

貯法：室温保存  
有効期間：3年

日本標準商品分類番号	
871319	

承認番号	22400AMX00702
販売開始	2011年11月

## 広範囲抗菌点眼剤

処方箋医薬品<sup>注)</sup>

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% 「NIG」

## Levofloxacin Ophthalmic Solution

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

### 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

販売名	レボフロキサシン点眼液0.5% 「NIG」
有効成分	1mL中：レボフロキサシン水和物 5mg
添加剤	塩化ナトリウム、pH調節剤

#### 3.2 製剤の性状

販売名	レボフロキサシン点眼液0.5% 「NIG」
色・性状	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）

### 4. 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

### 5. 効能又は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。

### 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にのみ投与すること。

#### 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。

### 16. 薬物動態

#### 16.8 その他

##### 16.8.1 生物学的同等性試験

眼組織移行性（ウサギ）

レボフロキサシン点眼液0.5% 「NIG」とクラビット点眼液0.5%を、それぞれ50  $\mu$  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<sup>1)</sup>。

### 18. 薬効薬理

#### 18.1 作用機序

主な作用機序はDNAジャイレース（トポイソメラーゼⅡ）活性及びトポイソメラーゼⅣ活性の阻害による細菌のDNA合成阻害である。DNAジャイレース（トポイソメラーゼⅡ）活性とトポイソメラーゼⅣ活性のどちらを強く阻害するかは細菌によって異なる<sup>2)～7)</sup>。

#### 18.2 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

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% 「NIG」、クラビット点眼液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、それぞれ1日6回（50×6  $\mu$  L/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、本剤及びクラビット点眼液0.5%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こと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<sup>1)</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）

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

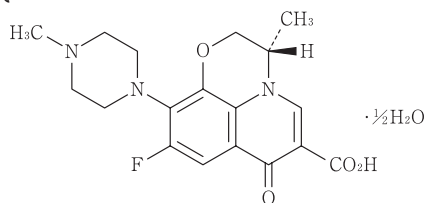
分子式：C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>・<sup>1</sup>/<sub>2</sub>H<sub>2</sub>O

分子量：370.38

融 点：約226℃（分解）

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。

化学構造式：



## 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（プラスチック点眼容器）×5本、

5mL（プラスチック点眼容器）×10本

## 23. 主要文献

- 1) 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) Kato, J. et al. : Cell 1990 ; 63 : 393-404
- 3) Hoshino, K. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 1994 ; 38 : 2623-2627
- 4) Akasaka, T. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 2001 ; 45 : 2263-2268
- 5) Tanaka, M. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 1997 ; 41 : 2362-2366
- 6) Onodera, Y. et al. : J. Antimicrob. Chemother. 1999 ; 44 : 533-536
- 7) Onodera, Y. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 2002 ; 46 : 1800-1804

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

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

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元



**日医工岐阜工場株式会社**

NICHI-IKO

富山市総曲輪1丁目6番21

### 26.2 発売元



**日医工株式会社**

NICHI-IKO

富山市総曲輪1丁目6番21

### 26.3 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