

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2008に準拠して作成

広範囲抗菌点眼剤
処方箋医薬品[※]
 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%「VTRS」
レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」
 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	レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」 1mL中 日局 レボフロキサシン水和物 5.0mg レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」 1mL中 日局 レボフロキサシン水和物 15.0mg		
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%「VTRS」	レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」
	製造販売承認年月日	2012年 8月15日	2013年2月15日
	薬価基準収載年月日	2022年 6月17日	2022年6月17日
	発売年月日	2012年12月14日	2013年6月21日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：マイランEPD合同会社 販売：ヴィアトリス製薬株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 https://www.viatris-e-channel.com/		

本IFは2022年6月改訂（第4版：レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」）、2022年6月改訂（第5版：レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」）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/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

更に 10 年が経過した現在、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 記載要領が策定された。

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 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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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。

(2008 年 9 月)

目次

I. 概要に関する項目	1
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	2
1. 販売名	2
2. 一般名	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）	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	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	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
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	10
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	11
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. 治療上注意が必要な容器に関する情報	11
15. 刺激性	12
16. その他	12
V. 治療に関する項目	13
1. 効能又は効果	13
2. 用法及び用量	13
3. 臨床成績	13
VI. 薬効薬理に関する項目	15
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	15
2. 薬理作用	15
VII. 薬物動態に関する項目	17
1. 血中濃度の推移・測定法	17
2. 薬物速度論的パラメータ	17
3. 吸収	18
4. 分布	18
5. 代謝	20
6. 排泄	21
7. 透析等による除去率	21

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	22
1. 警告内容とその理由	22
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	22
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意	22
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	22
5. 慎重投与内容とその理由	22
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	22
7. 相互作用	22
8. 副作用	22
9. 高齢者への投与	23
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	23
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	24
15. その他の注意	24
16. その他	24
IX. 非臨床試験に関する項目	25
1. 薬理試験	25
2. 毒性試験	25
X. 管理的事項に関する項目	26
1. 規制区分	26
2. 有効期間又は使用期限	26
3. 貯法・保存条件	26
4. 薬剤取扱い上の注意点	26
5. 承認条件等	26
6. 包装	26
7. 容器の材質	26
8. 同一成分・同効薬	27
9. 国際誕生年月日	27
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	27
11. 薬価基準収載年月日	27
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	27
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	27
14. 再審査期間	27
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	27
16. 各種コード	28
17. 保険給付上の注意	28
XI. 文献	29
1. 引用文献	29
2. その他の参考文献	29
XII. 参考資料	30
1. 主な外国での発売状況	30
2. 海外における臨床支援情報	30
XIII. 備考	31
その他の関連資料	31

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レボフロキサシン水和物は、ニューキノロン系抗菌薬であり、DNA ジャイレースおよびトポイソメラーゼIVに作用し、DNA 複製を阻害する。ニューキノロン系薬剤の一つ ofloxacin と平面構造は同じである。ofloxacin は *R*(+)-体、*S*(-)-体からなるが、levofloxacin は効力のある *S*(-)-体のみからなる¹⁾。

レボフロキサシン点眼液 0.5%・1.5%「ファイザー」は、ファイザー株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく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、レボフロキサシン点眼液 0.5%「ファイザー」は 2012 年 8 月に、レボフロキサシン点眼液 1.5%「ファイザー」は 2013 年 2 月に承認を得た製剤である。

2022 年 6 月、ファイザー株式会社からマイラン EPD 合同会社へ製造販売移管したため、販売名をレボフロキサシン点眼液 0.5%・1.5%「V T R S」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 幅広い菌種に殺菌的に作用するニューキノロン系点眼剤

レボフロキサシン水和物は、*R*(+)-体、*S*(-)-体からなるラセミ体であるオフロキサシンの抗菌活性本体の *S*(-)-体のみからなるニューキノロン系抗菌薬である¹⁾。作用は殺菌的で、ブドウ球菌属やレンサ球菌属から腸球菌属、アクネ菌などの幅広い菌種に対する適応が認められている。

2. 誤投与防止のための認識性向上の取り組み

- 1) 包装（小函、ラベル）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている^{2)~4)}。
- 2) 規格取り違えを防ぐ試みとして、複数規格の製剤は、上の規格（高用量）がある場合、記載含量の上に▲を配置し、下の規格（低用量）がある場合、記載含量の下に▼を配置している。
- 3) 携帯袋にピクトグラムを採用することで、患者さんが使用上の注意を直感的に理解できるように工夫し、使用上の注意などの記載事項はすべて「つたわるフォント」で作成している。
- 4) レボフロキサシン点眼液 0.5%・1.5%「V T R S」は、開封しやすいつまみ付きのシュリンクラベルを採用し、規格取り違えを防ぐためラベルに濃度表示をしている。
- 5) 容器を楕円形に変更し、横幅を広げることで、従来容器よりも転がりにくく、かつラベルの視認性を向上させた。

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が、レボフロキサシン水和物点眼液の重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーが報告されている。

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目」の「8. 副作用」の項を参照）

*「つたわるフォント」は誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

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% 「V T R S」

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「V T R S」

(2) 洋名

LEVOFLOXACIN Ophthalmic Solution

(3) 名称の由来

有効成分であるレボフロキサシンに剤形、含量及び「V T R S」を付した。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

レボフロキサシン水和物 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

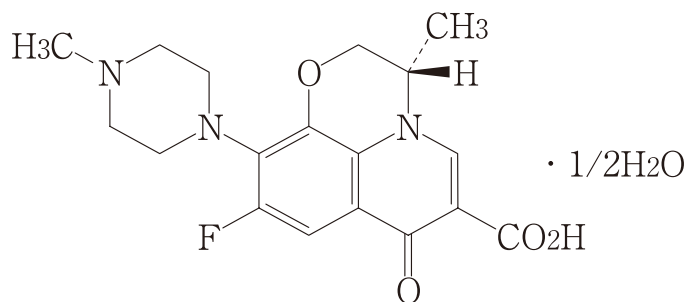
Levofloxacin Hydrate (JAN)

Levofloxacin (INN)

(3) ステム

ナリジクス酸誘導体系抗菌剤：-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 (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 (Levofloxacin Hydrate、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。

(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

施光度： $[\alpha]_D^{20}$ -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¹⁾

日局「レボフロキサシン水和物」の確認試験法による。

4. 有効成分の定量法¹⁾

日局「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、規格及び性状

1) 剤形：点眼剤

2) 規格及び性状：

	規格	性状
レボフロキサシン点眼液0.5% 「VTRS」	本品は1mL中に日局 レボフロキサシン水和物5.0mgを含有する点眼剤である。	微黄色～淡黄色澄明の液である。
レボフロキサシン点眼液1.5% 「VTRS」	本品は1mL中に日局 レボフロキサシン水和物15.0mgを含有する点眼剤である。	微黄色～黄色澄明の液である。

(3) 製剤の物性

該当資料なし

(4) 識別コード

該当資料なし

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

	レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」	レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」
pH	6.2～6.8	6.1～6.9
浸透圧比	1.0～1.1（生理食塩液対比）	1.0～1.1（生理食塩液対比）

(6) 無菌の有無

本剤は無菌である。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「VTRS」

1mL 中 日局 レボフロキサシン水和物 5.0mg

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「VTRS」

1mL 中 日局 レボフロキサシン水和物 15.0mg

(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

加速試験

試験条件：40±1℃、75±5%RH

①レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」⁵⁾

包装形態：ポリプロピレン製容器（5mL）充てん（紙箱）

試験項目及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（微黄色～淡黄色澄明の液である）		適合	適合	適合	適合
確認 試験	塩酸ヒドロキシアンモニウム 溶液、希塩酸及び希塩化鉄（Ⅲ） 試液による定性反応	適合	適合	適合	適合
	紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合
定量試験（95.0～105.0%）		99.7～ 101.3	99.3～ 100.9	100.3～ 101.7	101.1～ 102.1
浸透圧比（1.0～1.1）		1.03～1.05	1.03～1.06	1.04～1.05	1.04～1.06
pH（6.2～6.8）		6.53～6.55	6.55～6.57	6.52～6.55	6.54～6.56
不溶性異物（澄明で、たやすく検出される 不溶性異物を認めない）		適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子 （300μm以上：1個以下/1mL（個/25mL））		0～2	0	0～2	0～1
無菌試験 （微生物の増殖が観察されない）		適合	—	—	適合

各ロット：n=3

②レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」⁶⁾

包装形態：ポリプロピレン製容器（5mL）充てん（紙箱）

試験項目及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（微黄色～黄色澄明の液である）		適合	適合	適合	適合
確認試験	紫外可視吸光度測定法	適合	—	—	適合
	液体クロマトグラフィー	適合	—	—	適合
定量試験（95.0～107.0%）		100.6～ 101.9	—	—	101.2～ 102.7
純度試験	個々の類縁物質（0.4%以下）	0.00～0.03	0.00～0.03	0.00～0.06	0.00～0.11
	類縁物質の総量（0.8%以下）	0.05	0.06～0.07	0.09～0.11	0.15～0.17
浸透圧比（1.0～1.1（生理食塩水））		1.0	1.0	1.0	1.0
pH（6.1～6.9）		6.48	6.47～6.48	6.46～6.47	6.47～6.49
不溶性異物（澄明で、たやすく検出される不溶性異物を認めない）		適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子 （300μm以上：1個以下/1mL（個/25mL））		0	0	0	0
無菌試験 （微生物の増殖が観察されない）		適合	—	—	適合

各ロット：n=3

苛酷試験（光安定性試験）

試験条件：25℃

レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」⁷⁾

包装形態：ラベル及び携帯袋

包装形態		試験項目及び規格	試験開始時	照射量		結果	
ラベル	携帯袋			30万 lx・hr	60万 lx・hr		
無	無	性状（微黄色～黄色澄明の液である）	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	変化なし 規格に適合	
		純度試験	個々の類縁物質（0.4%以下）	0.13	1.35	2.01	変化あり 規格に不適合
			類縁物質の総量（0.8%以下）	0.18	3.64	5.01	
		含量（95.0～107.0%）		99.6	95.1 (95.5)	92.9 (93.3)	変化あり 規格に不適合
有	無	性状（微黄色～黄色澄明の液である）	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	変化なし 規格に適合	
		純度試験	個々の類縁物質（0.4%以下）	0.13	0.38	0.55	変化あり 規格に不適合
			類縁物質の総量（0.8%以下）	0.18	0.93	1.18	
		含量（95.0～107.0%）		99.6	98.8 (99.2)	97.8 (98.2)	変化なし 規格に適合
有	有	性状（微黄色～黄色澄明の液である）	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	変化なし 規格に適合	
		純度試験	個々の類縁物質（0.4%以下）	0.13	0.20	0.34	変化あり 規格に適合
			類縁物質の総量（0.8%以下）	0.18	0.57	0.79	
		含量（95.0～107.0%）		99.6	99.7 (100.1)	98.3 (98.7)	変化なし 規格に適合

レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」について、光に対する安定性を確認するため、ラベル・携帯袋の有無による光安定性試験を行った結果、ラベル貼付及び携帯袋に入れることにより、光安定性が得られた。

長期保存試験

試験条件：25±2℃、60±5%RH

①レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」⁸⁾

包装形態：ポリプロピレン製容器（5mL）充てん（紙箱）

試験項目及び規格		試験開始時	6ヵ月後	12ヵ月後	24ヵ月後	36ヵ月後
性状（微黄色～淡黄色澄明の液である）		適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	塩酸ヒドロキシアニモニウム溶液、希塩酸及び希塩化鉄（Ⅲ）試液による定性反応	適合	—	—	—	適合
	紫外可視吸光度測定法	適合	—	—	—	適合
定量試験（95.0～105.0%）		99.7～101.3	99.0～101.4	99.6～101.4	101.1～102.7	102.3～103.7
浸透圧比（1.0～1.1）		1.03～1.05	1.03～1.06	1.05	1.07～1.08	1.08～1.10
pH（6.2～6.8）		6.53～6.55	6.54～6.55	6.51～6.53	6.46～6.50	6.52～6.57
不溶性異物（澄明で、たやすく検出される不溶性異物を認めない）		適合	—	—	—	適合
不溶性微粒子（300μm以上：1個以下/1mL（個/25mL））		0～2	—	—	—	0～1
無菌試験（微生物の増殖が観察されない）		適合	—	—	—	適合

各ロット：n=3

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度60%、36ヵ月）の結果、レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

②レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」⁹⁾

包装形態：ポリプロピレン製容器（5mL）充てん（紙箱）

試験項目及び規格		試験開始時	3ヵ月後	6ヵ月後	9ヵ月後	12ヵ月後	18ヵ月後	24ヵ月後	36ヵ月後
性状(微黄色～黄色澄明の液である)		適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
	液体クロマトグラフィー	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験 (95.0～107.0%)		99.5～100.2	101.3～101.8	101.1～101.5	99.3～100.2	100.7～101.9	99.7～101.0	99.9～101.4	101.9～102.8
純度試験	個々の類縁物質 (0.4%以下)	0.00～0.03	0.00～0.03	0.00～0.04	0.00～0.05	0.00～0.08	0.00～0.12	0.00～0.17	0.00～0.28
	類縁物質の総量 (0.8%以下)	0.05	0.06	0.07～0.08	0.09	0.11～0.12	0.13～0.17	0.17～0.21	0.29～0.33
浸透圧比 (1.0～1.1 (生理食塩液))		1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
pH (6.1～6.9)		6.48	6.46～6.47	6.48～6.49	6.48～6.49	6.46	6.47	6.45～6.46	6.46～6.47
不溶性異物 (澄明で、たやすく検出される不溶性異物を認めない)		適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子 (300 μm 以上：1 個以下/1mL (個/25mL))		0	0	0	0	0	0	0	0
無菌試験(微生物の増殖が観察されない)		適合	—	—	—	適合	適合	適合	適合

各ロット：n=3

長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、36 ヶ月）の結果、レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」は通常の商品流通下において 3 年間安定であることが確認された。

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

他の点眼剤との配合変化¹⁰⁾

容量比：1：1、条件：室温、遮光下、観察時間：配合直後、24時間後

観察項目：性状、pH、浸透圧比、含量（95.0～105.0%）

配合薬剤名	成分名	結果
ヒアレイン点眼液0.1%	ヒアルロン酸ナトリウム	変化なし
フルメトロン点眼液0.1%	フルオロメトロン	変化なし
ニフラン点眼液0.1%	プラノプロフェン	変化なし
ジクロード点眼液0.1%	ジクロフェナクナトリウム	変化なし
リンデロン点眼・点耳・点鼻液 0.1%	ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム	変化なし
点眼・点鼻用リンデロンA液	ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム	変化なし
ブロナック点眼液0.1%	ブロムフェナクナトリウム水和物	変化なし

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「レボフロキサシン水和物」の確認試験による。

11. 製剤中の有効成分の定量法

日局「レボフロキサシン水和物」の定量法による。

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. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

15. 刺激性

①レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」¹¹⁾

レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」の眼刺激性についてウサギを用いて標準品と比較検討した。その結果、両剤ともに眼刺激性反応は認められず、一時及び累積の眼刺激性はないものと判断された。

②レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」¹²⁾

レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」の眼刺激性についてウサギを用いて標準品と比較検討した。その結果、両剤ともに眼刺激性反応は認められず、一時及び累積の眼刺激性はないものと判断された。

16. その他

該当資料なし

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、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：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

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

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ピリドンカルボン酸系化合物

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

レボフロキサシン水和物の作用機序は、細菌のDNA ジェイレース（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

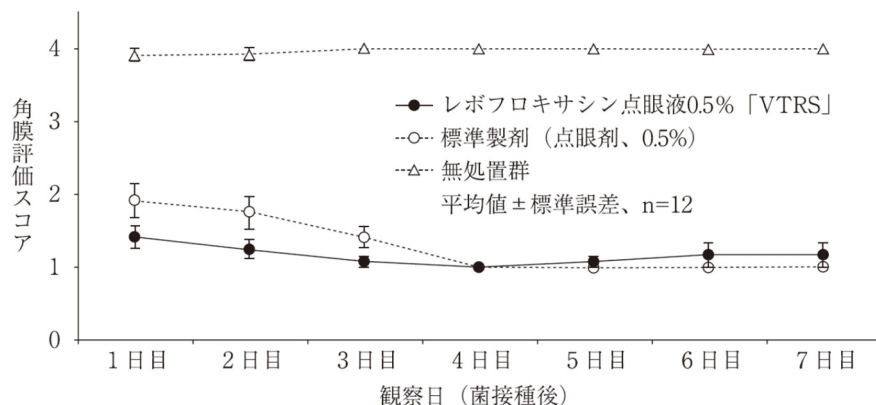
生物学的同等性試験

ウサギ緑膿菌角膜感染モデルに対する治癒効果

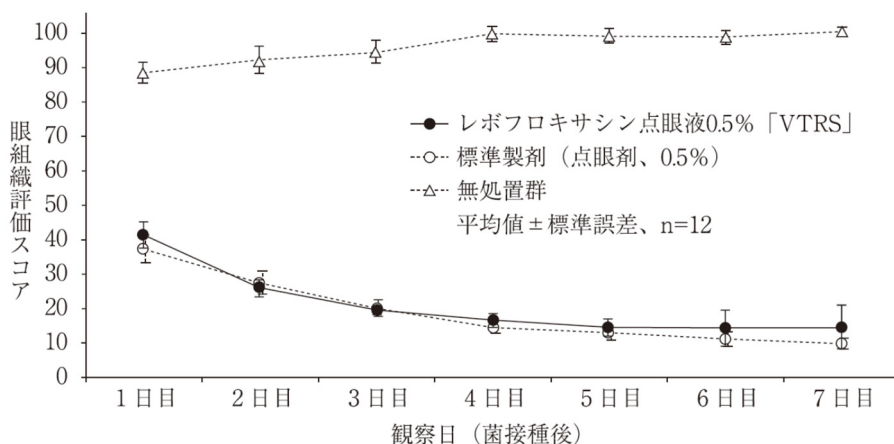
①レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」¹³⁾

レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」及び標準製剤におけるウサギ緑膿菌性角膜感染モデルに対する治癒効果を比較検討した。その結果両製剤ともに優れた治癒効果を示し、また両製剤間の治癒効果に有意差は認められず、生物学的同等性が確認された。

●角膜感染部位の臨床観察

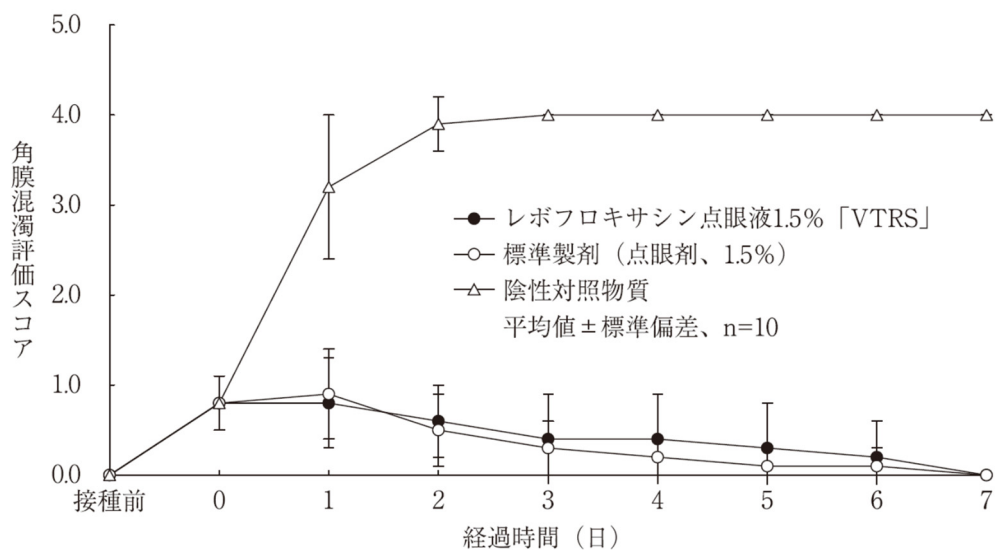


●眼組織感染部位の臨床観察



②レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」¹⁴⁾

レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」及び標準製剤におけるウサギ緑膿菌性角膜感染モデルに対する治癒効果を比較検討した。その結果両製剤ともに優れた治癒効果を示し、また両製剤間の治癒効果に有意差は認められず、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) コンパートメントモデル

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

生物学的同等性試験

【参考】

ウサギ眼組織内濃度測定試験

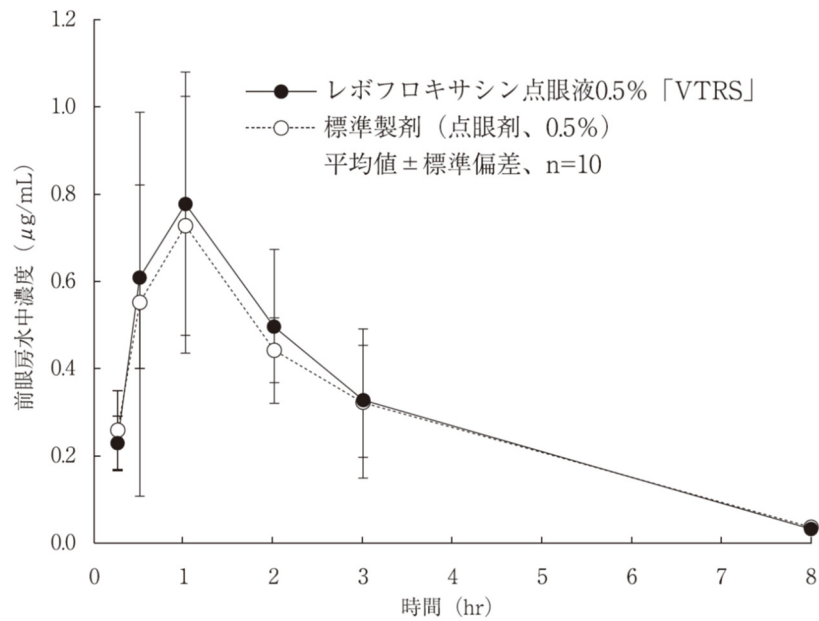
①レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」¹⁵⁾

レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」又は標準製剤をウサギに点眼し、各測定時点における前眼房水及び角膜中レボフロキサシン濃度を測定した。両製剤間の前眼房水及び角膜中レボフロキサシン濃度に有意差は認められず、生物学的同等性が確認された。

●ウサギ前眼房水中レボフロキサシン濃度（単回点眼後）

	濃度 (μg/mL)					
	0.25時間	0.5時間	1時間	2時間	3時間	8時間
レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」	0.229 ±0.062	0.610 ±0.210	0.780 ±0.304	0.495 ±0.177	0.325 ±0.129	0.0325 ±0.0099
標準製剤(点眼液、0.5%)	0.258 ±0.089	0.549 ±0.440	0.730 ±0.295	0.440 ±0.075	0.320 ±0.171	0.0354 ±0.0117

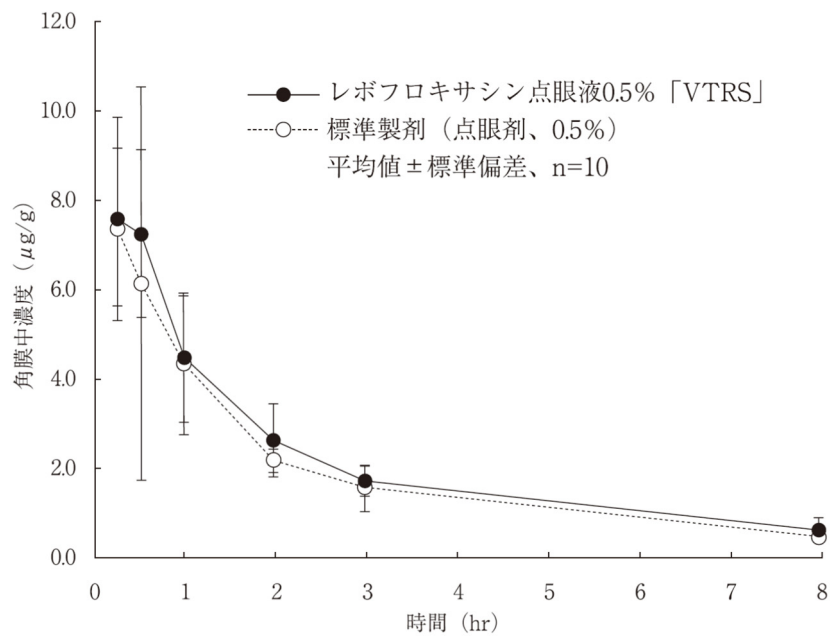
平均値±標準偏差 n=10



●ウサギ角膜中レボフロキサシン濃度 (単回点眼後)

	濃度 (μg/g)					
	0.25時間	0.5時間	1時間	2時間	3時間	8時間
レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」	7.61 ±2.29	7.29 ±1.88	4.51 ±1.46	2.65 ±0.81	1.74 ±0.35	0.670 ±0.256
標準品	7.42 ±1.77	6.16 ±4.40	4.34 ±1.57	2.19 ±0.26	1.57 ±0.51	0.512 ±0.113

平均値 ± 標準偏差 n=10



②レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」^{16, 17)}

レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」又は標準製剤をウサギに点眼し、各測定時点における眼房水及び角膜中レボフロキサシン濃度を測定した。両製剤間の眼房水及び角膜中レボフロキサシン濃度に有意差は認められず、生物学的同等性が確認された。

● 点眼後 60 分における眼房水中レボフロキサシン濃度

	濃度 (ng/mL)
レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」	3803.90±2106.85
標準品	3761.02±2325.64

平均値±標準偏差 n=90

● 点眼後 15 分における角膜中レボフロキサシン濃度

	濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」	25939.84±15591.77
標準品	26184.23±14731.19

平均値±標準偏差 n=94

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. 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

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」を参照すること。

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。

(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。

	レボフロキサシン点眼液0.5%「VTRS」	レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」
	頻度不明	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	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	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

該当資料なし

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

(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（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

該当しない

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) 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。

2) 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

該当しない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験
該当資料なし

(3) 安全性薬理試験
該当資料なし

(4) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験
該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験
該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験
該当資料なし

(4) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「V T R S」 処方箋医薬品^{注)}

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「V T R S」 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

有効成分：日局 レボフロキサシン水和物 5.0mg 処方箋医薬品^{注)}

日局 レボフロキサシン水和物 15.0mg 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

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：最終年月を外箱等に記載

(取扱い上の注意参照)

(「IV. 製剤に関する項目」の「5. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照。)

3. 貯法・保存条件

室温保存、遮光保存、気密容器

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「14. 適用上の注意」の項を参照。

(2) 薬剤交付時の注意（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」の「14. 適用上の注意」の項を参照。

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% 「V T R S」：5mL×10 本

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「V T R S」：5mL×10 本

7. 容器の材質

ボ ト ル：PP（ポリプロピレン）

キャップ：PP（ポリプロピレン）

中 栓：PE（ポリエチレン）（0.5%）

HDPE（高密度ポリエチレン）（1.5%）

ラ ベ ル：PET（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%（参天製薬株式会社、第一三共株式会社）、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（第一三共株式会社）

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、ロメフロキサシン塩酸塩 等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

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%「VTRS」	2012年8月15日	22400AMX01199
レボフロキサシン点眼液1.5%「VTRS」	2013年2月15日	22500AMX00157

11. 薬価基準収載年月日

レボフロキサシン点眼液 0.5%・1.5%「VTRS」：2022年6月17日

（旧販売名）

レボフロキサシン点眼液 0.5%「ファイザー」：2012年12月14日

レボフロキサシン点眼液 1.5%「ファイザー」：2013年6月21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、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準記載 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% 「VTRS」	122061203	1319742Q1306	622206103
レボフロキサシン点眼液 1.5% 「VTRS」	122332302	1319742Q2248	622233202

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編：“(処) レボフロキサシン水和物” 第十七改正 日本薬局方解説書 廣川書店：C-5960, 2016
- 2) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (1) -明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較-」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：25, 2009
- 3) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (2) -低視力状態での可視性の比較-」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：29, 2009
- 4) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (3) -低コントラスト状態での可視性の比較-」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：33, 2009
- 5) 社内資料：安定性試験（加速試験）（レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」）
- 6) 社内資料：安定性試験（加速試験）（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）
- 7) 社内資料：光安定性試験（苛酷試験）（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）
- 8) 社内資料：安定性試験（長期保存試験）（レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」）
- 9) 社内資料：安定性試験（長期保存試験）（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）
- 10) 社内資料：配合変化試験（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）
- 11) 社内資料：眼刺激性試験（レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」）
- 12) 社内資料：眼刺激性試験（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）
- 13) 社内資料：生物学的同等性試験（ウサギ緑膿菌感染治療効果）（レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」）
- 14) 社内資料：生物学的同等性試験（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）
- 15) 社内資料：生物学的同等性試験（ウサギ眼組織内濃度）（レボフロキサシン点眼液 0.5%「VTRS」）
- 16) 社内資料：生物学的同等性試験（ウサギ眼房水中濃度）（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）
- 17) 社内資料：生物学的同等性試験（ウサギ角膜中濃度）（レボフロキサシン点眼液 1.5%「VTRS」）

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

該当資料なし

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

該当資料なし

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ヴィアトリス製薬株式会社　メディカルインフォメーション部
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5-11-2
フリーダイヤル　0120-419-043

製造販売

マイラン EPD 合同会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5-11-2

販売

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5-11-2

