

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2018（2019年更新版）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

処方箋医薬品

レボフロキサシン点眼液1.5%「日点」

Levofloxacin Ophthalmic Solution

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	1mL中 日局 レボフロキサシン水和物 15mg
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 ・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2014年2月14日 薬価基準収載年月日：2014年6月20日 販売開始年月日：2014年6月20日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ロートニッテン株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ロートニッテン株式会社 医薬情報問合せ窓口 TEL 0120(691)910 FAX 052(823)9115 医療関係者向けホームページ https://www.rohto-nitten.co.jp/

本IFは2023年11月改訂の添付文書の記載に基づき改訂しました。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯 1
2. 製品の治療学的特性 1
3. 製品の製剤学的特性 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 ... 1
5. 承認条件
及び流通・使用上の制限事項 1
6. RMPの概要 1

II. 名称に関する項目

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）又は本質 2
6. 慣用名、別名、略号、
記号番号 2

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 3
2. 有効成分の各種条件下
における安定性 3
3. 有効成分の確認試験法、定量法 3

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 4
2. 製剤の組成 4
3. 添付溶解液の組成及び容量 4
4. 力価 4
5. 混入する可能性のある
夾雑物 4
6. 製剤の各種条件下における
安定性 5
7. 調製法及び溶解後の安定性 5
8. 他剤との配合変化
（物理化学的変化） 5
9. 溶出性 5
10. 容器・包装 5
11. 別途提供される資材類 5
12. その他 5

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 6
2. 効能又は効果に関連する注意 6
3. 用法及び用量 6
4. 用法及び用量に関連する注意 6
5. 臨床成績 6

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 9
2. 薬理作用 9

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移 11
2. 薬物速度論的パラメータ 11
3. 母集団（ポピュレーション）解析 .. 11
4. 吸収 11
5. 分布 11
6. 代謝 12
7. 排泄 12
8. トランスポーターに関する
情報 12
9. 透析等による除去率 12
10. 特定の背景を有する患者 12
11. その他 13

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 14
2. 禁忌内容とその理由 14
3. 効能又は効果に関連する
注意とその理由 14
4. 用法及び用量に関連する
注意とその理由 14
5. 重要な基本的注意とその理由 14
6. 特定の背景を有する患者に関する
注意 14
7. 相互作用 15
8. 副作用 15
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 15
10. 過量投与 15
11. 適用上の注意 16
12. その他の注意 16

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 17
2. 毒性試験 17

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分 18
2. 有効期間 18
3. 包装状態での貯法 18
4. 取扱い上の注意 18
5. 患者向け資材 18
6. 同一成分・同効薬 18
7. 国際誕生年月日 18
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 18
9. 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 18

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 19
11. 再審査期間 19
12. 投薬期間制限に関する情報 19
13. 各種コード 19
14. 保険給付上の注意 19

X I. 文献

1. 引用文献 20
2. その他の参考文献 20

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 21
2. 海外における臨床支援情報 21

X III. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して 臨床判断を行うにあたっての参考情報 22
2. その他の関連資料 22

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合成抗菌薬であり、ラセミ体であるオフロキサシンの抗菌活性本体（S (-)-体）のみからなる。本邦ではレボフロキサシン点眼液の0.5%製剤が2000年に上市され、その後、PK/PD理論に基づく1.5%製剤が2011年6月に上市された。

レボフロキサシン点眼液1.5%「日点」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。規格及び試験方法を設定し、生物学的同等性試験（薬力学的試験）、加速試験を行い、後発医薬品として2014年2月に承認を取得、2014年6月に販売開始した。

2. 製品の治療学的特性

(1) 有効性

ニューキノロン系合成抗菌薬であり、グラム陽性菌やグラム陰性菌に対して、広い抗菌スペクトルを示す。

(2) 安全性

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、アナフィラキシーが報告されている。

3. 製品の製剤学的特性

なし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

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 1.5% 「日点」

(2) 洋名

Levofloxacin Ophthalmic Solution

(3) 名称の由来

特になし

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)

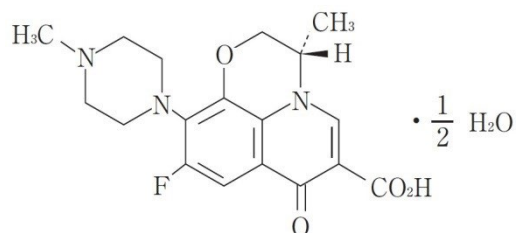
Levofloxacin Hydrate (JAN)

(3) ステム

抗菌薬、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： $C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot 1/2H_2O$

分子量：370.38

5. 化学名 (命名法) 又は本質

(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

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状¹⁾

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¹⁾

溶 媒	日本薬局方の表現
酢酸 (100)	溶けやすい
水	やや溶けにくい
メタノール	やや溶けにくい
エタノール (99.5)	溶けにくい
0.1mol/L 塩酸試液	溶ける

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点¹⁾

融点：約 226°C (分解)

(5) 酸塩基解離定数²⁾

pKa₁：6.11 (カルボキシル基)

pKa₂：8.18 (ピペラジンの 4 位の窒素)

(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¹⁾。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

(1) 確認試験法

日局「レボフロキサシン水和物」による

(2) 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) 剤形の区別 水性点眼剤 (2) 製剤の外観及び性状 微黄色～黄色澄明、無菌水性点眼剤 (3) 識別コード 該当しない (4) 製剤の物性 pH : 6.1 ~ 6.9 浸透圧比 : 1.0 ~ 1.1 (5) その他 無菌製剤である。
2. 製剤の組成	(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤 有効成分の含量 : 1mL 中 レボフロキサシン水和物を 15mg 含有 添加剤 : グリセリン、ホウ酸、pH 調節剤 (2) 電解質等の濃度 該当しない (3) 熱量 該当しない
3. 添付溶解液の組成及び容量	該当しない
4. 力価	該当しない
5. 混入する可能性のある 夾雑物	該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における
安定性

加速試験³⁾

試験条件：5mL プラスチック製点眼容器(青色)、
最終包装形態（紙箱入り）、40℃、75%RH

3ロット、n=3で試験を実施

	開始時	2ヵ月後	4ヵ月後	6ヵ月後
性状 (微黄色～黄色 澄明の液)	淡黄色澄明 の液	淡黄色澄明 の液	淡黄色澄明 の液	淡黄色澄明 の液
pH (6.1～6.9)	6.5	6.5	6.5	6.5
浸透圧比 (1.0～1.1)	1.0～1.1	1.1	1.0～1.1	1.1
含量(%) [※]	100.3～100.7	100.9～101.8	100.8～101.5	101.3～101.7

※表示量に対する割合

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化
(物理化学的変化)

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に
関する情報

該当しない

(2) 包装

プラスチック点眼容器 5mL×10本

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

	容器	中栓	キャップ
プラスチック容器	ポリエチレン	ポリエチレン	ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

投薬袋

12. その他

該当しない

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、
ミクロコッカス属、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、涙囊炎、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. 効能又は効果に関連する 注意

5. 効能又は効果に関連する注意

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. 用法及び用量

（1）用法及び用量の解説

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。

（2）用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する 注意

設定されていない

5. 臨床成績

（1）臨床データパッケージ

該当しない

（2）臨床薬理試験

該当資料なし

（3）用量反応探索試験

該当資料なし

（4）検証的試験

1) 有効性検証試験

〈結膜炎、角膜炎〉

〔国内第Ⅲ相試験〕⁴⁾

細菌性結膜炎及び細菌性角膜炎患者 238 例（有効性解析対象 176

例) を対象に、1.5%レボフロキサシン点眼液を1回1滴、1日3回(細菌性角膜炎患者は症状に応じて1日3~8回の間で適宜増減)、14日間点眼した結果、有効率※は100%であった。また、疾患別臨床効果は表1、有効菌種別臨床効果は表2のとおりであった。

副作用は238例中7例(2.9%)に認められ、主な副作用は眼刺激3件(1.3%)であった。

※日本眼感染症学会制定の評価判定基準および抗菌点眼薬臨床評価のガイドライン(案)等に準じて評価。

表1. 疾患別臨床効果

疾患名	有効率※ (%) [有効以上]	
	1.5%レボフロキサシン点眼液	参考: 0.5%レボフロキサシン点眼液 ⁵⁾
眼瞼炎	—	93.3 (14/15)
涙嚢炎	—	87.5 (28/32)
麦粒腫	—	92.5 (37/40)
結膜炎	100.0 (170/170)	91.6 (196/214)
瞼板腺炎	—	95.2 (20/21)
角膜炎(角膜潰瘍を含む)	100.0 (6/6)	94.3 (33/35)

※複数の疾患を合併している場合は各々の疾患に1例として算入

表2. 有効菌種別臨床効果

菌種	有効率※ (%) [有効以上]	
	1.5%レボフロキサシン点眼液	参考: 0.5%レボフロキサシン点眼液 ⁵⁾
ブドウ球菌属	100.0 (98/98)	91.8 (157/171)
レンサ球菌属	100.0 (10/10)	95.8 (23/24)
肺炎球菌	100.0 (25/25)	94.7 (18/19)
腸球菌属	100.0 (4/4)	87.5 (7/8)
ミクロコッカス属	—	100.0 (2/2)
モラクセラ属	—	85.7 (12/14)
コリネバクテリウム属	100.0 (79/79)	86.2 (25/29)
クレブシエラ属	100.0 (2/2)	85.7 (6/7)
エンテロバクター属	100.0 (2/2)	100.0 (4/4)
セラチア属	100.0 (2/2)	100.0 (3/3)
プロテウス属	100.0 (2/2)	75.0 (3/4)
モルガネラ・モルガニー	—	100.0 (2/2) ⁶⁾
インフルエンザ菌	100.0 (17/17)	100.0 (10/10)
シュードモナス属	—	100.0 (7/7)
緑膿菌	—	100.0 (5/5)
ステノトロホモナス(ザントモナス)・マルトフィリア	—	75.0 (3/4) ^{6,7)}
アシネトバクター属	100.0 (1/1)	94.1 (16/17)
アクネ菌	100.0 (13/13)	93.0 (40/43)

※複数の菌種が検出された場合は各々の菌種に1例として算入

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

〈眼科周術期の無菌化療法〉

〔国内一般臨床試験〕⁸⁾

眼手術予定患者を対象に、0.5%レボフロキサシン点眼液を1回1滴、1日5回^{注)}、手術前2日間点眼した結果、無菌化率は70.0% (35/50例)であった。

副作用は認められなかった。

注) 本剤が承認されている用法・用量は、1回1滴、1日3回点眼、症状により適宜増減である。

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査 (一般使用成績調査, 特定使用成績調査, 使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

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

キノロン系抗菌薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：眼組織

作用機序^{9~14)}：主な作用機序はDNAジャイレース（トポイソメラーゼⅡ）活性及びトポイソメラーゼⅣ活性の阻害による細菌のDNA合成阻害である。DNAジャイレース（トポイソメラーゼⅡ）活性とトポイソメラーゼⅣ活性のどちらを強く阻害するかは細菌によって異なる。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

[抗菌作用]

レボフロキサシン水和物の抗菌スペクトラムは広範囲に及び、ブドウ球菌属、肺炎球菌を含むレンサ球菌属、マイクロコッカス属、腸球菌属、コリネバクテリウム属等のグラム陽性菌及び緑膿菌を含むシュードモナス属、インフルエンザ菌、モラクセラ属、セラチア属、クレブシエラ属、プロテウス属、アシネトバクター属、エンテロバクター属等のグラム陰性菌並びに嫌気性菌であるアクネ菌等の眼感染症の起炎菌に対し、強い抗菌力を示す (*in vitro*)^{4,15)}。

レボフロキサシン水和物は、ラセミ体であるオフロキサシンの一方の光学活性体（左旋体）であり、オフロキサシンの約2倍の抗菌活性を有する¹⁵⁾。

[耐性菌に及ぼす用量の影響]^{16,17)}

*In vitro*眼組織中濃度シミュレーションモデルにおいて、1.5%レボフロキサシン点眼液1日3回点眼は0.5%レボフロキサシン点眼液1日3回点眼と比較して、メチシリン感受性黄色ブドウ球菌（HSA201-00027株、レボフロキサシンに対するMIC=0.5 µg/mL）及び緑膿菌（HSA201-00094株、レボフロキサシンに対するMIC=1 µg/mL）の耐性菌出現を抑制した。また、1.5%レボフロキサシン点眼液1日3回点眼及び0.5%レボフロキサシン点眼液1日3回点眼はいずれも、メチシリン感受性コアグラエゼ陰性ブドウ球菌（HSA201-00039株、レボフロキサシンに対するMIC=0.25 µg/mL）の耐性菌出現を抑制した。

[生物学的同等性試験]¹⁸⁾

白色家兎の角膜に創を作製し、菌液を接種した（菌接種0日目）。その後、菌接種1日目から家兎の両眼に各製剤（レボフロキサシン点眼液1.5%「日点」（以下、本剤）及びクラビット点眼液

1.5%)、対照 (生理食塩液) をそれぞれ 1 回 50 μ L、4 時間ごとに 1 日 3 回、3 日間点眼し、7 日間経過を観察した。

Draize 法及びあたらしい眼科 (1996 ; 13 (2) : 249-253) の評価基準に従いスコアをつけた。菌株は緑膿菌 (ATCC27853) を用いた。

Draize 法及びあたらしい眼科の評価基準に従った眼症状スコアをグラフに示した。

本剤及びクラビット点眼液 1.5% は対照に対して、いずれの評価基準においても菌接種後 2 日目から有意な眼症状スコアの減少を認めた。

また、菌接種後 2 日目以降のすべての観察時点において本剤とクラビット点眼液 1.5% の間に有意差は認められず、生物学的同等性が確認された (Bonferroni の多重比較)。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度¹⁹⁾

健康成人（8例）の両眼に1.5%レボフロキサシン点眼液を1日目に単回点眼し、2日目より反復（1回1滴、1日8回、7日間）点眼したとき、8日目（最終日）の最高血漿中濃度は24.1ng/mL、その到達時間は最終点眼後26分であった。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション） 解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 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

	<p>(4) 髄液への移行性 該当資料なし</p> <p>(5) その他の組織への移行性²⁰⁾ 白色ウサギの片眼に1.5%レボフロキサシン点眼液を50μL単回点眼したとき、角膜中濃度は投与後15分にC_{max} (32.5μg/g)を示した後、半減期86分で消失した。眼球結膜及び眼瞼結膜中濃度は投与後15分にC_{max} (共に14.7μg/g)を示した。房水中濃度は投与後30分にC_{max} (3.1μg/mL)を示した後、半減期71分で消失した。</p> <p>(6) 血漿蛋白結合率²⁾ 1~50μg/mLの<i>in vitro</i>でのヒト血漿蛋白結合率は約26~36%(限外ろ過法)、健康成人に500mgを単回点滴静注時、<i>ex vivo</i>での血漿蛋白結合率は、点滴開始1~12時間後で約29~33%(限外ろ過法)であった。</p>
6. 代謝	<p>(1) 代謝部位及び代謝経路 該当資料なし</p> <p>(2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率 該当資料なし</p> <p>(3) 初回通過効果の有無及びその割合 該当資料なし</p> <p>(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率 該当資料なし</p>
7. 排泄	該当資料なし
8. トランスポーターに関する情報	該当資料なし
9. 透析等による除去率	該当資料なし
10. 特定の背景を有する患者	該当資料なし

11. その他

〔生物学的同等性試験〕²¹⁾

白色家兎の両眼の結膜囊内にレボフロキサシン点眼液 1.5%「日点」又はクラビット点眼液1.5%をそれぞれ50 μ L単回点眼投与し、最高濃度到達時間 (Tmax) である 1 時間後における眼房水中レボフロキサシン濃度 (Cmax) を測定した。

両剤の Cmax 及び Tmax を表に示した。

両剤の 1 時間(Tmax)でのレボフロキサシン濃度(Cmax)に統計学的な有意差は認められなかった (F 検定、対応のない t 検定)。

生物学的同等性判定パラメータである両剤の Cmax の対数値の平均値の差は-0.044 であり、生物学的同等性の判定基準 $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ (-0.046 \sim 0.045)を満たしたことから、両剤の生物学的同等性が確認された。

製剤名	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)
レボフロキサシン点眼液 1.5%「日点」	3118.7 \pm 2061.3	1
クラビット点眼液 1.5%	3195.7 \pm 1480.2	1

(mean \pm S. D. n=30)

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）
2.1 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注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意
8.1 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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

- (1) 合併症・既往歴等のある患者
設定されていない
- (2) 腎機能障害患者
設定されていない
- (3) 肝機能障害患者
設定されていない
- (4) 生殖能を有する者
設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は8歳未満の小児に投与した臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者
設定されていない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由
設定されていない
(2) 併用注意とその理由
設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
眼	眼刺激	眼のそう痒感	びまん性表層角膜炎等の角膜障害、結膜炎、眼痛、角膜沈着物、眼瞼炎
皮膚		蕁麻疹	発疹、そう痒
その他		味覚異常（苦味）	

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・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こと。
- ・患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・遮光して保存すること。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」を参照すること
- (2) 安全性薬理試験
該当資料なし
- (3) 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) 遺伝毒性試験
該当資料なし
- (4) がん原性試験
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験
眼刺激性試験²²⁾
レボフロキサシン点眼液1.5%「日点」を白色家兎に1回50 μ L、1日6回1時間間隔、7日間反復投与した試験において、眼科的検査及び病理組織学的検査の結果、眼刺激性評価法に基づく評価では「刺激がない」と評価された。
- (7) 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	有効期間：3年
3. 包装状態での貯法	室温保存
4. 取扱い上の注意	20. 取扱い上の注意 外箱開封後は、遮光して保存すること。
5. 患者向け資材	患者向医薬品ガイド：無 くすりのしおり：有 その他の患者向け資材：無
6. 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) レボフロキサシン点眼液 0.5%「日点」(ロートニッテン) 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 (塩、水和物は省略)
7. 国際誕生年月日	1993年10月1日
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	製造販売承認年月日：2014年2月14日 承認番号：22600AMX00266000 薬価基準収載年月日：2014年6月20日 販 売 開 始 年 月：2014年6月20日
9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「日点」

厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT(9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
1319742Q2019	1319742Q2183	122655301	622265501

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十八改正日本薬局方解説書, 2021 (廣川書店)
- 2) 日本薬局方医薬品情報 (JPDI) 2021 (じほう)
- 3) ロートニッテン株式会社 社内資料 [安定性試験]
- 4) 大橋裕一 他: あたらしい眼科. 2012 ; 29 : 669-678
- 5) 有効性のまとめ (クラビット点眼液 0.5% : 2000 年 1 月 18 日承認、申請資料概要ト. 2. (1))
- 6) 臼井正彦: あたらしい眼科. 1997 ; 14 : 641-648
- 7) 臼井正彦: あたらしい眼科. 1997 ; 14 : 1113-1118
- 8) 臼井正彦: あたらしい眼科. 1997 ; 14 : 953-956
- 9) Kato J, et al. : Cell. 1990 ; 63 : 393-404
- 10) Hoshino K, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1994 ; 38 : 2623-2627
- 11) Akasaka T, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 2001 ; 45 : 2263-2268
- 12) Tanaka M, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1997 ; 41 : 2362-2366
- 13) Onodera Y, et al. : J Antimicrob Chemother. 1999 ; 44 : 533-536
- 14) Onodera Y, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 2002 ; 46 : 1800-1804
- 15) 外眼部感染症からの新鮮臨床分離株に対する抗菌力 (クラビット点眼液 0.5% : 2000 年 1 月 18 日承認、申請資料概要ホ. 1. (2))
- 16) *in vitro* 抗菌活性 (クラビット点眼液 1.5% : 2010 年 12 月 21 日承認、審査報告書)
- 17) 長野敬 他: あたらしい眼科. 2013 ; 30 : 1754-1760
- 18) ロートニッテン株式会社 社内資料 [生物学的同等性試験 II]
- 19) 臨床薬理試験の概略 (クラビット点眼液 1.5% : 2010 年 12 月 21 日承認、審査報告書)
- 20) 薬物動態試験成績の概要 (クラビット点眼液 1.5% : 2010 年 12 月 21 日承認、審査報告書)
- 21) ロートニッテン株式会社 社内資料 [生物学的同等性試験 I]
- 22) ロートニッテン株式会社 社内資料 [眼刺激性試験]

2. その他の参考文献

該当資料なし

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 該当しない

XIII. 備考

- | | |
|---|--|
| 1. 調剤・服薬支援に際して
臨床判断を行うに
あたっての参考情報 | (1) 粉碎
該当しない
(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性
該当しない |
| 2. その他の関連資料 | 該当資料なし |

N00448