

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%「わかもと」

LEVOFLOXACIN OPHTHALMIC SOLUTION 0.5%「WAKAMOTO」

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意-医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1mL中にレボフロキサシン水和物5mgを含有
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：わかもと製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション TEL：03-3279-0379 FAX：03-3279-1272 医療関係者向けホームページ： https://www.wakamoto-pharm.co.jp/

本IFは2021年7月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>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の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)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を掲載する医薬品情報提供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・薬剤師等にとっても、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。

- ②IF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「IF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。

[IFの作成]

- ①IF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。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIF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、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIF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。

[IFの発行]

- ①「IF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、「IF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IFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF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IFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページ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、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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、IF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、IF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、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

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もあり、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

IF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。IF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、IF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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	14
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	14
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	14
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	14
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	15
7. CAS登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	15
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	15
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	15
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	15
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	15
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	15
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	16
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	16
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	4	2. 毒性試験	16
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	X. 管理的事項に関する項目	17
5. 製剤の各種条件下における安定性	5	1. 規制区分	17
6. 溶解後の安定性	5	2. 有効期間又は使用期限	17
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	3. 貯法・保存条件	17
8. 溶出性	5	4. 薬剤取扱い上の注意点	17
9. 生物学的試験法	5	5. 承認条件等	17
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	5	6. 包装	17
11. 製剤中の有効成分の定量法	5	7. 容器の材質	17
12. 力価	5	8. 同一成分・同効薬	17
13. 混入する可能性のある夾雑物	6	9. 国際誕生年月日	18
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	18
15. 刺激性	6	11. 薬価基準収載年月日	18
16. その他	6	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	18
V. 治療に関する項目	7	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	18
1. 効能又は効果	7	14. 再審査期間	18
2. 用法及び用量	7	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	18
3. 臨床成績	7	16. 各種コード	18
VI. 薬効薬理に関する項目	9	17. 保険給付上の注意	18
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	XI. 文献	19
2. 薬理作用	9	1. 引用文献	19
VII. 薬物動態に関する項目	11	2. その他の参考文献	19
1. 血中濃度の推移・測定法	11	XII. 参考資料	19
2. 薬物速度論的パラメータ	11	1. 主な外国での発売状況	19
3. 吸収	12	2. 海外における臨床支援情報	19
4. 分布	12	XIII. 備考	19
5. 代謝	12	その他の関連資料	19
6. 排泄	13		
7. トランスポーターに関する情報	13		
8. 透析等による除去率	13		

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%「わかもと」は、レボフロキサシン水和物を有効成分とするニューキノロン系の広範囲抗菌剤である。

レボフロキサシンはオフロキサシンと平面構造が同じであるが、オフロキサシンがR(+)-体、S(-)-体からなる光学活性体を含むのに対し、レボフロキサシンは効力のあるS(-)-体のみ含有している。レボフロキサシン水和物は、幅広い抗菌スペクトルと強い抗菌活性を持ち、細菌のDNAの複製を妨げることで殺菌的に作用する。そのため各種の細菌性外眼部感染症に適応しており、また、房水内最高濃度が高く眼組織内への移行も良好なため、術後の抗菌にも適している。

レボフロキサシン点眼液0.5%「わかもと」は、後発医薬品として2011年7月に製造販売承認を取得し、2014年11月に薬価収載、発売した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) レボフロキサシン点眼液0.5%の後発医薬品である。

(2) 生物学的同等性試験により、標準製剤との同等性が確認されている。

(「VI. 薬効薬理に関する項目 - 2. 薬理作用」、「VII. 薬物動態に関する項目 - 4. 分布」の項 参照)

(3) 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。(再審査対象外)

レボフロキサシン点眼液0.5%の重大な副作用(頻度不明)として、ショック、アナフィラキシーの報告がある。(「VIII. 安全性(使用上の注意等)」に関する項目 - 8. 副作用」の項 参照)

II. 名称に関する項目

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%「わかもと」

(2) 洋名

LEVOFLOXACIN OPHTHALMIC SOLUTION 0.5%「WAKAMOTO」

(3) 名称の由来

有効成分名、濃度及び社名

(平成17年9月22日付け薬食審査発第0922001号に基づく)

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

レボフロキサシン水和物 (JAN)

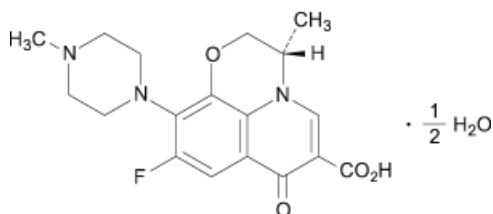
(2) 洋名(命名法)

Levofloxacin Hydrate (JAN)

(3) ステム

ナリジクス酸誘導体系抗菌剤：-oxacin (-floxacin)

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：LVFX (日本化学療法学会制定の抗微生物薬略号)

7. CAS登録番号

138199-71-0

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。

(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。

(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

該当資料なし

(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。

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「レボフロキサシン水和物」の確認試験による

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「レボフロキサシン水和物」の定量法による

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

剤形の区別：点眼剤

外観及び性状：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

キャップの色：クリアピンク

キャップ天面：

(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（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中にレボフロキサシン水和物5mgを含有

(2) 添加物

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

長期保存試験¹⁾、加速試験²⁾、苛酷試験（光³⁾、熱⁴⁾）

試験項目：含量、性状、確認試験*、浸透圧比、pH、純度試験（類縁物質）*、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験**、無菌試験**

*：加速試験のみ実施

**：長期保存試験、加速試験のみ実施

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25±2℃、60±5%RH、遮光	36 ヶ月	最終包装	規格に適合
加速試験	40±1℃、75±5%RH、遮光	6 ヶ月	ポリプロピレン製点眼ボトル (容器正立)	規格に適合
苛酷試験 (熱)	60℃	30 日	ポリプロピレン製点眼ボトル (シュリンクなし)	規格に適合
苛酷試験 (光)	25±1℃、60±5%RH 白色蛍光灯 3000lx	30 万 lx・hr	ポリプロピレン製点眼ボトル (容器横転、シュリンク有)	規格に適合

開封後安定性試験（光）⁵⁾

試験項目：含量、性状、浸透圧比、pH、不溶性異物試験

保存条件	保存期間	保存形態	結果
25±1℃、60±5%RH、白色蛍光灯 3000lx	30 万 lx・hr	ポリプロピレン製点眼ボトル (容器横転、シュリンクなし)	規格に適合

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

日本薬局方「レボフロキサシン点眼液」の確認試験による

11. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方「レボフロキサシン点眼液」の定量法による

12. 力価

該当しない

IV. 製剤に関する項目

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

該当しない

15. 刺激性

眼粘膜刺激性試験⁶⁾

1群家兎5羽に対し、片眼に对照として生理食塩液を、対側眼に本剤又は標準製剤（点眼剤、0.5%）を1回50 μ L、0.5時間間隔で10回点眼し、瞬目回数と刺激性を評価した。瞬目回数については、初回点眼時に点眼直後から3分間の瞬目回数を肉眼的に計測した結果、各群の点眼日前日と点眼日間の有意差も認められず、点眼日における本剤群と標準製剤群の有意差は認められなかった。刺激性の評価については、点眼前、最終点眼1、3、5、24時間後に、両眼の角膜、虹彩及び結膜について観察し、Draizeの基準により判定した結果、両群全例で各群点眼前と最終点眼後24時間の個別合計評点（ITS）は評点0であり、また生理食塩液点眼の对照眼も評点0で、差は見られなかった。

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

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

V. 治療に関する項目

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

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：眼組織

作用機序：ニューキノロン系抗菌薬。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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 角膜緑膿菌感染モデルに対する治療効果（ウサギ）

緑膿菌を接種して作製した実験的ウサギ角膜緑膿菌感染症に対し、菌接種4時間後から本剤50 μ Lを1日3回3日間点眼した結果、投与4日目の本剤の効果は、生理食塩液に比して有意であることが認められた⁷⁾。

<生物学的同等性試験⁷⁾>

対象：白色家兎20例（本剤群：10例、標準製剤（点眼剤、0.5%）群：10例）

方法：白色家兎の角膜に創を作成した後、緑膿菌液を点眼し作成した角膜感染症モデルを用い、片眼に生理食塩液、対側眼に本剤又は標準製剤（点眼剤、0.5%）各50 μ Lを菌接種4時間後から1日3回3日間点眼し、菌接種後3時間後から24時間ごとに8日間にわたり、外眼部感染症状の観察を行った。外眼部感染症状は、「外眼部感染症状の観察基準^{*}」に従い、スコア化した。

結果：本剤及び標準製剤群いずれにおいても、対側の生理食塩液群に対して総合スコアで有意な効果を認めた（Wilcoxonの順位和検定、本剤及び標準製剤いずれにおいても、対側の生理食塩液群に対して $p<0.001$ ）。

投与4日目の改善度スコア^{*}の平均値の差を90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

※外眼部感染症状の観察基準（栗山裕ら：ウサギ緑膿菌及び表皮ぶどう球菌角膜感染症に対するLomefloxacin点眼液の効果。日本眼科紀要. 1993；44：434～44より一部改変）

*改善度スコア=「生理食塩液投与眼の総合スコア」-「本剤又は標準製剤投与眼の総合スコア」

	改善度スコア
レボフロキサシン点眼液 0.5%「わかもと」	14.3 \pm 0.6
標準製剤（点眼剤、0.5%）	14.3 \pm 0.6

(Mean \pm S.E.,n=10)

改善度スコアのパラメータは、被験個体の選択、症状観察項目・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

VI. 薬効薬理に関する項目

2) 角膜黄色ブドウ球菌感染モデルに対する治療効果 (ウサギ)

黄色ブドウ球菌を接種して作製した実験的ウサギ角膜黄色ブドウ球菌感染症に対し、菌接種4時間後から本剤50 μ Lを1日3回3日間点眼した結果、投与3日目の本剤の効果は、生理食塩液に比して有意であることが認められた⁷⁾。

<生物学的同等性試験⁷⁾>

対象：白色家兎20例（本剤群：10例、標準製剤（点眼剤、0.5%）群：10例）

方法：白色ウサギの角膜実質内に黄色ブドウ球菌液10 μ L注入し、角膜感染モデルを作製した。

片眼に生理食塩液、対側眼に本剤又は標準製剤（点眼剤、0.5%）各50 μ Lを菌接種4時間後から1日3回3日間点眼し、菌接種後3時間後から24時間ごとに6日間にわたって、外眼部感染症状の観察を行った。外眼部感染症状は、「外眼部感染症状の観察基準^{*}」に従い、スコア化した。

結果：本剤及び標準製剤群いずれにおいても、対側の生理食塩液群に対して総合スコアで有意な効果を認めた（Wilcoxonの順位和検定、本剤及び標準製剤いずれにおいても、対側の生理食塩液群に対して $p<0.001$ ）。

投与3日目の改善度スコア^{*}の平均値の差を90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

※外眼部感染症状の観察基準（栗山裕ら：ウサギ緑膿菌及び表皮ぶどう球菌角膜感染症に対するLomefloxacin点眼液の効果。日本眼科紀要. 1993；44：434～44より一部改変）

*改善度スコア=「生理食塩液投与眼の総合スコア」-「本剤又は標準製剤投与眼の総合スコア」

	改善度スコア
レボフロキサシン点眼液 0.5% 「わかもと」	18.1 \pm 0.7
標準製剤（点眼剤、0.5%）	17.5 \pm 0.7

(Mean \pm S.E.,n=10)

改善度スコアのパラメータは、被験個体の選択、症状観察項目・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(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

VII. 薬物動態に関する項目

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

<参考：家兎>

生物学的同等性試験⁸⁾（房水中濃度）

方法：本剤又は標準製剤（点眼剤、0.5%）を30 μ L単回点眼し、1時間後（ T_{max} ）の房水中レボフロキサシン濃度（ C_{max} ）を測定した。

結果：得られた房水中のレボフロキサシン濃度を対数変換し、その平均値の差を同等性の指標として評価した。平均値の差が判定基準 $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ の範囲内であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された。

	C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)
レボフロキサシン点眼液 0.5%「わかもと」	0.919 ± 0.507
標準製剤（点眼剤、0.5%）	0.910 ± 0.439

(Mean \pm S.D., n=33)

眼組織中濃度並びに C_{max} 等のパラメータは、被験個体の選択、検体の採取時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

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

＜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。

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。(再審査対象外)

(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、そう痒感
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

〔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

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

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

(1) 投与経路 点眼用にのみ使用すること。
(2) 薬剤交付時 次のことを患者へ指導すること。
1) 原則として結膜囊内に点眼し、1～5 分間閉瞼と共に涙嚢部を圧迫すること。
2) 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。
3) 点眼のとき、液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。
4) 必ず添付の投薬袋に入れて保存すること。

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

「IV. 製剤に関する項目-15. 刺激性」の項 参照

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 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）

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期間：3年

3. 貯法・保存条件

遮光、気密容器、室温保存

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

「X. 管理的事項に関する項目-3. 貯法・保存条件」の項 参照

(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

5mL×5本、5mL×10本

7. 容器の材質

ボ ト ル：ポリプロピレン

中 栓：ポリエチレン

キャ ッ プ：ポリプロピレン

ラ ベ ル：ポリエチレンテレフタレート

8. 同一成分・同効薬

同一成分：クラビット点眼液0.5%・1.5%、クラビット錠250mg・500mg・細粒10%、

クラビット点滴静注500mg/20mL・バッグ500mg/100mL

同 効 薬：オフロキサシン、ガチフロキサシン水和物、トスフロキサシントシル酸塩水和物、ノルフロキサシン、モキシフロキサシン塩酸塩、塩酸ロメフロキサシン 等

X. 管理的事項に関する項目

9. 国際誕生年月日

1993年10月1日

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：22300AMX00796

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

販売名	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
レボフロキサシン点眼液 0.5%「わかもと」	120930301	1319742Q1233	622093001

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1)わかもと製薬株式会社 社内資料[長期保存試験]
- 2)わかもと製薬株式会社 社内資料[加速試験]
- 3)わかもと製薬株式会社 社内資料[苛酷試験（光安定性）]
- 4)わかもと製薬株式会社 社内資料[苛酷試験（熱安定性）]
- 5)わかもと製薬株式会社 社内資料[開封後安定性試験]
- 6)わかもと製薬株式会社 社内資料[眼粘膜刺激性試験]
- 7)わかもと製薬株式会社 社内資料[生物学的同等性試験（感染モデル）]
- 8)わかもと製薬株式会社 社内資料[生物学的同等性試験（房水中濃度）]

2. その他の参考文献

- ・ 第17改正日本薬局方 解説書, 廣川書店, p.C-5957 (2016)
- ・ 第17改正日本薬局方 解説書, 廣川書店, p.C-5970 (2016)

XII. 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

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料