

**2020年3月改訂(第5版)

*2016年3月改訂

貯法：遮光、気密容器、室温保存
使用期限：外箱、容器に記載あり(使用期間：3年)

日本標準商品分類番号

871319

広範囲抗菌点眼剤

処方箋医薬品[※]

レボフロキサシン点眼液0.5%「キッセイ」

Levofloxacin Eye Drops 0.5%「KISSEI」

〔日本薬局方レボフロキサシン点眼液〕

承認番号	22300AMX00797000
薬価収載	2011年11月
販売開始	2011年11月

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること。

【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%「キッセイ」
成分・含量	日局レボフロキサシン水和物 5mg/mL
添加物	塩化ナトリウム、塩酸、水酸化ナトリウム
色・剤形	微黄色～淡黄色澄明の無菌水性点眼剤
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、マイクロコッカス属、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、涙囊炎、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>

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。(再審査対象外)

(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	発疹、蕁麻疹、眼瞼炎(眼瞼発赤・浮腫等)、眼瞼皮膚炎、痒痒感
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) 投与時

- 1) 容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- 2) 点眼したときに液が眼瞼皮膚等についた場合は、すぐにふき取ること。

【薬物動態】

生物学的同等性試験

白色ウサギの両眼に本剤又は標準製剤を片眼ずつ30 μ L単回点眼し、1時間後(Tmax)における房水中レボフロキサシン濃度(Cmax)を測定した。得られた房水中レボフロキサシン濃度を対数変換し、その平均値の差を同等性の指標として評価した。平均値の差が判定基準log(0.90)～log(1.11)の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

	Cmax (μ g/mL)
レボフロキサシン点眼液0.5%「キッセイ」	0.919 \pm 0.507
標準製剤(点眼液、0.5%)	0.910 \pm 0.439

(Mean \pm S. D., n=33)

眼組織中濃度並びにCmax等のパラメータは、被験個体の選択、検体の採取時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬効薬理】

1. 角膜緑膿菌感染モデルに対する治療効果(ウサギ)

緑膿菌を接種して作製した実験的ウサギ角膜緑膿菌感染症に対し、菌接種4時間後から本剤50 μ Lを1日3回3日間点眼した結果、投与4日目の本剤の効果は、生理食塩液に比して有意であることが認められた²⁾。

生物学的同等性試験

実験的ウサギ角膜緑膿菌感染症における感染症状の改善度スコアを指標とし、本剤及び標準製剤について得られた投与4日目の改善度スコアの平均値の差を90%信頼区間法にて統計解析を行った。その結果、平均値の差の90%信頼区間が標準製剤の平均値の \pm 20%の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

	改善度スコア
レボフロキサシン点眼液0.5%「キッセイ」	14.3 \pm 0.6
標準製剤(点眼液、0.5%)	14.3 \pm 0.6

(Mean \pm S. E., n=10)

改善度スコアのパラメータは、被験個体の選択、症状観察項目・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 角膜黄色ブドウ球菌感染モデルに対する治療効果(ウサギ)

黄色ブドウ球菌を接種して作製した実験的ウサギ角膜黄色ブドウ球菌感染症に対し、菌接種4時間後から本剤50 μ Lを1日3回3日間点眼した結果、投与3日目の本剤の効果は、生理食塩液に比して有意であることが認められた²⁾。

生物学的同等性試験

実験的ウサギ角膜黄色ブドウ球菌感染症における感染症状の改善度スコアを指標とし、本剤及び標準製剤について得られた投与3日目の改善度スコアの平均値の差を90%信頼区間法にて統計解析を行った。その結果、平均値の差の90%信頼区間が標準製剤の平均値の $\pm 20\%$ の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

	改善度スコア
レボフロキサシン点眼液0.5%「キッセイ」	18.1 \pm 0.7
標準製剤(点眼液, 0.5%)	17.5 \pm 0.7

(Mean \pm S. E., n=10)

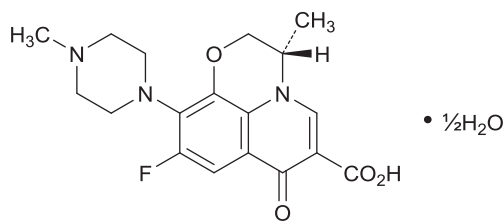
改善度スコアのパラメータは、被験個体の選択、症状観察項目・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【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) (JAN)

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：C₁₈H₂₀FN₃O₄・1/2H₂O

分子量：370.38

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。本品は酢酸(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)

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

ポリプロピレン製点眼容器に充てんしたものをを用いた加速試験(40 \pm 1℃, 相対湿度75 \pm 5%, 遮光, 6箇月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された³⁾。

【包装】

レボフロキサシン点眼液0.5%「キッセイ」：5mL \times 10本

【主要文献】

- 1) 生物学的同等性試験[房水中濃度] (社内資料)
- 2) 生物学的同等性試験[感染モデル] (社内資料)
- 3) 安定性試験(社内資料)

**【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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ください。

キッセイ薬品工業株式会社 くすり相談センター
〒112-0002 東京都文京区小石川3丁目1番3号
フリーダイヤル：0120-007-622