

**2022年6月改訂(第8版、承継に伴う改訂)
*2016年10月改訂

日本標準商品分類番号
871319

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%「NIG」

Levofloxacin Ophthalmic Solution

貯 法：遮光、室温保存

使用期限：3年(外箱、ラベルに表示)

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

| | |
|------|---------------|
| 承認番号 | 22400AMX00702 |
| 薬価収載 | 2022年6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%「NIG」 |
| 有効成分 | 日局レボフロキサシン水和物 |
| 含量(1mL中) | 5mg |
| 添加物 | 塩化ナトリウム、pH調節剤 |
| 性状・剤形 | 微黄色～淡黄色澄明、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、ステプトトロホモナス(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〉

- 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、眼瞼炎(眼瞼発赤・浮腫等)、眼瞼皮膚炎、痒痒感、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】

眼組織内移行性(ウサギ)

レボフロキサシン点眼液0.5%「NIG」と標準製剤を、それぞれ50 μ L(レボフロキサシン水和物として0.25mg)をウサギの眼結膜嚢内に点眼して眼房水内レボフロキサシン濃度を測定したところ、両剤とも同様の移行性を示し、生物学的同等性が確認された¹⁾。

【薬効薬理】

1. 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、その作用機序は、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²⁾。

2. 薬力学的同等性試験

実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果

ウサギ角膜表層に緑膿菌(菌株：緑膿菌IID-1210株)を接種した病態モデルを用いて、レボフロキサシン点眼液0.5%「N I G」、標準製剤及び生理食塩液(対照群)を菌接種後6時間後から2時間ごとに、それぞれ1日6回(50×6μL/eye/日)3日間投与し、緑膿菌接種後7日目までの角膜混濁スコアの観察、並びに7日目の角膜からの緑膿菌分離培養を行い生物学的同等性を検討した。その結果、本剤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、角膜から緑膿菌も検出されることがなく治療効果に有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された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、Levofloxacin Hydrate (JAN)

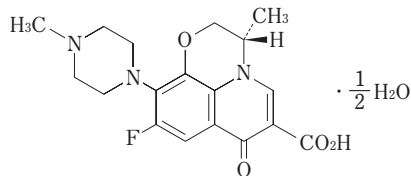
略号：LVFX

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：C₁₈H₂₀FN₃O₄ · 1/2H₂O

分子量：370.38

構造式：



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)の結果、本剤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】

レボフロキサシン点眼液0.5%「N I G」：

5 mL×5本(ポリエチレン製点眼容器)

5 mL×10本(ポリエチレン製点眼容器)

【主要文献】

- 1) 日医工岐阜工場(株)：社内資料(ウサギ眼組織内薬物移行動態)
- 2) 第十六改正日本薬局方解説書，廣川書店 2011；C-5329
- 3) 日医工岐阜工場(株)：社内資料(薬力学的同等性試験；ウサギ眼感染モデル)
- 4) 日医工岐阜工場(株)：社内資料(安定性試験)

***【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

TEL (0120) 517-215

FAX (076) 442-8948

*販売

武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号

***  発売元
日医工株式会社
富山市総曲輪1丁目6番21

***  製造販売元
日医工岐阜工場株式会社
富山市総曲輪1丁目6番21