2022年7月改訂(第1版)

日本標準商品分類番号	871313
承認番号	22100AMX01931
販売開始	1985年4月

貯　　法：室温保存
有効期間：3年

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ムス®点眼液0.4%「センジュ®」

OXYBUPROCAINE HYDROCHLORIDE MINIMS®OPHTHALMIC SOLUTION 0.4%

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ムス点眼液0.4%「センジュ」
有効成分	1mL中 オキシブプロカイン塩酸塩 4mg
添加剤	エデト酸ナトリウム水和物、酢酸ナトリウム水和物、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、等張化剤、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ムス点眼液0.4%「センジュ」
性状	無色～微黄褐色澄明のわずかに粘性がある無菌水性点眼剤
pH	3.5～4.5

4. 効能又は効果
眼科領域における表面麻酔

5. 効能又は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. 用法及び用量
通常成人では1～4滴を点眼する。
なお、年令、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 薬剤投与前の注意
本剤を酸化エチレン(EO)ガスで滅菌すると、有効成分の含量が低下し、白濁することがあるため、EOガス滅菌しないこと。
14.2 薬剤投与時の注意
14.2.1 使用の際は、開栓時の容器破片除去のため最初の2～3滴は捨てること。
14.2.2 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。
14.2.3 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。
14.2.4 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。
14.2.5 シングルユースタイプの製剤で、保存剤を含有しないので、必ず1本で1回の使用に限定し、使用後の容器は廃棄すること。

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、角膜上皮及び実質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分放置した後に、角膜全体の薬物濃度を測定すると、1分放置後では21.95mg/100mLであり、15分放置後では7.39mg/100mLとなり、30分放置後では4.24mg/100mLにまで低下した[1](*ex vivo*)。
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10分間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
白内障嚢外摘出術、虹彩切除術、切裂術、水晶体嚢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[注)]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[3]。
副作用は認められなかった。

注)本剤の承認された用法及び用量は「通常成人では1～4滴を点眼する。なお、年令、体質により適宜増減する。」である。

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細胞膜のNa^+チャネルを抑制することで神経インパルスの発生と伝導を抑制する[4]。

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/㎟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[5]。

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[6]。

18.3 生物学的同等性試験

ウサギの角膜をFreyの刺激毛で刺激することによって起こる瞬目反射を指標とし、本剤及びベノキシール点眼液0.4%について得られた麻酔作用発現時間(表1)及び麻酔持続時間(表2)について、t検定にて統計解析を行った。いずれの結果においても本剤とベノキシール点眼液0.4%間に有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された[7]。

表1

	麻酔作用発現開始時間(秒)
本剤	13.0±3.5
ベノキシール点眼液0.4%	14.0±3.9

平均値±標準偏差、n=10

表2

	麻酔持続時間(分)
本剤	55.5±8.0
ベノキシール点眼液0.4%	52.0±10.6

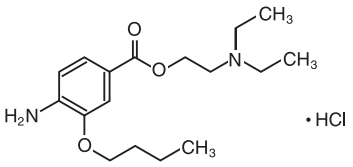
平均値±標準偏差、n=10

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)〔JAN〕

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

構造式：



分子式：$C_{17}H_{28}N_2O_3$・HCl

分子量：344.88

性　状：オキシブプロカイン塩酸塩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、舌を麻痺させる。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。
1.0gを水10mLに溶かした液のpHは5.0～6.0である。
光によって徐々に着色する。

22. 包装

プラスチック点眼容器 0.5mL×10

23. 主要文献

1)Schlegel HE, et al.：Arch Ophthalmol, 1954；51：663-670
2)Iselin H, et al.：Schweiz med Wschr, 1966；96：219-222
3)亀井俊郎：日本眼科学会雑誌, 1964；68：151-153
4)第十八改正日本薬局方解説書(廣川書店), 2021；C-1220
5)岡村治彦：日本眼科学会雑誌, 1962；66：557-562
6)Büchi J, et al.：Helv Chim Acta, 1951；34：1002-1013
7)社内資料：「S-OPM」の吸収・分布・代謝及び排泄等に関する資料

24. 文献請求先及び問い合わせ先

千寿製薬株式会社　カスタマーサポート室
〒541-0048 大阪市中央区瓦町三丁目1番9号
TEL 0120-069-618　FAX 06-6201-0577
受付時間　9：00～17：30(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

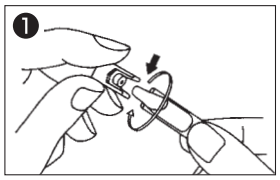
26.1 製造販売元

千寿製薬株式会社
大阪市中央区瓦町三丁目1番9号

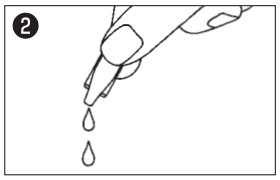
26.2 販売

武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号

オキシブプロカイン塩酸塩ミニムス点眼液0.4%「センジュ」の使用法



薬液が入っていない部分を持ち、⬆印のところをねじ切ってください。



使用する前に2～3滴捨ててください。

● 1本で1回の使用に限定し、使用後の容器は薬液が残っていても必ず捨ててください。