

## 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%「FFP」

## Levofloxacin Ophthalmic Solution 0.5%「FFP」

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	1mL中に日局レボフロキサシン水和物5.0mg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	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
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：共創未来ファーマ株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室 TEL 050-3383-3846 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html">http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html</a>

本IFは2019年2月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

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/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

# I F 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、I F と略す）の位置付け並びに I F 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 I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな I F 記載要領が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F 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-I F）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-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F は、（独）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-I F 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-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F 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、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. I F とは

I F 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 I F の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提出された I F 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。

### [I F の様式]

- ①規格は A 4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② I F 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「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 項にまとめる。

#### [ I F の作成 ]

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内服剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F 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、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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（P D F）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [ I F の発行 ]

- ① 「I F 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、「I F 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 I F が改訂される。

### 3. I F の利用にあたって

「I F 記載要領 2013」においては、P D F 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。

電子媒体での I F については、医薬品医療機器総合機構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、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、I F 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、I F 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、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構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

I F 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。I F 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、I F 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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1
1. 開発の経緯 .....	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	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） .....	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3
7. CAS登録番号 .....	3
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	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
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	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 .....	5
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	5
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 .....	6
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	6
8. 溶出性 .....	6
9. 生物学的試験法 .....	6
10. 製剤中の有効成分の確認試験 .....	6
11. 製剤中の有効成分の定量法 .....	6
12. 力価 .....	7
13. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....	7
15. 刺激性 .....	7
16. その他 .....	7
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	8
1. 効能又は効果 .....	8
2. 用法及び用量 .....	8
3. 臨床成績 .....	8
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	10
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 .....	10
2. 薬理作用 .....	10
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	12
1. 血中濃度の推移、測定法 .....	12
2. 薬物速度論的パラメータ .....	12
3. 吸収 .....	12
4. 分布 .....	13
5. 代謝 .....	14
6. 排泄 .....	14

7. トランスポーターに関する情報	14
8. 透析等による除去率	15
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	<b>16</b>
1. 警告内容とその理由	16
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	16
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
5. 慎重投与内容とその理由	16
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
7. 相互作用	16
8. 副作用	16
9. 高齢者への投与	17
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18
11. 小児等への投与	18
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
13. 過量投与	18
14. 適用上の注意	18
15. その他の注意	18
16. その他	18
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>19</b>
1. 薬理試験	19
2. 毒性試験	19
<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	<b>20</b>
1. 規制区分	20
2. 有効期間又は使用期限	20
3. 貯法・保存条件	20
4. 薬剤取扱い上の注意点	20
5. 承認条件等	20
6. 包装	20
7. 容器の材質	20
8. 同一成分・同効薬	20
9. 国際誕生年月日	21
10. 製造・販売承認年月日及び承認番号	21
11. 薬価基準収載年月日	21
12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	21
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
14. 再審査期間	21
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	21
16. 各種コード	21
17. 保険給付上の注意	21
<b>X I. 文献</b>	<b>22</b>
1. 引用文献	22
2. その他の参考文献	22
<b>X II. 参考資料</b>	<b>23</b>
1. 主な外国での発売状況	23
2. 海外における臨床支援情報	23
<b>X III. 備考</b>	<b>24</b>
その他の関連資料	24

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

レボフロキサシンはラセミ体であるオフロキサシンから抗菌活性本体(S体)を単離したもので、レボフロキサシン点眼液は、グラム陰性菌である緑膿菌、グラム陽性菌である肺炎球菌やブドウ球菌などに対して抗菌力を示す広範囲抗菌点眼剤である。本邦では広範囲抗菌点眼剤として2000年に上市された。

レボフロキサシン点眼液 0.5%「FFP」は興和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月に承認を得て、2011年11月に上市した。2012年10月に富士フイルムファーマ株式会社が製造販売を承継した。2019年2月より共創未来ファーマ株式会社が製造販売承認を承継し、製造・販売を行っている。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 標準製剤と同等の良好な眼内組織移行を示す(ウサギ)。 (13頁参照)
- 2) ウサギを用いた薬力学的検証において、標準製剤と同等であることが確認された。 (10頁参照)
- 3) ウサギを用いた眼刺激性試験において、眼刺激度の評価区分では無刺激物に分類された。 (18頁参照)
- 4) レボフロキサシン点眼液の重大な副作用としてショック、アナフィラキシー(頻度不明)が報告されている。

※禁忌を含む使用上の注意の詳細は「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目」を参照すること。

## 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% 「FFP」

#### (2) 洋名

Levofloxacin Ophthalmic Solution 0.5% 「FFP」

#### (3) 名称の由来

有効成分の慣用名（レボフロキサシン）＋剤形（点眼液）＋濃度（0.5%）＋屋号（FFP）

### 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）

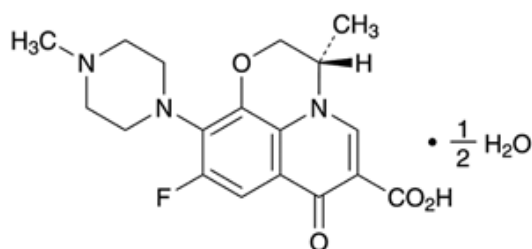
Levofloxacin（INN）

#### (3) ステム

抗菌剤、ナリジクス酸誘導体：-oxacin

### 3. 構造式又は示性式

構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub> · 1/2H<sub>2</sub>O

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)

## II. 名称に関する項目

---

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：LVFX（日本化学療法学会、抗微生物薬略号）

### 7. CAS 登録番号

100986-85-4（無水物）

138199-71-0（1/2 水和物）



### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

淡黄白色～黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。  
光によって徐々に暗淡黄白色になる。

##### (2) 溶解性

酢酸(100)に溶けやすく、水又はメタノールにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくい。  
0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

##### (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

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

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「レボフロキサシン水和物」による

#### 4. 有効成分の定量法

日局「レボフロキサシン水和物」による

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 投与経路

点眼

#### (2) 剤形の区別、規格及び性状

区別：点眼剤

規格：1mL 中に日局レボフロキサシン水和物 5.0mg を含有

性状：微黄色～黄色澄明の無菌水性点眼剤

#### (3) 製剤の物性

該当資料なし

#### (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

pH : 6.2 ~ 6.8

浸透圧比 : 1.0 ~ 1.1

#### (6) 無菌の有無

本剤は無菌製剤である。

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1mL 中に日局レボフロキサシン水和物 5.0mg 含有

#### (2) 添加物

塩化ナトリウム、pH 調節剤（希塩酸、水酸化ナトリウム）

#### (3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

### 4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

##### 5. 製剤の各種条件下における安定性

###### <加速試験><sup>1)</sup>

本品3ロットの検体を用い、下表の試験項目について加速試験（40℃/75%RH、6ヵ月間）を実施した。その結果、すべての項目において規格を満たし、レボフロキサシン点眼液 0.5%「FFP」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。

試験項目 \ 保存期間	開始時	6ヵ月
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
浸透圧比	1.03~1.05	1.04~1.06
pH	6.53~6.55	6.54~6.56
不溶性異物	適合	適合
不溶性微粒子	適合	適合
無菌	適合	適合
含量 (%)	99.7~101.3	101.1~102.1

保存形態：ポリプロピレン製容器＋紙箱

※「使用期限」、「貯法・保存条件」については「X. 管理的事項に関する項目」を参照すること。

##### 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

- 1) 呈色反応
- 2) 紫外吸光スペクトル
- 3) 液体クロマトグラフィー

##### 11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

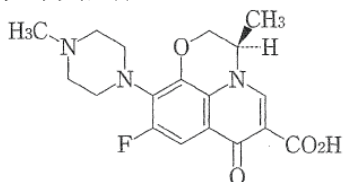
12. 力価

該当しない

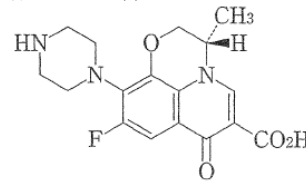
13. 混入する可能性のある夾雑物

本品に混入する可能性のある類縁物質として以下の I～Vがある。

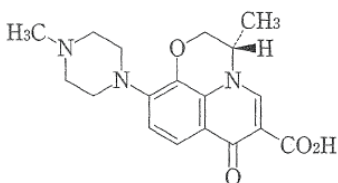
類縁物質 I：光学異性体



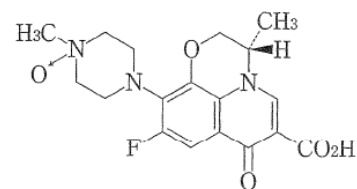
類縁物質 II：脱メチル体



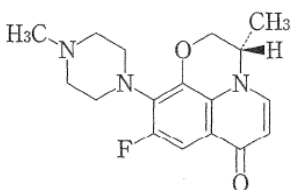
類縁物質 III：脱フッ素体



類縁物質 IV：N-オキシド体



類縁物質 V：脱炭酸体



14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

15. 刺激性

ウサギを用いた眼刺激性試験において、「無刺激物」の評価であった。（「IX. 非臨床試験に関する項目 2. 毒性試験」参照）

16. その他

1 滴量：約 47  $\mu$ L

## 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：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

細菌の DNA ジャイレースの活性阻害による 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

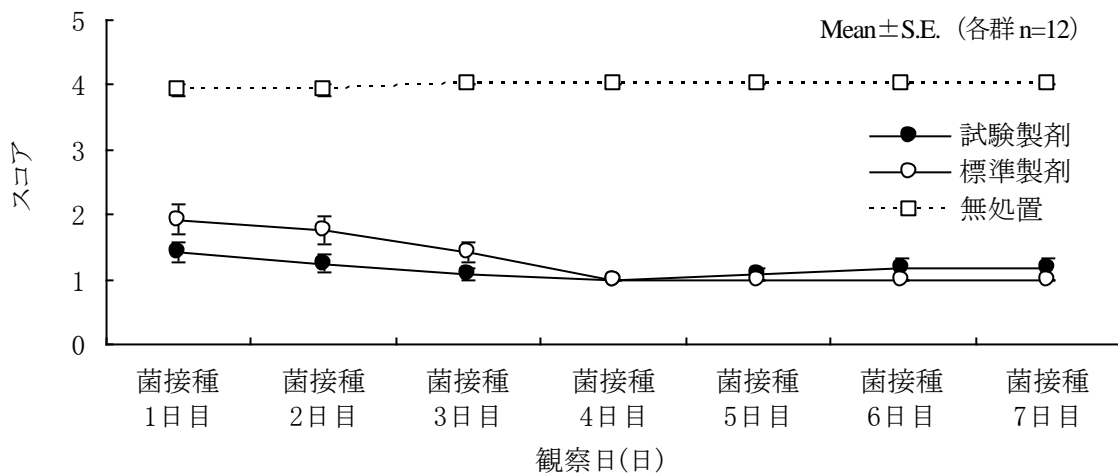
<生物学的同等性試験>

実験的ウサギ緑膿菌角膜感染モデルに対する治癒効果<sup>2)</sup>

ウサギを全身麻酔し右眼球圧迫脱臼後、トレパンで角膜中央に浅い傷を作製し、その中に「#」字型の創を注射針を用いて作製し、緑膿菌液( $1 \times 10^6$  cfu/mL)  $50 \mu\text{L}$  を 2 回点眼した。菌液接種日は菌液接種後 4 時間から 4 時間毎に 2 回、翌日からは 4 時間毎に 3 回レボフロキサシン点眼液 0.5% 「FFP」(試験製剤) または標準製剤を 3 日間点眼し、角膜感染部位の角膜所見及び眼組織全体について評価した。

秦野、中村らの評価基準に従った角膜所見の評価(図 1) 及び Draize 法に従った眼組織全体の評価(図 2) において、感染部位の角膜所見および眼組織所見は、無処置群と比較して標準製剤点眼群および試験製剤点眼群で症状の改善が認められた。統計学的解析において秦野・中村等の評価法による角膜所見は、菌液接種 1 日目(被験物質点眼 1 日目)より菌液接種 7 日目(観察終了日)で試験製剤点眼群および標準製剤点眼群に有意な治療効果が認められ、Draize 等の評価法による眼組織所見においても、同様に試験製剤点眼群および標準製剤点眼群に有意な治療効果がみられた。いずれの評価方法でも両製剤間に有意な差は認められず、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であることが確認された。

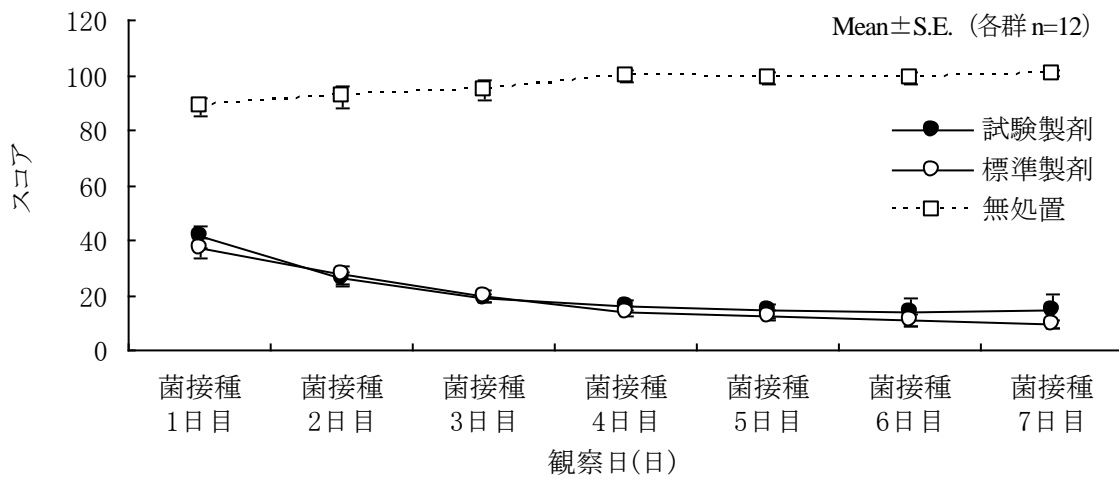
図 1. 角膜所見評価スコア(秦野、中村らの評価基準による評価)



各観察日における比較 [Tukey Type Test (Non parametric Joint Type)]

無処置 vs 標準製剤:  $p < 0.01$ , 無処置 vs 試験製剤:  $p < 0.01$ , 標準製剤 vs 試験製剤: n.s.

図2. 眼組織所見評価スコア(Draize 法による評価)



各観察日における比較 [Tukey Type Test (Non parametric Joint Type)]

無処置 vs 標準製剤 :  $p < 0.01$ , 無処置 vs 試験製剤 :  $p < 0.01$ , 標準製剤 vs 試験製剤 : n.s.

(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

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>

ウサギ眼組織内濃度測定試験<sup>3)</sup>

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「FFP」(試験製剤) または標準製剤それぞれ 50 $\mu$ L をウサギの右眼または左眼の眼瞼結膜嚢に単回点眼した後、前眼房水および角膜を採取して、前眼房水および角膜の 5% ホモジネート中のレボフロキサシン濃度を定量した。組織サンプルは、試験製剤、標準製剤ともに点眼 0.25、0.5、1、2、3、8 時間後の各測定時点において 10 眼採取した。試験製剤および標準製剤をウサギに単回点眼した後の前眼房水および角膜中レボフロキサシン濃度推移をそれぞれ図 1 および 2 に示した。統計解析の結果、試験製剤と標準製剤の間でレボフロキサシン濃度に有意差は認められず、試験製剤および標準製剤の生物学的同等性が確認された。

図 1. 前眼房水中レボフロキサシン濃度推移

各測定時点における比較 [t 検定] 標準製剤 vs 試験製剤 : n.s.

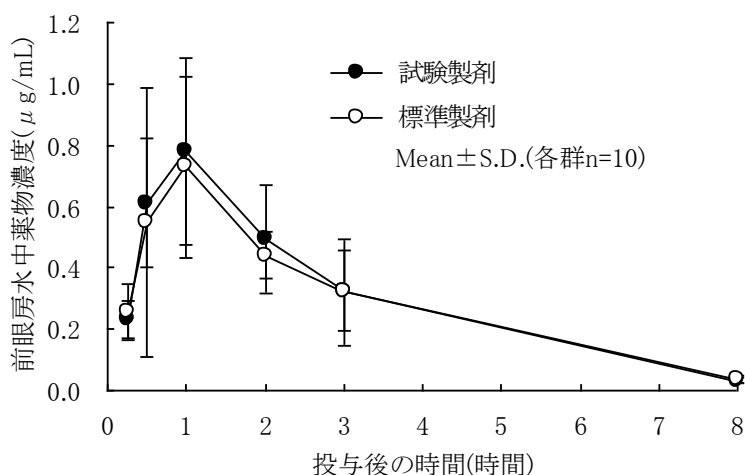
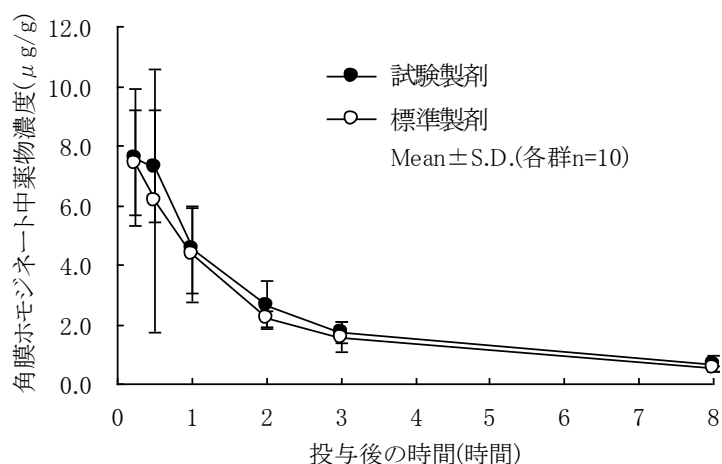


図2. 角膜中レボフロキサシン濃度推移

各測定時点における比較 [t 検定] 標準製剤 vs 試験製剤 : n.s.



## 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」を参照

### 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**

ショック、アナフィラキシー（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

以下の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

(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）**

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

**重大な副作用**

ショック、アナフィラキシー（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。

**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、そう痒感、発疹（頻度不明）

9. 高齢者への投与

該当資料なし

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

11. 小児等への投与

該当資料なし

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

(1) 投与経路：点眼用에만使用すること。  
(2) 点眼時：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。

15. その他の注意

該当資料なし

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」を参照）

(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

眼粘膜刺激性試験<sup>4)</sup>

ウサギ（6羽）を用いて、生理食塩液を対照として頻回点眼試験（30分間隔で1日10回、1回50 $\mu$ L）を実施した結果、本剤は、眼刺激度の評価区分では無刺激物<sup>注)</sup>に分類された。

注) Draize法により算出した平均合計評点の最高値を、KayらおよびGuillotらの基準を参考に評価



## 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

### 3. 貯法・保存条件

遮光、気密容器、室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当しない

#### (2) 薬剤交付時の取り扱いについて（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－14」参照

#### (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

5mL×5本、5mL×10本

### 7. 容器の材質

容 器：ポリプロピレン

中 栓：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：クラビット点眼液 0.5%、クラビット点眼液 1.5%

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

X. 管理的事項に関する項目

---

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

承認年月日：2011年7月15日

承認番号：22300AMX00665000

11. 薬価基準収載年月日

2011年11月28日

12. 効能・効果追加、用法・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97号(平成20年3月19日付)で定められた「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。

販売名	HOT 番号(9桁)	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%「FFP」	121157302	1319742Q1055	622115701

16. 各種コード

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) 安定性試験（共創未来ファーマ株式会社 社内資料）
- 2) 実験的ウサギ緑膿菌角膜感染モデルに対する治癒効果（共創未来ファーマ株式会社 社内資料）
- 3) ウサギ眼組織内濃度測定試験（共創未来ファーマ株式会社 社内資料）
- 4) ウサギ眼粘膜刺激性試験（共創未来ファーマ株式会社 社内資料）

### **2. その他の参考文献**

- 第十六改正日本薬局方解説書（廣川書店）

## **X II. 参考資料**

1. 主な外国での発売状況  
該当しない

2. 海外における臨床支援情報  
該当資料なし

### **XⅢ. 備考**

その他の関連資料  
該当資料なし