

** 2017年1月改訂(第5版)

* 2016年3月改訂

日本標準商品分類番号

871319

貯法：気密容器、遮光・室温保存
使用期限：外箱及びラベルに表示(期限内に使用する
こと。)

広範囲抗菌点眼剤

日本薬局方 レボフロキサシン点眼液

処方箋医薬品^{注)}

レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」

LEVOFLOXACIN Ophthalmic Solution 0.5% “KYORIN”

承認番号	22300AMX00658000
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】

成分・分量(1mL中)	日局レボフロキサシン水和物 5mg
添加物	塩化ナトリウム、pH調節剤
剤形	水性点眼剤
性状	微黄色～黄色澄明、無菌製剤
pH	6.2～6.8
浸透圧比 ^{注)}	0.95～1.05
識別コード	KRM003

注(浸透圧比)：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。

* (1) 重大な副作用

ショック、アナフィラキシー(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。

分類	副作用(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

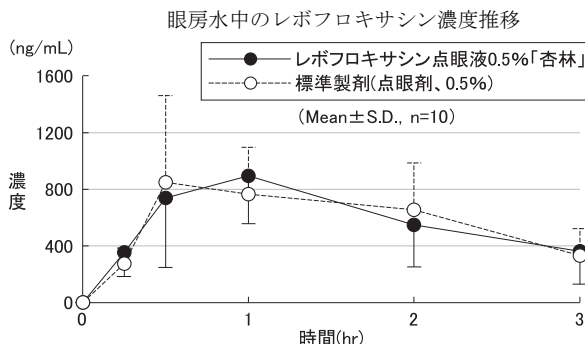
- (1) 投与経路：点眼用にのみ使用すること。
- (2) 投与时：薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意するよう指導すること。

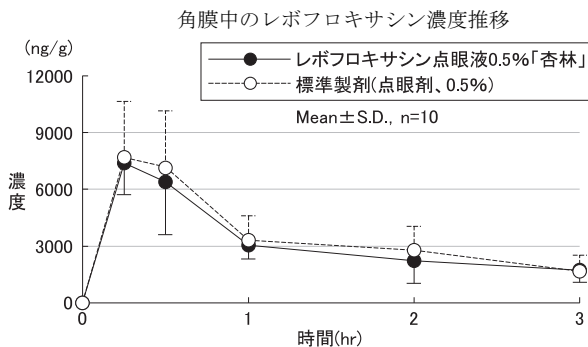
【薬物動態】

生物学的同等性試験

(1) ウサギにおける眼組織内薬物動態¹⁾

レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」及び標準製剤(点眼剤、0.5%)各50 μ L(レボフロキサシン水和物として0.25mg)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の統計解析を行った結果、すべての採取時間における眼組織中レボフロキサシン濃度について、両製剤間では有意差が認められなかった。(Studentのt検定、有意水準は両側5%)。





(2) ウサギにおける角膜中の濃度の分散分析²⁾

レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」及び標準製剤(点眼剤、0.5%)50μLをそれぞれウサギに片眼ずつ点眼し、最高角膜中濃度を示す15分後の角膜を採取した。採取した角膜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。

	角膜中濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」	15551 ± 6020
標準製剤(点眼剤、0.5%)	13933 ± 4643

(Mean ± S. D., n=49)

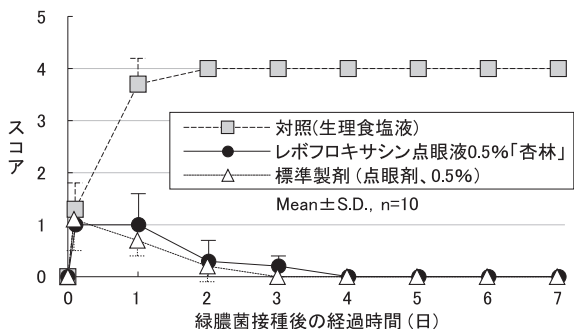
【薬効薬理】

生物学的同等性試験

実験的緑膿菌角膜炎に対する治療効果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0.5%「杏林」、標準製剤(点眼剤、0.5%)及び生理食塩液(対照群)を菌接種後6時間後から2時間ごとに1日6回、3日間点眼し、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、2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0.5%「杏林」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0.5%「杏林」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0.5%「杏林」群及び標準製剤群では全眼陰性を示した。

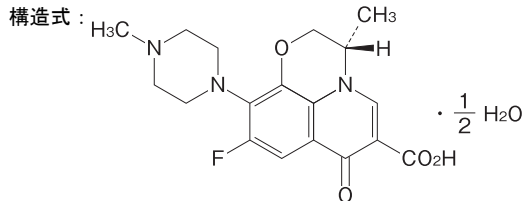
レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」及び標準製剤はいずれも緑膿菌による角膜混濁の増加を著明に抑制し、その治療効果に有意な差が認められなかったことからレボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」は標準製剤と生物学的に同等と判断された。



【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



分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄ · 1/2H₂O

分子量：370.38

性状：レボフロキサシン水和物は淡黄白色～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。

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)の結果、レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」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】「**」

5mL×5本

5mL×10本

【主要文献】

- 1)キョーリンメディオ株式会社社内資料：レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料-薬物動態-
- 2)キョーリンメディオ株式会社社内資料：レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料-角膜中濃度-
- 3)キョーリンメディオ株式会社社内資料：レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料-治療効果-
- 4)キョーリンメディオ株式会社社内資料：レボフロキサシン点眼液0.5%「杏林」の安定性試験に関する資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料は下記にご請求下さい。

キョーリンメディオ株式会社 学術部

〒920-0017 金沢市諸江町下丁287番地1

TEL 0120-960189

FAX 0120-189099

販売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

製造販売元

キョーリンメディオ株式会社

富山県南砺市井波885番地