

貯 法：室温保存  
有効期間：3年

承認番号	22300AMX00656
販売開始	2011年11月

広範囲抗菌点眼剤

処方箋医薬品  
(注意-医師等の処方箋により使用すること)

# 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0.5%「タカタ」

Levofloxacin Ophthalmic Solution“TAKATA”



2. 禁忌 (次の患者には投与しないこと)  
2.1 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

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

有効成分	添加剤
1mL 中 日局レボフロキサシン 水和物 5.0mg	塩化ナトリウム、塩酸、水酸化ナトリウム

#### 3.2 製剤の性状

性状	pH	浸透圧比 (生理食塩水に対する比)
無菌に製した微黄色～淡黄色の澄明な点眼液	6.2～6.8	0.95～1.05

### 4. 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法

### 5. 効能・効果に関連する注意

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。

### 6. 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。

### 8. 重要な基本的注意

8.1 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。

### 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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のみ投与すること。

#### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

### 11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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。

### 11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー (いずれも頻度不明)  
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。

### 11.2 その他の副作用

	1%未満	頻度不明
眼	眼刺激、結膜炎、眼のそう痒感	びまん性表層角膜炎等の角膜障害、眼痛、眼瞼炎
皮膚		蕁麻疹、発疹、そう痒

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・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こと。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・遮光して保存すること。

### 18. 薬効薬理

#### 18.1 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<sup>1)</sup>。

#### 18.2 眼組織内薬物動態

レボフロキサシン点眼液0.5%「タカタ」とクラビット点眼液0.5%をウサギにそれぞれ50 $\mu$ L (レボフロキサシン水和物として0.25mg)を単回点眼し、点眼後経時的に眼房水及び角膜を採取した。HPLCにより測定した眼房水中及び角膜中レボフロキサシン濃度はすべての採取時間において有意差は認められなかった<sup>2)</sup>。

#### 18.3 生物学的同等性試験

##### 18.3.1 角膜中レボフロキサシン濃度

レボフロキサシン点眼液0.5%「タカタ」とクラビット点眼液0.5%をウサギの片眼ずつにそれぞれ50 $\mu$ L (レボフロキサシン水和物として0.25mg)を点眼し、最高角膜中濃度となる15分後に角膜を採取した。HPLCにより測定した角膜中レボフロキサシン濃度は次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、角膜中レボフロキサシン濃度の対数値の平均値の差はlog(0.8)～log(1.25)の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>3)</sup>。

表 18-1 角膜中濃度

	角膜中濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液0.5%「タカタ」	15551 ± 6020
クラビット点眼液0.5%	13933 ± 4643

(mean ± S.D., n = 49)

##### 18.3.2 緑膿菌角膜感染症に対する治療効果

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%「タカタ」とクラビット点眼液0.5%を50 $\mu$ L (レボフロキサシンとして0.25mg)1日6回、3日間点眼し緑膿菌角膜感染症に対する治療効果を比較検討した。レボフロキサシン点眼液0.5%「タカタ」及びクラビット点眼液0.5%による角膜の混濁抑制及び緑膿菌に対する抗菌効果に有意な差が認められず、生物学的同等性が確認された<sup>4)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

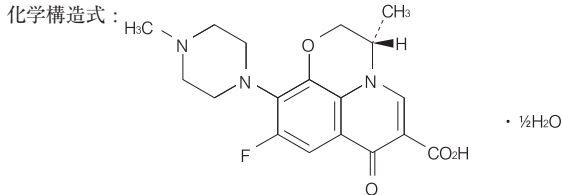
一般的名称：レボフロキサシン水和物  
(Levofloxacin Hydrate)

化学名：(3*S*)-9-Fluoro-3-methyl-10-(4-methylpiperazin-1-yl)-7-oxo-2,3-dihydro-7*H*-pyrido [1,2,3-*de*] [1,4] benzoxazine-6-carboxylic acid hemihydrate

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub> · ½H<sub>2</sub>O

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)



旋光度：[α]<sub>D</sub><sup>20</sup>：-92～-99° (脱水物に換算したもの0.1g、メタノール、10mL、100mm)

## 20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。

## 22. 包装

5mL [5本、点眼瓶]  
5mL [10本、点眼瓶]

## 23. 主要文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十八改正 日本薬局方解説書 2021：C-6260-6265
- 2) 社内資料：生物学的同等性試験(レボフロキサシン点眼液 0.5%「タカタ」)
- 3) 社内資料：生物学的同等性試験(レボフロキサシン点眼液 0.5%「タカタ」)
- 4) 社内資料：生物学的同等性試験(レボフロキサシン点眼液 0.5%「タカタ」)

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

高田製薬株式会社 文献請求窓口  
〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号  
電話 0120-989-813  
FAX 048-816-4183

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**高田製薬株式会社**  
さいたま市西区宮前町203番地1