

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%「NIG」

レボフロキサシン点眼液1.5%「NIG」

Levofloxacin Ophthalmic Solution

| | | | |
|---------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------|--------------|
| 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 | 0.5%：1mL 中レボフロキサシン水和物 5mg 含有 1.5%：1mL 中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 洋名：Levofloxacin Hydrate | | |
| 製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日 | | 0.5% | 1.5% |
| | 承認年月日 | 2012年 6月 1日 | 2013年 2月 15日 |
| | 薬価基準収載 | 2022年 6月 17日 | 2022年 6月 17日 |
| | 販売年月日 | 2011年 11月 28日 | 2013年 6月 21日 |
| 開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名 | 販売：武田薬品工業株式会社 発売元：日医工株式会社 製造販売元：日医工岐阜工場株式会社 | | |
| 医薬情報担当者の連絡先 | | | |
| 問い合わせ窓口 | 日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ https://www.nichiiko.co.jp/ | | |

本IFは2022年6月改訂（0.5%：第8版，1.5%：第7版，承継に伴う改訂）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，医薬品医療機器総合機構ホームページ
<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

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ホームページ（<https://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式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、今後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 | VI. 薬効薬理に関する項目 | 15 |
| 1. 開発の経緯 | 1 | 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 .. | 15 |
| 2. 製品の治療学的・製剤学的特性 | 1 | 2. 薬理作用 | 15 |
| II. 名称に関する項目 | 2 | VII. 薬物動態に関する項目 | 17 |
| 1. 販売名 | 2 | 1. 血中濃度の推移・測定法 | 17 |
| 2. 一般名 | 2 | 2. 薬物速度論的パラメータ | 17 |
| 3. 構造式又は示性式 | 2 | 3. 吸収 | 17 |
| 4. 分子式及び分子量 | 2 | 4. 分布 | 17 |
| 5. 化学名（命名法） | 2 | 5. 代謝 | 20 |
| 6. 慣用名，別名，略号，記号番号 | 2 | 6. 排泄 | 20 |
| 7. CAS登録番号 | 2 | 7. トランスポーターに関する情報 | 20 |
| III. 有効成分に関する項目 | 3 | 8. 透析等による除去率 | 20 |
| 1. 物理化学的性質 | 3 | VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 | 21 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 | 3 | 1. 警告内容とその理由 | 21 |
| 3. 有効成分の確認試験法 | 3 | 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .. | 21 |
| 4. 有効成分の定量法 | 3 | 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 | 21 |
| IV. 製剤に関する項目 | 4 | 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 | 21 |
| 1. 剤形 | 4 | 5. 慎重投与内容とその理由 | 21 |
| 2. 製剤の組成 | 4 | 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .. | 21 |
| 3. 用時溶解して使用する製剤の調製法 | 4 | 7. 相互作用 | 21 |
| 4. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 | 4 | 8. 副作用 | 21 |
| 5. 製剤の各種条件下における安定性 | 5 | 9. 高齢者への投与 | 22 |
| 6. 溶解後の安定性 | 7 | 10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 | 22 |
| 7. 他剤との配合変化（物理化学的変化） | 10 | 11. 小児等への投与 | 22 |
| 8. 溶出性 | 10 | 12. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 22 |
| 9. 生物学的試験法 | 10 | 13. 過量投与 | 22 |
| 10. 製剤中の有効成分の確認試験法 | 10 | 14. 適用上の注意 | 22 |
| 11. 製剤中の有効成分の定量法 | 10 | 15. その他の注意 | 22 |
| 12. 力価 | 10 | 16. その他 | 22 |
| 13. 混入する可能性のある夾雑物 | 10 | IX. 非臨床試験に関する項目 | 23 |
| 14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 | 11 | 1. 薬理試験 | 23 |
| 15. 刺激性 | 11 | 2. 毒性試験 | 23 |
| 16. その他 | 11 | X. 管理的事項に関する項目 | 24 |
| V. 治療に関する項目 | 13 | 1. 規制区分 | 24 |
| 1. 効能又は効果 | 13 | 2. 有効期間又は使用期限 | 24 |
| 2. 用法及び用量 | 13 | 3. 貯法・保存条件 | 24 |
| 3. 臨床成績 | 13 | | |

| | |
|-------------------------------------|-----------|
| 4. 薬剤取扱い上の注意点 | 24 |
| 5. 承認条件等 | 24 |
| 6. 包装 | 24 |
| 7. 容器の材質 | 24 |
| 8. 同一成分・同効薬 | 24 |
| 9. 国際誕生年月日 | 24 |
| 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 | 25 |
| 11. 薬価基準収載年月日 | 25 |
| 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 | 25 |
| 13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容 | 25 |
| 14. 再審査期間 | 25 |
| 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 | 25 |
| 16. 各種コード | 25 |
| 17. 保険給付上の注意 | 25 |
| X I. 文献 | 26 |
| 1. 引用文献 | 26 |
| 2. その他の参考文献 | 26 |
| X II. 参考資料 | 26 |
| 1. 主な外国での発売状況 | 26 |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 26 |
| X III. 備考 | 26 |

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、レボフロキサシン水和物を有効成分とする広範囲抗菌点眼剤である。

「レボフロキサシン点眼液 0.5%「興和テバ」」は、武田テバ薬品株式会社（旧 大正薬品工業株式会社）が後発医薬品として開発を企画し、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、2011年7月15日に承認を取得し、2011年11月28日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

2012年6月1日、販売名を「レボフロキサシン点眼液 0.5%「興和テバ」」から「レボフロキサシン点眼液 0.5%「TYK」」に変更の承認を得て、2012年12月14日から販売した。

「レボフロキサシン点眼液 1.5%「テバ」」は、武田テバ薬品株式会社（旧 大正薬品工業株式会社）が後発医薬品として開発を企画し、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、2013年2月15日に承認を取得し、2013年6月21日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

2022年6月1日、武田テバ薬品株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「NIG」に変更した。

2022年6月17日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、レボフロキサシン水和物を有効成分とする広範囲抗菌点眼剤である。
- (2) 重大な副作用（頻度不明）として、ショック、アナフィラキシーが報告されている。

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%「NIG」

レボフロキサシン点眼液 1.5%「NIG」

(2) 洋名

Levofloxacin Ophthalmic Solution

(3) 名称の由来

一般名より

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

レボフロキサシン水和物 (JAN)

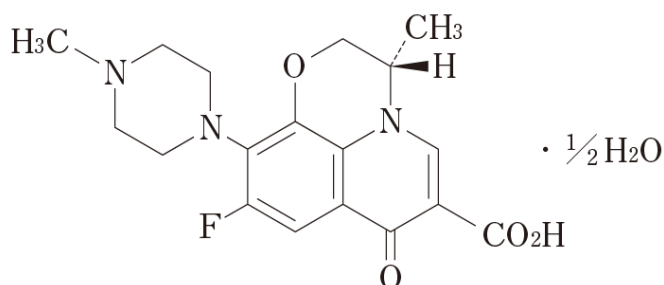
(2) 洋名 (命名法)

Levofloxacin Hydrate (JAN)

(3) ステム

ナリジクス酸系抗菌薬 : -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 (IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

略号 : LVFX

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。(本品は無臭で、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°C (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 $[\alpha]_D^{20}$: $-92 \sim -99^\circ$ (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

(1) 紫外可視吸光度測定法

本品の塩酸試液溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

(2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

本品を酢酸に溶かし、過塩素酸で滴定する。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

点眼剤

(2) 剤形の区別, 外観及び性状

| | | |
|-------|------------------------|------------------------|
| 販売名 | レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 | レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 |
| 性状・剤形 | 微黄色～淡黄色澄明, 無菌水性点眼液 | 微黄色～黄色澄明, 無菌水性点眼液 |
| 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) | |

(3) 製剤の物性

(「IV. 5. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

(4) 識別コード

なし

(5) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等

(「IV. 1. (2) 剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

(6) 無菌の有無

無菌の水性点眼液である。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

| | | |
|-----------------|------------------------|------------------------|
| 販売名 | レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 | レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 |
| 有効成分 (1mL 中) | レボフロキサシン水和物 5mg | レボフロキサシン水和物 15mg |
| 添加物 | 塩化ナトリウム, pH 調節剤 | |

(2) 添加物

(「IV. 2. (1) 有効成分 (活性成分) の含量」の項参照)

(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¹⁾

(1) 加速試験

◇レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 加速試験 [最終包装形態]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 保存期間 | | | |
|-----------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------|------------------------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|
| | | 開始時 | 1 ヶ月 | 3 ヶ月 | 6 ヶ月 |
| 性状 <微黄色～淡黄色澄明の液> | 1 2 3 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 確認試験 (紫外可視吸光度測定法, HPLC) | 1 2 3 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 浸透圧比 n=3 <1.0～1.1 (生理食塩液に対する比)> | 1 2 3 | 1.03 1.03～1.04 1.03～1.04 | 1.04～1.05 1.05～1.06 1.06～1.07 | 1.05～1.06 1.04～1.05 1.05～1.06 | 1.04～1.05 1.05～1.06 1.06～1.07 |
| pH n=3 <6.2～6.8> | 1 2 3 | 6.46～6.48 6.47 6.46～6.48 | 6.52～6.53 6.52～6.53 6.51～6.52 | 6.50～6.51 6.48～6.49 6.49～6.50 | 6.45～6.47 6.45～6.47 6.45～6.47 |
| 不溶性異物 <不溶性異物を認めない> | 1 2 3 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) <平均微粒子数が 1mL あたり 300 μ m 以上のものは 1 個以下である.> | 1 2 3 | 0 0 0 | 0 0 0 | 0 0 0 | 0 0 0 |
| 無菌 <菌の発育を認めない> | 1 2 3 | 菌の発育を認めなかった | - | - | 菌の発育を認めなかった |
| 含量 (%) * n=3 <95.0～105.0%> | 1 2 3 | 101.5～102.8 101.5～101.6 101.6～102.9 | 99.5～102.4 100.0～101.0 100.6～101.6 | 100.4～102.3 100.8～103.5 100.4～103.5 | 100.1～102.1 101.2～102.1 101.6～103.4 |

※：表示量に対する含有率 (%) -：未実施

試験実施期間：2011/5/27～2011/12/13

◇レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 加速試験 [最終包装形態：ポリエチレン容器+紙箱]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 保存期間 | | | |
|------------------------------------------------------------------------|-------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|
| | | 開始時 | 1 ヶ月 | 3 ヶ月 | 6 ヶ月 |
| 性状 n=3 <微黄色～黄色澄明の液> | LXN01 LXN02 LXN03 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 確認試験 n=3 (紫外可視吸光度測定法, HPLC) | LXN01 LXN02 LXN03 | 適合 | 適合※2 | 適合※2 | 適合 |
| 浸透圧比 n=3 <0.9～1.1 (生理食塩液に対する比)> | LXN01 LXN02 LXN03 | 0.99～1.00 0.99～1.00 0.99 | 0.98 0.98 0.98～0.99 | 1.01～1.02 1.02 1.01 | 1.01 1.01～1.02 1.01～1.02 |
| pH n=3 <6.1～6.9> | LXN01 LXN02 LXN03 | 6.50 6.51～6.52 6.52 | 6.49～6.50 6.51 6.51 | 6.46～6.47 6.48～6.49 6.49 | 6.47 6.48 6.48～6.49 |
| 不溶性異物 n=3 <不溶性異物を認めない> | LXN01 LXN02 LXN03 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) n=3 <本剤 1mL 中の個数に換算するとき、300 μ m 以上のものは 1 個以下である.> | LXN01 LXN02 LXN03 | 0 0 0 | 0 0 0 | 0 0 0 | 0 0 0 |
| 無菌 n=1 <菌の発育を認めない> | LXN01 LXN02 LXN03 | 菌の発育を認めなかった | - | - | 菌の発育を認めなかった |
| 含量 (%) *1 n=3 <95.0～107.0%> | LXN01 LXN02 LXN03 | 100.9～101.2 100.7～101.2 100.9～101.3 | 100.8～101.4 100.9～101.3 101.0～101.2 | 101.0～101.6 100.9～101.7 101.0～101.6 | 101.6～102.2 101.3～102.8 101.3～102.1 |

※1：表示量に対する含有率 (%) ※2：n=1 -：未実施

(2) 長期保存試験

試験実施期間：2011/5/27～2013/6/12

◇レボフロキサシン点眼液 1.5%「NIG」 長期保存試験 [最終包装形態: ポリエチレン容器+紙箱]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 保存期間 | | | | |
|----------------------------------------------------------------------|-------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|-------------------------------------------|
| | | 開始時 | 6 ヶ月 | 12 ヶ月 | 18 ヶ月 | 24 ヶ月 |
| 性状 n=3 <微黄色～黄色澄明の液> | LXN01 LXN02 LXN03 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 確認試験 n=3 (紫外可視吸光度測定法, HPLC) | LXN01 LXN02 LXN03 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合※2 | 適合 |
| 浸透圧比 n=3 <0.9～1.1 (生理食塩液に対する比)> | LXN01 LXN02 LXN03 | 0.99～1.00 0.99～1.00 0.99 | 1.01 1.01～1.02 1.01～1.02 | 1.01 1.00～1.01 1.00～1.01 | 1.01～1.02 1.01 1.01 | 1.01 1.01 1.00～1.01 |
| pH n=3 <6.1～6.9> | LXN01 LXN02 LXN03 | 6.50 6.51～6.52 6.52 | 6.47 6.48 6.48～6.49 | 6.49～6.50 6.51～6.52 6.51～6.53 | 6.52 6.55 6.56 | 6.47 6.49 6.49～6.50 |
| 不溶性異物 n=3 <不溶性異物を認めない> | LXN01 LXN02 LXN03 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) n=3 <本剤 1mL 中の個数に換算するとき, 300 μm 以上のものは 1 個以下である> | LXN01 LXN02 LXN03 | 0 0 0 | 0 0 0 | 0 0 0 | 0 0 0 | 0 0 0 |
| 無菌 n=1 <菌の発育を認めない> | LXN01 LXN02 LXN03 | 菌の発育を認めなかった | 菌の発育を認めなかった | 菌の発育を認めなかった | 菌の発育を認めなかった | 菌の発育を認めなかった |
| 含量 (%) ※1 n=3 <95.0～107.0%> | LXN01 LXN02 LXN03 | 100.9～101.2 100.7～101.2 100.9～101.3 | 101.6～102.2 101.3～102.8 101.3～102.1 | 101.0～101.6 101.2～101.4 101.0～101.5 | 102.4～102.9 101.7～102.8 101.5～102.6 | 100.9～102.6 100.7～102.4 100.7～103.0 |

※1：表示量に対する含有率 (%) ※2：n=1 -：未実施

本品の一定の流通期間中における安定性を確認するため、平成 3 年 2 月 15 日薬審第 43 号「医薬品の製造（輸入）承認申請に際して添付すべき安定性試験成績の取扱いについて」に準拠して、安定性試験の結果から、浸透圧比、pH 及び定量法について検討した。その結果、平成 15 年 6 月 3 日医薬審発第 0603004 号「安定性データの評価に関するガイドラインについて」の「長期データ及び加速データが経時的な変化及び変動をほとんど示さない場合」に該当すると考えられたことから、長期保存試験のデータがカバーする期間の 2 倍まで、かつ長期保存試験 12 箇月を超えない期間として、36 ヶ月（24 ヶ月+12 ヶ月）までの外挿が可能と判断し、使用期限は 36 ヶ月とした。

(3) 苛酷試験

◇レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 温度苛酷 60℃, 1000Lx [最終包装形態：ポリエチレン容器]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 保存期間 | | |
|---------------------------|-----------|---------|---------|---------|
| | | 開始時 | 1 ヶ月 | 2 ヶ月 |
| 性状 <微黄色～淡黄色澄明の液> | 1 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| pH <6.2～6.8> | 1 | 6.51 | 6.44 | 6.43 |
| 含量 (%) ※ <95.0～105.0%> | 1 | 101.5 | 102.5 | 103.0 |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 光苛酷 1000Lx [最終包装形態：ポリエチレン容器]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 総曝光量 | |
|---------------------------|-----------|-------------|------------|
| | | 開始時 | 30 万 Lx・hr |
| 性状 <微黄色～淡黄色澄明の液> | 1 | 微黄色澄明の液 | 黄色澄明の液 |
| pH <6.2～6.8> | 1 | 6.51 | 6.25 |
| 含量 (%) ※ <95.0～105.0%> | 1 | 100.3～102.6 | 92.7～93.3 |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 光苛酷 1000Lx [最終包装形態：ポリエチレン容器＋紙箱]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 総曝光量 | | | |
|---------------------------|-----------|-------------|-------------|-------------|-------------|
| | | 開始時 | 30 万 Lx・hr | 60 万 Lx・hr | 120 万 Lx・hr |
| 性状 <微黄色～淡黄色澄明の液> | 1 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| pH <6.2～6.8> | 1 | 6.51 | 6.45 | 6.45 | 6.49 |
| 含量 (%) ※ <95.0～105.0%> | 1 | 100.3～102.6 | 102.0～102.6 | 101.5～102.5 | 101.6～102.5 |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 温度苛酷 60℃ [最終包装形態：ポリエチレン容器]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 保存期間 | | |
|----------------------------------------------------------------------|-----------|--------------|--------------|--------------------|
| | | 開始時 | 1 ヶ月 | 2 ヶ月 |
| 性状 n=3 <微黄色～淡黄色澄明の液> | NS169 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| 浸透圧比 n=3 <1.0～1.1 (生理食塩液に対する比)> | NS169 | 1.00 | 1.02～1.03 | 1.08～1.09 |
| pH n=3 <6.1～6.8> | NS169 | 6.52 | 6.47～6.49 | 6.54 |
| 不溶性異物 n=3 <不溶性異物を認めない> | NS169 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) n=3 <本剤 1mL 中の個数に換算するとき, 300 μm 以上のものは 1 個以下である> | NS169 | 0 | 0 | 0 |
| 含量 (%) ※ n=3 <95.0～107.0%> | NS169 | 100.8～100.9 | 103.1～105.3 | 110.6～111.2 |

※：表示量に対する含有率 (%) 規格外：太字

(4) 光安定性試験

◇レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 曝光 [1000Lx, ポリエチレン容器]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 総曝光量 | |
|---------------------------|-----------|-------------|------------|
| | | 開始時 | 30 万 Lx・hr |
| 性状 <微黄色～淡黄色澄明の液> | 1 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| pH <6.2～6.8> | 1 | 6.52 | 6.34 |
| 含量 (%) ※ <95.0～105.0%> | 1 | 100.3～101.5 | 94.8～95.7 |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 曝光 [1000Lx, ポリエチレン容器+薬袋]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 総曝光量 | | | |
|---------------------------|-----------|-------------|-------------|------------|-------------|
| | | 開始時 | 30 万 Lx・hr | 60 万 Lx・hr | 120 万 Lx・hr |
| 性状 <微黄色～淡黄色澄明の液> | 1 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| pH <6.2～6.8> | 1 | 6.52 | 6.49 | 6.48 | 6.47 |
| 含量 (%) ※ <95.0～105.0%> | 1 | 100.3～101.5 | 100.0～100.8 | 99.0～100.6 | 97.3～98.9 |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 曝光 [1000Lx, ポリエチレン容器+紙箱]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 総曝光量 | |
|---------------------------|-----------|-------------|-------------|
| | | 開始時 | 120 万 Lx・hr |
| 性状 <微黄色～淡黄色澄明の液> | 1 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| pH <6.2～6.8> | 1 | 6.52 | 6.51 |
| 含量 (%) ※ <95.0～105.0%> | 1 | 100.3～101.5 | 101.1～101.7 |

※：表示量に対する含有率 (%)

試験実施期間：2012/2/15～2013/2/18

◇レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 曝光 [D65 光源 (1000Lx), ポリエチレン容器]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 総曝光量 | | |
|-------------------------------------------------------------------------|-----------|--------------|--------------|-------------------|
| | | 開始時 | 30 万 Lx・hr | 40 万 Lx・hr |
| 性状 n=3 <微黄色～黄色澄明の液> | LXN03 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| 浸透圧比 n=3 <0.9～1.1 (生理食塩液に対する比)> | LXN03 | 1.01～1.02 | 1.02～1.03 | 1.02 |
| pH n=3 <6.1～6.9> | LXN03 | 6.50～6.51 | 6.34～6.39 | 6.34～6.36 |
| 不溶性異物 n=3 <不溶性異物を認めない> | LXN03 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) n=3 <本剤 1mL 中の個数に換算するとき, 300 μm 以上のものは 1 個以下である> | LXN03 | 0 | 0 | 0 |
| 含量 (%) ※ n=3 <95.0～107.0%> | LXN03 | 100.7～100.9 | 95.2～97.0 | 94.0 ～95.2 |

※：表示量に対する含有率 (%) 規格外：太字

◇レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 曝光 [D65 光源 (1000Lx) , ポリエチレン容器 + シュリンク包装]

| 試験項目 ＜規格＞ | ロット 番号 | 総曝光量 | | | |
|-------------------------------------------------------------------------|-----------|--------------|--------------|--------------|------------------|
| | | 開始時 | 40 万 Lx・hr | 60 万 Lx・hr | 120 万 Lx・hr |
| 性状 n=3 ＜微黄色～黄色澄明の液＞ | LXN03 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| 浸透圧比 n=3 ＜0.9～1.1 (生理食塩液に対する比)＞ | LXN03 | 1.01～1.02 | 1.02 | 1.02 | 1.02 |
| pH n=3 ＜6.1～6.9＞ | LXN03 | 6.50～6.51 | 6.44～6.46 | 6.38 | 6.34～6.38 |
| 不溶性異物 n=3 ＜不溶性異物を認めない＞ | LXN03 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) n=3 ＜本剤 1mL 中の個数に換算するとき, 300 μm 以上のものは 1 個以下である＞ | LXN03 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 含量 (%) ※ n=3 ＜95.0～107.0%＞ | LXN03 | 100.7～100.9 | 98.6～98.9 | 96.2～96.9 | 93.2～96.0 |

※：表示量に対する含有率 (%) 規格外：太字

◇レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 曝光 [D65 光源 (1000Lx) , ポリエチレン容器 + シュリンク包装 + 薬袋]

| 試験項目 ＜規格＞ | ロット 番号 | 総曝光量 | | | |
|-------------------------------------------------------------------------|-----------|--------------|--------------|--------------|--------------|
| | | 開始時 | 40 万 Lx・hr | 60 万 Lx・hr | 120 万 Lx・hr |
| 性状 n=3 ＜微黄色～黄色澄明の液＞ | LXN03 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| 浸透圧比 n=3 ＜0.9～1.1 (生理食塩液に対する比)＞ | LXN03 | 1.01～1.02 | 1.01 | 1.02 | 1.01 |
| pH n=3 ＜6.1～6.9＞ | LXN03 | 6.50～6.51 | 6.50～6.51 | 6.46～6.47 | 6.49～6.50 |
| 不溶性異物 n=3 ＜不溶性異物を認めない＞ | LXN03 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) n=3 ＜本剤 1mL 中の個数に換算するとき, 300 μm 以上のものは 1 個以下である＞ | LXN03 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 含量 (%) ※ n=3 ＜95.0～107.0%＞ | LXN03 | 100.7～100.9 | 101.0～101.4 | 100.3～100.4 | 99.5～100.3 |

※：表示量に対する含有率 (%) 規格外：太字

◇レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 曝光 [D65 光源 (1000Lx) , ポリエチレン容器 + シュリンク包装 + 化粧箱]

| 試験項目 <規格> | ロット 番号 | 総曝光量 | |
|-------------------------------------------------------------------------|-----------|--------------|--------------|
| | | 開始時 | 120 万 Lx・hr |
| 性状 n=3 <微黄色～黄色澄明の液> | LXN03 | 微黄色澄明の液 | 微黄色澄明の液 |
| 浸透圧比 n=3 <0.9～1.1 (生理食塩液に対する比)> | LXN03 | 1.01～1.02 | 1.01～1.02 |
| pH n=3 <6.1～6.9> | LXN03 | 6.50～6.51 | 6.53～6.54 |
| 不溶性異物 n=3 <不溶性異物を認めない> | LXN03 | 不溶性異物を認めなかった | 不溶性異物を認めなかった |
| 不溶性微粒子 (個/mL) n=3 <本剤 1mL 中の個数に換算するとき, 300 μm 以上のものは 1 個以下である> | LXN03 | 0 | 0 |
| 含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%> | LXN03 | 100.7～100.9 | 101.4～101.9 |

※：表示量に対する含有率 (%) 規格外：太字

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

(1) 紫外可視吸光度測定法

本品の塩酸試液溶液につき吸収スペクトルを測定するとき、波長 225～229nm 及び 292～296nm に吸収の極大を示す。

(2) 液体クロマトグラフィー

本品の水/メタノール混液溶液から得た主ピークの保持時間は、標準溶液から得た主ピークの保持時間と等しい。

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸二水素カリウム，酢酸アンモニウム，水，塩酸試液，アセトニトリル混液

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

該当資料なし

16. その他

<レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 滴下試験>

(1) 試験方法

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」を3回、30滴ずつ同一試験者が同一条件にて滴下量の測定を行った。

(2) 試験項目

①滴下量の分布 (30滴)

②1容器あたりの滴下回数 (約5mL/容器)

(3) 試験結果

①滴下量の分布 (30滴)

| | レボフロキサシン点眼液0.5% 「NIG」 (回) | | |
|---------------------|---------------------------|-----|-----|
| | 1回目 | 2回目 | 3回目 |
| 42 μ L以下 | 0 | 0 | 0 |
| 42.01~45.00 μ L | 0 | 0 | 0 |
| 45.01~48.00 μ L | 3 | 3 | 10 |
| 48.01~51.00 μ L | 25 | 27 | 20 |
| 48.01~51.00 μ L | 2 | 0 | 0 |
| 54.01 μ L以上 | 0 | 0 | 0 |
| 合計 | 30 | 30 | 30 |

②1容器あたりの滴下回数 (約5mL/容器)

| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 (回) | | |
|----------------------------|-----|-----|
| 1回目 | 2回目 | 3回目 |
| 105 | 103 | 106 |

＜レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 滴下試験＞

(1) 試験方法

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」を 3 回、30 滴ずつ同一試験者が同一条件にて滴下量の測定を行った。

(2) 試験項目

①滴下量の分布 (30 滴)

②1 容器あたりの滴下回数 (約 5mL/容器)

(3) 試験結果

①滴下量の分布 (30 滴)

| | レボフロキサシン点眼液1.5% 「NIG」 (回) | | |
|---------------------|---------------------------|-----|-----|
| | 1回目 | 2回目 | 3回目 |
| 42 μ L以下 | 0 | 0 | 0 |
| 42.01～45.00 μ L | 3 | 0 | 0 |
| 45.01～48.00 μ L | 25 | 29 | 28 |
| 48.01～51.00 μ L | 2 | 1 | 2 |
| 48.01～51.00 μ L | 0 | 0 | 0 |
| 54.01 μ L以上 | 0 | 0 | 0 |
| 合計 | 30 | 30 | 30 |

②1 容器あたりの滴下回数 (約 5mL/容器)

| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 (回) | | |
|----------------------------|------|------|
| 1 回目 | 2 回目 | 3 回目 |
| 108 | 103 | 104 |

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

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³⁾

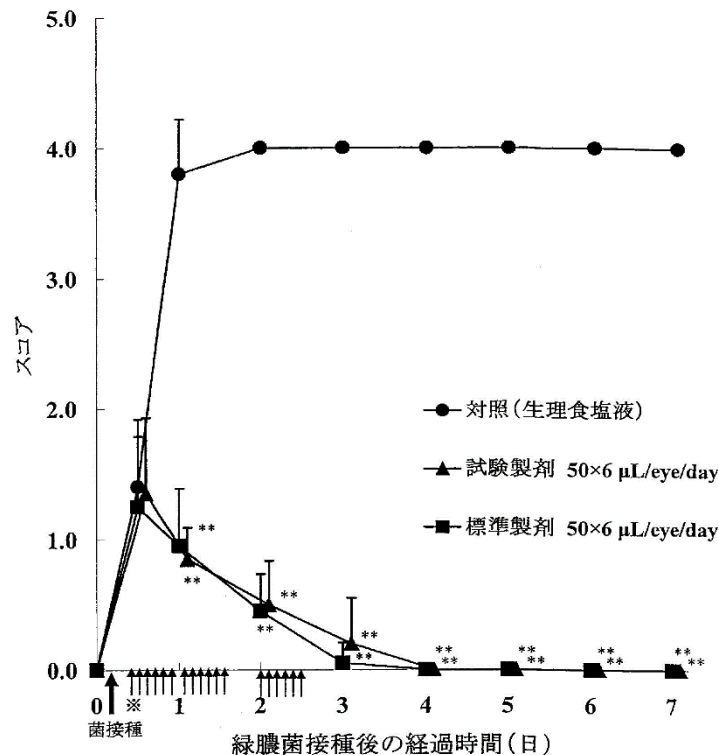
レボフロキサシン水和物は、ニューキノロン系抗菌薬で、その作用機序は、細菌の DNA ジヤイレース (DNA 複製時にらせん状の DNA 鎖を一度切断し、その後再結合する酵素) の活性阻害による DNA の複製阻害であり、殺菌的に作用する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果⁴⁾

<レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」>

ウサギ角膜表層に緑膿菌 (菌株: 緑膿菌 IID - 1210 株) を接種した病態モデルを用いて、レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」、標準製剤及び生理食塩液 (対照群) を菌接種後 6 時間後から 2 時間ごとに、それぞれ 1 日 6 回 ($50 \times 6 \mu\text{L}/\text{eye}/\text{日}$) 3 日間投与し、緑膿菌接種後 7 日目までの角膜混濁スコアの観察、並びに 7 日目の角膜からの緑膿菌分離培養を行い生物学的同等性を検討した。その結果、本剤及び標準製剤はいずれも緑膿菌による角膜混濁の増加を著明に抑制し、角膜から緑膿菌も検出されことなく治療効果に有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された。

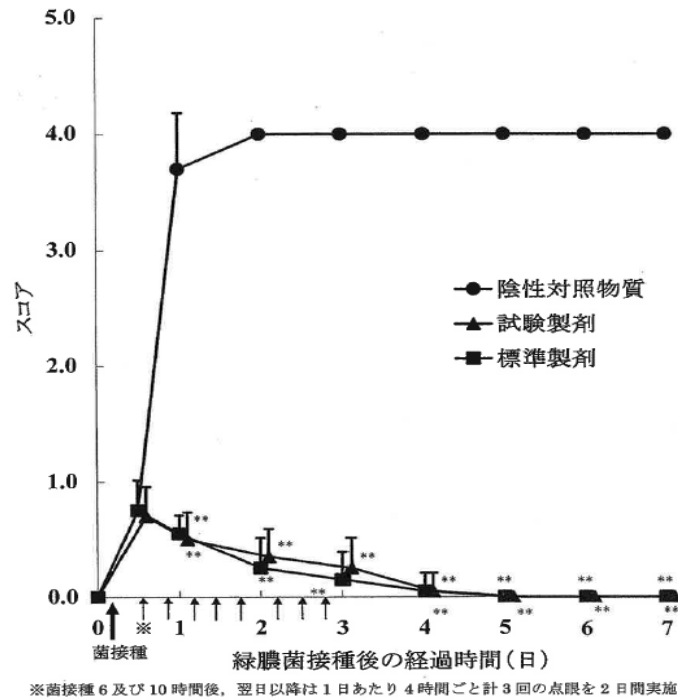


ウサギ眼感染モデルにおける治療効果 (角膜混濁のスコア推移)

** : $p < 0.01$ 対照群との間に Mann-Whitney の U 検定 (Bonferroni 調整後) で有意差あり
試験製剤群と標準製剤群の間に Mann-Whitney の U 検定 (Bonferroni 調整後) で有意差なし

<レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 >

ウサギ角膜表層に緑膿菌を接種した病態モデルを用いて、レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」と標準製剤を、それぞれ 50 μL/回（レボフロキサシン水和物として 0.75mg）3日間、計 8 回点眼し緑膿菌接種後 7 日目までの角膜混濁スコアを指標に生物学的同等性を検討した。その結果、本剤及び標準製剤は、生理食塩液点眼群（対照群）と比較していずれも緑膿菌による角膜混濁の増加を著明に抑制し、その治療効果に有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された。



ウサギ眼感染モデルにおける治療効果（角膜混濁のスコア推移）

** : p<0.01 対照群との間に Mann-Whitney の U 検定(Bonferroni 調整後)で有意差あり
 試験製剤群と標準製剤群の間に Mann-Whitney の U 検定(Bonferroni 調整後) で有意差なし

(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

(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

（「VIII. 10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項参照）

(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⁵⁾

<レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 >

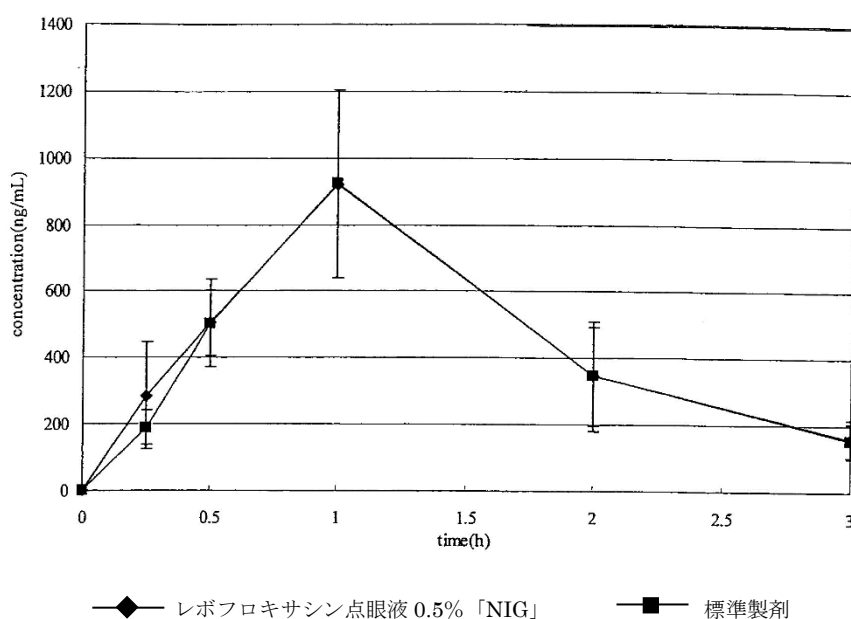
眼組織内移行性 (ウサギ)

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」と標準製剤を、それぞれ 50 μ L (レボフロキサシン水和物として 0.25mg) をウサギの眼結膜嚢内に点眼して眼房水内レボフロキサシン濃度を測定したところ、両剤とも同様の移行性を示し、生物学的同等性が確認された。

薬物動態パラメータ

| | Cmax (ng/mL) | AUCt (ng·hr/mL) | Tmax (hr) | F検定及びt検定 |
|------|---------------------|----------------------|-----------------|----------|
| 試験製剤 | 920.25 \pm 281.48 | 1375.03 \pm 346.81 | 1.00 \pm 0.00 | 有意差なし |
| 標準製剤 | 922.10 \pm 282.93 | 1350.96 \pm 261.80 | 1.00 \pm 0.00 | |

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



試験製剤及び標準製剤投与後のウサギ眼房水内の薬物濃度-時間曲線

<レボフロキサシン点眼液 1.5%「NIG」>

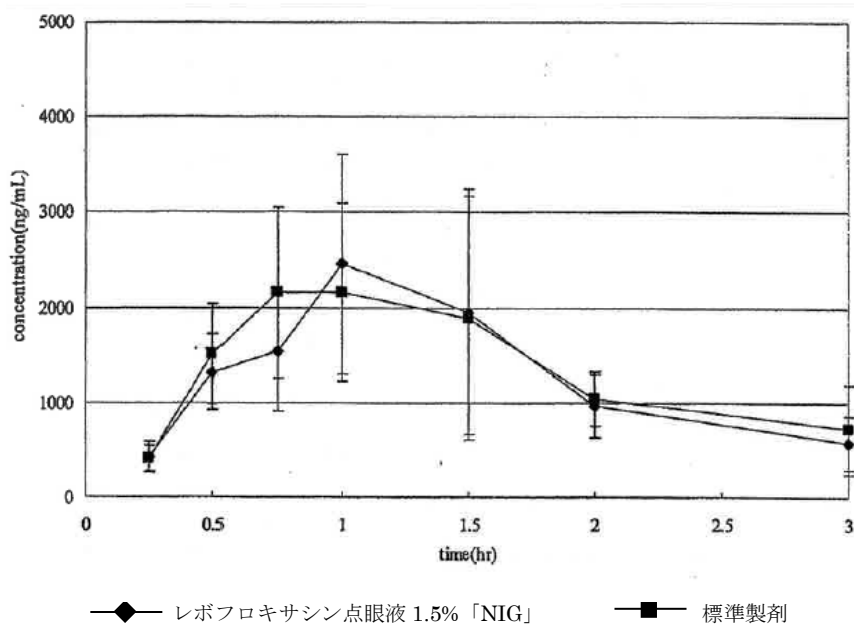
(参考) 眼組織内移行性 (ウサギ)

レボフロキサシン点眼液 1.5%「NIG」と標準製剤を、それぞれ 50 μ L (レボフロキサシン水和物として 0.75mg) をウサギの眼結膜嚢内に点眼して眼房水内レボフロキサシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ (AUC, Cmax) につい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。

薬物動態パラメータ

| | Cmax (ng/mL) | AUC ₀₋₃ (ng·hr/mL) | Tmax (hr) | F 検定及び t 検定 |
|------|-----------------|----------------------------------|--------------|-------------|
| 試験製剤 | 3220.48±979.68 | 3732.71±659.02 | 1.13±0.29 | 有意差なし |
| 標準製剤 | 3212.90±930.66 | 3909.72±846.05 | 0.96±0.3 | |

(Mean±S. D., n=12)



試験製剤及び標準製剤投与後のウサギ眼房水内の薬物濃度-時間曲線

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

該当記載事項なし

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

（「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

該当記載事項なし

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当記載事項なし

7. 相互作用

（1）併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

（2）併用注意とその理由

該当記載事項なし

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（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。

<レボフロキサシン点眼液 0.5%「NIG」>

| | 頻度不明 |
|--------------|--------------------------------------|
| 過 敏 症 | 蕁麻疹，眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等），眼瞼皮膚炎，そう痒感，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 |

<レボフロキサシン点眼液 1.5%「NIG」>

| | 頻度不明 |
|--------------|--------------------------------------------|
| 過 敏 症 | 蕁麻疹，そう痒感，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，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

- 1) **禁忌**：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には投与しないこと。
- 2) **重大な副作用**（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。
- 3) **その他の副作用**：過敏症（蕁麻疹，眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等），眼瞼皮膚炎，発疹，そう痒感）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。

9. 高齢者への投与

該当記載事項なし

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

＜レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」のみ＞

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）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当記載事項なし

13. 過量投与

該当記載事項なし

14. 適用上の注意

- (1) **投与経路**：点眼用のみ使用すること。
- (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。

＜レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」のみ＞

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

15. その他の注意

該当記載事項なし

16. その他

該当記載事項なし

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

| | | |
|------|--------------------------------------------------|-----------------------------------|
| 製 剤 | レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 | 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 | レボフロキサシン水和物 | なし |

2. 有効期間又は使用期限

3年（外箱，ラベルに表示）（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

遮光，室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱い上の留意点について

（「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）

くすりのしおり：有

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目）を参照）

（3）調剤時の留意点について

該当記載事項なし

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% 「NIG」：5mL×5本（ポリエチレン製点眼容器）

5mL×10本（ポリエチレン製点眼容器）

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」：5mL×5本（ポリエチレン製点眼容器）

7. 容器の材質

| 容器 | 中栓 | キャップ |
|--------|--------|---------|
| ポリエチレン | ポリエチレン | ポリプロピレン |

8. 同一成分・同効薬

同一成分：クラビット点眼液 0.5%/1.5%

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

| 販売名 | 製造承認年月日 | 承認番号 |
|------------------------|------------|---------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 | 2012年6月1日 | 22400AMX00702 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 | 2013年2月15日 | 22500AMX00311 |

| 旧販売名 | 製造承認年月日 | 承認番号 |
|------------------------|------------|---------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「TYK」 | 2012年6月1日 | 22400AMX00702 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「テバ」 | 2013年2月15日 | 22500AMX00311 |

| 旧販売名 | 製造承認年月日 | 承認番号 |
|-------------------------|------------|---------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「興和テバ」 | 2011年7月15日 | 22300AMX00648 |

11. 薬価基準収載年月日

| 販売名 | 薬価基準収載年月日 |
|------------------------|------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 | 2022年6月17日 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 | 2022年6月17日 |

| 旧販売名 | 薬価基準収載年月日 |
|------------------------|-------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「TYK」 | 2012年12月14日 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「テバ」 | 2013年6月21日 |

| 旧販売名 | 薬価基準収載年月日 |
|-------------------------|-------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「興和テバ」 | 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，投薬期間に関する制限は定められていない。（「V. 治療に関する項目」の項参照）

16. 各種コード

| 販売名 | 薬価基準収載 医薬品コード | レセプト 電算コード | HOT(9桁) コード |
|------------------------|------------------|---------------|----------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「NIG」 | 1319742Q1292 | 622097004 | 120970904 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「NIG」 | 1319742Q2230 | 622241803 | 122418403 |

| 旧販売名 | 薬価基準収載 医薬品コード | レセプト 電算コード | HOT(9桁) コード |
|------------------------|------------------|---------------|----------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「TYK」 | 1319742Q1241 | 622097002 | 120970903 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「テバ」 | 1319742Q2124 | 622241801 | 122418402 |

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) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料（安定性試験）
- 2) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料（配合変化試験）
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書 C-5957, 廣川書店, 東京（2016）
- 4) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料（薬力学的同等性試験；ウサギ眼感染モデル）
- 5) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料（ウサギ眼組織内薬物移行動態）

2. その他の参考文献

なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

なし

2. 海外における臨床支援情報

なし

X III. 備考

その他の関連資料

なし