2024年4月改訂（第13版）

日本標準商品分類番号
871319

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（一部2018に準拠）

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%「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	製造販売元：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販売元：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2023年11月改訂（第1版：レボフロキサシン点眼液0.5%「ＶＴＲＳ」）、2023年11月改訂（第1版：レボフロキサシン点眼液1.5%「ＶＴＲＳ」）の電子化された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があり、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. 効能又は効果に関連する注意 13
3. 用法及び用量 13
4. 用法及び用量に関連する注意 13
5. 臨床成績 14

VI. 薬効薬理に関する項目 19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 19
2. 薬理作用 19

VII. 薬物動態に関する項目 22
1. 血中濃度の推移・測定法 22
2. 薬物速度論的パラメータ 22
3. 吸収 23
4. 分布 23

5. 代謝 26
6. 排泄 27
7. 透析等による除去率 27

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 28
1. 警告内容とその理由 28
2. 禁忌内容とその理由 28
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 28
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 28
5. 重要な基本的注意とその理由 28
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 28
7. 相互作用 29
8. 副作用 30
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 30
10. 過量投与 30
11. 適用上の注意 31
12. その他の注意 31

IX. 非臨床試験に関する項目 32
1. 薬理試験 32
2. 毒性試験 32

X. 管理的事項に関する項目 33
1. 規制区分 33
2. 有効期間又は使用期限 33
3. 貯法・保存条件 33
4. 薬剤取扱い上の注意点 33
5. 承認条件等 33
6. 包装 33
7. 容器の材質 34
8. 同一成分・同効薬 34
9. 国際誕生年月日 34
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 34
11. 薬価基準収載年月日 34
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 34
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 34
14. 再審査期間 34
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 35
16. 各種コード 35
17. 保険給付上の注意 35

XI. 文献 36
1. 引用文献 36
2. その他の参考文献 37

XII. 参考資料 38
1. 主な外国での発売状況 38
2. 海外における臨床支援情報 38

XIII. 備考 39
その他の関連資料 39

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（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社）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%「ＶＴＲＳ」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%「ＶＴＲＳ」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. 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-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%「ＶＴＲＳ」
レボフロキサシン点眼液1.5%「ＶＴＲＳ」

(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「ＶＴＲＳ」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）

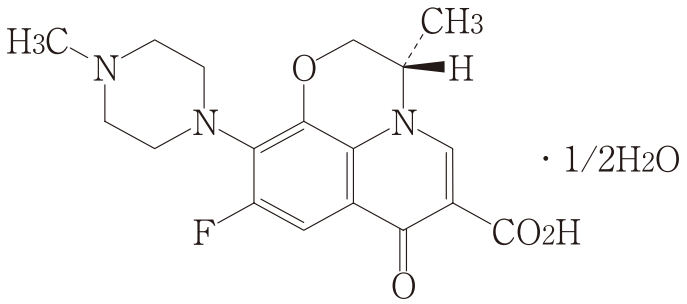
(2) 洋名（命名法）

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：$C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot 1/2H_2O$
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℃（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：［α］$^{20}_{D}$ -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

<table>
<tr><th colspan="2">包装形態</th><th colspan="2" rowspan="2">試験項目及び規格</th><th rowspan="2">試験開始時</th><th colspan="2">照射量</th><th rowspan="2">結果</th></tr>
<tr><th>ラベル</th><th>携帯袋</th><th>30万lx・hr</th><th>60万lx・hr</th></tr>
<tr><td rowspan="4">無</td><td rowspan="4">無</td><td colspan="2">性状（微黄色～黄色澄明の液である）</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>変化なし
規格に適合</td></tr>
<tr><td rowspan="2">純度試験</td><td>個々の類縁物質
（0.4%以下）</td><td>0.13</td><td>1.35</td><td>2.01</td><td rowspan="2">変化あり
規格に不適合</td></tr>
<tr><td>類縁物質の総量
（0.8%以下）</td><td>0.18</td><td>3.64</td><td>5.01</td></tr>
<tr><td colspan="2">含量（95.0～107.0%）</td><td>99.6</td><td>95.1
(95.5)</td><td>92.9
(93.3)</td><td>変化あり
規格に不適合</td></tr>
<tr><td rowspan="4">有</td><td rowspan="4">無</td><td colspan="2">性状（微黄色～黄色澄明の液である）</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>変化なし
規格に適合</td></tr>
<tr><td rowspan="2">純度試験</td><td>個々の類縁物質
（0.4%以下）</td><td>0.13</td><td>0.38</td><td>0.55</td><td rowspan="2">変化あり
規格に不適合</td></tr>
<tr><td>類縁物質の総量
（0.8%以下）</td><td>0.18</td><td>0.93</td><td>1.18</td></tr>
<tr><td colspan="2">含量（95.0～107.0%）</td><td>99.6</td><td>98.8
(99.2)</td><td>97.8
(98.2)</td><td>変化なし
規格に適合</td></tr>
<tr><td rowspan="4">有</td><td rowspan="4">有</td><td colspan="2">性状（微黄色～黄色澄明の液である）</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>微黄色
澄明の液</td><td>変化なし
規格に適合</td></tr>
<tr><td rowspan="2">純度試験</td><td>個々の類縁物質
（0.4%以下）</td><td>0.13</td><td>0.20</td><td>0.34</td><td rowspan="2">変化あり
規格に適合</td></tr>
<tr><td>類縁物質の総量
（0.8%以下）</td><td>0.18</td><td>0.57</td><td>0.79</td></tr>
<tr><td colspan="2">含量（95.0～107.0%）</td><td>99.6</td><td>99.7
(100.1)</td><td>98.3
(98.7)</td><td>変化なし
規格に適合</td></tr>
</table>

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
	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（300μm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ヵ月）の結果、レボフロキサシン点眼液1.5%「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。

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）

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

4. 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. 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

6. 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。

(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

該当資料なし

(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

レボフロキサシン点眼液0.5%「ＶＴＲＳ」

〈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）〉

①国内第Ⅱ相試験

外眼部細菌感染症患者252例（有効性解析対象181例）を対象に、レボフロキサシン点眼液0.3%[注1)]、0.5%又は0.3%オフロキサシン点眼液を1回1滴、1日3回、原則3日以上（症状消失後2日まで、通算14日間まで）点眼した結果、有効率※はレボフロキサシン点眼液0.3%群90.6%、（58/64例）、レボフロキサシン点眼液0.5%群92.2%（59/64例）、0.3%オフロキサシン点眼液群90.6%、（48/53例）であり、3群間に有意差は認められなかった。また、レボフロキサシン点眼液0.5%群の疾患別及び2例以上の株数の見られた菌種における有効菌種別臨床効果は表1及び表2のとおりであった。

レボフロキサシン点眼液0.5%群に副作用は認められなかった[13)]。

※日本眼感染症学会制定の評価判定基準（1985年改訂、1988、1993年一部追加）に準拠し評価。

注1）本剤が承認されている濃度は0.5%である。

表1．疾患別臨床効果

疾患名	有効率※（%）〔有効以上〕
眼瞼炎	100.0（3/3）
涙嚢炎	85.7（6/7）
麦粒腫	87.5（7/8）
結膜炎	90.2（37/41）
瞼板腺炎	100.0（4/4）
角膜炎（角膜潰瘍を含む）	100.0（3/3）

※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〕
ブドウ球菌属	93.3（28/30）
肺炎球菌	87.5（7/8）
腸球菌属	100.0（2/2）
コリネバクテリウム属	100.0（3/3）
アクネ菌	85.7（6/7）

※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国内第Ⅲ相試験

外眼部細菌感染症患者 366 例（有効性解析対象 287 例）を対象に、レボフロキサシン点眼液又は 0.3%オフロキサシン点眼液を 1 回 1 滴、1 日 3 回、原則 3 日以上（症状消失後 2 日まで、通算 14 日間まで）点眼した結果、レボフロキサシン点眼液群の有効率※は 97.2%（140/144 例）であり、0.3%オフロキサシン点眼液群の 88.1%、（126/143 例）と比較し、有意に優れた臨床効果が認められた。また、レボフロキサシン点眼液群の疾患別及び有効菌種別臨床効果は表 3 及び表 4 のとおりであった。

副作用はレボフロキサシン点眼液群 176 例中 5 例（2.8%）に認められ、主な副作用はしみる及びそう痒感 1.1%（2/176 例）であった[14]。

※日本眼感染症学会制定の評価判定基準（1985 年改訂、1988、1993 年一部追加）に準拠し評価。

表 3．疾患別臨床効果

疾患名	有効率※（%）〔有効以上〕
眼瞼炎	100.0（7/7）
涙嚢炎	100.0（12/12）
麦粒腫	95.8（23/24）
結膜炎	97.1（102/105）
瞼板腺炎	100.0（7/7）
角膜炎（角膜潰瘍を含む）	100.0（11/11）

※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 4．有効菌種別臨床効果

菌種	有効率※（%）〔有効以上〕
ブドウ球菌属	98.7（77/78）
レンサ球菌属	100.0（10/10）
肺炎球菌	100.0（9/9）
腸球菌属	100.0（3/3）
ミクロコッカス属	100.0（2/2）
モラクセラ属	87.5（7/8）
コリネバクテリウム属	85.7（12/14）
クレブシエラ属	100.0（5/5）
エンテロバクター属	100.0（4/4）
セラチア属	100.0（2/2）
プロテウス属	100.0（1/1）
モルガネラ・モルガニー	100.0（2/2）
インフルエンザ菌	100.0（7/7）
シュードモナス属	100.0（2/2）
緑膿菌	100.0（2/2）
ステノトロホモナス（ザントモナス）・マルトフィリア	100.0（1/1）
アシネトバクター属	100.0（7/7）
アクネ菌	92.9（13/14）

※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

③国内一般臨床試験

外眼部細菌感染症患者 152 例（有効性解析対象 115 例）を対象に、レボフロキサシン点眼液を 1 回 1 滴、1 日 3 回、原則 3 日以上（症状消失後 2 日まで、通算 14 日間まで）点眼した結果、有効率※は 84.3%（97/115 例）であった。また、疾患別及び有効菌種別臨床効果は表 5 及び表 6 のとおりであった。

副作用は 145 例中 3 例（2.1%）に認められ、主な副作用はしみる 1.4%（2/145 例）であった[15]。

※日本眼感染症学会制定の評価判定基準（1985 年改訂、1988、1993 年一部追加）に準拠し評価。

表 5. 疾患別臨床効果

疾患名	有効率※（%）〔有効以上〕
眼瞼炎	80.0（4/5）
涙嚢炎	76.9（10/13）
麦粒腫	87.5（7/8）
結膜炎	83.8（57/68）
瞼板腺炎	90.0（9/10）
角膜炎（角膜潰瘍を含む）	90.5（19/21）

※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 6. 有効菌種別臨床効果

菌種	有効率※（%）〔有効以上〕
ブドウ球菌属	83.1（49/59）
レンサ球菌属	88.9（8/9）
肺炎球菌	100.0（2/2）
腸球菌属	50.0（1/2）
モラクセラ属	100.0（4/4）
コリネバクテリウム属	83.3（10/12）
プロテウス属	50.0（1/2）
インフルエンザ菌	100.0（3/3）
シュードモナス属	66.7（2/3）
緑膿菌	100.0（2/2）
ステノトロホモナス（ザントモナス）・マルトフィリア	66.7（2/3）
アシネトバクター属	83.3（5/6）
アクネ菌	95.5（21/22）

※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

レボフロキサシン点眼液 1.5%「ＶＴＲＳ」

〈結膜炎、角膜炎〉

国内第Ⅲ相試験

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、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 7、有効菌種別臨床効果は表 8 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[16]。

※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 7．疾患別臨床効果

疾患名	有効率※（%）〔有効以上〕	
	レボフロキサシン点眼液（1.5%製剤）	（参考：0.5%製剤※）
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 8．有効菌種別臨床効果

菌種	有効率※（%）〔有効以上〕	
	レボフロキサシン点眼液（1.5%製剤）	（参考：0.5%製剤※）
ブドウ球菌属	100.0（98/98）	92.2（154/167）
レンサ球菌属	100.0（10/10）	94.7（18/19）
肺炎球菌	100.0（25/25）	94.7（18/19）
腸球菌属	100.0（4/4）	85.7（6/7）
ミクロコッカス属	－	100.0（2/2）
モラクセラ属	－	80.0（8/10）
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）	100.0（5/5）
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（2/2）
プロテウス属	100.0（2/2）	66.7（2/3）
モルガネラ・モルガニー	－	100.0（2/2）
インフルエンザ菌	100.0（17/17）	100.0（10/10）
シュードモナス属	－	80.0（4/5）
緑膿菌	－	100.0（4/4）
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）
アシネトバクター属	100.0（1/1）	92.3（12/13）
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

レボフロキサシン点眼液 0.5%・1.5%「ＶＴＲＳ」
〈眼科周術期の無菌化療法〉
国内一般臨床試験

眼手術予定患者を対象に、レボフロキサシン点眼液を1回1滴、1日5回[注2)]、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[17)]。

注2）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。

2）安全性試験

該当資料なし

(5) 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（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

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学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

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、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

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[18)～23)]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1）抗菌作用[16)、24)、25)]

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、レボフロキサシン点眼液はブドウ球菌属、肺炎球菌を含むレンサ球菌属、ミクロコッカス属、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*）。

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。

2）角膜感染予防作用（レボフロキサシン点眼液0.5%「ＶＴＲＳ」のみ該当）

緑膿菌性角膜潰瘍のウサギ感染症モデルを用い、菌接種30分後からレボフロキサシン点眼液を1回約50μL、2時間間隔で1日6回、3日間点眼した結果、角膜混濁は認められず、レボフロキサシン点眼液は有意な予防効果を示した[26)]。

3）耐性菌に及ぼす用量の影響（レボフロキサシン点眼液1.5%「ＶＴＲＳ」のみ該当）

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=0.5μg/mL）及び緑膿菌（HSA201-00094株、レボフロキサシンに対するMIC=1μg/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ーゼ陰性ブドウ球菌（HSA201-00039株、レボフロキサシンに対するMIC=0.25μg/mL）の耐性菌出現を抑制した[27)、28)]。

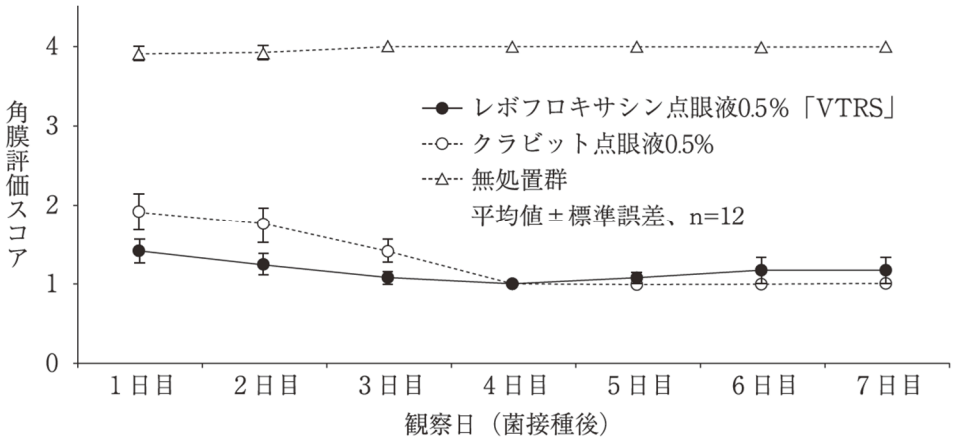
4）生物学的同等性試験

ウサギ緑膿菌角膜感染モデルに対する治癒効果

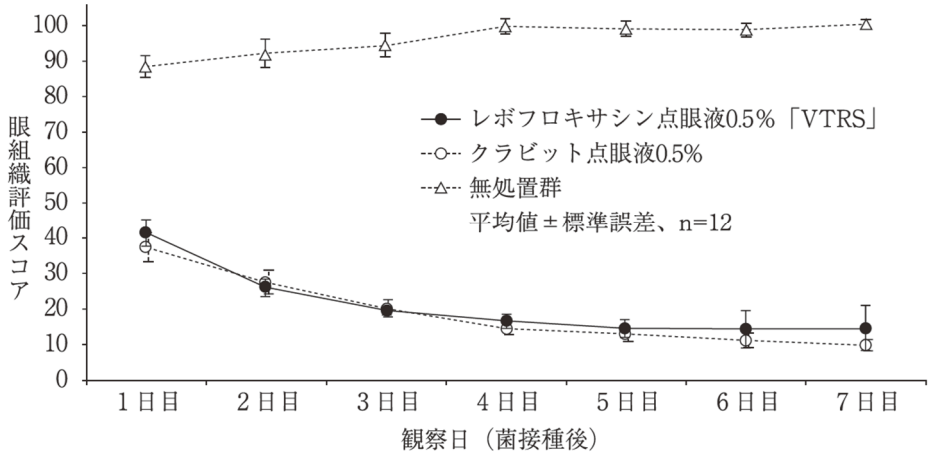
①レボフロキサシン点眼液 0.5%「ＶＴＲＳ」[29)]

レボフロキサシン点眼液 0.5%「ＶＴＲＳ」及びクラビット点眼液 0.5%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

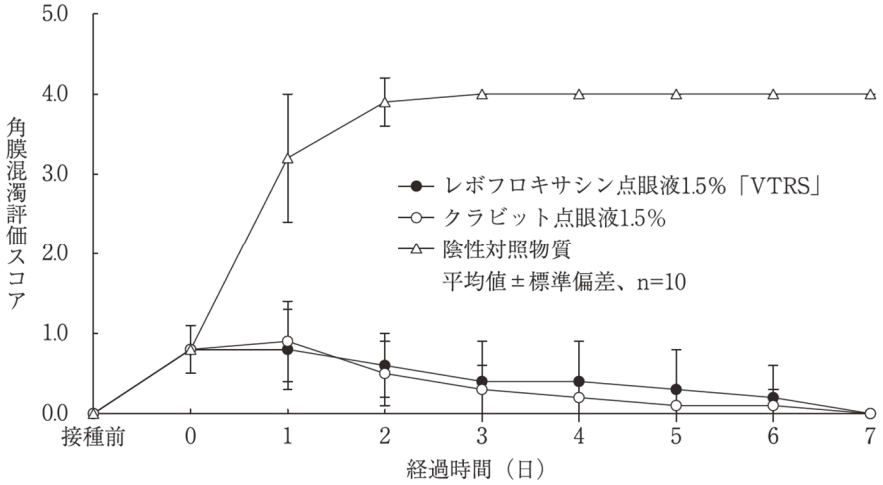


●眼組織感染部位の臨床観察



②レボフロキサシン点眼液 1.5%「ＶＴＲＳ」[30)]

レボフロキサシン点眼液 1.5%「ＶＴＲＳ」及びクラビット点眼液 1.5%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

レボフロキサシン点眼液0.5%「ＶＴＲＳ」

健康成人男性（10例）の片眼にレボフロキサシン点眼液を1回2滴、1日4回、2週間連続点眼したとき、最終日の点眼1時間後の血中濃度は定量下限値（0.01μg/mL）未満であった[31]。

レボフロキサシン点眼液1.5%「ＶＴＲＳ」

健康成人（8例）の両眼に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[32]。

(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

レボフロキサシン点眼液 0.5%「ＶＴＲＳ」

・有色ウサギに 0.5%^{14}C-標識レボフロキサシン点眼液を 1 回 50μL 点眼したとき、眼球結膜及び眼瞼結膜では点眼後 15 分で各々最高濃度（C_{max}）1433.8、1058.8ng eq./g を示し、角膜及び房水では点眼後 30 分で各々C_{max}6839.5ngeq./g、842.8ng eq./mL を示した後、経時的に減少した。メラニン含有組織である虹彩・毛様体及び網膜色素上皮・脈絡膜では点眼後 2 時間で各々C_{max}11514.4、3269.6ng eq./g を示し、その後緩慢に消失した[33]。

・有色ラットに 0.5%^{14}C-標識レボフロキサシン点眼液 1 回 1μL を、1 日 3 回、1 週間点眼したとき、最終点眼 1 時間後の角膜、房水及び硝子体における眼組織中濃度はそれぞれ 2270.8、267.1、372.0ng eq./g を示し、その後経時的に減少した。一方、虹彩・毛様体及び網膜色素上皮・脈絡膜では最終点眼 1 時間後でそれぞれ 185047.6、36549.6ng eq./g を示し、その後緩慢に消失した[34]。

・ビーグル犬に 0.3%レボフロキサシン点眼液を 1 回 1 滴、1 日 4 回、2 週間連続点眼したとき、最終点眼 24 時間後の眼組織内濃度は、虹彩・毛様体で 39.4μg/g、脈絡膜・網膜色素上皮で 12.3μg/g であり、眼組織のうちメラニン色素を含む組織には高度に分布することが認められた。一方、色素上皮を除く網膜への移行はわずかであった[35]。

レボフロキサシン点眼液 1.5%「ＶＴＲＳ」

白色ウサギの片眼に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、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[36]。

生物学的同等性試験

【参考】

ウサギ眼組織内濃度測定試験

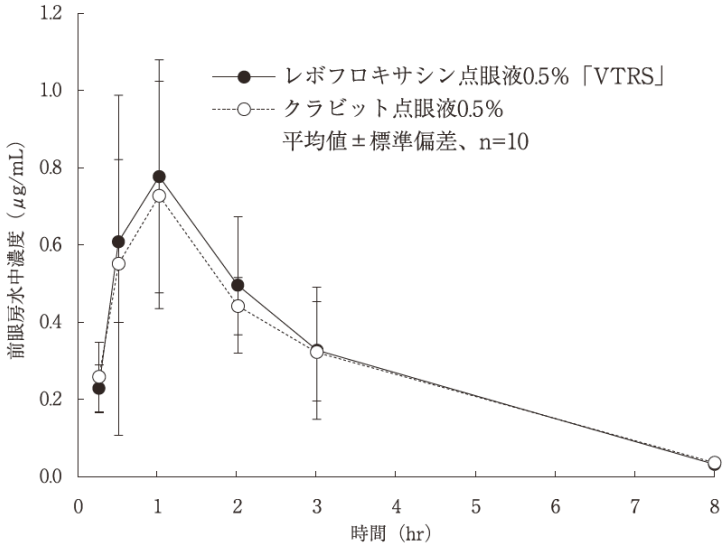
①レボフロキサシン点眼液 0.5%「ＶＴＲＳ」[37]

レボフロキサシン点眼液 0.5%「ＶＴＲＳ」又はクラビット点眼液 0.5%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
クラビット点眼液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

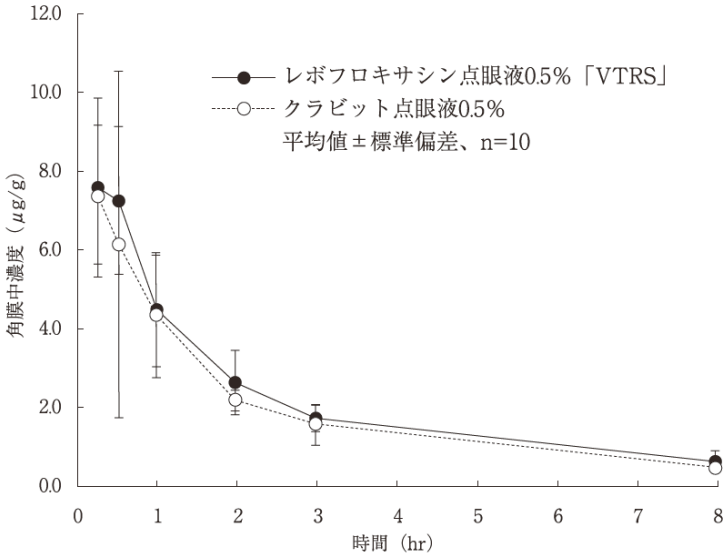
平均値±標準偏差　n=10



●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
クラビット点眼液0.5%	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」[38)、39)]
レボフロキサシン点眼液 1.5%「ＶＴＲＳ」又はクラビット点眼液 1.5%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
クラビット点眼液1.5%	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
クラビット点眼液1.5%	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

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」の項を参照

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

レボフロキサシン点眼液1.5%

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

レボフロキサシン点眼液0.5%「ＶＴＲＳ」

11.2 その他の副作用

	1%未満	頻度不明
眼	眼刺激、結膜炎、眼のそう痒感	びまん性表層角膜炎等の角膜障害、眼痛、眼瞼炎
皮膚		蕁麻疹、発疹、そう痒

レボフロキサシン点眼液1.5%「ＶＴＲＳ」

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（苦味等）	

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。

(____はレボフロキサシン点眼液 1.5%「ＶＴＲＳ」のみ)

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」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%「ＶＴＲＳ」　処方箋医薬品[注)]
レボフロキサシン点眼液1.5%「ＶＴＲＳ」　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

有効期間：3年
（「Ⅳ-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

4. 薬剤取扱い上の注意点

20. 取扱い上の注意
外箱開封後は、遮光して保存すること。

「Ⅷ-11. 適用上の注意」の項を参照
くすりのしおり：あり
患者向医薬品ガイド：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%「ＶＴＲＳ」：5mL×10本
レボフロキサシン点眼液1.5%「ＶＴＲＳ」：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

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%「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. 2016：C-5960
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. 2009：25
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. 2009：29
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. 2009：33
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) 臼井正彦：あたらしい眼科. 1997：14：299-307
14) 臼井正彦：あたらしい眼科. 1997；14：641-648
15) 臼井正彦：あたらしい眼科. 1997；14：1113-1118
16) 大橋裕一ほか：あたらしい眼科. 2012；29：669-678
17) 臼井正彦：あたらしい眼科. 1997；14：953-956
18) Kato J,et al.：Cell. 1990；63：393-404
19) Hoshino K,et al.：Antimicrob Agents Chemother. 1994；38：2623-2627
20) Akasaka T,et al.：Antimicrob Agents Chemother. 2001；45：2263-2268
21) Tanaka M,et al.：Antimicrob Agents Chemother. 1997；41：2362-2366
22) Onodera Y,et al.：J Antimicrob Chemother. 1999；44：533-536
23) Onodera Y,et al.：Antimicrob Agents Chemother. 2002；46：1800-1804
24) 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：2000.1.18 承認、申請資料概要ホ.1.（2））
25) 薬効薬理（クラビット点眼液：2000.1.18 承認、申請資料概要イ.1.（1））
26) 柏瀬光寿ほか：あたらしい眼科. 1996；13：249-253
27) 効力を裏付ける試験（クラビット点眼液：2010.12.21 承認、審査報告書）
28) 長野敬ほか：あたらしい眼科. 2013；30：1754-1760
29) 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」）
30) 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」）
31) 薄井紀夫ほか：眼科臨床医報. 1995；89：917-919
32) 健康成人男性を対象とした臨床薬理試験－第Ⅰ相－（クラビット点眼液：2010.12.21 承認、審査報告書）
33) 伊吹肇ほか：あたらしい眼科. 1997；14：1100-1104
34) 伊吹肇ほか：薬物動態. 1997；12：281-288
35) 伊吹肇ほか：あたらしい眼科. 1993；10：2071-2074

36）ウサギ点眼時の房水、角膜、眼瞼結膜及び眼球結膜中レボフロキサシン濃度の測定（クラビット点眼液：2010.12.21 承認、審査報告書）
37）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」）
38）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」）
39）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丁目11番2号
フリーダイヤル　0120-419-043

製造販売元

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

販売元

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

VIATRIS

MIF13C026M