

## 広範囲抗菌点眼剤

# 日本薬局方 レボフロキサシン点眼液

J・P Levofloxacin Ophthalmic Solution

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: 遮光、室温保存  
使用期限: 3年(外箱に記載)

# レボフロキサシン点眼液0.5%「日新」

承認番号	22300AMX00646000
薬価収載	2011年11月
販売開始	2011年11月

### 【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】

販売名	レボフロキサシン点眼液0.5%「日新」
有効成分・含量 (1 mL中)	日本薬局方レボフロキサシン水和物 5 mg
添加物	塩化ナトリウム、pH調整剤
性状	微黄色～黄色澄明の無菌水性点眼液
pH	6.2～6.8
浸透圧比	1.0～1.1(生理食塩液に対する比)

### 【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剤

### 【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. 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(頻度不明)

ショック、アナフィラキシー: 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	蕁麻疹、眼瞼炎(眼瞼発赤・浮腫等)、眼瞼皮膚炎、そう痒感、発疹
眼	刺激感、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

#### 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) 投与时: 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。
- (3) 薬剤交付時: 必ず添付の投薬袋に入れて保存するよう指導すること。

### 【薬物動態】

#### 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

(参考: ウサギ)

#### ウサギ眼組織内薬物移行動態

レボフロキサシン点眼液0.5%「日新」と標準製剤について、ウサギの左眼にはレボフロキサシン点眼液0.5%「日新」を、右眼には標準製剤をそれぞれ50 $\mu$ L(レボフロキサシン水和物として0.25mg)点眼し、房水中のレボフロキサシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、有意差は認められず、両製剤の生物学的同等性が確認された。

### 【薬効薬理】

#### 1. 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

##### 実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果

レボフロキサシン点眼液0.5%「日新」と標準製剤について、右眼に緑膿菌を接種したウサギに対し、菌接種6時間後から、1回50 $\mu$ L(レボフロキサシン水和物として0.25mg)、1日6回、3日間点眼し、感染症による角膜混濁のスコア判定を行ったところ、プラセボ(生理食塩液)と比較して両製剤とも同様の有意な治療効果が認められた。また、統計解析を行った結果、両製剤の治療効果に有意差は認められず、両製剤の生物学的同等性が確認された。

#### 2. 薬理作用<sup>2)</sup>

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。

## 【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 (Levofloxacin Hydrate)

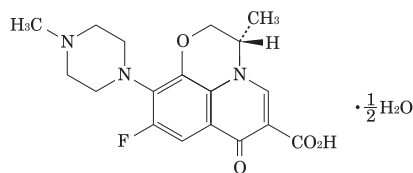
略号：LVFX

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

分子式： $C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot \frac{1}{2}H_2O$

分子量：370.38

構造式：



性状：本品は淡黄白色～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。

本品は0.1mol/L塩酸試液に溶ける。

本品は光によって徐々に暗淡黄白色になる。

融点：約226℃(分解)

## 【取扱い上の注意】

### \*安定性試験<sup>3)</sup>

レボフロキサシン点眼液0.5%「日新」は、最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、遮光、室温保存において3年間安定であることが推測された。また、最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、遮光、室温保存における3年間の安定性が確認された。

## 【包装】

レボフロキサシン点眼液0.5%「日新」(5mL) 5瓶 10瓶

## 【主要文献】

- 1) 日新製薬株式会社 社内資料：生物学的同等性に関する資料
- 2) 第十六改正日本薬局方解説書, C-5329, 廣川書店(2011)
- 3) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

## 【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下さい。

日新製薬株式会社 安全管理部

〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号

TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419

E-mail: d-info@yg-nissin.co.jp

製造販売元

 **日新製薬株式会社**

山形県天童市清池東二丁目3番1号