

## 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

広範囲経口抗菌製剤

**レボフロキサシン粒状錠250mg「モチダ」**

**レボフロキサシン粒状錠500mg「モチダ」**

**Levofloxacin granular tablets 250mg MOCHIDA**

**Levofloxacin granular tablets 500mg MOCHIDA**

(レボフロキサシン水和物・小型フィルムコーティング錠)

剤形	小型フィルムコーティング錠	
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	レボフロキサシン粒状錠250mg「モチダ」： 1包中、日局 レボフロキサシン水和物 256.23mg （レボフロキサシンとして250mg）含有 レボフロキサシン粒状錠500mg「モチダ」： 1包中、日局 レボフロキサシン水和物 512.46mg （レボフロキサシンとして500mg）含有	
一般名	和名：レボフロキサシン水和物（JAN） 洋名：Levofloxacin Hydrate（JAN）、levofloxacin（INN）	
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	2014年 8月15日
	薬価基準収載・ 発売年月日	2014年12月12日 2014年12月12日
	製造販売一部変更 承認年月日	2016年 1月27日 （効能・効果、用法・用量の追加による）
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：持田製薬販売株式会社 販 売：持田製薬株式会社	
医療情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	持田製薬株式会社 くすり相談窓口 TEL 0120-189-522 03-5229-3906 FAX 03-5229-3955 受付時間 9:00～17:40（土・日、祝日、会社休日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.mochida.co.jp/dis/index.html">http://www.mochida.co.jp/dis/index.html</a>	

本IFは2019年 9月作成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、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://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るべきである。

### **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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>
1. 開発の経緯.....	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	2
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>3</b>
1. 販売名 .....	3
2. 一般名 .....	3
3. 構造式又は示性式.....	3
4. 分子式及び分子量.....	4
5. 化学名（命名法） .....	4
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	4
7. CAS登録番号.....	4
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>5</b>
1. 物理化学的性質 .....	5
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	5
3. 有効成分の確認試験法.....	5
4. 有効成分の定量法.....	5
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>6</b>
1. 剤形.....	6
2. 製剤の組成.....	7
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意.....	7
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	8
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	8
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化） .....	8
7. 溶出性.....	8
8. 生物学的試験法 .....	8
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	9
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	9
11. 力価.....	9
12. 混入する可能性のある夾雑物.....	9
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....	9
14. その他.....	9
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>10</b>
1. 効能又は効果 .....	10
2. 用法及び用量 .....	10
3. 臨床成績 .....	11
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>13</b>
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群.....	13
2. 薬理作用 .....	13

<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>14</b>
1. 血中濃度の推移・測定法 .....	14
2. 薬物速度論的パラメータ .....	16
3. 吸収 .....	16
4. 分布 .....	16
5. 代謝 .....	17
6. 排泄 .....	18
7. トランスポーターに関する情報 .....	18
8. 透析等による除去率 .....	18
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>19</b>
1. 警告内容とその理由 .....	19
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	19
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	19
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	19
5. 慎重投与内容とその理由 .....	19
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	20
7. 相互作用 .....	20
8. 副作用 .....	21
9. 高齢者への投与 .....	24
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 .....	24
11. 小児等への投与 .....	24
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	24
13. 過量投与 .....	24
14. 適用上の注意 .....	25
15. その他の注意 .....	25
16. その他 .....	25
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>26</b>
1. 薬理試験 .....	26
2. 毒性試験 .....	26
<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>27</b>
1. 規制区分 .....	27
2. 有効期間又は使用期限 .....	27
3. 貯法・保存条件 .....	27
4. 薬剤取扱い上の注意点 .....	27
5. 承認条件等 .....	27
6. 包装 .....	27
7. 容器の材質 .....	28
8. 同一成分・同効薬 .....	28
9. 国際誕生年月日 .....	28
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 .....	28
11. 薬価基準収載年月日 .....	28
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 .....	28
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 .....	28

14. 再審査期間.....	29
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 .....	29
16. 各種コード.....	29
17. 保険給付上の注意.....	29
<b>X I. 文献.....</b>	<b>30</b>
1. 引用文献 .....	30
2. その他の参考文献.....	30
<b>X II. 参考資料.....</b>	<b>31</b>
1. 主な外国での発売状況.....	31
2. 海外における臨床支援情報 .....	31
<b>X III. 備考.....</b>	<b>32</b>
1. その他の関連資料.....	32

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

レボフロキサシンは、ニューキノロン系抗菌薬であり、ラセミ体であるオフロキサシンの効力のある  $S(-)$ -体のみからなる<sup>1)</sup>。本邦では、1993年に製造承認が取得されている。その後、各種感染症に対する効能追加を取得し、幅広く使用されてきた。一方、耐性化抑制の観点から、PK-PD理論（キノロン系抗菌薬は濃度依存的な殺菌作用を示すとともに、高用量投与すなわち高い濃度で耐性化抑制作用を発揮する）を踏まえ、レボフロキサシンの500mg 1日1回投与の用法・用量で、2009年にレボフロキサシンの錠250mg、錠500mg、細粒10%が市場に提供されている。ただし、1回の投与量が500mgと多くなり、製剤は嵩高いものとならざるをえない。

持田製薬株式会社では、2010年に薬剤師を対象とした剤形に関する医療ニーズ収集のための聞き取り調査を実施したところ、錠剤の小型化を望む声が多く寄せられた。介護職を対象としたアンケート調査でも、「欠きな薬、苦い薬」は服用してもらう時に困るとの訴えが多いと報告されている<sup>2)</sup>。

レボフロキサシン服用者は高齢の患者が多く<sup>3)</sup>、また、嚥下機能は加齢とともに低下している場合が多い<sup>4)</sup>。高齢者を対象とした服薬模擬試験の報告<sup>4,5)</sup>では、円形錠については直径10mmを超えるものは7割以上の者が飲み込みにくいと感じており、楕円錠については長径12mmを超えるものは6割以上の者が飲み込みにくいと感じている。一方、顆粒剤は口中での広がりや喉への付着、義歯の間への入り込みによる不快感を訴える高齢者が多いこと<sup>4)</sup>から、高齢者にとって服薬しやすい製剤であるとは言い難い。口腔内崩壊錠は、用量が多い薬剤には適用し難い技術であり、ゼリー剤や液剤は、苦味マスキング性が困難であると考え<sup>6)</sup>。このような背景の基で、持田製薬株式会社では、高齢者でも服薬しやすいレボフロキサシン粒状錠を開発することとした。

レボフロキサシン粒状錠は、1包中にフィルムコーティングされた小型（直径約3.2mm、厚さ約3.2mm）の錠剤が複数個スティック包装された分包剤である。

全体でそれぞれレボフロキサシン水和物256.23mg（レボフロキサシンとして250mg）及びレボフロキサシン水和物512.46mg（レボフロキサシンとして500mg）を含有する。本剤のフィルムコーティングは、口腔内での主薬の溶出を抑制して苦みをマスキングする効果を有する。更に、水あるいは唾液と接すると表面のコーティング層がゲル状となることにより、表面の摩擦抵抗が低下し、嚥下の際に抵抗感が少なくなる。この製剤及び製剤技術をゲル化粒状錠、GEMTAB（Gelation Mini Tablets；ジェムタブ）<sup>6)</sup>と称し、服用性が向上することが期待される。

レボフロキサシン粒状錠250mg「モチダ」及びレボフロキサシン粒状錠500mg「モチダ」は、後発医薬品として開発を企画し、平成21年3月4日付の薬食発第0304004号の別表2-(1)の区分(8の2)剤形追加に係る医薬品（再審査期間中でないもの）に基づき規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2014年8月に承認を取得した。

2016年1月に適応菌種として「結核菌」、適応症に「肺結核及びその他の結核症」が追加された。2017年2月に、持田製薬株式会社より持田製薬販売株式会社に製造販売承認の継承が行われた。

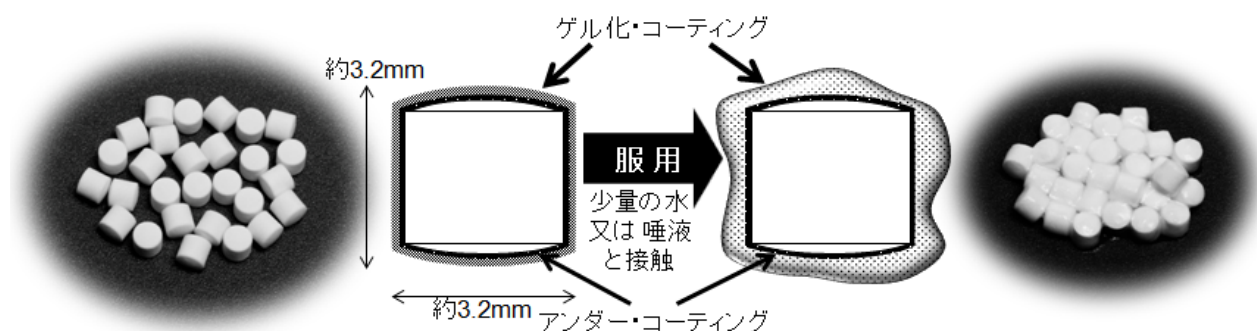
剤形名・技術名	口腔内崩壊錠	ゼリー剤	液剤
嚥下性	嚥下しやすい	嚥下しやすい	嚥下しやすい
苦味マスキング性	可能 (微粒子コーティング)	困難	困難
服用後の残留感	有	無	無



ゲル化粒状錠(GEMTAB)の開発へ

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) レボフロキサシン粒状錠「モチダ」は、ニューキノロン系抗菌薬であり、44 の適応症と 35 の適応菌種を持つ。
- (2) PK-PD 理論に基づき、500mg 1 日 1 回投与での治療が可能である。
- (3) 1 包中にフィルムコーティングされた小型（直径約 3.2mm、厚さ約 3.2mm）の錠剤が複数個スティック包装された分包剤で、服用がしやすいゲル化粒状錠、GEMTAB（Gelation Mini Tablets；ジェムタブ）<sup>6)</sup> である。
  - ・錠剤表面をゲル形成成分でコーティング（ゲル化・コーティング）することにより、少量の水あるいは唾液と接すると表面のコーティング層がゲル状となるため、表面の摩擦抵抗が低下し、嚥下の際の抵抗感が少ない。
  - ・主薬であるレボフロキサシン水和物は苦みがあり、ゲル化・コーティングによってある程度苦みをマスキングすることができるが、マスキング効果を高めるためにゲル化・コーティングの下にコーティングを施した（アンダー・コーティング）。
  - ・粒状錠の大きさは、直径約 3.2mm、厚さ約 3.2mm とした（図）。この大きさ及び形状は、義歯へ挟まらず、嚥下を容易にするのに適当と考えられる。
  - ・服用時の操作性が良好と考えられるスティックタイプの分包剤とした。



- (4) 疾患・症状に応じた適宜減量に対応するため、250mg 製剤及び 500mg 製剤の 2 含量の分包剤とした。  
（「IV. 1. 剤形」の項参照）
- (5) 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。  
重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、痙攣、QT 延長、心室頻拍（Torsades de pointes を含む）、急性腎障害、間質性腎炎、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少、間質性肺炎、好酸球性肺炎、偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎、横紋筋融解症、低血糖、アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害、錯乱、せん妄、抑うつ等の精神症状、過敏性血管炎、重症筋無力症の悪化、大動脈瘤、大動脈解離、末梢神経障害が認められている。  
（「VIII. 8. 副作用」の項参照）



---

## Ⅱ. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

#### (1) 和名

レボフロキサシン粒状錠 250mg 「モチダ」

レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」

#### (2) 洋名

Levofloxacin granular tablets 250mg MOCHIDA

Levofloxacin granular tablets 500mg MOCHIDA

#### (3) 名称の由来

「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について：平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号」に従い、有効成分の一般的名称に剤形、含量及び会社名（屋号等）を付している。

### 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）

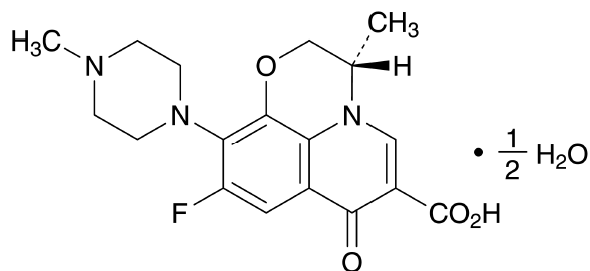
Levofloxacin Hydrate（JAN）

levofloxacin（INN）

#### (3) ステム（Stem）

ナリジクス酸系抗菌薬：-oxacin

### 3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot \frac{1}{2} H_2O$   
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

LVFX（日本化学療法学会制定の抗微生物薬略号）  
MDK-13（治験番号）

7. CAS 登録番号

138199-71-0 (Levofloxacin Hydrate)  
100986-85-4 (levofloxacin)

---

## 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（無臭で、味は苦い）。  
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。

#### (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

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」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法（参照スペクトルとの比較による）

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法、参照スペクトルとの比較による）


### 4. 有効成分の定量法

日局「レボフロキサシン水和物」の定量法による（電位差滴定法）。

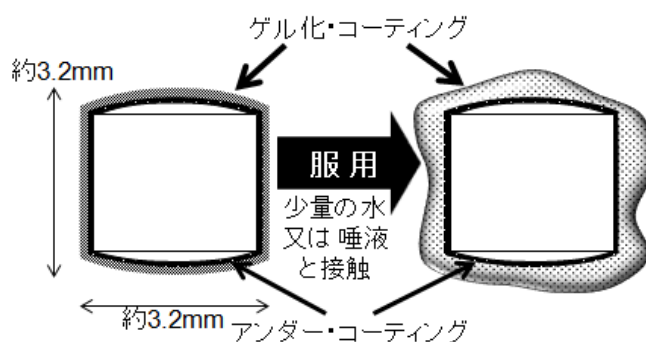
## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 製剤の区別、外観及び性状

販売名	レボフロキサシン粒状錠 250mg「モチダ」	レボフロキサシン粒状錠 500mg「モチダ」
成分・含量	1包中 日局 レボフロキサシン水和物 256.23mg (レボフロキサシンとして 250mg)	1包中 日局 レボフロキサシン水和物 512.46mg (レボフロキサシンとして 500mg)
色調・剤形	白色～微黄白色の小型フィルムコーティング錠	
外形	直径約 3.2mm×厚さ約 3.2mm	
		
重量 (1包中)	382.3mg	764.5mg

口腔内での主薬の溶出を抑制して苦みをマスキングするアンダー・コーティングを施している。更に、少量の水あるいは唾液と接することでゲル状となるコーティング層（ゲル化・コーティング）を表面に施しているため、少量の水あるいは唾液で表面がゲル状になることにより、表面の摩擦抵抗が低下し、嚥下の際の抵抗性を少なくしている。



(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

レボフロキサシン粒状錠 250mg 「モチダ」 : MO680 (分包に表示)

レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」 : MO681 (分包に表示)

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

販売名	レボフロキサシン粒状錠 250mg 「モチダ」	レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」
成分・含量	1包中 日局 レボフロキサシン水和物 256.23mg (レボフロキサシンとして 250mg)	1包中 日局 レボフロキサシン水和物 512.46mg (レボフロキサシンとして 500mg)

(2) 添加物

結晶セルロース、デンプングリコール酸ナトリウム、アルファー化デンプン、フマル酸ステアリルナトリウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、キサンタンガム、カルボキシビニルポリマー、ヒドロキシプロピルセルロース、エリスリトール、塩化カルシウム水和物、スクラロース

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）及び長期保存試験（25℃、相対湿度60%、24ヵ月）の結果、レボフロキサシン粒状錠250mg「モチダ」及びレボフロキサシン粒状錠500mg「モチダ」は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<sup>7)</sup>。

試験	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	24ヵ月 (継続中)	スティック包装	規格に適合。変化なし。
加速試験	40±2℃ 75±5%RH	6ヵ月	スティック包装	規格に適合。 類縁物質のわずかな増加傾向。 その他の項目は変化なし。
苛酷試験 (温度) <sup>a)</sup>	50±2℃	3ヵ月	スティック包装 無包装	溶出率がわずかに低下（3ヵ月）。 類縁物質のわずかな増加傾向。 その他の項目は変化なし。
苛酷試験 (湿度) <sup>a)</sup>	25±2℃ 75±5%RH	3ヵ月	スティック包装 無包装	規格に適合。変化なし。
苛酷試験 (光) <sup>a)</sup>	25±2℃ 総照度 120万lx・hr以上 総近紫外放射エネルギー 200W・hr/m <sup>2</sup> 以上	10日	無包装（遮光）	規格に適合。変化なし。
			無包装	外観（色）の変化（1ヵ月）。類縁物質のわずかな増加。 その他の項目は変化なし。

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性（苛酷試験では実施せず）、溶出性、定量、類縁物質  
スティック包装：防湿性の高いアルミラミネートフィルムからなる容器に充填したスティックタイプの分包剤  
a：500mg包装品で実施。

#### 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

#### 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

#### 7. 溶出性

方法：日局「溶出試験法（パドル法）」

条件：回転数 50rpm

試験液 900mL（溶出試験第2液）

結果：レボフロキサシン粒状錠 500mg「モチダ」及びレボフロキサシン粒状錠 250mg「モチダ」の溶出試験を実施した結果、両製剤とも30分間の溶出率は80%以上であった<sup>8)</sup>。

#### 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法（吸収の極大及び吸収の肩との比較による）

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

## 11. 力価

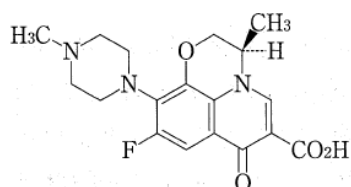
該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

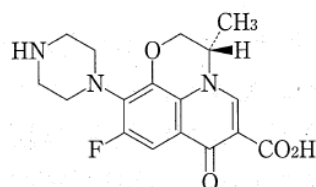
該当資料なし

<参考>

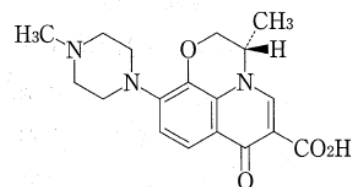
混在する可能性のある主な類縁物質としては、次の〔1〕～〔5〕の報告がある<sup>1)</sup>。



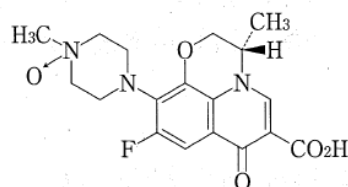
〔1〕 光学異性体



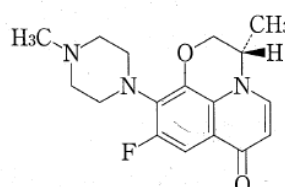
〔2〕 脱メチル体



〔3〕 脱フッ素体



〔4〕 N-オキシド体



〔5〕 脱炭酸体

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

スティック包装：防湿性の高いアルミラミネートフィルムからなる容器に充填した、スティックタイプの分包剤である。

【例示】



## 14. その他

適用上の注意：服用時

本剤は主薬の苦みを防ぐため、コーティングを施しているため、噛まずに服用させること。

（患者用服用の手引き：「XIII. 備考 1. その他の関連資料」の項参照）

---

## 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、淋菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、炭疽菌、結核菌、大腸菌、赤痢菌、サルモネラ属、チフス菌、パラチフス菌、シトロバクター属、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、プロビデンシア属、ペスト菌、コレラ菌、インフルエンザ菌、緑膿菌、アシネトバクター属、レジオネラ属、ブルセラ属、野兎病菌、カンピロバクター属、ペプトストレプトコッカス属、アクネ菌、Q熱リケッチア（コクシエラ・ブルネティ）、トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）、肺炎クラミジア（クラミジア・ニューモニエ）、肺炎マイコプラズマ（マイコプラズマ・ニューモニエ）

#### <適応症>

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、ざ瘡（化膿性炎症を伴うもの）、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、前立腺炎（急性症、慢性症）、精巣上体炎（副睾丸炎）、尿道炎、子宮頸管炎、胆嚢炎、胆管炎、感染性腸炎、腸チフス、パラチフス、コレラ、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、炭疽、ブルセラ症、ペスト、野兎病、肺結核及びその他の結核症、Q熱

#### （効能・効果に関連する使用上の注意）

咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、感染性腸炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>9)</sup>を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

#### 【効能・効果に関連する使用上の注意の設定理由】

平成30年3月27日付薬生安発0327第1号厚生労働省医薬・生活衛生局医薬安全対策課長通知『抗微生物薬の「使用上の注意」の改訂について』に基づき、追記した。

### 2. 用法及び用量

通常、成人にはレボフロキサシンとして1回500mgを1日1回経口投与する。なお、疾患・症状に応じて適宜減量する。

肺結核及びその他の結核症については、原則として他の抗結核薬と併用すること。

腸チフス、パラチフスについては、レボフロキサシンとして1回500mgを1日1回14日間経口投与する。



(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. 本剤の500mg 1日1回投与は、100mg 1日3回投与に比べ耐性菌の出現を抑制することが期待できる。本剤の投与にあたり、用量調節時を含め250mg 製剤を用いる場合も分割投与は避け、必ず1日量を1回で投与すること。
3. 腸チフス、パラチフスについては、レボフロキサシンとして（注射剤より本剤に切り替えた場合には注射剤の投与期間も含め）14日間投与すること。
4. 炭疽の発症及び進展の抑制には、欧州医薬品庁（EMA）が60日間の投与を推奨している。
5. 長期投与が必要となる場合には、経過観察を十分に行うこと。
6. 腎機能低下患者では高い血中濃度が持続するので、下記の用法・用量を目安として、必要に応じて投与量を減じ、投与間隔をあけて投与することが望ましい。

腎機能 Ccr (mL/min)	用法・用量
$20 \leq \text{Ccr} < 50$	初日500mgを1回、2日目以降250mgを1日に1回投与する。
$\text{Ccr} < 20$	初日500mgを1回、3日目以降250mgを2日に1回投与する。

【用法・用量に関連する使用上の注意の設定理由】

1. 抗菌薬に共通の注意事項である。「抗菌性物質製剤の使用上の注意事項の変更について」（1993年1月19日付薬安第5号）に従い、設定した。
2. 先発品と同様に、設定した。
3. 抗菌薬使用のガイドライン（2005年）において、腸チフス、パラチフスに対しフルオロキノロン系薬の投与期間として14日間が推奨されていることから設定した。なお、腸チフス、パラチフスの治療方法として、症状が改善傾向を示した場合には、レボフロキサシン注射剤からレボフロキサシン経口剤への切り替えが想定されるが、その場合も経口剤の投与期間を含めて14日間が推奨される。
4. 2002年7月に公布された EMEA/CPMP ガイダンス<sup>※</sup>において、炭疽に対するレボフロキサシン製剤の推奨投与期間が60日間とされていることから、設定した。  
※: Guidance document on use of medicinal products for treatment and prophylaxis of biological agents that might be used as weapons of bioterrorism (EMEA/CPMP/4048/01, 25 July 2002)
5. 炭疽等、長期投与が必要な場合は、副作用発現に対する経過観察を十分に行う必要があると考えられることから、設定した。
6. 先発品と同様に、設定した。

### 3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(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(キノロン)系化合物：オフロキサシン(OFLX)、ノルフロキサシン(NFLX)、塩酸シプロフロキサシン(CPFX)、ロメフロキサシン塩酸塩(LFLX)、プルリフロキサシン(PUFX)、トスフロキサシントシル酸塩水和物(TFLX)、モキシフロキサシン塩酸塩(MFLX)、メシル酸ガレノキサシン水和物(GRNX)、シタフロキサシン水和物(STFX)等  
(略号：日本化学療法学会制定の抗微生物薬略号)

### 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複製を阻害することであり、殺菌的に作用する<sup>1)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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（感染の部位、原因菌の感受性に依存する）。

#### (2) 最高血中濃度到達時間

健康成人男子にレボフロキサシン粒状錠 500mg「モチダ」を絶食単回投与した際の  $t_{max}$  は  $0.89 \pm 0.47$  時間であった<sup>10)</sup>。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」（平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号）に準拠し、本剤と標準製剤の生物学的同等性試験を実施した<sup>10)</sup>。

#### 1) 試験方法

非盲検ランダム化 2 剤 2 期クロスオーバー法

空腹時単回経口投与

健康成人男子

目標症例数 20 例（1 群 10 名）

<投与量及び投与薬剤>

第一期

A 群：レボフロキサシン粒状錠 500mg「モチダ」×1 包  
（レボフロキサシンとして 500mg 含有）

B 群：標準製剤 ×1 錠（レボフロキサシンとして 500mg 含有）

（7 日間の休薬）

第二期

A 群：標準製剤 ×1 錠（レボフロキサシンとして 500mg 含有）

B 群：レボフロキサシン粒状錠 500mg「モチダ」×1 包  
（レボフロキサシンとして 500mg 含有）

#### 2) 試験結果

1 例が第一期の投与日に被験者の都合により中止となったため、生物学的同等性解析対象は 19 例であった。

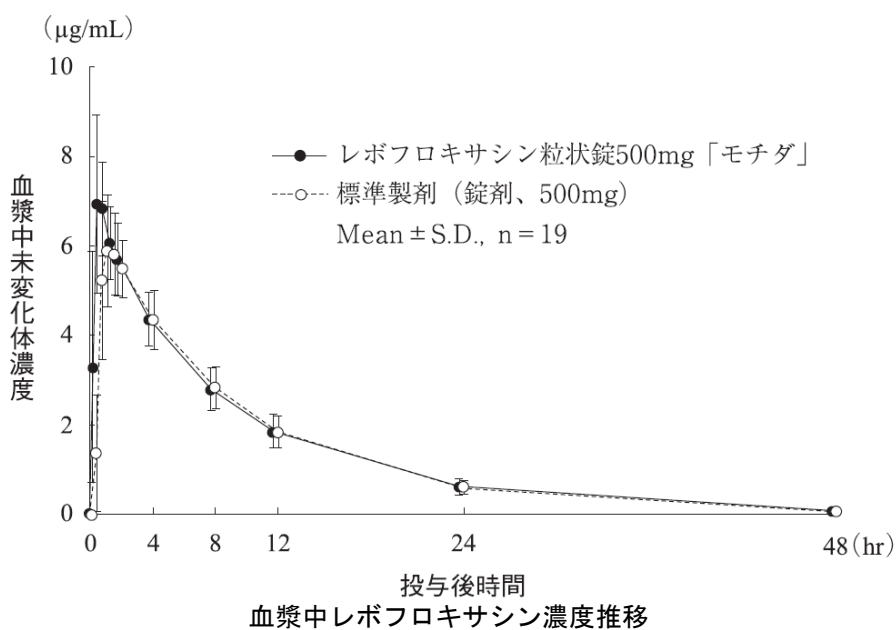
血漿中レボフロキサシン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ ( $C_{max}$  及び  $AUC_{0-48}$ ) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

薬物動態パラメータ及び血漿中濃度推移は次頁に示した。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	t <sub>1/2</sub> (hr)	t <sub>max</sub> (hr)
レボフロキサシン粒状錠 500mg「モチダ」	67.37 ±11.23	7.61 ±1.25	7.59 ±0.65	0.89 ±0.47
標準製剤 (錠剤、500mg)	65.10 ±9.61	6.65 ±1.01	7.56 ±0.57	1.32 ±0.82

(Mean ± S.D., n = 19)



血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(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

<参考>

「Ⅷ. 7. (2) 併用注意とその理由」の項参照

(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

健康成人男子にレボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」を空腹時単回投与した際の消失速度定数 ( $k_{el}$ ) は  $0.092 \pm 0.008 \text{hr}^{-1}$  であった<sup>10)</sup>。

### (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

<参考>

ラセミ体であるオフロキサシンでヒト母乳中へ移行することが報告されている。

(「VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

(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

<参考>

経口投与した場合、皮膚や唾液などに高い移行性を示す<sup>1)</sup>。

## 5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

<参考>

経口投与した場合、主に尿中に排泄される。投与後 24 時間までの累積尿中排泄率は、未変化体が投与量の 79.6%、脱メチル体は 1.75%、*N*-オキサイドが 1.63%であった。また、胆汁中のグルクロン酸抱合体濃度は、未変化体に対して 3.9~25.8%であった<sup>1)</sup>。

(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

経口投与した場合、主に尿中に排泄される<sup>1)</sup>。  
#

### (2) 排泄率

該当資料なし

<参考>

「VII. 5. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照

### (3) 排泄速度

該当資料なし

<参考>

「VII. 5. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照

## 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）】

1. 本剤の成分又はオフロキサシンに対し過敏症の既往歴のある患者
2. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人（「妊婦・産婦・授乳婦等への投与」の項参照）
3. 小児等（「小児等への投与」及び「その他の注意」の項参照）  
ただし、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び小児等に対しては、炭疽等の重篤な疾患に限り、治療上の有益性を考慮して投与すること。

#### 【解説】

1. 過敏症関係の副作用のある医薬品に対する注意事項である。なお、ラセミ体であるオフロキサシンを含めている。「VIII. 8. (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法」の項参照
2. 「VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 (1)」の項参照
3. 「VIII. 11. 小児等への投与」、「VIII. 15. その他の注意」の項参照  
「妊婦又は妊娠している可能性のある婦人」及び「小児等」に対しては、投与禁忌としているが、炭疽等の重篤な疾患に限り、治療上の有益性が危険性を上回ると判断した場合のみ、投与しても差し支えない。

### 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」の項参照

### # 5. 慎重投与内容とその理由

#### 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 高度の腎機能障害のある患者 [高い血中濃度の持続が認められている。]（「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照）
- (2) てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者 [痙攣を起こすことがある。]
- (3) キノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者
- (4) 重篤な心疾患（不整脈、虚血性心疾患等）のある患者 [QT 延長を起こすことがある。]
- (5) 重症筋無力症の患者 [症状を悪化させることがある。]
- (6) 大動脈瘤又は大動脈解離を合併している患者、大動脈瘤又は大動脈解離の既往、家族歴若しくはリスク因子（マルファン症候群等）を有する患者 [海外の疫学研究において、フルオロキノロン系抗菌薬投与後に大動脈瘤及び大動脈解離の発生リスクが増加したとの報告がある。]（「重要な基本的注意」、「重大な副作用」の項参照）
- (7) 高齢者 [腱障害があらわれやすいとの報告がある。]（「高齢者への投与」の項参照）

**【解説】**

- (1) 「V. 2. 用法及び用量」の項参照。レボフロキサシン製剤の腎機能障害患者における単回投与試験において、腎機能低下に伴い、血漿中濃度の生物学的半減期の延長、尿中濃度の低下及び尿中排泄率の低下が認められたことから、設定した。
- (2) レボフロキサシン製剤の使用による「痙攣の発現」の報告があることから、設定した。
- (3) キノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者では、本剤の投与により過敏症状を起こす可能性があることから、設定した。
- (4) 国内外のレボフロキサシン製剤の使用による「重篤なQT延長」の報告があることから、設定した。
- (5) 国内外のレボフロキサシン製剤の使用による「重症筋無力症の悪化」の報告があることから、設定した。
- (6) 海外において、フルオロキノロン系抗菌薬投与による大動脈瘤又は大動脈解離の発生リスクの増加が報告されている<sup>11-14)</sup>。
- (7) 「VIII. 9. 高齢者への投与」の項参照

**6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法**

**重要な基本的注意**

- (1) 他の抗結核薬との併用により、重篤な肝障害があらわれることがあるので、併用する場合は定期的に肝機能検査を行うこと。
- (2) 意識障害等があらわれることがあるので、自動車の運転等、危険を伴う機械の操作に従事する際には注意するよう患者に十分に説明すること。
- (3) 大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、観察を十分に行うとともに、腹部、胸部又は背部に痛み等の症状があらわれた場合には直ちに医師の診察を受けるよう患者に指導すること。大動脈瘤又は大動脈解離を合併している患者、大動脈瘤又は大動脈解離の既往、家族歴若しくはリスク因子を有する患者では、必要に応じて画像検査の実施も考慮すること。（「慎重投与」、「重大な副作用」の項参照）

**【解説】**

- (2) レボフロキサシン製剤の使用による「意識障害等」の報告があることから、自動車の運転等、危険を伴う機械の操作に関する注意を設定した。
- (3) フルオロキノロン系抗菌薬の使用により大動脈瘤及び大動脈解離発現リスクの上昇を示唆する海外での疫学研究及び海外での発生機序に関する非臨床研究の報告を踏まえ、記載した。

**# 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

併用注意（併用に注意すること）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
フェニル酢酸系又はプロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛薬 フルルビプロフェン等	痙攣を起こすおそれがある。	中枢神経におけるGABA <sub>A</sub> 受容体への結合阻害が増強されると考えられている。
アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸薬等、鉄剤	本剤の効果が減弱されるおそれがある。これらの薬剤は本剤投与から1～2時間後に投与する。	これらの薬剤とキレートを形成し、本剤の吸収が低下すると考えられている。
クマリン系抗凝固薬 ワルファリン	ワルファリンの作用を増強し、プロトロンビン時間の延長が認められたとの報告がある。	ワルファリンの肝代謝を抑制、又は蛋白結合部位での置換により遊離ワルファリンが増加する等と考えられている。
QT延長を起こすことが知られている薬剤 デラマニド等	QT延長を起こすおそれがある。	併用によりQT延長作用が相加的に増加するおそれがある。
副腎皮質ホルモン剤（経口剤及び注射剤） プレドニゾロン ヒドロコルチゾン等	臍障害のリスクが増大するとの報告がある。これらの薬剤との併用は、治療上の有益性が危険性を上回る場合のみとすること。	機序不明

# 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）

1) ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシー（初期症状：紅斑、悪寒、呼吸困難等）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し、適切な処置を行うこと。

2) 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）

中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群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し、適切な処置を行うこと。

3) 痙攣

痙攣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し、適切な処置を行うこと。

- 4) **QT 延長、心室頻拍 (Torsades de pointes を含む)**  
QT 延長、心室頻拍 (Torsades de pointes を含む) 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し、適切な処置を行うこと。
- 5) **急性腎障害、間質性腎炎**  
急性腎障害、間質性腎炎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し、適切な処置を行うこと。
- 6) **劇症肝炎、肝機能障害、黄疸**  
劇症肝炎、肝機能障害、黄疸 (初期症状: 嘔気・嘔吐、食欲不振、倦怠感、痒痒等) 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し、適切な処置を行うこと。
- 7) **汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少**  
汎血球減少症、無顆粒球症 (初期症状: 発熱、咽頭痛、倦怠感等)、ヘモグロビン尿等を伴う溶血性貧血、血小板減少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し、適切な処置を行うこと。
- 8) **間質性肺炎、好酸球性肺炎**  
発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎、好酸球性肺炎があらわれることがあるので、このような症状が認められた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤投与等の適切な処置を行うこと。
- 9) **偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎**  
偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがあるので、腹痛、頻回の下痢等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。
- 10) **横紋筋融解症**  
筋肉痛、脱力感、CK (CPK) 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等を特徴とし、急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症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し、適切な処置を行うこと。
- 11) **低血糖**  
低血糖があらわれることがあり、低血糖性昏睡に至る例も報告されているので、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し、適切な処置を行うこと。糖尿病患者 (特にスルホニルウレア系薬剤やインスリン製剤等を投与している患者)、腎機能障害患者、高齢者であらわれやすい。
- 12) **アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害**  
アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害があらわれることがあるので、腱周辺の痛み、浮腫、発赤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。臓器移植の既往のある患者であらわれやすい。
- 13) **錯乱、せん妄、抑うつ等の精神症状**  
錯乱、せん妄、抑うつ等の精神症状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し、適切な処置を行うこと。
- 14) **過敏性血管炎**  
過敏性血管炎があらわれることがあるので、発熱、腹痛、関節痛、紫斑、斑状丘疹や、皮膚生検で白血球破碎性血管炎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。
- 15) **重症筋無力症の悪化**  
重症筋無力症の患者で症状の悪化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し、適切な処置を行うこと。

- 16) **大動脈瘤、大動脈解離**  
大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。（「慎重投与」、「重要な基本的注意」の項参照）
- 17) **末梢神経障害**  
末梢神経障害があらわれることがあるので、しびれ、筋力低下、痛み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

その他の副作用	
下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ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、痒痒症、蕁麻疹、光線過敏症
精神神経系	不眠、めまい、頭痛、傾眠、しびれ感、振戦、ぼんやり、幻覚、意識障害、錐体外路障害
泌尿器	クレアチニン上昇、血尿、BUN 上昇、尿蛋白陽性、頻尿、尿閉、無尿
肝臓	AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、LDH 上昇、肝機能異常、ALP 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、血中ビリルビン増加
血液	白血球数減少、好酸球数増加、好中球数減少、リンパ球数減少、血小板数減少、貧血
消化器	悪心、嘔吐、下痢、腹部不快感、腹痛、食欲不振、消化不良、口渇、腹部膨満、胃腸障害、便秘、口内炎、舌炎
感覚器	耳鳴、味覚異常、味覚消失、視覚異常、無嗅覚、嗅覚錯誤
循環器	動悸、低血圧、頻脈
その他	CK (CPK) 上昇、関節痛 <sup>注)</sup> 、胸部不快感、倦怠感、四肢痛、咽喉乾燥、尿中ブドウ糖陽性、高血糖、熱感、浮腫、筋肉痛、脱力感、発熱、関節障害、発汗、胸痛

注) 結核患者での使用において 91 例中 4 例 (4.4%) に関節痛が認められたとの報告がある<sup>15)</sup>。

(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）】

1. 本剤の成分又はオフロキサシンに対し過敏症の既往歴のある患者

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (3) キノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者

#### 副作用

##### (1) 重大な副作用（頻度不明）

###### 1) ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシー（初期症状：紅斑、悪寒、呼吸困難等）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し、適切な処置を行うこと。

###### 14) 過敏性血管炎

過敏性血管炎があらわれることがあるので、発熱、腹痛、関節痛、紫斑、斑状丘疹や、皮膚生検で白血球破砕性血管炎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

発疹、掻痒症、蕁麻疹、光線過敏症：異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

#### 9. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので投与量並びに投与間隔に留意し、慎重に投与すること。  
（「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照）

#### 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。

【妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。】

(2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。

【オフロキサシンでヒト母乳中へ移行することが報告されている。】

#### 11. 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ので、投与しないこと。（「その他の注意」の項参照）

#### 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

服用時

本剤は主薬の苦みを防ぐため、コーティングを施しているため、嚙まずに服用させること。

15. その他の注意

動物実験（幼若犬、若い成犬（13 ヶ月齢）、幼若ラット）で関節異常が認められている。

16. その他

該当資料なし

---

## 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  
<参考>  
「VIII. 15. その他の注意」の項参照



## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤	レボフロキサシン粒状錠 250mg 「モチダ」	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
	レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	レボフロキサシン水和物	該当しない

注) 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

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

該当しない

#### (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. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」、「Ⅷ. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」、「Ⅷ. 14. 適用上の注意」の項参照

くすりのしおり：有り

患者用服用の手引き：有り（「XⅢ. 1. その他の関連資料」の項参照）

#### (3) 調剤時の留意点について

スティック包装は、識別性向上のため以下のように含量別に色分けしている。

販売名	スティック包装
レボフロキサシン粒状錠 250mg 「モチダ」	水色を基調とし、文字は黒色
レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」	淡紫色を基調とし、文字は黒色

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

販売名	スティック包装
レボフロキサシン粒状錠 250mg 「モチダ」	50包（5包×10）
レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」	20包（5包×4）
レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」	50包（5包×10）

7. 容器の材質

分包（スティック包装）：アルミラミネートフィルム  
ピロー包装：ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：クラビット錠 250mg、クラビット錠 500mg、クラビット細粒 10%、  
レボフロキサシン水和物（100mg 含有）の後発品、  
クラビット点眼液 0.5%、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

同効薬：オフロキサシン、ノルフロキサシン、塩酸シプロフロキサシン、ロメフロキサシン塩酸塩、プルリフロキサシン、トスフロキサシントシル酸塩水和物、モキシフロキサシン塩酸塩、メシル酸ガレノキサシン水和物、シタフロキサシン水和物等

9. 国際誕生年月日

1993 年 10 月 1 日（日本）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
レボフロキサシン粒状錠 250mg 「モチダ」	2014 年 8 月 15 日	22600AMX00970000
レボフロキサシン粒状錠 500mg 「モチダ」	2014 年 8 月 15 日	22600AMX00971000

11. 薬価基準収載年月日

2014 年 12 月 12 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

変更年月日：2016 年 1 月 27 日

効能又は効果の追加：

<適応菌種>結核菌  
<適応症>肺結核及びその他の結核症

用法及び用量の変更：（下線部分追加）

通常、成人にはレボフロキサシンとして 1 回 500mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、疾患・症状に応じて適宜減量する。

肺結核及びその他の結核症については、原則として他の抗結核薬と併用すること。

腸チフス、パラチフスについては、レボフロキサシンとして 1 回 500mg を 1 日 1 回 14 日間経口投与する。

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 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
レボフロキサシン粒状錠 250mg「モチダ」	123682801	6241013F6026	622368201
レボフロキサシン粒状錠 500mg「モチダ」	123683501	6241013F7022	622368301

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。

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書,C-5957-5961,廣川書店 (2016)
- 2) 上野和行 : *Progress in Medicine* 33 (5) ,1065-70 (2013)
- 3) 田中恒明 他 : *日病薬誌* 39 (1) ,29-31 (2003)
- 4) 大嶋耐之 : *Pharm Stage* 7 (6) , 16-20 (2007)
- 5) 三浦宏子 他 : *日本老年医学会雑誌* 44 (5) , 627-33 (2007)
- 6) 蕨野訓臣 他 : *Pharm Tech Japan* 29 (10) ,1977-80 (2013)
- 7) 持田製薬販売社内資料 (安定性試験)
- 8) 持田製薬販売社内資料 (溶出試験)
- 9) 厚生労働省健康局結核感染症課編 : 抗微生物薬適正使用の手引き
- 10) 持田製薬販売社内資料 (生物学的同等性試験)
- 11) Lee CC, et al. : *JAMA Intern Med.* 175 (11) , 1839-1847 (2015)
- 12) Daneman N, et al. : *BMJ Open* 5 (11) ,e010077 (2015)
- 13) Pasternak B, et al. : *BMJ.* 360 ,k678 (2018)
- 14) Lee CC, et al. : *J Am Coll Cardiol* 72 (12) ,1369-1378 (2018)
- 15) 結核療法研究協議会内科会 : *結核* 89(7),643-647 (2014)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

---

## XII. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

本剤は海外では発売されていない。

本剤の有効成分は、ドイツ、フランス、イギリス、オランダ、イタリア、アメリカ、中国、香港、韓国、タイ、シンガポール等で承認され、発売されている。

### 2. 海外における臨床支援情報

#### (1) 妊婦への投与に関する海外情報

該当資料なし

#### (2) 小児等に関する記載

本邦における使用上の注意「小児等への投与」の項の記載は以下の通りである。

本剤は海外では発売されていないが、類薬の米国の添付文書及び英国の SPC の記載とは異なる。

#### 【使用上の注意】「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ので、投与しないこと（「その他の注意」の項参照）。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2019年5月)	8.4 Pediatric Use Quinolones, including levofloxacin, cause arthropathy and osteochondrosis in juvenile animals of several species.
英国の SPC (2019年1月)	4. Clinical particulars 4.3 Contraindications Levofloxacin tablets must not be used: • in children or growing adolescents.

---

## XⅢ. 備考

---

### 1. その他の関連資料

JAID/JSC 感染症治療ガイドライン—呼吸器感染症—

[http://www.chemotherapy.or.jp/guideline/jaidjsc-kansenshochiryo\\_kokyuki.html](http://www.chemotherapy.or.jp/guideline/jaidjsc-kansenshochiryo_kokyuki.html)

(2019年 7月 19日 アクセス)