

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%「科研」
レボフロキサシン点眼液1.5%「科研」

LEVOFLOXACIN Ophth.Soln.

| | |
|---------------------------|--|
| 剤形 | 水性点眼剤 |
| 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中に日本薬局方レボフロキサシン水和物5mgを含有する。 1.5%：1mL中に日本薬局方レボフロキサシン水和物15mgを含有する。 |
| 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%「科研」： 製造販売承認年月日：2011年7月15日 薬価基準収載年月日：2011年11月28日 発売年月日：2011年11月28日 |
| | レボフロキサシン点眼液1.5%「科研」： 製造販売承認年月日：2013年2月15日 薬価基準収載年月日：2013年6月21日 発売年月日：2013年6月21日 |
| 開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名 | 発売元：科研製薬株式会社 製造販売元：ダイト株式会社 |
| 医薬情報担当者の連絡先 | |
| 問合せ窓口 | 科研製薬株式会社 医薬品情報サービス室 TEL：0120-519-874 受付時間：9:00～17:00（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） ホームページアドレス： https://www.kaken.co.jp/ |

本IFは2022年7月改訂（レボフロキサシン点眼液1.5%「科研」）及び2022年8月改訂（レボフロキサシン点眼液0.5%「科研」）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 <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

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 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、医薬品医療機器総合機構ホームページ（<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、薬価基準収載に合わせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い、IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ① 「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

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

| | | | |
|-------------------------------------|-----------|------------------------------------|-----------|
| (1) 血液－脳関門通過性 | 12 | (1) 薬効薬理試験 | 18 |
| (2) 血液－胎盤関門通過性 | 12 | (2) 副次的薬理試験 | 18 |
| (3) 乳汁への移行性 | 12 | (3) 安全性薬理試験 | 18 |
| (4) 髄液への移行性 | 12 | (4) その他の薬理試験 | 18 |
| (5) その他の組織への移行性 | 12 | 2. 毒性試験 | 18 |
| 5. 代謝 | 13 | (1) 単回投与毒性試験 | 18 |
| (1) 代謝部位及び代謝経路 | 13 | (2) 反復投与毒性試験 | 18 |
| (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種 | 13 | (3) 生殖発生毒性試験 | 18 |
| (3) 初回通過効果の有無及びその割合 | 13 | (4) その他の特殊毒性 | 18 |
| (4) 代謝物の活性の有無及び比率 | 13 | X. 管理的事項に関する項目 | 19 |
| (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ | 13 | 1. 規制区分 | 19 |
| 6. 排泄 | 13 | 2. 有効期間又は使用期限 | 19 |
| (1) 排泄部位及び経路 | 13 | 3. 貯法・保存条件 | 19 |
| (2) 排泄率 | 13 | 4. 薬剤取扱い上の注意点 | 19 |
| (3) 排泄速度 | 13 | (1) 薬局での取扱い上の留意点について | 19 |
| 7. トランスポーターに関する情報 | 14 | (2) 薬剤交付時の取扱いについて | 19 |
| 8. 透析等による除去率 | 14 | (患者等に留意すべき必須事項等) | 19 |
| VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 | 15 | (3) 調剤時の留意点について | 19 |
| 1. 警告内容とその理由 | 15 | 5. 承認条件等 | 19 |
| 2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む) | 15 | 6. 包装 | 19 |
| 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 | 15 | 7. 容器の材質 | 19 |
| 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 | 15 | 8. 同一成分・同効薬 | 19 |
| 5. 慎重投与内容とその理由 | 15 | 9. 国際誕生年月日 | 20 |
| 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 | 15 | 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 | 20 |
| 7. 相互作用 | 15 | 11. 薬価基準収載年月日 | 20 |
| (1) 併用禁忌とその理由 | 15 | 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 | 20 |
| (2) 併用注意とその理由 | 15 | 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 | 20 |
| 8. 副作用 | 15 | 14. 再審査期間 | 20 |
| (1) 副作用の概要 | 15 | 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 | 20 |
| (2) 重大な副作用と初期症状 | 15 | 16. 各種コード | 20 |
| (3) その他の副作用 | 16 | 17. 保険給付上の注意 | 20 |
| (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧 | 16 | XI. 文献 | 21 |
| (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 | 16 | 1. 引用文献 | 21 |
| (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法 | 16 | 2. その他の参考文献 | 21 |
| 9. 高齢者への投与 | 16 | XII. 参考資料 | 22 |
| 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 | 16 | 1. 主な外国での発売状況 | 22 |
| 11. 小児等への投与 | 16 | 2. 海外における臨床支援情報 | 22 |
| 12. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 16 | XIII. 備考 | 23 |
| 13. 過量投与 | 17 | 1. その他の関連資料 | 23 |
| 14. 適用上の注意 | 17 | (1) GS1 コード | 23 |
| 15. その他の注意 | 17 | | |
| 16. その他 | 17 | | |
| IX. 非臨床試験に関する項目 | 18 | | |
| 1. 薬理試験 | 18 | | |

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の合成抗菌剤であり、ラセミ体「オフロキサシン」の一方の光学活性体 (*S*- (-)体)である。本邦では1993年に経口剤が、2000年に点眼剤が上市され、広く臨床で使用されている。

レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」は、レボフロキサシン水和物を主成分とする点眼剤の後発医薬品としてダイト株式会社が開発を企画し、薬食発第0331015号(2005年3月31日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2011年7月に承認を取得、2011年11月に発売に至った。

また、「後発医薬品の必要な規格を揃えること等について(平成18年3月10日付医政発第0310001号)」に基づき、レボフロキサシン水和物 15mg/mLを含有する製剤(レボフロキサシン点眼液 1.5%「科研」)の承認申請を行い、2013年2月に承認を取得、2013年6月に上市した。

なお、主成分であるレボフロキサシン水和物は第十五改正日本薬局方第二追補に、レボフロキサシン点眼液は第十六改正日本薬局方第一追補に記載された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

該当しない

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% 「科研」、レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」

(2) 洋 名

LEVOFLOXACIN Ophth. Soln. 0.5% 「KAKEN」、
LEVOFLOXACIN Ophth. Soln. 1.5% 「KAKEN」

(3) 名称の由来

「有効成分名」 + 「剤形」 + 「規格」 + 「屋号」 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)

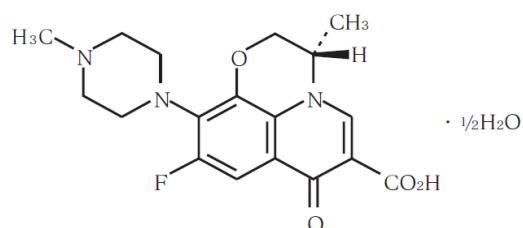
(2) 洋 名 (命名法)

Levofloxacin Hydrate (JAN)
levofloxacin (INN) (無水物として命名)

(3) ステム

-oxacin (ナリジクス酸系の抗菌薬)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₁₈H₂₀FN₃O₄ · 1/2 H₂O

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 (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 [Levofloxacin]

138199-71-0 [Levofloxacin hemihydrate]

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

淡黄白色～黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

| 溶 媒 | 1g を溶かすのに要する溶媒量 | 日本薬局方の 溶解度表記 |
|--------------|--------------------|-----------------|
| 酢酸 (100) | 1mL 以上 10mL 未満 | 溶けやすい |
| 水、メタノール | 30mL 以上 100mL 未満 | やや溶けにくい |
| エタノール (99.5) | 100mL 以上 1000mL 未満 | 溶けにくい |

0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 226℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ ：-92～-99°（脱水物に換算したもの 0.1g、メタノール、10mL、100mm）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に暗淡黄白色になる。

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「レボフロキサシン水和物」の確認試験法による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「レボフロキサシン水和物」の定量法による。

・電位差滴定法

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%「科研」 | レボフロキサシン点眼液 1.5%「科研」 |
|-------|-----------------------------------|------------------------------------|
| 剤形の区別 | 水性点眼剤 | |
| 規格 | 1mL 中に日本薬局方レボフロキサシン水和物 5mg を含有する。 | 1mL 中に日本薬局方レボフロキサシン水和物 15mg を含有する。 |
| 性状 | 微黄色～黄色澄明 | 微黄色～黄色澄明 |
| 浸透圧比 | 1.0～1.1 | 1.0～1.1 |
| pH | 6.2～6.8 | 6.1～6.9 |
| 添加物 | 塩化ナトリウム、pH 調節剤 | 塩化ナトリウム、pH 調節剤 |

(3) 製剤の物性

「(2) 剤形の区別、規格及び性状」の項参照

(4) 識別コード

該当しない

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

「(2) 剤形の区別、規格及び性状」の項参照

(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 - (2) 剤形の区別、規格及び性状」の項参照

(2) 添加物

「1 - (2) 剤形の区別、規格及び性状」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

[レボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」]

○長期保存試験

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、レボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」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¹⁾。

| 保存条件 | 包装形態 | 保存期間 | 結果 |
|------------------|----------|------|-----------------|
| 25±2℃ 60±5%RH | ポリエチレン容器 | 3年 | 適合 [※] |

※性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌試験、定量

○加速試験（参考）

| 保存条件 | 包装形態 | 保存期間 | 結果 |
|------------------|----------|------|-----------------|
| 40±1℃ 75±5%RH | ポリエチレン容器 | 6ヵ月 | 適合 [※] |

※性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌試験、定量

[レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」]

○長期保存試験

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」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⁾。

| 保存条件 | 包装形態 | 保存期間 | 結果 |
|------------------|----------|------|-----------------|
| 25±2℃ 60±5%RH | ポリエチレン容器 | 3年 | 適合 [※] |

※性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌試験、定量

○加速試験（参考）

| 保存条件 | 包装形態 | 保存期間 | 結果 |
|------------------|----------|------|-----------------|
| 40±1℃ 75±5%RH | ポリエチレン容器 | 6ヵ月 | 適合 [※] |

※性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌試験、定量

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方「レボフロキサシン水和物」の確認試験法による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 液体クロマトグラフィー

11. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方「レボフロキサシン水和物」の定量法による。

- ・液体クロマトグラフィー

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

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、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

該当資料なし

(6) 治療的使用

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

ニューキノロン系抗菌薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

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、作用機序は、細菌の DNA ジャイレース (DNA 複製時にらせん状の DNA 鎖を一度切断し、その後再結合する酵素) の活性阻害による DNA の複製阻害であり、殺菌的に作用する³⁾。

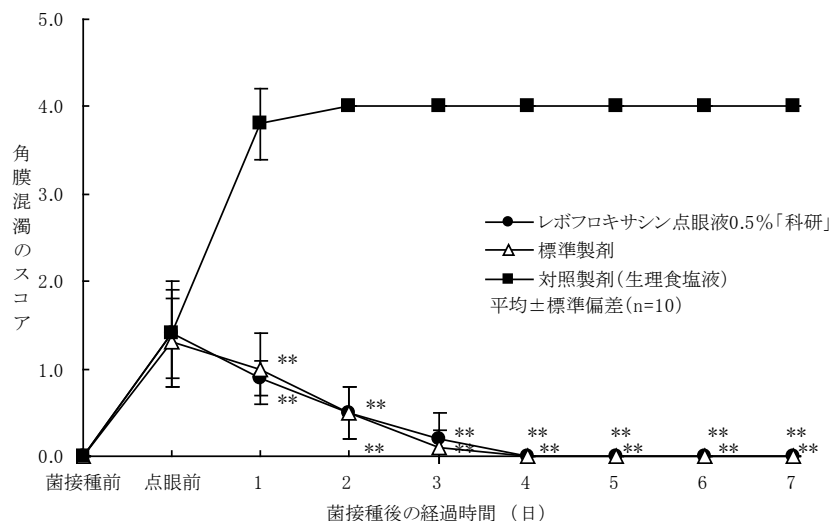
(2) 薬効を裏付ける試験成績

薬力学的試験

実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果

[レボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」]

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」と標準製剤について、右眼に緑膿菌を接種したウサギに対し、菌接種 6 時間後から、1 回 50 μ L (レボフロキサシン水和物として 0.25mg)、1 日 6 回、3 日間点眼し、感染症による角膜混濁のスコア判定を行ったところ、プラセボ (生理食塩液) と比較して両剤とも同様の有意な治療効果が認められた。また、統計解析を行った結果、両剤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⁴⁾。

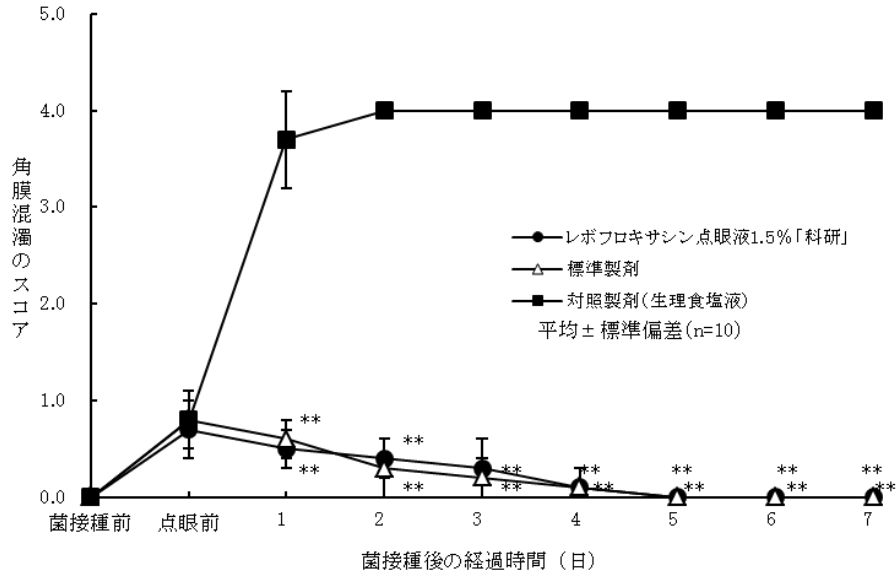


**P<0.01、対照群との間に Mann-Whitney の U 検定で有意差あり
試験製剤群と標準製剤群の間に Mann-Whitney の U 検定で有意差なし

実験的緑膿菌角膜感染症に対するレボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」 の治療効果 (角膜混濁のスコア推移)

[レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」]

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」と標準製剤について、右眼に緑膿菌を接種したウサギに対し、1 回 50 μ L (レボフロキサシン水和物として 0.75mg) を菌接種 6 時間後及び 10 時間後、翌日以降は 1 日あたり 4 時間ごと計 3 回の点眼を 2 日間実施し、感染症による角膜混濁のスコア判定を行ったところ、プラセボ (生理食塩液) と比較して両剤とも同様の有意な治療効果が認められた。また、統計解析を行った結果、両剤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⁵⁾。



**P<0.01、対照群との間に Mann-Whitney の U 検定で有意差あり
 試験製剤群と標準製剤群の間に Mann-Whitney の U 検定で有意差なし

実験的緑膿菌角膜感染症に対するレボフロキサシン点眼液 1.5%「科研」の治療効果
 (角膜混濁のスコア推移)

(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

該当しない

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

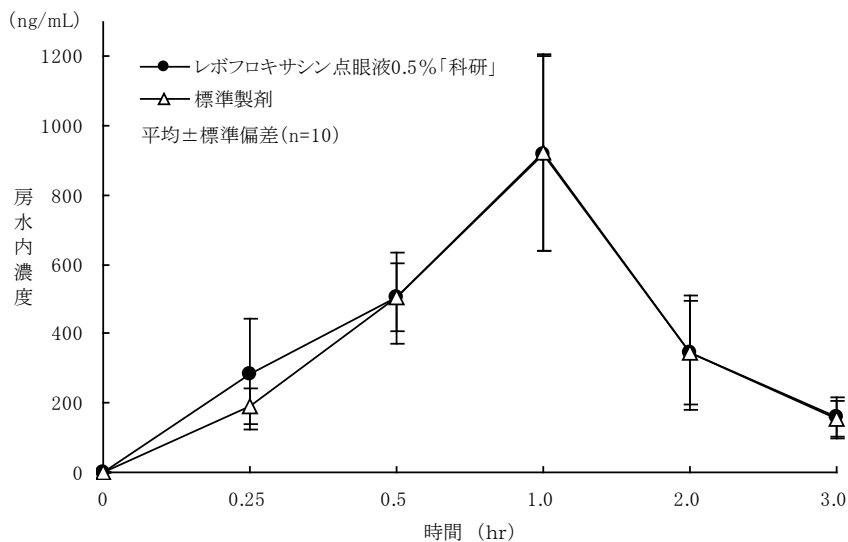
該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

眼組織内薬物移行動態（ウサギ）

[レボフロキサシン点眼液0.5%「科研」]

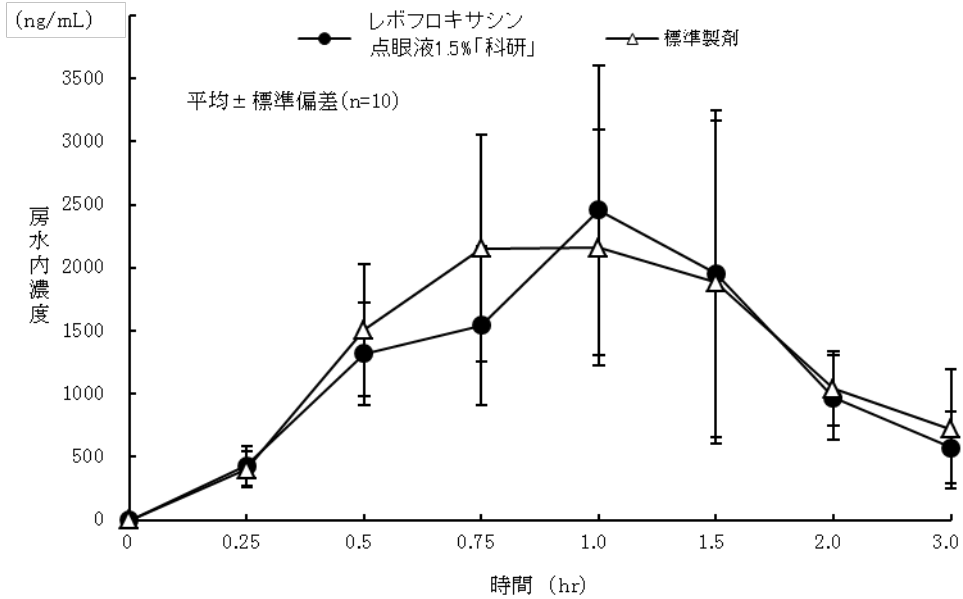
レボフロキサシン点眼液0.5%「科研」と標準製剤について、ウサギの左眼にはレボフロキサシン点眼液0.5%「科研」を、右眼には標準製剤をそれぞれ50 μ L（レボフロキサシン水和物として0.25mg）点眼し、房水中のレボフロキサシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された⁴⁾。



平均眼房水内レボフロキサシン水和物濃度推移

[レボフロキサシン点眼液 1.5%「科研」]

レボフロキサシン点眼液1.5%「科研」と標準製剤について、ウサギの左眼にはレボフロキサシン点眼液1.5%「科研」を、右眼には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）点眼し、房水中の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、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⁵⁾。



平均眼房水内レボフロキサシン水和物濃度推移

5. 代 謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排 泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分、オフロキサシン及びキノロン系抗菌剤に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「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

（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

| その他の副作用 | |
|-----------------------------------|--|
| [レボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」] | |
| 副作用が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。 | |
| 頻度 | 頻度不明 |
| 分類 | |
| 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% 「科研」] | |
| 副作用が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。 | |
| 頻度 | 頻度不明 |
| 分類 | |
| 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

該当しない

(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

「2. 禁忌内容とその理由」、「(2) 重大な副作用と初期症状」及び「(3) その他の副作用」の項参照

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、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

小児等への投与

[レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」]

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

該当しない

14. 適用上の注意

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

特になし

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：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

気密容器、遮光、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）

使用の際の注意：「Ⅷ－14. 適用上の注意」の項参照

取扱い上の注意：「3. 貯法・保存条件」の項参照

くすりのしおり：あり

患者向医薬品ガイド：なし

（3）調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

[レボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」]

5mL×10本、5mL×50本

[レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」]

5mL×10本

7. 容器の材質

瓶、中栓…ポリエチレン

キャップ…ポリプロピレン

ラベル…ポリエチレンテレフタレート

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：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 等

X. 管理的事項に関する項目

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 等

9. 国際誕生年月日

1993年10月1日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

| 製品名 | 製造販売承認年月日 | 承認番号 |
|-------------------------|------------|------------------|
| レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」 | 2011年7月15日 | 22300AMX00649000 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5%「科研」 | 2013年2月15日 | 22500AMX00149000 |

11. 薬価基準収載年月日

レボフロキサシン点眼液 0.5%「科研」 : 2011年11月28日

レボフロキサシン点眼液 1.5%「科研」 : 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

該当しない

16. 各種コード

| 製品名 | 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%「科研」 | 121229701 | 1319742Q1136 | 622122901 |
| レボフロキサシン点眼液 1.5%「科研」 | 122604101 | 1319742Q2094 | 622260401 |

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) ダイト株式会社 社内資料（安定性試験）（0.5%製剤）
- 2) ダイト株式会社 社内資料（安定性試験）（1.5%製剤）
- 3) 第十八改正日本薬局方解説書（廣川書店）
- 4) ダイト株式会社 社内資料（生物学的同等性試験）（0.5%製剤）
- 5) ダイト株式会社 社内資料（生物学的同等性試験）（1.5%製剤）

2. その他の参考文献

特になし

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

該当しない

XIII. 備考

1. その他の関連資料

(1) GS1 コード

| 製品名 | 包装 | GS1 コード | |
|--------------------------|--------|---------------------|---------------------|
| | | 販売包装単位 | 調剤包装単位 |
| レボフロキサシン点眼液 0.5% 「科研」 | 5mL×10 | (01)14987042 391019 | (01)04987042 391517 |
| | 5mL×50 | (01)14987042 391040 | |
| レボフロキサシン点眼液 1.5% 「科研」 | 5mL×10 | (01)14987042 391163 | (01)04987042 391616 |

