発現及び持続時間

健康人5例10眼に0.4%オキシブプロカイン塩酸塩点眼液を1滴点眼し、Freyの角膜知覚測定法に従い3g/mm²の圧迫力をもつ毛髪で角膜中央部を圧迫したときの角膜知覚消失を基準として麻酔効果を判定した。その結果、0.4%オキシブプロカイン塩酸塩点眼液の麻酔効果発現時間は平均16秒、麻酔持続時間は平均13分51秒であった⁴⁾。

18.2.2 表面麻酔強度

ウサギの角膜反射消失作用を指標としたオキシブプロカイン塩酸塩の表面麻酔強度はコカインの約20倍であった⁵⁾。

18.3 生物学的同等性

正常ウサギを用いて角膜知覚に対する表面麻酔作用を検討し、得られた作用開始時間、及び作用持続時間について統計解析を行った。その結果、主要評価項目である作用持続時間に関して、本剤及びベノキシール点眼液0.4% (標準製剤)の平均値の差の90%信頼区間は、標準製剤の平均値の±0.30の範囲内であったことから、本剤は標準製剤と生物学的に同等であることが確認された⁶⁾。

	作用開始時間 (秒)	作用持続時間 (分)
本剤	21.3±7.9	41.4±11.3
ベノキシール点眼液0.4%(標準製剤)	21.4±6.2	44.5±12.2

(平均値±標準偏差 n=28)

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-butylxybenzoate monohydrochloride

分子式：C₁₇H₂₈N₂O₃·HCl

分子量：344.88

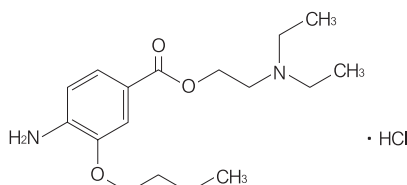
性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は塩辛く、舌を麻痺する。

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：



20. 取扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は、室温で保存し、6ヵ月以内に使用すること。

22. 包装

プラスチック点眼容器 0.5mL×10本(アルミピロー1袋10本入り)

23. 主要文献

- Schlegel HE, et al. : Arch Ophthalmol. 1954 ; 51 : 663-670 [50666]
- Iselin H, et al. : Schweiz med Wschr. 1966 ; 96 : 219-222 [50671]
- 亀井 俊郎 : 日本眼科学会雑誌. 1964 ; 68 : 151-153 [50662]
- 岡村 治彦 : 日本眼科学会雑誌. 1962 ; 66 : 557-562 [50663]
- Büchi J, et al. : Helv Chim Acta. 1951 ; 34 : 1002-1013 [50658]
- 社内資料：正常ウサギの角膜知覚に対する表面麻酔作用を指標とした0.4% DE-131点眼液及びベノキシール点眼液0.4%の生物学的同等性試験 [66174]

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)

25. 保険給付上の注意

本剤は保険給付の対象とならない(薬価基準未収載)。

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

オキシブプロカイン塩酸塩ミニ点眼液0.4%「参天」の使用方法

