

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2013 に準拠して作成

広範囲抗菌点眼剤

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%「JG」

Levofloxacin Ophthalmic Solution

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	処方せん医薬品（注意 - 医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1mL中 レボフロキサシン水和物 5mg 含有
一般名	和名：レボフロキサシン水和物（JAN） 洋名：Levofloxacin Hydrate（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日：2011年7月15日 薬価基準収載年月日：2011年11月28日 発売年月日：2011年11月28日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本ジェネリック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 受付時間：9時～18時（土、日、祝日を除く） TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172 医療関係者向けホームページ： http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html

本 IF は 2016 年 3 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独) 医薬品医療機器総合機構 (PMDA) ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する PMDA ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ② I F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③ 表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

【I F の作成】

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【I F の発行】

- ① 「I F 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「I F 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「I F 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の I F については、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」に掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」で確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I F を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	11. 製剤中の有効成分の定量法	7
1. 開発の経緯	1	12. 力価	7
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	13. 混入する可能性のある夾雑物	7
II. 名称に関する項目	2	14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	7
1. 販売名	2	15. 刺激性	7
(1)和名	2	16. その他	8
(2)洋名	2	V. 治療に関する項目	9
(3)名称の由来	2	1. 効能又は効果	9
2. 一般名	2	2. 用法及び用量	9
(1)和名(命名法)	2	3. 臨床成績	9
(2)洋名(命名法)	2	(1)臨床データパッケージ	9
(3)ステム	2	(2)臨床効果	9
3. 構造式又は示性式	2	(3)臨床薬理試験	9
4. 分子式及び分子量	2	(4)探索的試験	9
5. 化学名(命名法)	2	(5)検証的試験	9
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1)無作為化並行用量反応試験	9
7. CAS登録番号	2	2)比較試験	9
III. 有効成分に関する項目	3	3)安全性試験	9
1. 物理化学的性質	3	4)患者・病態別試験	9
(1)外観・性状	3	(6)治療的使用	10
(2)溶解性	3	1)使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	10
(3)吸湿性	3	2)承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要	10
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	3	VI. 薬効薬理に関する項目	11
(5)酸塩基解離定数	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	11
(6)分配係数	3	2. 薬理作用	11
(7)その他の主な示性値	3	(1)作用部位・作用機序	11
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	11
3. 有効成分の確認試験法	3	(3)作用発現時間・持続時間	13
4. 有効成分の定量法	4	VII. 薬物動態に関する項目	14
IV. 製剤に関する項目	5	1. 血中濃度の推移・測定法	14
1. 剤形	5	(1)治療上有効な血中濃度	14
(1)投与経路	5	(2)最高血中濃度到達時間	14
(2)剤形の区別、外観及び性状	5	(3)臨床試験で確認された血中濃度	14
(3)製剤の物性	5	(4)中毒域	14
(4)識別コード	5	(5)食事・併用薬の影響	14
(5)pH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等	5	(6)母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因	14
(6)無菌の有無	5	2. 薬物速度論的パラメータ	14
2. 製剤の組成	5	(1)解析方法	14
(1)有効成分(活性成分)の含量	5	(2)吸収速度定数	14
(2)添加物	5	(3)バイオアベイラビリティ	14
(3)添付溶解液の組成及び容量	5	(4)消失速度定数	14
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	5	(5)クリアランス	14
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	(6)分布容積	14
5. 製剤の各種条件下における安定性	5	(7)血漿蛋白結合率	14
6. 溶解後の安定性	6		
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6		
8. 溶出性	6		
9. 生物学的試験法	6		
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	6		

3. 吸収	14	16. その他	18
4. 分布	14		
(1)血液-脳関門通過性	14		
(2)血液-胎盤関門通過性	14		
(3)乳汁への移行性	15		
(4)髄液への移行性	15		
(5)その他の組織への移行性	15		
5. 代謝	15		
(1)代謝部位及び代謝経路	15		
(2)代謝に關与する酵素(CYP450 等)の分 子種	15		
(3)初回通過効果の有無及びその割合	15		
(4)代謝物の活性の有無及び比率	15		
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	15		
6. 排泄	15		
(1)排泄部位及び経路	15		
(2)排泄率	15		
(3)排泄速度	15		
7. トランスポーターに関する情報	15		
8. 透析等による除去率	15		
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16		
1. 警告内容とその理由	16		
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	16		
3. 効能又は効果に關連する使用上の注意 とその理由	16		
4. 用法及び用量に關連する使用上の注意 とその理由	16		
5. 慎重投与内容とその理由	16		
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置 方法	16		
7. 相互作用	16		
(1)併用禁忌とその理由	16		
(2)併用注意とその理由	16		
8. 副作用	16		
(1)副作用の概要	16		
(2)重大な副作用と初期症状	16		
(3)その他の副作用	17		
(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値 異常一覧	17		
(5)基礎疾患、合併症、重症度及び手術の 有無等背景別の副作用発現頻度	17		
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験 法	17		
9. 高齢者への投与	17		
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17		
11. 小児等への投与	17		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17		
13. 過量投与	17		
14. 適用上の注意	17		
15. その他の注意	17		
IX. 非臨床試験に関する項目	19		
1. 薬理試験	19		
(1)薬効薬理試験(「VI.薬効薬理に関する項 目」参照)	19		
(2)副次的薬理試験	19		
(3)安全性薬理試験	19		
(4)その他の薬理試験	19		
2. 毒性試験	19		
(1)単回投与毒性試験	19		
(2)反復投与毒性試験	19		
(3)生殖発生毒性試験	19		
(4)その他の特殊毒性	19		
X. 管理的事項に関する項目	20		
1. 規制区分	20		
2. 有効期間又は使用期限	20		
3. 貯法・保存条件	20		
4. 薬剤取扱い上の注意点	20		
(1)薬局での取扱い上の留意点について	20		
(2)薬剤交付時の取扱いについて(患者等に 留意すべき必須事項等)	20		
(3)調剤時の留意点について	20		
5. 承認条件等	20		
6. 包装	20		
7. 容器の材質	20		
8. 同一成分・同効薬	20		
9. 国際誕生年月日	20		
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	21		
11. 薬価基準収載年月日	21		
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更 追加等の年月日及びその内容	21		
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及 びその内容	21		
14. 再審査期間	21		
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	21		
16. 各種コード	21		
17. 保険給付上の注意	21		
X I. 文献	22		
1. 引用文献	22		
2. その他の参考文献	22		
X II. 参考資料	23		
1. 主な外国での発売状況	23		
2. 海外における臨床支援情報	23		
X III. 備考	24		
その他の関連資料	24		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」は、レボフロキサシンを含有する広範囲抗菌点眼剤である。レボフロキサシン水和物はピリドンカルボン酸を基本骨格とし、母核がピリドベンゾキサジンであるニューキノロン系抗菌薬である。¹⁾

本邦ではレボフロキサシン点眼液は2000年に販売されている。

本剤は日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成17年3月31日 薬食発第0331015号）」に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2011年7月に製造販売承認を得て、2011年11月に販売開始した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1)レボフロキサシンはオフロキサシンと平面構造は同じである。オフロキサシンは*R* (+) -体、*S* (-) -体からなるが、レボフロキサシンは効力のある*S* (-) -体のみからなる。²⁾

(2)重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーを起こすことがある（頻度不明）。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」

(2) 洋名

Levofloxacin Ophthalmic Solution 0.5% “JG”

(3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「濃度」 + 「屋号」より命名

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

レボフロキサシン水和物（JAN）

(2) 洋名（命名法）

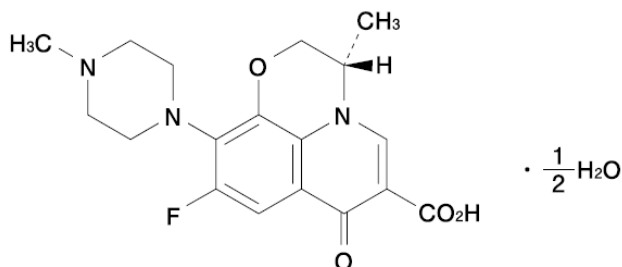
Levofloxacin Hydrate（JAN）

Levofloxacin（INN）

(3) ステム

ナリジクス酸誘導体抗菌剤:-oxacin

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄ · 1/2H₂O

分子量：370.38

5. 化学名（命名法）

(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 (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：LVFX

7. CAS 登録番号

100986-85-4 (Levofloxacin)

138199-71-0 (Levofloxacin Hydrate)

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

淡黄白色～黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

光によって徐々に暗淡黄白色になる。

(2) 溶解性

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。

溶解度（37℃） ³⁾	pH1.2 : 46.1mg/mL
	pH4.0 : 22.3mg/mL
	pH6.8 : 13.1mg/mL
	水 : 11.2mg/mL

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約226℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

pK_{a1} : 6.11（カルボキシ基、滴定法）³⁾

pK_{a2} : 8.18（ピペラジンの4位の窒素、滴定法）³⁾

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$: -92～-99°（脱水物に換算したもの0.1g、メタノール、10mL、100mm）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に暗淡黄白色になる。

安定性 ³⁾	液性（pH）	中性及び塩基性水溶液では、安定である。
	光	1.0mg/mL水溶液は、蛍光灯照射下(30万lx・hr)で約44%分解する。

3. 有効成分の確認試験法

日局「レボフロキサシン水和物」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

（極大吸収波長：226nm付近、293nm付近及び326nm付近）²⁾

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

2800 cm^{-1} : CHの伸縮振動、1725 cm^{-1} : カルボキシ基 C=Oの伸縮振動、

1620 cm^{-1} : 芳香族ケトン C=Oの伸縮振動、1520 cm^{-1} : 芳香環 C=Cの伸縮振動、

1470 cm^{-1} : CH₃の変角振動、1050 cm^{-1} : C-Fの伸縮振動、805 cm^{-1} : 芳香環

C-Hの面外変角振動)²⁾

4. 有効成分の定量法

日局「レボフロキサシン水和物」の定量法による。

電位差滴定法

0.1mol/L 過塩素酸 1mL=36.14mg $C_{18}H_{20}FN_3O_4$

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

点眼

(2) 剤形の区別、外観及び性状

剤形：水性点眼剤

性状：微黄色～黄色澄明の液

(3) 製剤の物性

該当資料なし

(4) 識別コード

該当しない

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等

pH：6.2～6.8

浸透圧比：1.0～1.1（0.9%生理食塩液に対する比）

(6) 無菌の有無

無菌製剤である。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1mL中 レボフロキサシン水和物 5mg 含有

(2) 添加物

クエン酸ナトリウム水和物、塩化ナトリウム、pH調節剤

(3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

◎加速試験⁴⁾

包装形態：ポリエチレン（容器）、ポリエチレン（中栓）、ポリプロピレン（キャップ）、紙箱

試験条件：40±1°C/75±5%RH

試験期間：6ヵ月

試験項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性異物検査、不溶性微粒子試験、無菌試験、定量試験

試験項目	規格	試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状	(1)	適合 (微黄色)	適合 (微黄色)	適合 (微黄色)	適合 (微黄色)
確認試験	(2)	適合	適合	適合	適合
	(3)	適合	—	—	適合
浸透圧比	(4)	1.1	1.1	1.1	1.1
pH	(5)	6.5	6.5	6.5	6.5
不溶性異物検査	(6)	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	(7)	適合	適合	適合	適合
無菌試験	(8)	適合	—	—	適合
定量試験	(9)	100.1	100.6	99.5	101.5

(1)微黄色～淡黄色澄明の水性点眼剤である。

(2)紫外可視吸光度測定法：波長 292～296nm に吸収の極大を示す。

(3)液体クロマトグラフィー：標準溶液のレボフロキサシンのピーク保持時間に対する試料溶液のレボフロキサシンのピーク保持時間の比は 0.90～1.10 である。

(4)1.0～1.1

(5)6.2～6.8

(6)澄明で、たやすく検出される不溶性異物を認めない。

(7)300 μ m 以上の不溶性微粒子が 1 個/mL 以下である。

(8)メンブランフィルター法：微生物の増殖が認められない。

(9)95.0～105.0%

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、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。

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「レボフロキサシン点眼液」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法（極大吸収波長：225～229nm 及び 292～296nm）

(2) 液体クロマトグラフィー

11. 製剤中の有効成分の定量法

日局「レボフロキサシン点眼液」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

12. 力価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

15. 刺激性

【眼刺激性試験】⁵⁾

〈参考〉

「医薬品の安全性に関する非臨床試験の実施の基準に関する省令（平成9年3月26日 厚生省令第21号、一部改正 平成20年6月13日 厚生労働省令第114号）」に準じる。

試験方法

日本白色種雄性ウサギの下眼瞼を穏やかに引き離し、左眼の結膜嚢内にレボフロキサシン点眼液0.5%「JG」を、対照として右眼の結膜嚢内に生理食塩液を、それぞれ50 μ L点眼した。点眼後、上下眼瞼を緩やかに合わせ約2秒間保持した。この操作を約30分間隔で10回行った。最終投与24、48、72及び96時間後に、両眼について、Draize法による眼障害判定基準に従って前眼部障害度及びフルオレセイン染色斑の判定基準に従って角膜上皮障害度を判定した。

判定基準

- ・ Draize法による眼障害判定基準

平均評点の最高点* (MMTS)	評価
$0 \leq \text{MMTS} \leq 5$	無刺激物
$5 < \text{MMTS} \leq 15$	軽度刺激物
$15 < \text{MMTS} \leq 30$	刺激物
$30 < \text{MMTS} \leq 60$	中等度刺激物
$60 < \text{MMTS} \leq 80$	中～強度刺激物
$80 < \text{MMTS} \leq 110$	強度刺激物

*：投与後24、48、72、96時間における平均評点の最高点

・フルオレセイン染色斑の判定基準

判定基準	評点
フルオレセイン染色なし。	0
わずかな範囲に限られたかすかなフルオレセイン染色。 散乱光による下部構造の観察は容易である。	1
わずかな範囲に限られた中程度のフルオレセイン染色。 散乱光による下部構造の観察では、細部がはっきりとわからない。	2
著しいフルオレセイン染色。染色が角膜の広い範囲におよぶ。 散乱光による下部構造の観察は、全く見えないことはないが困難である。	3
著しいフルオレセイン染色。散乱光による下部構造の観察は不可能。	4

試験結果

表1. Draize法による眼障害判定基準による前眼部障害度

	24時間	48時間	72時間	96時間
右眼 (レボフロキサシン 点眼液0.5%「JG」)	0	0	0	0
左眼 (生理食塩液)	0	0	0	0

(n=6)

表2. フルオレセイン染色斑の判定基準による角膜上皮障害度

	24時間	48時間	72時間	96時間
右眼 (レボフロキサシン 点眼液0.5%「JG」)	0	0	0	0
左眼 (生理食塩液)	0	0	0	0

(n=6)

結論

本試験条件下で、レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」はウサギの前眼部に対し刺激性を示さない。

16. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 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、マイクロコッカス属、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

2. 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。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

- (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。
- (2)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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ピリドンカルボン酸系化合物：ノルフロキサシン、オフロキサシン、エノキサシン水和物、塩酸シプロフロキサシン、トスフロキサシントシル酸塩水和物 等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

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。²⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

【生物学的同等性試験】

〈参考〉

◎ウサギを用いた眼組織内濃度⁶⁾

レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」と標準製剤をそれぞれウサギに点眼し、点眼30分後の眼房水中及び角膜中レボフロキサシン濃度を測定した。その結果、両剤の眼房水中及び角膜中レボフロキサシン濃度に有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された。

表1. 点眼30分後の眼房水中レボフロキサシン濃度

	レボフロキサシン濃度 (ng/mL)
レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」	561±250
標準製剤	539±164

(Mean±S.D.,n=10)

表2. 点眼30分後の角膜中レボフロキサシン濃度

	レボフロキサシン濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」	5240±2150
標準製剤	5550±1730

(Mean±S.D.,n=10)

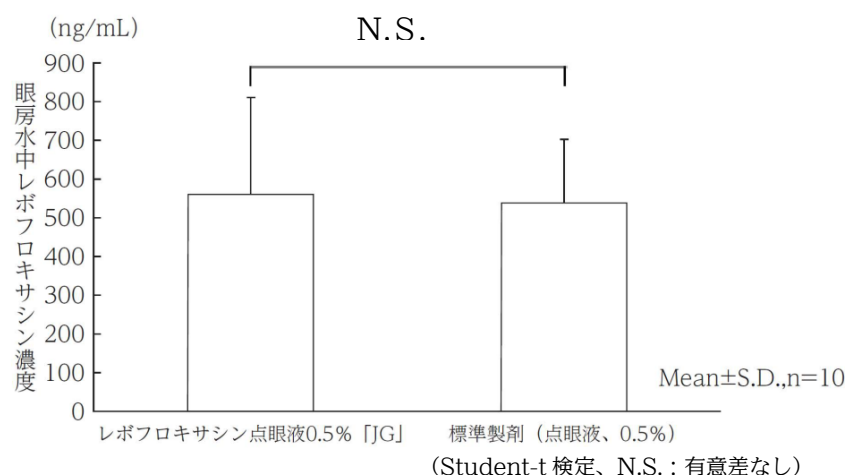
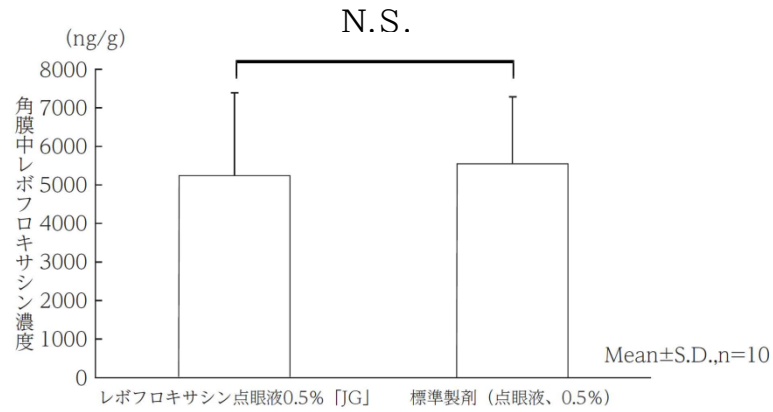


図1. 点眼30分後の眼房水中レボフロキサシン濃度



(Student-t検定、N.S. : 有意差なし)

図2. 点眼30分後の角膜中レボフロキサシン濃度

◎ウサギ緑膿菌角膜感染症モデルに対する効果⁶⁾

レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」と標準製剤を実験的ウサギ緑膿菌角膜感染症モデルを用い、点眼後の角膜混濁をスコア化した。その結果両剤の角膜混濁スコアは無投与およびレボフロキサシン点眼液0.5%「JG」基剤に対し有意な差が認められ、また両剤の角膜混濁スコアに有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された。

表3. 角膜混濁のスコア基準

スコア	角膜混濁症状
0	角膜混濁がない
1	角膜混濁が直径6mmより小さい
2	角膜混濁が直径6mmに及ぶ
3	角膜混濁が直径6mmより大きい
4	角膜混濁が角膜全体に及ぶ

表4. 個々の角膜混濁のスコア推移

	スコア			
	0時間	36時間	60時間	84時間
対照（無投与）群	0.0±0.0	4.0±0.0	4.0±0.0	4.0±0.0
レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」群	0.0±0.0	0.0±0.0	0.0±0.0	0.0±0.0
標準製剤群	0.0±0.0	0.0±0.0	0.0±0.0	0.0±0.0
レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」基剤群	0.0±0.0	4.0±0.0	4.0±0.0	4.0±0.0

(Mean±S.D.,n=10)

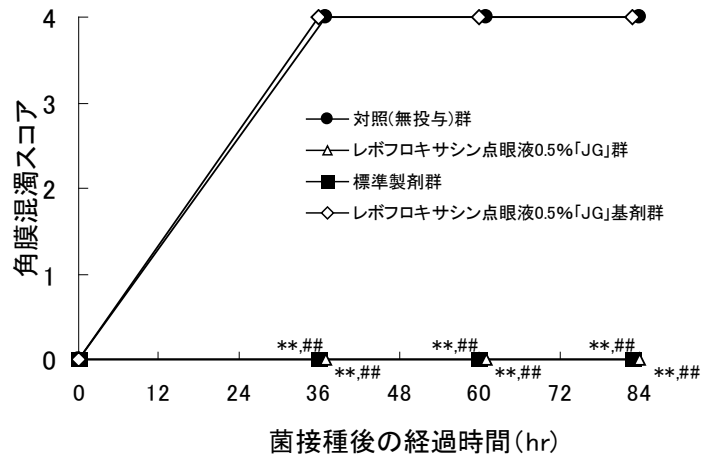


図3. 角膜混濁のスコア推移

**p<0.01, vs 対照(無投与)群 (Steel-Dwass型多重比較検定)

##p<0.01, vs レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」基剤群 (Steel-Dwass型多重比較検定)

(Mean±S.D.,n=10)

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

- (1) 治療上有効な血中濃度
該当資料なし
- (2) 最高血中濃度到達時間
該当資料なし
- (3) 臨床試験で確認された血中濃度
該当資料なし
- (4) 中毒域
該当資料なし
- (5) 食事・併用薬の影響
該当資料なし
- (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因
該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) 吸収速度定数
該当資料なし
- (3) バイオアベイラビリティ
該当資料なし
- (4) 消失速度定数
該当資料なし
- (5) クリアランス
該当資料なし
- (6) 分布容積
該当資料なし
- (7) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

- (1) 血液－脳関門通過性
該当資料なし
- (2) 血液－胎盤関門通過性
該当資料なし

- (3) 乳汁への移行性
該当資料なし
- (4) 髄液への移行性
該当資料なし
- (5) その他の組織への移行性
該当資料なし

5. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
該当資料なし
- (2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種
該当資料なし
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
該当資料なし
- (4) 代謝物の活性の有無及び比率
該当資料なし
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
該当資料なし

6. 排泄

- (1) 排泄部位及び経路
該当資料なし
- (2) 排泄率
該当資料なし
- (3) 排泄速度
該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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て過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目 -2. 用法及び用量」の項参照

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

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。

(3) 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	発疹、蕁麻疹、眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎、掻痒感
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

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 -2.禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）、
-8.副作用(2)重大な副作用と初期症状、(3)その他の副作用」の項参照

9. 高齢者への投与

該当しない

10. 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〕

11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

該当しない

14. 適用上の注意

(1)投与経路：

点眼用에만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。

15. その他の注意

該当しない

16. その他
該当しない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤	レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」	処方箋医薬品※
有効成分	レボフロキサシン水和物	該当しない

※注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

遮光保存、室温保存、気密容器

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目-14.適用上の注意」の項参照
くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」
5mL×10本

7. 容器の材質

ポリエチレン（容器）、ポリエチレン（中栓）、ポリプロピレン（キャップ）、紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：クラビット[®]点眼液0.5%（参天製薬＝第一三共）、レボフロキサシン錠
250mg/500mg「CH」 他

同 効 薬：ノルフロキサシン、オフロキサシン、エノキサシン水和物、塩酸シプロフロキサシン、
トスフロキサシントシル酸塩水和物 等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2011年7月15日

承認番号：22100AMX00365000

11. 薬価基準収載年月日

2011年11月28日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
121140501	1319742Q1063	622114001

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 田中千賀子、加藤隆一、成宮周編集；NEW薬理学（改訂第7版）、567（2017）、南江堂
- 2) 第十七改正日本薬局方解説書、廣川書店、C - 5957（2016）
- 3) 日本版オレンジブック研究会；
オレンジブック総合版 <http://www.jp-orangebook.gr.jp/index.html>
- 4) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；
レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」の安定性試験（2011）
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；
レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」の眼刺激性試験（2011）
- 6) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；
レボフロキサシン点眼液0.5%「JG」の生物学的同等性試験（2011）

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA、オーストラリア分類とは異なる。

【使用上の注意】「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〕

	分類
FDA : Pregnancy Category	C (2010年)
オーストラリア分類	該当資料なし

参考：分類の概要

FDA : Pregnancy Category

Consistency of Pregnancy Labeling Across Therapeutic Class for the Top 20 Drugs(2010) by Sales ; <<http://www.fda.gov/downloads/scienceresearch/specialtopics/womenshealthresearch/ucm309040.pdf>> (2013/09/18 アクセス)

C : Animal studies have shown an adverse effect and there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women. Or no animal studies have been conducted and there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women.

XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし

Memo

Memo



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目9番1号