

日本標準商品分類番号	
871319	
承認番号	22500AMX00177000
薬価収載	2013年6月
販売開始	2013年6月

貯法：室温保存、気密容器、遮光
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。

広範囲抗菌点眼剤
処方箋医薬品[※]

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%「オーハラ」
LEVOFLOXACIN OPHTHALMIC SOLUTION 1.5% OHARA

【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1.5%「オーハラ」
有効成分	日局レボフロキサシン水和物
含量（1mL中）	15mg
添加物	塩化ナトリウム、pH調節剤
性状	微黄色～黄色澄明・無菌水性点眼剤
pH	6.1～6.9
浸透圧比	1.0～1.1（生理食塩液）

【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。

	副作用の頻度
	頻度不明
過敏症	蕁麻疹、痒痒感、眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎、発疹

	副作用の頻度
	頻度不明
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、角膜沈着物
その他	味覚異常（苦味等）

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. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。（低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対しては使用経験がない。小児に対しては使用経験が少ない。）

4. 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：

- 1) 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。
- 2) 他の点眼剤と併用する場合には、少なくとも5分間以上の間隔をあけて点眼するよう指導すること。

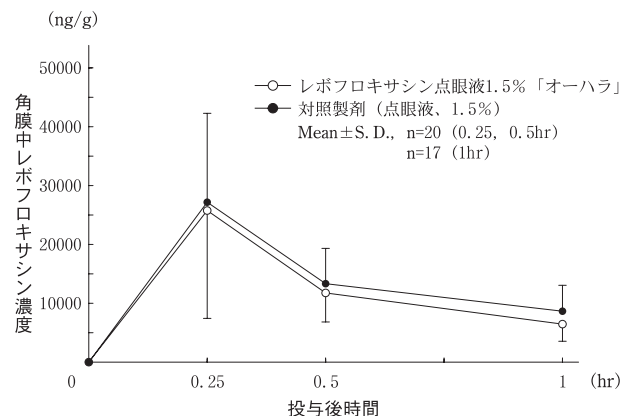
【薬物動態】

（参考）

動物における眼組織内移行（ウサギ）

レボフロキサシン点眼液1.5%「オーハラ」と対照となるレボフロキサシン点眼液（以下、対照製剤）を30μL（いずれもレボフロキサシン水和物として0.45mg）ウサギに単回点眼し、角膜中及び眼房水中未変化体濃度を測定した。点眼後15分の角膜中及び点眼後60分の眼房水中レボフロキサシン濃度について統計解析を行った結果、いずれもlog(0.80)～log(1.25)の範囲であり、両製剤の生物学的同等性が確認された^{1),2)}。

角膜中レボフロキサシン濃度の推移

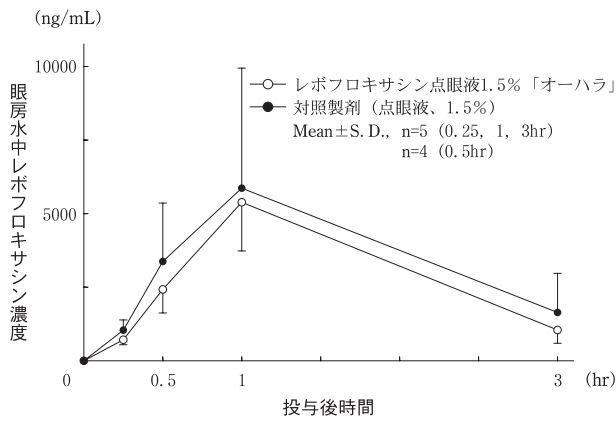


点眼後15分の角膜中レボフロキサシン濃度

製剤名	n	レボフロキサシン濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液1.5%「オーハラ」	94	25939.84 ± 15591.77
対照製剤 (点眼液、1.5%)	94	26184.23 ± 14731.19

(Mean ± S. D.)

眼房水中レボフロキサシン濃度の推移



点眼後60分の眼房水中レボフロキサシン濃度

製剤名	n	レボフロキサシン濃度 (ng/mL)
レボフロキサシン点眼液1.5% 「オーハラ」	90	3803.90 ± 2106.85
対照製剤 (点眼液、1.5%)	90	3761.02 ± 2325.64

(Mean ± S. D.)

【薬効薬理】

1. 作用機序

本剤は、ラセミ体であるオフロキサシンの一方の光学活性S-(-)体のレボフロキサシン水和物を含有するニューキノロン系抗菌剤である。レボフロキサシン水和物は、細菌のDNAジャイレース及びトポイソメラーゼIVに作用し、DNA複製を阻害し、抗菌作用は殺菌的である。

2. 緑膿菌角膜感染症に対する治療効果 (ウサギ)

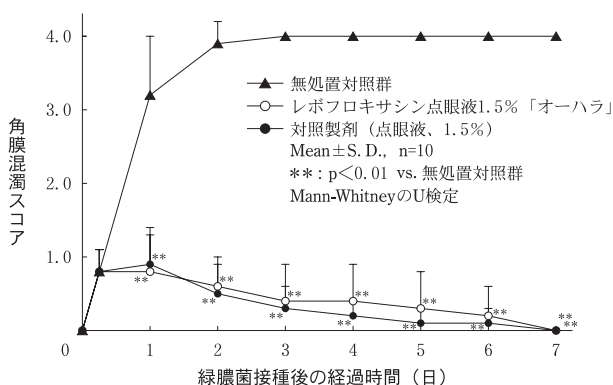
ウサギの眼球角膜表層やや実質に至る深さに円形の創を作製し、角膜を混濁させる量の緑膿菌を接種した。菌接種後6時間及び10時間の2回、レボフロキサシン点眼液1.5% 「オーハラ」、対照となるレボフロキサシン点眼液(以下、対照製剤) 50 μ L (いずれもレボフロキサシン水和物として0.75mg) 及び生理食塩液(以下、無処置対照群) 50 μ Lを点眼し、翌日以降は4時間ごとに1日3回、2日間点眼した。菌接種日より7日目まで角膜混濁度を評価し無処置対照群と比較した。観察終了後、角膜から緑膿菌を分離培養した³⁾。

(治療効果)

- 角膜の混濁に対して、両製剤は菌接種日以降有意な抑制作用を示し、両製剤とも緑膿菌角膜感染症に優れた治療効果を示した。また、観察期間を通して、両製剤間で効力に差はみられなかった。
- 緑膿菌の分離培養において、無処置対照群では全眼で陽性であった。一方、両製剤では全眼で陰性であり、両製剤間で効力に差はみられなかった。

このことから、レボフロキサシン点眼液1.5% 「オーハラ」の治療効果は、対照製剤と同等であると判断された。

緑膿菌角膜感染症に対する治療効果



(角膜混濁スコア)

- 0 : 角膜混濁がない。
- 0.5 : 角膜混濁がない軽度の浮腫。
- 1 : 角膜混濁が直径6 mmより小さい。
- 2 : 角膜混濁が直径6 mmに及ぶ。
- 3 : 角膜混濁が直径6 mmより大きい。
- 4 : 角膜混濁が角膜全体に及ぶ。

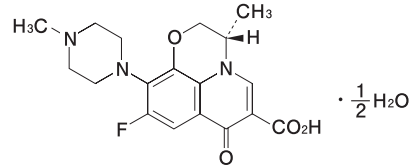
【有効成分に関する理化学的知見】

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

略名：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

構造式：



分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄ · 1/2H₂O

分子量：370.38

性状：本品は淡黄白色～黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

本品は酢酸(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。

本品は0.1mol/L塩酸試液に溶ける。

本品は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

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、36ヵ月)の結果、レボフロキサシン点眼液1.5% 「オーハラ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された⁴⁾。

【包装】

レボフロキサシン点眼液1.5% 「オーハラ」：5 mL × 10本

*【主要文献】

- 大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験－ウサギにおける単回点眼後の角膜中薬物動態－(2012年)
- 大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験KR1291(レボフロキサシン点眼液1.5%)の生物学的同等性試験(眼房水中濃度について)(2012年)
- 大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験－ウサギ眼感染モデルにおける治療効果－(2011年)
- 大原薬品工業株式会社 社内資料：安定性試験(2014年)

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。

大原薬品工業株式会社 安全管理部 お客様相談室

〒104-6591 東京都中央区明石町8-1 聖路加タワー36階

☎ 0120-419-363 FAX 03-6740-7703

URL <http://www.ohara-ch.co.jp>



製造販売元 **大原薬品工業株式会社**
滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121-15