

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

処方箋医薬品^{注)}

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%「キッセイ」

Levofloxacin Eye Drops 0.5%「KISSEI」

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%「キッセイ」

Levofloxacin Eye Drops 1.5%「KISSEI」

注) 注意-医師等の処方箋により使用すること。

剤形	点眼剤		
製剤の規制区分	処方箋医薬品 ^{注)} (注) 注意-医師等の処方箋により使用すること)		
規格・含量	レボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」: 1mL 中 日局レボフロキサシン水和物 5mg 含有 レボフロキサシン点眼液 1.5% 「キッセイ」: 1mL 中 日局レボフロキサシン水和物 15mg 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		レボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5% 「キッセイ」
	製造販売承認年月日	2011年7月15日	2014年2月14日
	薬価基準収載年月日	2011年11月28日	2014年6月20日
	発売年月日	2011年11月28日	2014年6月20日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元: キッセイ薬品工業株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	キッセイ薬品工業株式会社 くすり相談センター フリーダイヤル: 0120-007-622 受付時間: 土日祝日・当社休日を除く月～金 9:00-17:40 医療関係者向けホームページ https://www.kissei.co.jp/di_enter/		

本IFは2020年3月改訂(第5版:レボフロキサシン点眼液0.5%「キッセイ」),2020年3月改訂(第5版:レボフロキサシン点眼液1.5%「キッセイ」)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」<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新たな 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.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 A 4 判、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

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. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	
1. 販売名	2
(1) 和名	2
(2) 洋名	2
(3) 名称の由来	2
2. 一般名	2
(1) 和名(命名法)	2
(2) 洋名(命名法)	2
(3) ステム	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名(命名法)	2
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2
7. CAS登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
(1) 外観・性状	3
(2) 溶解性	3
(3) 吸湿性	3
(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点	3
(5) 酸塩基解離定数	3
(6) 分配係数	4
(7) その他の主な示性値	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	5
(1) 投与経路	5
(2) 剤形の区別, 外観及び性状	5
(3) 製剤の物性	5
(4) 識別コード	5
(5) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定なpH域等	5
(6) 無菌の有無	5
2. 製剤の組成	5
(1) 有効成分(活性成分)の含量	5
(2) 添加物	5
(3) 添付溶解液の組成及び容量	6
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	6
4. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意	6
5. 製剤の各種条件下における安定性	6
6. 溶解後の安定性	7
7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	7
8. 溶出性	11
9. 生物学的試験法	11
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	11
11. 製剤中の有効成分の定量法	11
12. 力価	11
13. 混入する可能性のある夾雑物	11
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	11
15. 刺激性	11
16. その他	11
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	12
2. 用法及び用量	12
3. 臨床成績	12
(1) 臨床データパッケージ	12
(2) 臨床効果	12
(3) 臨床薬理試験	12
(4) 探索的試験	12
(5) 検証的試験	12
(6) 治療的使用	13
VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	14
2. 薬理作用	14
(1) 作用部位・作用機序	14
(2) 薬効を裏付ける試験成績	15
(3) 作用発現時間・持続時間	17
VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	18
(1) 治療上有効な血中濃度	18
(2) 最高血中濃度到達時間	18
(3) 臨床試験で確認された血中濃度	18
(4) 中毒域	18
(5) 食事・併用薬の影響	18
(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	18
2. 薬物速度論的パラメータ	18
(1) 解析方法	18
(2) 吸収速度定数	18
(3) バイオアベイラビリティ	18
(4) 消失速度定数	18
(5) クリアランス	18
(6) 分布容積	18
(7) 血漿蛋白結合率	18
3. 吸収	18
4. 分布	19
(1) 血液-脳関門通過性	19

(2) 血液-胎盤関門通過性	19	(2) 副次的薬理試験	24
(3) 乳汁への移行性	19	(3) 安全性薬理試験	24
(4) 髄液への移行性	19	(4) その他の薬理試験	24
(5) その他の組織への移行性	19	2. 毒性試験	24
5. 代謝	20	(1) 単回投与毒性試験	24
(1) 代謝部位及び代謝経路	20	(2) 反復投与毒性試験	24
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	20	(3) 生殖発生毒性試験	24
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	20	(4) その他の特殊毒性	24
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	20	X. 管理的事項に関する項目	
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	20	1. 規制区分	25
6. 排泄	20	2. 有効期間又は使用期限	25
(1) 排泄部位及び経路	20	3. 貯法・保存条件	25
(2) 排泄率	20	4. 薬剤取扱い上の注意点	25
(3) 排泄速度	20	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	25
7. トランスポーターに関する情報	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)	25
8. 透析等による除去率	20	(3) 調剤時の留意点について	25
VII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目		5. 承認条件等	25
1. 警告内容とその理由	21	6. 包装	25
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	21	7. 容器の材質	25
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	21	8. 同一成分・同効薬	25
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	21	9. 国際誕生年月日	25
5. 慎重投与内容とその理由	21	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21	11. 薬価基準収載年月日	26
7. 相互作用	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	26
(1) 併用禁忌とその理由	21	13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	26
(2) 併用注意とその理由	21	14. 再審査期間	26
8. 副作用	21	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	26
(1) 副作用の概要	21	16. 各種コード	26
(2) 重大な副作用と初期症状	21	17. 保険給付上の注意	26
(3) その他の副作用	22	XI. 文献	
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	22	1. 引用文献	27
(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	22	2. その他の参考文献	27
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	22	XII. 参考資料	
9. 高齢者への投与	22	1. 主な外国での発売状況	28
10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与	22	2. 海外における臨床支援情報	28
11. 小児等への投与	22	XIII. 備考	
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	22	その他の関連資料	29
13. 過量投与	22		
14. 適用上の注意	23		
15. その他の注意	23		
16. その他	23		
IX. 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	24		
(1) 薬効薬理試験	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は、ニューキノロン系抗菌薬であるレボフロキサシン水和物 (LVFX) を有効成分とする広範囲抗菌点眼剤である。LVFX は、ラセミ体であるオフロキサシン (OFLX) の一方の光学活性体 *S*-(-)体であり、OFLX は化学構造中に1個の不斉炭素を有するため、2つの光学活性 *S*-(-)体、*R*-(+)体が1:1で存在するが、そのうちの抗菌活性本体 *S*-(-)体がLVFXである。

本剤は、後発医薬品としてレボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」は2011年7月に、レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」は2014年2月に製造販売承認を取得した。

また、第十六改正日本薬局方第一追補に「レボフロキサシン点眼液」が収載された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 幅広い抗菌スペクトルを有するニューキノロン系点眼剤である。
2. レボフロキサシン点眼液 0.5%、レボフロキサシン点眼液 1.5%の後発医薬品である。
3. 生物学的同等性試験により、先発医薬品との同等性が確認されている。
4. レボフロキサシン点眼液の重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）が報告されている（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）。

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% 「キッセイ」
レボフロキサシン点眼液 1.5% 「キッセイ」

(2) 洋名

Levofloxacin Eye Drops 0.5% 「KISSEI」
Levofloxacin Eye Drops 1.5% 「KISSEI」

(3) 名称の由来

有効成分の一般名より命名

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

レボフロキサシン水和物 (JAN) [1/2 水和物として命名]

(2) 洋名 (命名法)

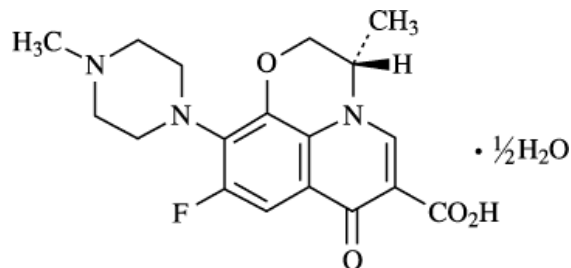
Levofloxacin Hydrate (JAN) [1/2 水和物として命名]
Levofloxacin (USAN) [1/2 水和物として命名]
levofloxacin (INN) [無水物として命名]

(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

構造式：



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)

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 (IUPAC)

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

100986-85-4 [無水物]
138199-71-0 [1/2 水和物]

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。

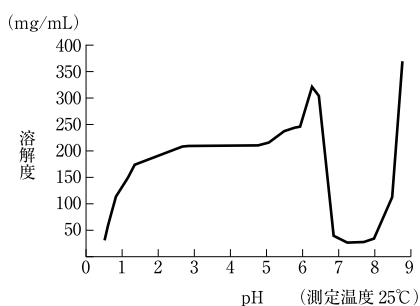
各種溶媒における溶解度

溶媒	本品 1g を溶解するのに 要する溶媒量 (mL) ¹⁾	日局の 溶解性表現
酢酸（100）	3.7	溶けやすい
水	4.0×10	やや溶けにくい
メタノール	7.9×10	やや溶けにくい
エタノール（99.5）	1.6×10 ²	溶けにくい
0.1mol/L 塩酸試液	—	溶ける

測定温度：20℃

各種 pH の水溶液に対する溶解度¹⁾

pH7～8 付近で最も小さく（約 24mg/mL），pH8 以上および pH7 以下で増大し，pH2 以下で減少する。



(3) 吸湿性¹⁾

11～93%RH において吸湿性は示さなかった。

(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¹⁾

pKa₁：5.5（カルボキシル基）

pKa₂：8.0（ピペラジンの 4 位の窒素）（測定法：電位差滴定法）

(6) 分配係数¹⁾

水層	有機層／水層
0.1mol/L 塩酸	0.003
pH3 (McIlvaine buffer)	0.002
pH5 (McIlvaine buffer)	0.004
pH7 (Sørensen buffer)	0.553
pH8 (Sørensen buffer)	0.242
水	1.022

有機層：n-オクタノール，測定温度 37°C

(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

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

日局「レボフロキサシン水和物」による

4. 有効成分の定量法

日局「レボフロキサシン水和物」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

	レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」
剤形の区別	水性点眼剤	水性点眼剤
規格	1mL中 日局レボフロキサシン水和物5mg含有	1mL中 日局レボフロキサシン水和物15mg含有
外観及び性状	微黄色～淡黄色澄明の液	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
キャップの上部に KISSEI と記載

(5) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等

	レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」
pH	6.2～6.8	6.1～6.9
浸透圧比	1.0～1.1 (生理食塩液に対する比)	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

- 1) レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」
1mL 中 日局レボフロキサシン水和物 5mg 含有する。
- 2) レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」
1mL 中 日局レボフロキサシン水和物 15mg 含有する。

(2) 添加物

- 1) レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」
塩化ナトリウム, 塩酸, 水酸化ナトリウム
- 2) レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」
塩化ナトリウム, ポリソルベート 80, 塩酸, 水酸化ナトリウム

(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

<レボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」>

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験 ²⁾	40℃±1℃, 75%RH±5%, 遮光	6 箇月	5mL ポリプロピレン製点眼ボトル	変化なし

試験項目：含量，性状，確認試験，浸透圧比，pH，無菌試験，不溶性微粒子試験，不溶性異物試験

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
光苛酷試験 ³⁾	25℃±1℃, 60%RH±5%, 3000lx	30万lx・hr	5mL ポリプロピレン製点眼ボトル (シュリンクなし，点眼袋なし)	含量の低下
		120万lx・hr	5mL ポリプロピレン製点眼ボトル (シュリンクあり，点眼袋あり)	変化なし

試験項目：含量，性状，浸透圧比，pH，不溶性異物試験

<レボフロキサシン点眼液 1.5% 「キッセイ」>

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験 ⁴⁾	40℃±1℃, 75%RH±5%	6 箇月	5mL ポリエチレン製点眼ボトル	変化なし

試験項目：含量，性状，確認試験，浸透圧比，pH，無菌試験，不溶性微粒子試験，不溶性異物試験

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
光苛酷試験 ⁵⁾	25℃±1℃, 60%RH±5%, 3000lx	60万lx・hr	5mL ポリエチレン製点眼ボトル (シュリンクなし，点眼袋なし)	含量の低下*
		120万lx・hr	5mL ポリエチレン製点眼ボトル (シュリンクあり，点眼袋あり)	変化なし

試験項目：含量，性状，浸透圧比，pH，不溶性異物試験

*：規格内の変化であった。

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）

<レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」>⁶⁾

方法：レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」と各配合薬剤を等量配合し、配合直後、配合 1 時間後、配合 24 時間後まで経時的に外観、pH の変化を観察すると共に配合 24 時間後の残存率（レボフロキサシン）を測定した。

結果：配合後の含量では、若干含量が高い結果を得るものもあったが、配合によりレボフロキサシン含量を著しく低下させるものではなく、配合直後から 24 時間後にかけて変化は見られなかった。性状（外観）・pH の結果では、レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」と各配合薬剤の中間の結果を示したといえ、配合による著しい変化は観察されなかった。

	配合薬剤	測定項目	配合前	配合直後	配合1時間後	配合24時間後	24時間後 レボフロキサシン 残存率
ステロイド剤	ピトス 点眼液 0.1%	外観	白色～乳白色の懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁 (振とう前： 白色の沈殿)	100.9%
		pH	6.5～7.5	6.7	6.7	6.7	
	フルメトロン 点眼液 0.1%	外観	振り混ぜるとき、白濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁 (振とう前： 白色の沈殿)	100.9%
		pH	6.8～7.8	7.0	7.0	7.0	
	リノロサル眼科 耳鼻科用液 0.1%	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	101.8%
		pH	7.5～8.5	8.0	8.0	8.0	
	リンデロン 点眼・点耳・ 点鼻液 0.1%	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	101.3%
		pH	7.5～8.5	7.5	7.5	7.5	
抗緑内障剤	リズモン 点眼液 0.5%	外観	無色～微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	103.5%
		pH	6.5～7.5	6.8	6.8	6.8	
	チモプトル 点眼液 0.5%	外観	無色～微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	103.0%
		pH	6.5～7.5	6.8	6.8	6.8	
	リズモンTG 点眼液 0.5%	外観	無色～微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	105.2%
		pH	7.2～8.0	7.0	7.0	7.0	
	ラタプロスト 点眼液 0.005% 「キッセイ」	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	103.6%
		pH	6.5～6.9	6.6	6.6	6.7	
	キサラタン 点眼液 0.005%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	103.9%
		pH	6.5～6.9	6.7	6.7	6.7	
	イソプロピルウノプロストン 点眼液 0.12% 「サワイ」	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	104.0%
		pH	5.5～7.0	6.5	6.6	6.5	
	レスキュラ 点眼液 0.12%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	103.9%
		pH	5.0～6.5	6.4	6.4	6.4	
ザラカム配合点眼液	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	103.9%	
	pH	5.8～6.2	6.1	6.1	6.1		
抗アレルギー剤	ゼベリン 点眼液 0.1%	外観	無色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	101.2%
		pH	4.5～6.0	6.3	6.3	6.3	
	レボカバチン塩酸塩 点眼液 0.025% 「わかもと」	外観	白色の懸濁	微黄色懸濁	微黄色懸濁	微黄色懸濁	103.1%
		pH	6.0～8.0	6.9	6.8	6.9	
	リボスチン 点眼液 0.025%	外観	振り混ぜるとき、白濁	微黄色懸濁	微黄色懸濁	微黄色懸濁	102.1%
		pH	6.0～8.0	6.7	6.7	6.7	
	ルゲオン 点眼液 2%	外観	無色～微黄色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	102.5%
		pH	6.0～7.0	6.9	7.0	7.0	
インタール 点眼液 2%	外観	無色～微黄色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	101.5%	
	pH	4.0～7.0	7.1	7.1	7.1		
パタノール 点眼液 0.1%	外観	無色～微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	101.9%	
	pH	約7.0	6.9	6.9	6.9		
リザベン 点眼液 0.5%	外観	微黄色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	薄黄色澄明	102.0%	
	pH	7.0～8.0	7.6	7.6	7.6		
非ステロイド性抗炎症剤	ジクロード 点眼液 0.1%	外観	無色～微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	101.1%
		pH	6.0～7.5	7.5	7.5	7.5	
	プロナック 点眼液 0.1%	外観	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	100.2%
		pH	8.0～8.6	8.3	8.3	8.3	
	ネバナック懸濁性 点眼液 0.1%	外観	淡黄色～薄橙色の懸濁	黄色懸濁	黄色懸濁	黄色懸濁 (振とう前： 黄色の沈殿)	102.9%
		pH	7.0～7.8	6.9	6.9	6.9	
ブラノプロフェン 点眼液 0.1% 「わかもと」	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	99.7%	
	pH	7.5～8.5	7.9	7.9	7.9		
ニフラン 点眼液 0.1%	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	100.6%	
	pH	7.0～8.0	7.8	7.8	7.8		
角膜障害治療剤	ムコファジン 点眼液	外観	淡黄色	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	101.1%
		pH	4.5～6.0	6.2	6.2	6.2	
	ヒアレイン 点眼液 0.1%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.8%
		pH	6.0～7.0	6.5	6.5	6.5	
ジクアス 点眼液 3%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.0%	
	pH	7.2～7.8	6.8	6.8	6.8		

<レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」>⁷⁾

方法：レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」と各配合薬剤を等量配合し、配合直後、配合 1 時間後、配合 24 時間後まで経時的に外観、pH 及び浸透圧比の変化を観察すると共に配合 24 時間後の残存率（レボフロキサシン）を測定した。

結果：配合後の含量及び浸透圧比は、配合により著しく上昇、低下するものではなく、配合直後から 24 時間かけて変化は見られなかった。外観及び pH はレボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」と各配合薬剤の中間の結果を示したといえ、配合による著しい変化は観察されなかった。

	配合薬剤	測定項目	配合前	配合直後	配合1時間後	配合24時間後	24時間後 レボフロキサシン 残存率
ステロイド剤	フルメトロン 点眼液 0.1%	外観	白色白濁	微黄白色, 懸濁	微黄白色, 懸濁	微黄白色, 懸濁	101.4%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
		pH	-	6.7	6.7	6.7	
	リンデロン 点眼・点耳・点鼻液 0.1%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	101.6%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
		pH	-	7.1	7.2	7.2	
	点眼・点鼻用 リンデロンA液	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	99.8%
		浸透圧比	-	0.9	-	0.9	
		pH	-	6.8	6.8	6.8	
抗緑内障剤	チモプトールXE 点眼液 0.5%	外観	無色澄明, 粘稠性	微黄色澄明, 粘性	微黄色澄明, 粘性	微黄色澄明, 粘性	100.0%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
		pH	-	6.5	6.5	6.5	
	キサラン 点眼液 0.005%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.0%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
		pH	-	6.6	6.6	6.6	
	タブロス 点眼液 0.0015%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	99.9%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
		pH	-	6.4	6.4	6.4	
	エイゾプト懸濁性 点眼液 1%	外観	白色懸濁	微黄白色, 懸濁	微黄白色, 懸濁	微黄白色, 懸濁	100.2%
		浸透圧比	-	1.1	-	1.1	
		pH	-	6.7	6.8	6.8	
	コソプト配合 点眼液	外観	無色澄明, 粘稠性	微黄色澄明, わずかな粘性	微黄色澄明, わずかな粘性	微黄色澄明, わずかな粘性	100.0%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.1	
		pH	-	6.1	6.1	6.1	
	アイファガン 点眼液 0.1%	外観	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.0%
		浸透圧比	-	1.1	-	1.1	
		pH	-	6.4	6.5	6.5	
抗アレルギー剤	パタノール 点眼液 0.1%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.0%
		浸透圧比	-	1.1	-	1.1	
		pH	-	6.7	6.7	6.8	
非ステロイド性抗炎症剤	ジクロード 点眼液 0.1%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.6%
		浸透圧比	-	1.2	-	1.2	
		pH	-	7.1	7.1	7.1	
	ブロナック 点眼液 0.1%	外観	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	100.7%
		浸透圧比	-	1.2	-	1.2	
		pH	-	8.0	8.0	8.0	
ニフラン 点眼液 0.1%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	101.2%	
	浸透圧比	-	1.1	-	1.2		
	pH	-	7.5	7.5	7.5		
角膜障害治療剤	ヒアレイン 点眼液 0.1%	外観	無色澄明, 粘稠性	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.7%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
		pH	-	6.4	6.5	6.5	
抗感染症治療剤	ベストロン 点眼用 0.5%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.8%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
		pH	-	6.7	6.7	6.8	
	トブラシン 点眼液 0.3%	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	100.1%
		浸透圧比	-	1.0	-	1.0	
pH	-	6.7	6.7	6.7			

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」による
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」による
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	該当しない
15. 刺激性	レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」またはレボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」の眼刺激性について、ウサギを用いて対照物質（生理食塩液）と比較検討した。その結果、両剤ともに刺激性反応は認められず、ウサギの前眼部に対し無刺激であると判断された。
16. その他	特になし

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，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・エジプトチウス（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

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）

該当しない

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

該当しない

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

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⁸⁾。

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⁹⁻¹³⁾。

各種細菌の標的酵素に対する阻害活性（*in vitro* 試験）

	IC ₅₀ (μg/mL)									
	<i>E. coli</i> (DH1, KL-16)		<i>P. aeruginosa</i> (wild type)		<i>S. aureus</i> (FDA209-P)		<i>S. pneumoniae</i> (J24)		<i>E. faecalis</i> (ATCC19433)	
	Gyrase	TopoIV	Gyrase	TopoIV	Gyrase	TopoIV	Gyrase	TopoIV	Gyrase	TopoIV
LVFX	0.38	5.95	0.88	4.96	31	2.3	49.7	17.6	28.1	8.49
CPFV	0.21	5.7	0.55	4.06	52	2.5	135	10.7	27.8	9.30

Gyrase : DNA ジャイレース, TopoIV : トポイソメラーゼ IV

LVFX : レボフロキサシン

CPFV : シプロフロキサシン

阻害の強さは OFLX の 2 倍である¹⁴⁻¹⁶⁾。MIC と MBC には大きな差異は認められず、その作用は殺菌的であり^{14,17)}、菌の形態学的観察では MIC 付近の濃度で溶菌が認められている¹⁸⁾。

哺乳動物細胞のトポイソメラーゼ II に対する阻害活性は、細菌の DNA ジャイレース（トポイソメラーゼ II）阻害活性及びトポイソメラーゼ IV 阻害活性よりはるかに弱いことが認められている^{16,19)}。

トポイソメラーゼ II に対する阻害活性（*in vitro* 試験）

	IC ₅₀ ± S.D. (μg/mL)			選択性	
	Gyrase (<i>E. coli</i> KL-16)	TopoIV (<i>S. aureus</i> FDA209-P)	Topo II (human placenta)	Topo II / Gyrase	Topo II / TopoIV
LVFX	0.39 ± 0.00	2.36 ± 0.41	1,854 ± 35	4,754	786
OFLX	0.71 ± 0.07	4.17 ± 1.25	2,221 ± 48	3,129	532

Gyrase : DNA ジャイレース, TopoIV : トポイソメラーゼ IV, Topo II : トポイソメラーゼ II

LVFX : レボフロキサシン

OFLX : オフロキサシン

(2) 薬効を裏付ける試験成績

＜レボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」＞

生物学的同等性試験

1) 角膜緑膿菌感染モデルに対する治療効果 (ウサギ)²⁰⁾

方法：緑膿菌液 (4.2×10^8 CFU/mL) を 1 眼につき $80 \mu\text{L}$ 接種して作製したウサギ角膜緑膿菌感染モデルに対し、レボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」または標準製剤 $50 \mu\text{L}$ を 1 日 3 回 3 日間 (菌接種後 4, 8, 12, 28, 32, 36, 52, 56 及び 60 時間) 投与し、外眼部感染症状をスコア化して評価した。なお、スコア化は菌接種日を含め 8 日間 1 日 1 回行った。

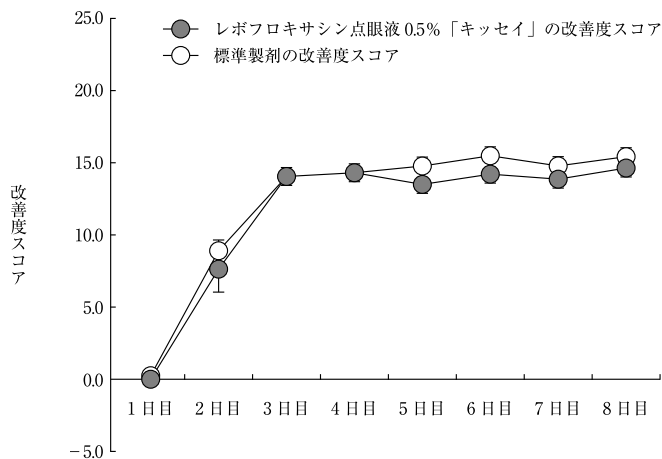
結果：ウサギ角膜緑膿菌感染モデルにおける感染症状の改善度スコアを指標とし、本剤及び標準製剤について得られた投与 4 日目の改善度スコアの平均値の差の 90% 信頼区間を求めた。その結果、平均値の差の 90% 信頼区間が標準製剤の平均値の $\pm 20\%$ の範囲内 ($-10.6 \sim 11.3\%$) であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	改善度スコア	90%信頼区間
レボフロキサシン点眼液0.5% 「キッセイ」	14.3 \pm 0.6	-1.5~1.6
標準製剤 (点眼液, 0.5%)	14.3 \pm 0.6	(-10.6~11.3%)

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

ウサギ角膜緑膿菌感染モデルに対するレボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」及び標準製剤の治療効果

—改善度スコア—



各ポイントは、Mean \pm S.E. (n=10) で示した。

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)²⁰⁾

方法：黄色ブドウ球菌液 (1.9×10^4 CFU/mL) $10 \mu\text{L}$ を角膜実質内に接種して作製したウサギ角膜黄色ブドウ球菌感染モデルに対し、レボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」または標準製剤 $50 \mu\text{L}$ を 1 日 3 回 3 日間 (菌接種後 4, 8, 12, 28, 32, 36, 52, 56, 60 時間) 投与し、外眼部感染症状をスコア化して評価した。なお、スコア化は菌接種日を含め 6 日間 1 日 1 回行った。

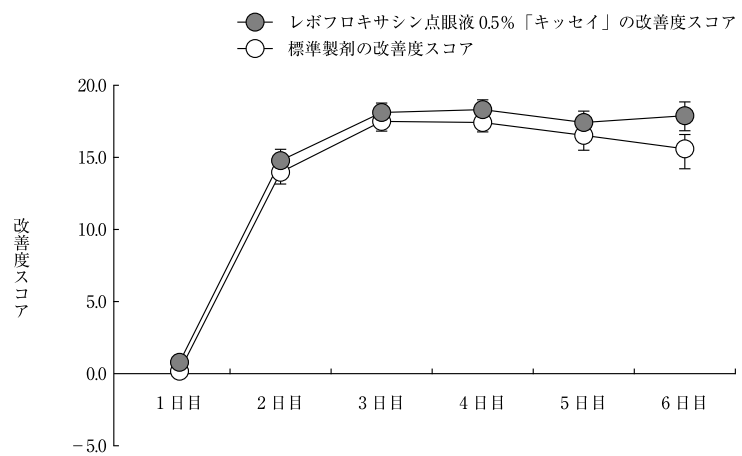
結果：ウサギ角膜黄色ブドウ球菌感染モデルにおける感染症状の改善度スコアを指標とし、本剤及び標準製剤について得られた投与 3 日目の改善度スコアの平均値の差の 90%信頼区間を求めた。その結果、平均値の差の 90%信頼区間が標準製剤の平均値の $\pm 20\%$ の範囲内 ($-6.9 \sim 13.1\%$) であったことから、両剤の生物学的同等性が確認された。

試験物質	改善度スコア	90%信頼区間
レボフロキサシン点眼液0.5% 「キッセイ」	18.1 \pm 0.7	-1.2 \sim 2.3 (-6.9 \sim 13.1%)
標準製剤 (点眼液, 0.5%)	17.5 \pm 0.7	

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

ウサギ角膜黄色ブドウ球菌感染モデルに対するレボフロキサシン点眼液 0.5% 「キッセイ」 及び標準製剤の治療効果

—改善度スコア—



各ポイントは、Mean \pm S.E. (n=10) で示した。

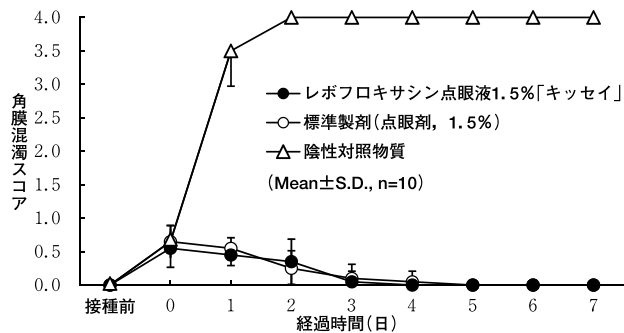
<レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」>

生物学的同等性試験

1) 角膜緑膿菌感染モデルに対する治療効果 (ウサギ)²¹⁾

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6時間後から本剤 50 μ L を1日6回3日間点眼した結果、投与1日目以降の本剤の効果は、生理食塩液に比して有意であることが認められた。

実験的ウサギ角膜緑膿菌感染症における角膜混濁スコアを指標とし、本剤及び標準製剤について得られたスコアについて Steel-Dwass 型多重比較検定を行った結果、観察期間を通じて有意な差は認められなかったことから、両剤の生物学的同等性が確認された。



(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
該当しない
- (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

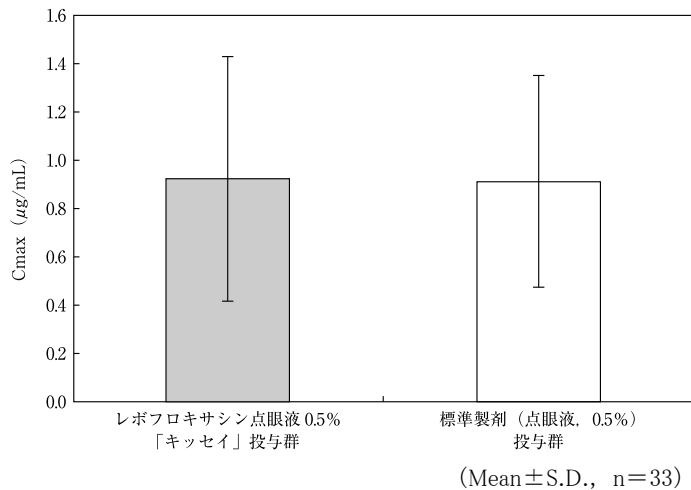
<レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」>

房水中濃度²²⁾

方法：白色ウサギにレボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」又は標準製剤（点眼液，0.5%）を 30 μ L/眼単回点眼し，房水中のレボフロキサシン濃度より生物学的同等性を評価した。

結果：両製剤の T_{max}（1 時間）における房水中レボフロキサシン濃度（C_{max}）を対数変換した値の平均値の差より，両製剤は生物学的に同等であると判断した。

白色ウサギにレボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」又は標準製剤を 30 μ L/眼単回点眼した場合の T_{max}（1 時間）における房水中レボフロキサシン濃度（C_{max}）



判定項目	平均値の差
結果	log (0.973)
判定基準	log (0.90) ~ log (1.11)

<レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」>

生物学的同等性試験²³⁾

白色ウサギの両眼に本剤又は標準製剤を片眼ずつ 30 μ L 単回点眼し、30 分後における眼房水中レボフロキサシン濃度を測定した。得られた眼房水中レボフロキサシン濃度を対数変換し、その平均値の差を 90%信頼区間法にて統計解析を行った。その結果、平均値の差の 90%信頼区間が $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ 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。

	眼房水中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%「キッセイ」	1418.76 \pm 786.84
標準製剤 (点眼剤, 1.5%)	1453.80 \pm 626.73

(Mean \pm S.D., n=60)

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）	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	「V. 治療に関する項目」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	<p>(1) 併用禁忌とその理由 該当しない</p> <p>(2) 併用注意とその理由 該当しない</p>
8. 副作用	<p>(1) 副作用の概要</p> <div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>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)</p> </div> <p>(2) 重大な副作用と初期症状</p> <div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>ショック，アナフィラキシー（いずれも頻度不明）：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。</p> </div>

(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。

	レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」
	頻度不明	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	蕁麻疹, 掻痒感, 眼瞼炎 (眼瞼発赤・浮腫等), 眼瞼皮膚炎, 発疹
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	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)

(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

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

該当資料なし

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

(1.5%製剤)

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 (使用経験がない)。

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) 投与时

- 1) 容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- 2) 点眼したときに液が眼瞼皮膚等についた場合は、すぐにふき取ること (0.5%製剤)。
- 3) 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 (1.5%製剤)。

15. その他の注意

該当しない

16. その他

なし

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	<p>製剤：レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」 処方箋医薬品^{注)} レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」 処方箋医薬品^{注)} 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること。</p> <p>有効成分：日局レボフロキサシン水和物 0.5mg 該当しない 日局レボフロキサシン水和物 1.5mg 該当しない</p>												
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，気密容器，室温保存												
4. 薬剤取扱い上の注意点	<p>(1) 薬局での取扱い上の留意点について 「VIII-14. 適用上の注意」の項参照</p> <p>(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-14. 適用上の注意」の項参照</p> <p>(3) 調剤時の留意点について 「VIII-14. 適用上の注意」の項参照</p>												
5. 承認条件等	該当しない												
6. 包装	5mL×10本												
7. 容器の材質	<table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse; text-align: center;"> <tr> <td style="width: 15%;"></td> <td style="width: 35%;">レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」</td> <td style="width: 35%;">レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」</td> </tr> <tr> <td>容器</td> <td>ポリプロピレン</td> <td>ポリエチレン</td> </tr> <tr> <td>中栓</td> <td>ポリエチレン</td> <td>ポリエチレン</td> </tr> <tr> <td>キャップ</td> <td>ポリプロピレン</td> <td>ポリプロピレン</td> </tr> </table>		レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」	容器	ポリプロピレン	ポリエチレン	中栓	ポリエチレン	ポリエチレン	キャップ	ポリプロピレン	ポリプロピレン
	レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」											
容器	ポリプロピレン	ポリエチレン											
中栓	ポリエチレン	ポリエチレン											
キャップ	ポリプロピレン	ポリプロピレン											
8. 同一成分・同効薬	<p>1) 同一成分薬：クラビット点眼液 0.5%，クラビット点眼液 1.5%，クラビット錠 250mg，クラビット錠 500mg，クラビット細粒 10%，クラビット点滴静注バッグ 500mg/100mL，クラビット点滴静注 500mg/20mL</p> <p>2) 同効薬：オフロキサシン，ガチフロキサシン，トスフロキサシン，ノルフロキサシン，モキシフロキサシン，ロメフロキサシン （塩，水和物は省略）</p>												
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

	レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」
製造販売承認年月日	2011年7月15日	2014年2月14日
承認番号	22300AMX00797000	22600AMX00389000

11. 薬価基準収載年月日

	レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」
薬価基準収載年月日	2011年11月28日	2014年6月20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%「キッセイ」	120902001	1319742Q1144	622090201
レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」	123063501	1319742Q2019 (統一名) 1319742Q2175 (YJコード)	622332800 (統一名) 622306301 (銘柄別)

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 中上博秋 他：化学療法の領域. 10(6), 1121, 1994
- 2) レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」：安定性試験（加速試験）（社内資料）
- 3) レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」：安定性試験（光苛酷試験）（社内資料）
- 4) レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」：安定性試験（加速試験）（社内資料）
- 5) レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」：安定性試験（光苛酷試験）（社内資料）
- 6) レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」：配合変化試験（社内資料）
- 7) レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」：配合変化試験（社内資料）
- 8) Kato, J. et al. : Cell, 63(2), 393, 1990
- 9) Hoshino, K. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 38(11), 2623, 1994
- 10) Akasaka, T. et al. : Antimicrob Agents Chemother. 45(8), 2263, 2001
- 11) Tanaka, M. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 41(11), 2362, 1997
- 12) Onodera, Y. et al. : J. Antimicrob. Chemother. 44(4), 533, 1999
- 13) Onodera, Y. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 46(6), 1800, 2002
- 14) Fujimoto, T. et al. : Chemotherapy (Basel) 36(4), 268, 1990
- 15) Imamura, M. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 31(2), 325, 1987
- 16) Hoshino, K. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 35(2), 309, 1991
- 17) Une, T. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 32(9), 1336, 1988
- 18) Tanaka, M. et al. : Arzneimittel-Forsch. Drug Res. 39(7), 750, 1989
- 19) Akasaka, T. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 42(5), 1284, 1998
- 20) レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」：生物学的同等性試験「感染モデル」（社内資料）
- 21) レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」：生物学的同等性試験「感染モデル」（社内資料）
- 22) レボフロキサシン点眼液 0.5%「キッセイ」：生物学的同等性試験「房水中濃度」（社内資料）
- 23) レボフロキサシン点眼液 1.5%「キッセイ」：生物学的同等性試験「眼房水中濃度」（社内資料）

2. その他の参考文献

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

