

広範囲抗菌点眼剤

日本薬局方レボフロキサシン点眼液

レボフロキサシン点眼液 1.5% [FFP]

LEVOFLOXACIN Ophthalmic Solution 1.5% [FFP]

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：室温保存、気密容器、遮光保存
使用期限：外箱及びラベルに表示（3年）

承認番号	22500AMX00225000
薬価収載	2013年6月
販売開始	2013年6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

1. 組成

成分・含量	日局 レボフロキサシン水和物 15.0mg/mL
添加物	塩化ナトリウム、pH調節剤

2. 性状

性状	微黄色～黄色澄明、無菌水性点眼剤
pH	6.1～6.9
浸透圧比 ^注	1.0～1.1

注（浸透圧比）：生理食塩液に対する比

■効能又は効果

＜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・エジプトチウス（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

■用法及び用量

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。

＜用法及び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（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、そう痒感、眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎、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、角膜沈着物
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。
- 他の点眼剤と併用する場合には、少なくとも5分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

＜生物学的同等性試験＞

ウサギにおける眼組織内薬物動態¹⁾²⁾

レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP]（試験製剤）及び標準製剤（点眼剤、1.5%）各30μL（レボフロキサシン水和物として0.45mg）をウサギに単回点眼し、眼房水中及び角膜中のレボフロキサシン濃度について検討を行った。最高眼房水中濃度を示す60分後及び最高角膜中濃度を示す15分後のレボフロキサシン濃度について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80)～log (1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	眼房水中濃度 (ng/mL)		角膜中濃度 (ng/g)	
レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP]	n=90	3804 ±2107	n=94	25940 ±15592
標準製剤 (点眼剤、1.5%)	n=90	3761 ±2326	n=94	26184 ±14731

(Mean ± S.D.)

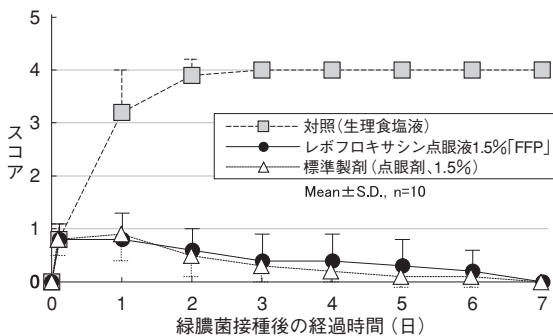
■薬効薬理

<生物学的同等性試験>

実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果³⁾

緑膿菌を接種したウサギに対して、レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP]、標準製剤（点眼剤、1.5%）及び生理食塩液（対照群）を菌接種日は菌接種後6時間及び10時間後に、菌接種翌日及び翌々日は4時間ごとに1日3回点眼し、緑膿菌接種後7日目までの角膜混濁の度合い（スコア）の観察、並びに7日目の角膜より緑膿菌を分離培養した（各群10例）。対照群では、緑膿菌接種後からスコアが徐々に増加し、1日目以降観察終了時まで全例で角膜混濁が確認された。一方、レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP] 群及び標準製剤群では、2日目以降スコアが低下し、点眼を中止した3日目以降もスコアの増加はみられず、1日目以降観察終了時まで対照群と比較して有意な低値を示した。レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP] 群と標準製剤群のスコアには、観察期間を通じて有意差が認められなかった。また対照群では全眼で緑膿菌の陽性を示したのに対して、レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP] 群及び標準製剤群では全眼陰性を示した。

レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP] 及び標準製剤はいずれも緑膿菌による角膜混濁の増加を著明に抑制し、その治療効果に有意な差が認められなかったことからレボフロキサシン点眼液1.5% [FFP] は標準製剤と生物学的に同等と判断された。



■主要文献

- 1) 眼房水中薬物動態試験
(共創未来ファーマ株式会社 社内資料)
- 2) 角膜中薬物動態試験
(共創未来ファーマ株式会社 社内資料)
- 3) 実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果
(共創未来ファーマ株式会社 社内資料)
- 4) 安定性試験
(共創未来ファーマ株式会社 社内資料)

■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。

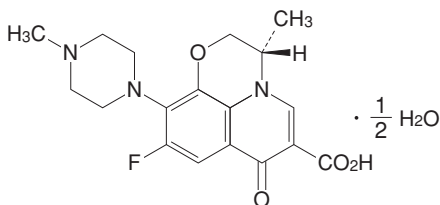
共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室
〒155-8655 東京都世田谷区代沢5-2-1
TEL 050-3383-3846

■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)

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 · 1/2 H₂O

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）


■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℃、相対湿度75%、6ヵ月）にて得られたデータを評価した結果、レボフロキサシン点眼液1.5% [FFP] は、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。

■包装

5 mL×10本

製造販売元
 共創未来ファーマ株式会社
東京都品川区広町1-4-4