

貯 法：遮光した気密容器に入れ、室温保存

使用期限：外箱等に表示(3年)

承認番号	22500AMX00250
薬価収載	2013年6月
販売開始	2013年6月

広範囲抗菌点眼剤

処方箋医薬品

(注意-医師等の処方箋により使用する)

レボフロキサシン点眼液1.5% [タカタ]

日本薬局方 レボフロキサシン点眼液

LEVOFLOXACIN



【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分、オフロキサシン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】

1. 組成

品名	レボフロキサシン点眼液1.5%[タカタ]
成分・分量	1 mL中 レボフロキサシン水和物 15.0mg
添加物	塩化ナトリウム、塩酸、水酸化ナトリウム

2. 性状

品名	レボフロキサシン点眼液1.5%[タカタ]
性状	無菌に製した微黄色～黄色の澄明な点眼液
pH	6.1～6.9
浸透圧比 (生理食塩水に対する比)	1.0～1.1

【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、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、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)、シュールドモナス属、緑膿菌、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、涙嚢炎、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〉

- 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。

- 本剤におけるメチシリン耐性黄色ブドウ球菌(MRSA)に対する有効性は証明されていないので、MRSAによる感染症が明らかであり、臨床症状の改善が認められない場合、速やかに抗MRSA作用の強い薬剤を投与すること。

【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	眼瞼炎(眼瞼発赤・浮腫等)、眼瞼皮膚炎、発疹、蕁麻疹、そう痒感
眼	びまん性表層角膜炎等の角膜障害、結膜炎(結膜充血・浮腫等)、眼痛、角膜沈着物、刺激感
その他	味覚異常(苦味等)

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. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。(低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対しては使用経験がない。小児に対しては使用経験が少ない。)

4. 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。
- 他の点眼剤と併用する場合には、少なくとも5分間以上の間隔をあけて点眼するよう指導すること。

【薬物動態】

(参考)

1. 眼房水中レボフロキサシン濃度(ウサギ)¹⁾

本剤と標準製剤(点眼剤、1.5%)をウサギにそれぞれ30 μ L(レボフロキサシンとして0.45mg)を単回点眼し、点眼後60分に眼房水を採取した。

HPLCにより測定した眼房水中レボフロキサシン濃度は次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、眼房水中レボフロキサシン濃度の対数値の平均値の差は $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	眼房水中濃度 (ng/mL)
レボフロキサシン点眼液1.5%「タカタ」	3803.9 \pm 2106.9
標準製剤(点眼剤、1.5%)	3761.0 \pm 2325.6

(mean \pm S. D., n=90)

2. 角膜中レボフロキサシン濃度(ウサギ)¹⁾

本剤と標準製剤(点眼剤、1.5%)をウサギの片眼ずつにそれぞれ30 μ L(レボフロキサシンとして0.45mg)を点眼し、最高角膜中濃度となる15分後に角膜を採取した。

HPLCにより測定した角膜中レボフロキサシン濃度は次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、角膜中レボフロキサシン濃度の対数値の平均値の差は $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	角膜中濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液1.5%「タカタ」	25940 \pm 15592
標準製剤(点眼剤、1.5%)	26184 \pm 14731

(mean \pm S. D., n=94)

【薬効薬理】

1. 緑膿菌角膜感染症に対する治療効果²⁾

緑膿菌を接種したウサギに対して、本剤と標準製剤(点眼剤、1.5%)50 μ L(レボフロキサシンとして0.75mg)を菌接種後6時間、10時間及び翌日以降1日3回、2日間点眼し緑膿菌角膜感染症に対する治療効果を比較検討した。本剤及び標準製剤による角膜の混濁抑制及び緑膿菌に対する抗菌効果に有意な差が認められず、生物学的同等性が確認された。

2. 作用機序

レボフロキサシン水和物は、ニューキノロン系抗菌薬である。キノロン系及びニューキノロン系抗菌薬の作用機序は、細菌のDNAジャイレース(DNA複製時にらせん状のDNA鎖を一度切断し、その後再結合する酵素)の活性阻害によるDNAの複製阻害であり、殺菌的に作用する。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

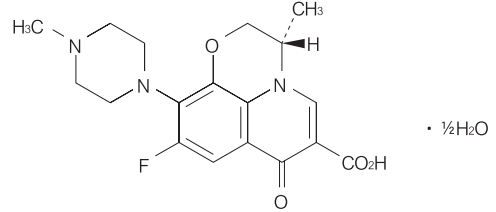
一般名：レボフロキサシン水和物[日局]

Levofloxacin Hydrate

略号：LVFX

化学名：(3S)-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 hemihydrate

構造式：



分子式：C₁₈H₂₀FN₅O₄ · 1/2H₂O

分子量：370.38

性状：淡黄白色～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、水又はメタノールにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくい。

0.1mol/L塩酸試液に溶ける。

光によって徐々に暗淡黄白色になる。

融点：約226℃(分解)

旋光度：[α]_D²⁰：-92～-99°(脱水物に換算したもの0.1g、メタノール、10mL、100mm)

【取扱い上の注意】

安定性試験⁴⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、3年間安定であることが推測された。

【包装】

レボフロキサシン点眼液1.5%「タカタ」

5 mL \times 10本(点眼瓶)

【主要文献】

- 1) 高田製薬(株)社内資料(生物学的同等性)
- 2) 高田製薬(株)社内資料(生物学的同等性)
- 3) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十七改正 日本薬局方解説書(廣川書店)C-5961, 2016.
- 4) 高田製薬(株)社内資料(安定性)

【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下さい。

高田製薬株式会社 学術部

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

前回
改訂
⇒

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1