

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

<p>広範囲抗菌点眼剤</p> <p>日本薬局方 レボフロキサシン点眼液</p> <p>レボフロキサシン点眼液0.5%「KOG」</p> <p>Levofloxacin Ophthalmic Solution 0.5%“KOG”</p> <p>レボフロキサシン点眼液1.5%「KOG」</p> <p>Levofloxacin Ophthalmic Solution 1.5%“KOG”</p>

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	レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」：1mL 中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%「KOG」：1mL 中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	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	製造販売元：興和株式会社 販売提携：興和創薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先 電話番号・FAX 番号	TEL.： FAX.：
問い合わせ窓口	興和株式会社 くすり相談センター 電話 0120-347-021 03-3279-7021 受付時間 9：00～17：00（土・日・祝日・弊社休日を除く） 医療関係者向けホームページ https://medical.kowa.co.jp/product/

本 IF はレボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」（2019年4月改訂）及びレボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」（2019年4月改訂）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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://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 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 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、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	VI. 薬効薬理に関する項目	11
1. 開発の経緯	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	11
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬理作用	11
II. 名称に関する項目	2	VII. 薬物動態に関する項目	13
1. 販売名	2	1. 血中濃度の推移・測定法	13
2. 一般名	2	2. 薬物速度論的パラメータ	13
3. 構造式又は示性式	2	3. 吸収	13
4. 分子式及び分子量	2	4. 分布	14
5. 化学名（命名法）	2	5. 代謝	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	6. 排泄	15
7. CAS 登録番号	2	7. 透析等による除去率	16
III. 有効成分に関する項目	3	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
1. 物理化学的性質	3	1. 警告内容とその理由	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17
3. 有効成分の確認試験法	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	17
4. 有効成分の定量法	4	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17
IV. 製剤に関する項目	5	5. 慎重投与内容とその理由	17
1. 剤形	5	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17
2. 製剤の組成	5	7. 相互作用	17
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	5	8. 副作用	17
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	9. 高齢者への投与	18
5. 製剤の各種条件下における安定性	6	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18
6. 溶解後の安定性	7	11. 小児等への投与	18
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
8. 溶出性	7	13. 過量投与	18
9. 生物学的試験法	7	14. 適用上の注意	19
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	7	15. その他の注意	19
11. 製剤中の有効成分の定量法	7	16. その他	19
12. 力価	7	IX. 非臨床試験に関する項目	20
13. 混入する可能性のある夾雑物	7	1. 薬理試験	20
14. 治療上注意が必要な容器に関する情報	7	2. 毒性試験	20
15. 刺激性	8	X. 管理的事項に関する項目	21
16. その他	8	1. 規制区分	21
V. 治療に関する項目	9	2. 有効期間又は使用期限	21
1. 効能又は効果	9		
2. 用法及び用量	9		
3. 臨床成績	9		

3. 貯法・保存条件	21
4. 薬剤取扱い上の注意点	21
5. 承認条件等	21
6. 包装	21
7. 容器の材質	21
8. 同一成分・同効薬	21
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	22
11. 薬価基準収載年月日	22
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	22
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	22
14. 再審査期間	22
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	22
16. 各種コード	22
17. 保険給付上の注意	22
XI. 文献	23
1. 引用文献	23
2. その他の参考文献	23
XII. 参考資料	24
1. 主な外国での発売状況	24
2. 海外における臨床支援情報	24
XIII. 備考	25
その他の関連資料	25

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レボフロキサシン点眼液は、広範囲抗菌点眼剤であり、本邦では2000年に上市されている。レボフロキサシン点眼液0.5%「KOG」及びレボフロキサシン点眼液1.5%「KOG」は、後発医薬品として開発が企画され、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、長期保存試験、生物学的同等性試験を実施し、2013年2月に承認され、2013年6月より販売された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) ウサギを対象に、実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果を評価した試験及び眼房水中及び角膜中のレボフロキサシン濃度を比較した試験により、レボフロキサシン水和物標準製剤との生物学的同等性が確認された後発医薬品である。(11, 14 頁参照)
- (2) 下記疾患に適応を有する。
＜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・エジプトチウス（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(9 頁参照)
- (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。重大な副作用としてショック、アナフィラキシーがあらわれることがある。(17 頁参照)

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% 「KOG」

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」

(2) 洋名

Levofloxacin Ophthalmic Solution 0.5% “KOG”

Levofloxacin Ophthalmic Solution 1.5% “KOG”

(3) 名称の由来

有効成分の活性本体（レボフロキサシン）＋投与経路・剤形（点眼液）＋規格・濃度（0.5%、1.5%）＋屋号（「KOG」）

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）

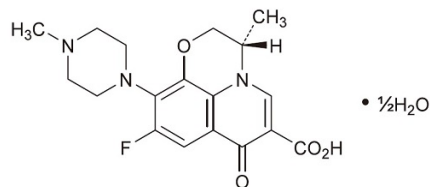
Levofloxacin Hydrate（JAN）

levofloxacin（INN）

(3) ステム

antibacterials, nalidixic acid derivatives（抗菌剤、ナリジクス酸誘導体）：-oxacin

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

別名：レボフロキサシン

7. CAS 登録番号

138199-71-0

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

溶解性

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 塩酸試液に溶ける。

溶解度¹⁾

液性	溶解度 (37℃)
pH1.2	46.1mg/mL
pH4.0	22.3mg/mL
pH6.8	13.1mg/mL
水	11.2mg/mL

(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¹⁾

pKa₁ (25℃) : 6.11 (カルボキシル基、滴定法)

pKa₂ (25℃) : 8.18 (ピペラジンの4位の窒素、滴定法)

(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

液性 (pH) : 中性及び塩基性水溶液では、安定である。¹⁾

光 : 1.0mg/mL 水溶液は、蛍光灯照射下 (30 万 lx・hr) で約 44%分解する。¹⁾

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。

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。

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

販売名	レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」	レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」
容 量	5mL	5mL
色 調 ・ 剤 形	微黄色～黄色澄明・無菌水性点眼剤	微黄色～黄色澄明・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

販売名	レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」	レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」
pH	6.2～6.8	6.1～6.9
浸 透 圧 比	0.95～1.05 (生理食塩液に対する比)	1.0～1.1 (生理食塩液に対する比)

(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

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」：1mL 中 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% 「KOG」：1mL 中 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

レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」^{2) 3)}

試験	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
加速試験 ^{注)}	40°C、75%RH	6 ヶ月	点眼容器＋紙箱	規格範囲内

測定項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌試験、定量法

試験	保存条件	保存期間 (曝光量)	保存形態	試験結果
光安定性試験	25°C、60%RH 1000 lx	25 日 (60 万 lx・hr)	点眼容器 露光	性状：変化なし 純度試験：変化あり（規格外） 定量：変化あり（規格外）
			点眼容器 添付の投薬袋入り	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし
		50 日 (120 万 lx・hr)	点眼容器 露光	性状：変化なし 純度試験：変化あり（規格外） 定量：変化あり（規格外）
			点眼容器 添付の投薬袋入り	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし
	25°C、60%RH 暗所	50 日	点眼容器	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし
			点眼容器	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし

測定項目：性状、純度試験、定量法

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」^{4) 5)}

試験	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
加速試験 ^{注)}	40°C、75%RH	6 ヶ月	点眼容器＋紙箱	規格範囲内
長期保存試験 ^{注)}	25°C、60%RH	18 ヶ月	点眼容器＋紙箱	規格範囲内

測定項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌試験、定量法

試験	保存条件	保存期間 (曝光量)	保存形態	試験結果
光安定性試験	25°C、60%RH 1000 lx	25 日 (60 万 lx・hr)	点眼容器 露光	性状：変化なし 純度試験：変化あり（規格外） 定量：変化なし
			点眼容器 添付の投薬袋入り	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし
		50 日 (120 万 lx・hr)	点眼容器 露光	性状：変化なし 純度試験：変化あり（規格外） 定量：変化あり（規格内）
			点眼容器 添付の投薬袋入り	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし
	25°C、60%RH 暗所	50 日	点眼容器	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし
			点眼容器	性状：変化なし 純度試験：変化なし 定量：変化なし

測定項目：性状、純度試験、定量法

注) 容器寸法変更前の結果

レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」・レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」の貯法は気密容器、遮光、室温保存、使用期限は製造後 3 年である。（「X.管理的事項に関する項目」参照）

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）

「XIII.備考」の項参照

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「レボフロキサシン点眼液」の確認試験法による。

11. 製剤中の有効成分の定量法

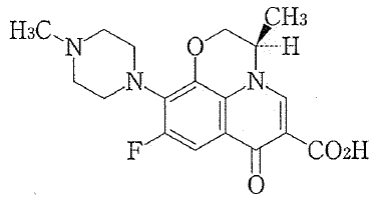
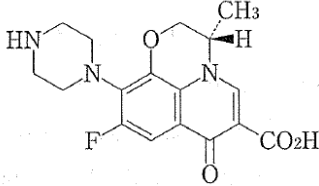
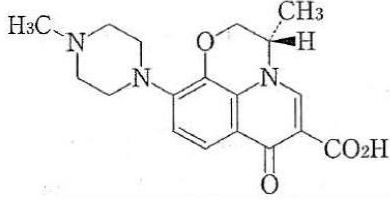
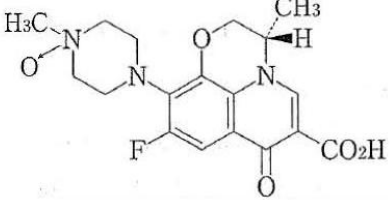
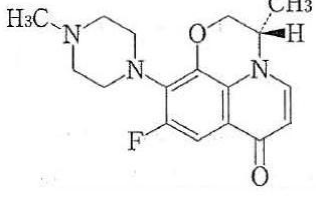
日本薬局方「レボフロキサシン点眼液」の定量法による。

12. 力価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

混入する可能性のある類縁物質としては、次の〔1〕～〔5〕がある。

 <p>〔1〕 光学異性体</p>	 <p>〔2〕 脱メチル体</p>
 <p>〔3〕 脱フッ素体</p>	 <p>〔4〕 N-オキシド体</p>
 <p>〔5〕 脱炭酸体</p>	

14. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

15. 刺激性

「IX.2. (4) その他の特殊毒性」の項参照

16. その他

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」⁶⁾

1 滴質量：45.7mg (10 回滴下の平均値)

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」⁷⁾

1 滴質量：44.2mg (10 回滴下の平均値)

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. 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（2009年4月以降承認品目）

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

ニューキノロン系化合物：

ノルフロキサシン、オフロキサシン、ガチフロキサシン、トスフロキサシントシル酸塩水和物、モキシフロキサシン塩酸塩、ロメフロキサシン塩酸塩

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：眼

作用機序：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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

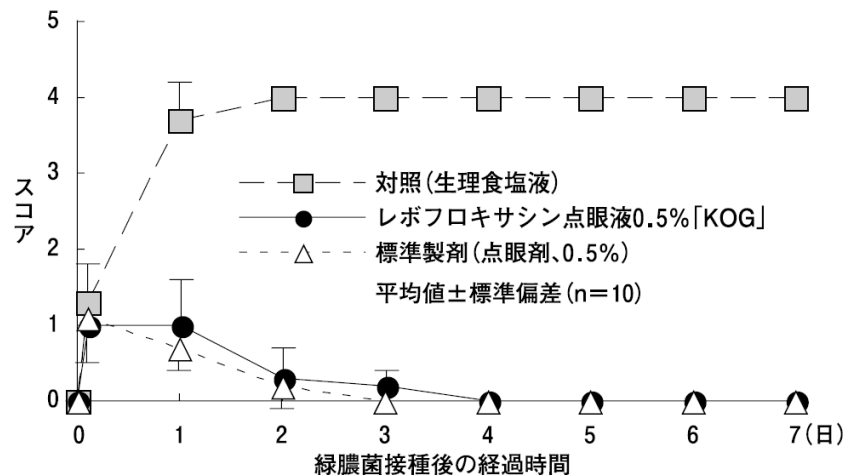
生物学的同等性試験

ウサギ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%「KOG」⁸⁾

緑膿菌を接種したウサギに対して、レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」、標準製剤（点眼剤、0.5%）及び生理食塩液（対照群）を菌接種後 6 時間後から 2 時間ごとに 1 日 6 回、3 日間点眼し、緑膿菌接種後 7 日目までの角膜混濁の度合い（スコア）の観察、並びに 7 日目の角膜より緑膿菌を分離培養した（各群 10 例）。対照群では、緑膿菌接種後からスコアが徐々に増加し、2 日目以降観察終了時まで全例で角膜混濁が確認された。一方、レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」群及び標準製剤群では、2 日目以降スコアが低下し、点眼を中止した 3 日目以降もスコアの増加はみられず、1 日目以降観察終了時まで対照群と比較して有意な低値（ $p < 0.01$ 、Mann-Whitney の U 検定）を示した。レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」群及び標準製剤群のスコアには、観察期間を通じて有意差が認められなかった。また対照群では全眼で緑膿菌の陽性を示したのに対して、レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」群及び標準製剤群では全眼陰性を示した。

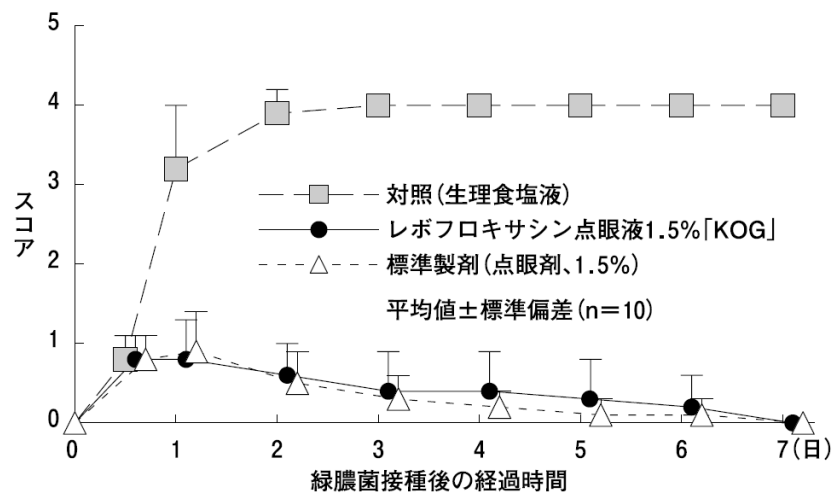
レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」及び標準製剤はいずれも緑膿菌による角膜混濁の増加を著明に抑制し、その治療効果に有意な差が認められなかったことからレボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」は標準製剤と生物学的に同等と判断された。



レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」⁹⁾

緑膿菌を接種したウサギに対して、レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」、標準製剤（点眼剤、1.5%）及び生理食塩液（対照群）を菌接種 6 時間後及び 10 時間後の 2 回点眼投与（投与量：50 μ L/回）、翌日以降、1 日あたり 4 時間ごとに計 3 回、2 日間点眼し、菌接種後 7 日目まで角膜混濁の度合い（スコア）を評価し、7 日目（最終日）の角膜より緑膿菌を分離培養した（各群 10 例）。対照群では、緑膿菌接種後からスコアが増加し、1 日目以降観察終了まで全例で角膜混濁が確認されたが、レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」群及び標準製剤群では、2 日目以降スコアが低下し、7 日目では全例において角膜混濁は認められず、1 日目以降観察終了まで対照群と比較して有意な低値（ $p < 0.01$ 、Mann-Whitney の U 検定）を示した。レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」群と標準製剤群のスコアには、観察期間を通じて有意差が認められなかった。また、対照群では全眼で緑膿菌の陽性を示したのに対して、レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」群及び標準製剤群では全眼陰性を示した。

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」及び標準製剤はいずれも緑膿菌による角膜混濁の増加を著明に抑制し、その治療効果に有意な差が認められなかったことから、レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」は標準製剤と生物学的に同等と判断された。



(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) 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

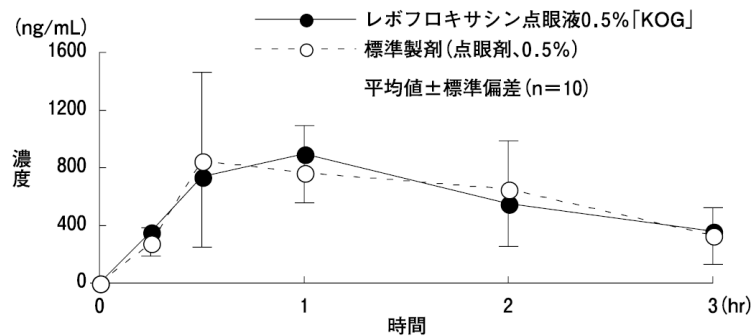
(5) その他の組織への移行性

生物学的同等性試験

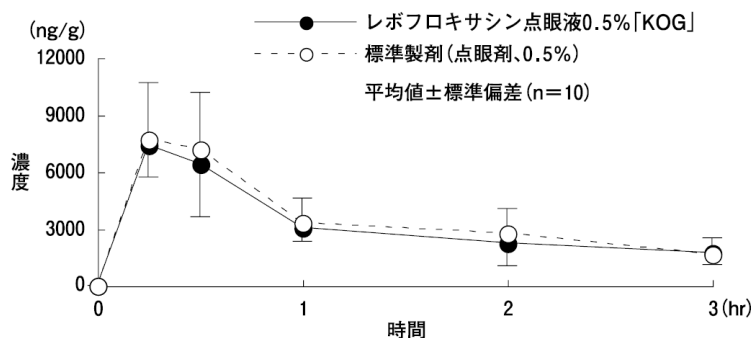
レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」

1) ウサギ眼組織内薬物動態¹⁰⁾

レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」及び標準製剤（点眼剤、0.5%）各 50 μ L（レボフロキサシン水和物として 0.25mg）をウサギに単回点眼し、眼房水中及び角膜中のレボフロキサシン濃度の統計解析を行った結果、すべての採取時間における眼組織中レボフロキサシン濃度について、両製剤間では有意差が認められなかった。（Student の t 検定、有意水準は両側 5%）



眼房水中のレボフロキサシンの濃度推移



角膜中のレボフロキサシンの濃度推移

(2) ウサギ角膜中薬物最高濃度¹¹⁾

レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」と標準製剤（点眼剤、0.5%）50 μ L をそれぞれウサギに片眼

ずつ点眼し、最高角膜中濃度を示す 15 分後の角膜を採取した。採取した角膜のレボフロキサシン濃度について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、標準製剤とレボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」の角膜中レボフロキサシン濃度の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は $\log(0.9880) \sim \log(1.2456)$ であり、生物学的同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ 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。

	角膜中濃度 (ng/g)
レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」	15551.01 ± 6020.22
標準製剤 (点眼剤、0.5%)	13932.89 ± 4642.83

(平均値 ± 標準偏差、n=49)

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」

ウサギ眼房水中及び角膜中薬物最高濃度¹²⁾

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」及び標準製剤 (点眼剤、1.5%) 30 μ L (レボフロキサシン水和物として 0.45mg) をそれぞれウサギに片眼ずつ点眼し、最高眼房水中濃度を示す 60 分後の眼房水及び最高角膜中濃度を示す 15 分後の角膜を採取した。採取した眼房水及び角膜中のレボフロキサシン濃度について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、標準製剤と試験製剤の眼房水中レボフロキサシン濃度の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は $\log(0.8895) \sim \log(1.1452)$ 、標準製剤と試験製剤の角膜中レボフロキサシン濃度の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は $\log(0.8555) \sim \log(1.0941)$ であり、それぞれ生物学的同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ 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。

	眼房水中濃度 (ng/mL)		角膜中濃度 (ng/g)	
レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」	n=90	3803.90 ± 2106.85	n=94	25939.84 ± 15591.77
標準製剤 (点眼剤、1.5%)	n=90	3761.02 ± 2325.64	n=94	26184.23 ± 14731.19

(平均値 ± 標準偏差)

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	
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	発疹、蕁麻疹、眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎、そう痒感
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）

*1.5%製剤のみ

(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（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。

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。

過敏症：発疹、蕁麻疹、眼瞼炎（眼瞼発赤・浮腫等）、眼瞼皮膚炎、そう痒感（頻度不明）

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（1.5%製剤のみ）

小児等への投与

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%製剤のみ)

15. その他の注意

該当しない

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」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

レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」¹³⁾

日本白色種雄性ウサギ（各群 6 例）を用いて、右眼にレボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」または標準製剤（点眼剤、0.5%）を 1 回につき 50 μ L ずつ 30 分間隔で 15 回投与し、眼刺激性を検討した。左眼には陰性対照物質として生理食塩液を同様に投与した。投与前、最終投与後 1、3、24、48、72、96 及び 168 時間に、両眼を肉眼的に観察し、Draize の基準により角膜、虹彩及び結膜の刺激性反応を評価した。

その結果、レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」及び標準製剤は共に無刺激物であると評価された。

レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」¹⁴⁾

日本白色種雄性ウサギ（各群 6 例）を用いて、右眼にレボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」または標準製剤（点眼剤、1.5%）を 1 回につき 50 μ L ずつ 30 分間隔で 15 回投与し、眼刺激性を検討した。左眼には陰性対照物質として生理食塩液を同様に投与した。投与前、最終投与後 1、3、24、48、72、96 及び 168 時間に、両眼を肉眼的に観察し、Draize の基準により角膜、虹彩及び結膜の刺激性反応を評価した。

その結果、レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」及び標準製剤は共に無刺激物であると評価された。

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%「KOG」・点眼液 1.5%「KOG」）
 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（レボフロキサシン水和物）
 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：外箱等に表示（製造後3年）

3. 貯法・保存条件

貯法：気密容器、遮光、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII.14.適用上の注意」の項参照

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%「KOG」	5mL×10本
レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」	5mL×10本

7. 容器の材質

レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」	本体：ポリプロピレン（チヌビン*含有） 中栓：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン
レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」	本体：ポリプロピレン（チヌビン*含有） 中栓：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン

*紫外線吸収剤

8. 同一成分・同効薬

同一成分：クラビット点眼液 0.5%、クラビット点眼液 1.5%

同効薬：ノルフロキサシン、オフロキサシン、ガチフロキサシン、トスフロキサシントシル酸塩
 水和物、モキシフロキサシン塩酸塩、ロメフロキサシン塩酸塩

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

販売名	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%「KOG」	2013年2月15日	22500AMX00139000
レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」		22500AMX00197000

11. 薬価基準収載年月日

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、投与期間に関する制限は定められていない。

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%「KOG」	122402301	1319742Q1268	622240201
レボフロキサシン 点眼液 1.5%「KOG」	122403001	1319742Q2043	622240301

17. 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。

XI . 文献

1. 引用文献

- 1) (財) 日本公定書協会編：医療用医薬品品質情報集 (Orange Book No.25)
- 2) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の安定性試験に関する資料
- 3) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の光安定性
- 4) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」 の安定性試験に関する資料
- 5) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」 の光安定性
- 6) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の 1 滴質量に関する資料
- 7) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」 の 1 滴質量に関する資料
- 8) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の生物学的同等性試験 (ウサギ実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果) に関する資料
- 9) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」 の生物学的同等性試験 (ウサギ実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果) に関する資料
- 10) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の生物学的同等性試験 (ウサギ眼組織内薬物動態) に関する資料
- 11) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の生物学的同等性試験 (ウサギ角膜中薬物最高濃度) に関する資料
- 12) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」 の生物学的同等性試験 (ウサギ眼房水中及び角膜中薬物最高濃度) に関する資料
- 13) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の眼粘膜刺激性試験に関する資料
- 14) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」 の眼粘膜刺激性試験に関する資料
- 15) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 0.5% 「KOG」 の配合変化試験に関する資料
- 16) 興和 (株) 社内資料：レボフロキサシン点眼液 1.5% 「KOG」 の配合変化試験

2. その他の参考文献

第十七改正日本薬局方 解説書 廣川書店 (2016)

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

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」の配合変化試験¹⁵⁾

配合前に各薬剤について試験(外観及びpH)を行った後、室温下でレボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」と各配合薬剤を等量混合し、配合直後及び5分後の外観及びpHの変動を観察した。

試験結果

○変化あり(規格外)

サンテゾーン点眼液(0.1%)は配合直後から、白濁が認められ、5分後も白濁していた。

○変化あり(規格内)

フルメトロン点眼液 0.02%、フルメトロン点眼液 0.1%、フルオロメトロン 0.02%点眼液 T、フルオロメトロン 0.1%点眼液 T、ブロナック点眼液 0.1%、リボスチン点眼液 0.025%、エイズプト懸濁性点眼液 1%、サンコバ点眼液 0.02%、ファルコバ点眼液 0.02%、ピマリシン 5%点眼液「センジュ」及びカタリン点眼用 0.005%では、配合薬剤自体の有する色調に由来する色調の変化を認めた。

○変化なし

その他の配合薬剤では、外観変化は認められなかった。

販売名	一般名	色調	pH	配合直後		5分後		
				外観	pH	外観	pH	
レボフロキサシン点眼液 0.5%「KOG」	レボフロキサシン	微黄色 澄明	6.54	—	—	—	—	
ステロイド剤	フルメトロン点眼液 0.02%	フルオロメトロン	白濁	7.28	白濁(微黄色) ^{**1}	6.97	白濁(微黄色) ^{**1}	6.98
	フルメトロン点眼液 0.1%		白濁	7.27	白濁(微黄色) ^{**1}	6.97	白濁(微黄色) ^{**1}	6.97
	フルオロメトロン 0.02%点眼液 T		白濁	7.06	白濁(微黄色) ^{**1}	6.84	白濁(微黄色) ^{**1}	6.85
	フルオロメトロン 0.1%点眼液 T		白濁	7.04	白濁(微黄色) ^{**1}	6.84	白濁(微黄色) ^{**1}	6.84
	サンテゾーン点眼液(0.1%)	デキサメタゾンメタスルホ安息香酸エステルナトリウム	無色澄明	5.57	白濁 ^{**2}	6.21	白濁 ^{**2}	6.36
	オルガドロン点眼・点耳・点鼻液 0.1%	デキサメタゾンリン酸エステルナトリウム	無色澄明	7.84	微黄色澄明	7.78	微黄色澄明	7.80
	リンデロン点眼液 0.01%	ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム	無色澄明	7.84	微黄色澄明	7.47	微黄色澄明	7.48
非ステロイド剤	ジクロード点眼液 0.1%	ジクロフェナクナトリウム	無色澄明	7.40	微黄色澄明	7.44	微黄色澄明	7.48
	ジクロフェナック点眼液 0.1%		無色澄明	7.14	微黄色澄明	7.12	微黄色澄明	7.15
	ニフラン点眼液 0.1%	プラノプロフェン	無色澄明	7.70	微黄色澄明	7.79	微黄色澄明	7.79
	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	黄色澄明	8.34	黄色澄明 ^{**1}	8.28	黄色澄明 ^{**1}	8.28

	販売名	一般名	色調	pH	配合直後		5分後	
					外観	pH	外観	pH
抗アレルギー剤	エリックス点眼液 0.25%	アンレキサノクス	無色澄明	7.44	微黄色澄明	7.59	微黄色澄明	7.60
	パタノール点眼液 0.1%	オロパタジン塩酸塩	無色澄明	7.09	微黄色澄明	6.99	微黄色澄明	6.92
	インタール点眼液 2%	クロモグリク酸ナトリウム	微黄色澄明	5.81	微黄色澄明	6.90	微黄色澄明	7.03
	ミタヤク点眼液 2%		無色澄明	5.87	微黄色澄明	6.95	微黄色澄明	7.02
	リザベン点眼液 0.5%	トラニラスト	微黄色澄明	7.50	微黄色澄明	7.57	微黄色澄明	7.56
	ザジテン点眼液 0.05%	ケトチフェンフマル酸塩	無色澄明	4.82	微黄色澄明	6.14	微黄色澄明	6.42
	セキトン点眼液 0.05%		無色澄明	5.61	微黄色澄明	6.19	微黄色澄明	6.40
	アレキサール点眼液 0.1%	ペミロラストカリウム	無色澄明	7.71	微黄色澄明	6.99	微黄色澄明	6.97
	アラジオフ点眼液 0.1%		無色澄明	7.79	微黄色澄明	6.89	微黄色澄明	6.95
	リボスチン点眼液 0.025%	レボカバスチン塩酸塩	白色の懸濁	6.96	微黄色の懸濁 ^{※1}	6.85	微黄色の懸濁 ^{※1}	6.86
ゼペリン点眼液 0.1%	アシタザノラスト水和物	無色澄明	5.59	微黄色澄明	6.09	微黄色澄明	6.21	
緑内障治療剤	ウブレチド点眼液 0.5%	ジスチグミン臭化物	無色澄明	5.68	微黄色澄明	5.97	微黄色澄明	6.02
	ウブレチド点眼液 1%		無色澄明	5.71	微黄色澄明	6.00	微黄色澄明	6.02
	レスキュラ点眼液 0.12%	イソプロピルウノプロストン	無色澄明	5.83	微黄色澄明	6.30	微黄色澄明	6.42
	ミケラン点眼液 1%	カルテオロール塩酸塩	無色澄明	6.61	微黄色澄明	6.63	微黄色澄明	6.52
	ミケラン点眼液 2%		無色澄明	6.63	微黄色澄明	6.50	微黄色澄明	6.52
	トルソプト点眼液 0.5%	ドルゾラミド塩酸塩	無色澄明	5.66	微黄色澄明	5.87	微黄色澄明	5.89
	トルソプト点眼液 1%		無色澄明	5.59	微黄色澄明	5.74	微黄色澄明	5.82
	デタントール 0.01%点眼液	ブナゾシン塩酸塩	無色澄明	6.00	微黄色澄明	6.11	微黄色澄明	6.34
	ミロル点眼液 0.5%	レボプロノール塩酸塩	無色澄明	6.50	微黄色澄明	6.54	微黄色澄明	6.56
	トラバタンズ点眼液 0.004%	トラボプロスト	無色澄明	5.73	微黄色澄明	6.10	微黄色澄明	6.26
	ハイパジール ^{ユー} 点眼液 0.25%	ニブラジロール	無色澄明	6.86	微黄色澄明	6.75	微黄色澄明	6.76
	キサラタン点眼液 0.005%	ラタノプロスト	無色澄明	6.72	微黄色澄明	6.67	微黄色澄明	6.67
	タプロス点眼液 0.0015%	タフルプロスト	無色澄明	6.06	微黄色澄明	6.14	微黄色澄明	6.25
	チモプトール点眼液 0.25%	チモロールマレイン酸塩	無色澄明	6.81	微黄色澄明	6.76	微黄色澄明	6.78
	チモプトール点眼液 0.5%		無色澄明	6.84	微黄色澄明	6.78	微黄色澄明	6.80
	ファルチモ点眼液 0.25		無色澄明	6.75	微黄色澄明	6.69	微黄色澄明	6.72
	ファルチモ点眼液 0.5		無色澄明	6.82	微黄色澄明	6.77	微黄色澄明	6.78
	チモプトールXE点眼液 0.25%		無色澄明	6.80	微黄色澄明	6.51	微黄色澄明	6.53
	チモプトールXE点眼液 0.5%		無色澄明	6.82	微黄色澄明	6.59	微黄色澄明	6.60
	リズモンTG点眼液 0.25%		無色澄明	7.40	微黄色澄明	7.05	微黄色澄明	7.01
リズモンTG点眼液 0.5%	無色澄明		7.43	微黄色澄明	7.08	微黄色澄明	7.04	
エイゾプト懸濁性点眼液 1%	プリンゾラミド		白濁	7.46	白濁 ^{※1}	6.92	白濁 ^{※1}	6.93
ビタミン剤	サンコバ点眼液 0.02%		シアノコバラミン	紅色澄明	6.00	紅色澄明 ^{※1}	6.13	紅色澄明 ^{※1}
	ファルコバ点眼液 0.02%	紅色澄明		5.86	紅色澄明 ^{※1}	6.12	紅色澄明 ^{※1}	6.35
散瞳剤	ピバレフリン点眼液 0.04%	ジピベフリン塩酸塩	無色澄明	5.24	微黄色澄明	6.03	微黄色澄明	6.21
	ピバレフリン点眼液 0.1%		無色澄明	5.29	微黄色澄明	6.10	微黄色澄明	6.22
抗生物質製剤	ピマリシン点眼液 5% 「センジュ」	ピマリシン	微黄乳白色	7.26	微黄乳白色 ^{※1}	6.91	微黄乳白色 ^{※1}	6.97

販売名		一般名	色調	pH	配合直後		5分後	
					外観	pH	外観	pH
角膜疾患 治療剤	ヒアレイン点眼液 0.1%	ヒアルロン酸ナトリウム	無色澄明	6.29	微黄色澄明	6.48	微黄色澄明	6.43
	ヒアルロン酸Na点眼液 0.1% 「杏林」		無色澄明	6.15	微黄色澄明	6.39	微黄色澄明	6.42
白内障 治療剤	カタリン点眼用 0.005%	ピレノキシシ	黄色澄明	5.95	黄色澄明 ^{※1}	6.37	黄色澄明 ^{※1}	6.40

※1：配合剤自体の有する色調に由来 ※2：配合直後に変化あり
(2011年8月試験実施、2017年9月時点での販売名を記載した)

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」の配合変化試験¹⁶⁾

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」と併用使用される可能性のある他剤との配合変化試験を行った。以下に結果を示す。

試験結果

○変化あり（規格内）

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」に、フルメトロン点眼液 0.1%及びブロナック点眼液 0.1%を配合したとき、性状は各製剤の有する色調に由来して、変化を認めた。

しかし、レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」といずれの製剤を配合しても、含量 (%) は全測定時点において規格値に適合しており、配合直後から経時的変化を認めなかった。よって、フルメトロン点眼液 0.1%及びブロナック点眼液 0.1%は「変化あり（規格内）」と判定した。

○変化なし

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」に、ヒアレイン点眼液 0.1%、ニフラン点眼液 0.1%、ジクロード点眼液 0.1%、リンデロン点眼・点耳・点鼻液 0.1%及び点眼・点耳用リンデロン A 液を配合したとき、性状及び含量 (%) は全測定時点において規格値に適合しており、配合直後から経時的変化を認めなかった。よって、上記の配合製剤については「変化なし」と判定した。

○参考値

レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」の pH 及び浸透圧比は、いずれの製剤を配合しても著しい変化を認めなかった。

配合製剤名		性状			pH			浸透圧比			定量法 [含量 (%)]		評価
		配合前	配合直後	24時間後	配合前	配合直後	24時間後	配合前	配合直後	24時間後	配合直後	24時間後	
検体	レボフロキサシン点眼液 1.5%「KOG」	微黄色澄明の液	—	—	6.46	—	—	1.0	—	—	98.7~99.4 (配合前)	—	—
	ヒアレイン点眼液 0.1%	無色澄明で粘稠性のある液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	6.54	6.38	6.36	1.0	1.0	1.0	99.4	99.3	変化なし
	フルメトロン点眼液 0.1%	振り混ぜるとき、白濁	振り混ぜるとき、微黄色に懸濁	振り混ぜるとき、微黄色に懸濁	7.26	6.62	6.63	1.0	1.0	1.0	98.7	98.9	変化あり (規格内)
	ニフラン点眼液 0.1%	無色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	7.63	7.43	7.42	1.1	1.1	1.1	99.8	99.8	変化なし

配合製剤名	性状			pH			浸透圧比			定量法 [含量 (%)]		評価
	配合前	配合直後	24時間後	配合前	配合直後	24時間後	配合前	配合直後	24時間後	配合直後	24時間後	
ジクロード 点眼液 0.1%	微黄色澄明 の液	微黄色澄明 の液	微黄色澄明 の液	7.38	7.00	6.99	1.1	1.1	1.1	99.3	99.4	変化なし
リンデロン点 眼・点耳・点 鼻液 0.1%	無色澄明の 液	微黄色澄明 の液	微黄色澄明 の液	7.85	7.12	7.11	0.8	0.9	0.9	99.3	99.3	変化なし
点眼・点鼻用 リンデロン A 液	微黄色澄明 の液	微黄色澄明 の液	微黄色澄明 の液	7.02	6.75	6.75	0.7	0.9	0.9	100.1	100.2	変化なし
ブロナック 点眼液 0.1%	黄色澄明の 液	黄色澄明の 液	黄色澄明の 液	8.29	7.94	7.94	1.0	1.1	1.1	100.1	100.0	変化あり (規格内)

(2012年11月試験実施、2017年9月時点での販売名を記載した)

