

貯 法：室温保存
有効期間：3年

承認番号	22500AMX00250
販売開始	2013年6月

広範囲抗菌点眼液

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1.5%「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 15.0mg	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～ 黄色の澄明な点眼液	6.1～6.9	1.0～1.1

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。

9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は8歳未満の小児に投与した臨床試験は実施していない。

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

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
眼	眼刺激	眼のそう痒感	びまん性表層 角膜炎等の角 膜障害、結膜 炎、眼痛、角 膜沈着物、眼 瞼炎
皮膚		蕁麻疹	発疹、そう痒
その他		味覚異常 (苦 味等)	

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。
- ・患眼を開眼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉眼して涙嚢部を圧迫させた後、開眼すること。
- ・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¹⁾。

18.2 生物学的同等性試験

18.2.1 眼房水中レボフロキサシン濃度

レボフロキサシン点眼液1.5%「タカタ」とクラビット点眼液1.5%をウサギにそれぞれ30μL (レボフロキサシンとして0.45mg) を単回点眼し、点眼後60分に眼房水を採取した。HPLCにより測定した眼房水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、眼房水中レボフロキサシン濃度の対数値の平均値の差はlog (0.80) ～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²⁾。

表 18-1 眼房水中濃度

	眼房水中濃度 (ng/mL)
レボフロキサシン点眼液1.5%「タカタ」	3803.9±2106.9
クラビット点眼液1.5%	3761.0±2325.6

(mean±S. D., n = 90)

18.2.2 角膜中レボフロキサシン濃度

レボフロキサシン点眼液1.5%「タカタ」とクラビット点眼液1.5%をウサギの片眼ずつにそれぞれ30μL (レボフロキサシンとして0.45mg) 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 (0.80) ～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²⁾。

表 18-2 角膜中濃度

	角膜中濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液 1.5% 「タカタ」	25940 ± 15592
クラビット点眼液 1.5%	26184 ± 14731

(mean ± S. D., n = 94)

18.2.3 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 1.5% 「タカタ」とクラビット点眼液 1.5% 50 μ L (レボフロキサシンとして 0.75mg) を菌接種後 6 時間、10 時間及び翌日以降 1 日 3 回、2 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。本剤及び標準製剤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³⁾。

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：C₁₈H₂₀FN₃O₄ · 1/2H₂O

分子量：370.38

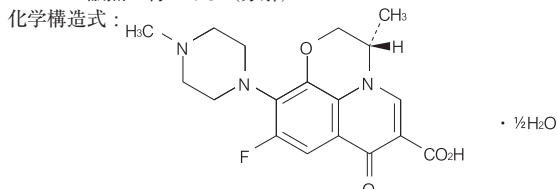
性状：淡黄白色～黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

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°C (分解)



旋光度：[α]_D²⁰：-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 [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 1.5% 「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 1.5% 「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