

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

広範囲経口抗菌製剤

処方箋医薬品

日本薬局方 レボフロキサシン錠

レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」

レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」

日本薬局方 レボフロキサシン細粒

レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」

LEVOFLOXACIN TABLETS, FINE GRANULES 「DSEP」

剤形	レボフロキサシン錠 250mg、錠 500mg：錠剤（フィルムコーティング錠） レボフロキサシン細粒 10%：細粒剤（コーティング細粒）
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	錠 250mg 「DSEP」：1 錠中 レボフロキサシン水和物（日局）256.2mg （レボフロキサシンとして 250mg）を含有 錠 500mg 「DSEP」：1 錠中 レボフロキサシン水和物（日局）512.5mg （レボフロキサシンとして 500mg）を含有 細粒 10% 「DSEP」：細粒 1g 中レボフロキサシン水和物（日局）102.5mg （レボフロキサシンとして 100mg）を含有
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：2014年8月15日 薬価基準収載年月日：2014年12月12日 発売年月日：2014年12月12日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：第一三共エスファ株式会社 販売提携：第一三共株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	第一三共エスファ株式会社 お客様相談室 TEL：0120-100-601 医療関係者向けホームページ： https://med.daiichisankyo-ep.co.jp/index.php

本 IF は 2019 年 9 月改訂（第 7 版）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、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.htm> 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、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、(独) 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ

(<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.htm>) 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、薬価基準収載にあわせて 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。

- ② IF 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]

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

(6) 分布容積.....	14	16. その他.....	24
(7) 血漿蛋白結合率.....	14		
3. 吸 収.....	15	IX. 非臨床試験に関する項目	25
4. 分 布.....	15	1. 薬理試験.....	25
(1) 血液－脳関門通過性.....	15	(1) 薬効薬理試験.....	25
(2) 血液－胎盤関門通過性.....	15	(2) 副次的薬理試験.....	25
(3) 乳汁への移行性.....	15	(3) 安全性薬理試験.....	25
(4) 髄液への移行性.....	15	(4) その他の薬理試験.....	25
(5) その他の組織への移行性.....	15	2. 毒性試験.....	25
5. 代 謝.....	15	(1) 単回投与毒性試験.....	25
(1) 代謝部位及び代謝経路.....	15	(2) 反復投与毒性試験.....	25
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種.....	16	(3) 生殖発生毒性試験.....	26
(3) 初回通過効果の有無及びその割合.....	16	(4) その他の特殊毒性.....	26
(4) 代謝物の活性の有無及び比率.....	16	X. 管理的事項に関する項目	28
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ.....	16	1. 規制区分.....	28
6. 排 泄.....	16	2. 有効期間又は使用期限.....	28
(1) 排泄部位及び経路.....	16	3. 貯法・保存条件.....	28
(2) 排泄率.....	16	4. 薬剤取扱い上の注意点.....	28
(3) 排泄速度.....	16	(1) 薬局での取扱い上の留意点について.....	28
7. トランスポーターに関する情報.....	16	(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）.....	28
8. 透析等による除去率.....	16	(3) 調剤時の留意点について.....	28
VII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	18	5. 承認条件等.....	28
1. 警告内容とその理由.....	18	6. 包 装.....	28
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）.....	18	7. 容器の材質.....	29
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由.....	18	8. 同一成分・同効薬.....	29
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由.....	18	9. 国際誕生年月日.....	29
5. 慎重投与内容とその理由.....	19	10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	29
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法.....	19	11. 薬価基準収載年月日.....	29
7. 相互作用.....	19	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.....	29
(1) 併用禁忌とその理由.....	19	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	30
(2) 併用注意とその理由.....	19	14. 再審査期間.....	30
8. 副作用.....	20	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	30
(1) 副作用の概要.....	20	16. 各種コード.....	30
(2) 重大な副作用と初期症状.....	20	17. 保険給付上の注意.....	30
(3) その他の副作用.....	22	XI. 文 献	31
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧.....	22	1. 引用文献.....	31
(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.....	22	2. その他の参考文献.....	32
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法.....	22	XII. 参考資料	33
9. 高齢者への投与.....	23	1. 主な外国での発売状況.....	33
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	23	2. 海外における臨床支援情報.....	33
11. 小児等への投与.....	23	XIII. 備 考	34
12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	23	その他の関連資料.....	34
13. 過量投与.....	24		
14. 適用上の注意.....	24		
15. その他の注意.....	24		

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、細菌の DNA の複製を阻害することにより殺菌作用を示すニューキノロン系抗菌薬であり、本邦では 1993 年に製造販売承認を取得している。

レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」、レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」及びレボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」は、第一三共株式会社が製造販売しているクラビット®錠 250mg、クラビット®錠 500mg 及びクラビット®細粒 10%と原薬、添加物及び製造方法がそれぞれ同一のオーソライズド・ジェネリックであり、第一三共エスファ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、平成 17 年 3 月 31 日付薬食発第 0331015 号に基づき承認申請を行い、2014 年 8 月に承認を取得し、2014 年 12 月より販売を開始した。その後、結核療法研究協議会が実施し公表した臨床研究、及び一般社団法人日本結核病学会が実施した使用実態調査（アンケート方式）の結果を踏まえ、「肺結核及びその他の結核症」の効能・効果追加の承認事項一部変更承認申請を行い、2015 年 8 月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) レボフロキサシン水和物は、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）及びトポイソメラーゼ IV に作用することにより DNA の複製を阻害し、殺菌作用を示す。抗菌作用は殺菌的であり MIC 付近の濃度で溶菌が認められた。
- (2) 500mg1 日 1 回投与は、PK-PD 理論に基づいた投与方法であり、高い初期殺菌効果と耐性菌の出現抑制効果が期待されている。
- (3) レボフロキサシン水和物は苦味を有することから、マスキングにより苦味を抑え、また、フィルムコーティング錠にすることで光による分解を抑えている。
- (4) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、痙攣、QT 延長、心室頻拍（Torsades de pointes を含む）、急性腎障害、間質性腎炎、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少、間質性肺炎、好酸球性肺炎、偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎、横紋筋融解症、低血糖、アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害、錯乱、せん妄、抑うつ等の精神症状、過敏性血管炎、重症筋無力症の悪化、大動脈瘤、大動脈解離、末梢神経障害が報告されている。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1)和名

レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」

レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」

レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」

(2)洋名

LEVOFLOXACIN TABLETS 250mg 「DSEP」

LEVOFLOXACIN TABLETS 500mg 「DSEP」

LEVOFLOXACIN FINE GRANULES 10% 「DSEP」

(3)名称の由来

通知「平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

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)

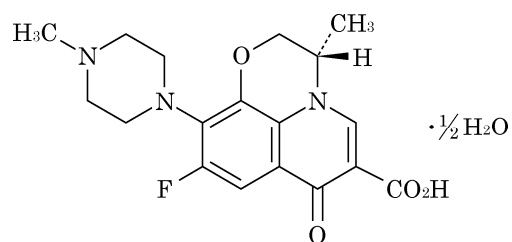
Levofloxacin Hydrate (JAN)

levofloxacin (INN)

(3)ステム

ナリジクス酸系抗菌薬：-oxacin

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

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

138199-71-0 (Levofloxacin Hydrate)

100986-85-4 (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。

溶媒	本品 1g を溶解するための溶媒量
酢酸（100）	約 4mL
水	約 60mL
メタノール	約 95mL
エタノール（99.5）	約 200mL

(3) 吸湿性¹⁾

相対湿度 11～93%において吸湿性は示さなかった。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

約 226℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数²⁾

pKa₁ : 6.11（カルボキシル基、滴定法）

pKa₂ : 8.18（ピペラジンの4位の窒素、滴定法）

(6) 分配係数

n-オクタノール - Sørensen 緩衝液（pH7.0） ; 0.553（37℃）

(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²⁾

液性（pH）	中性及び塩基性水溶液では安定である。
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。

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) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	有効成分	剤形	色	外形			刻印	
				大きさ (mm)	厚さ (mm)	重さ (mg)		
レボフロキサシン錠 250mg「DSEP」	1錠中 レボフロキサシン水和物 (日局) 256.2mg (レボフロキサシン として 250mg)	フィルム コーティング錠 (楕円形・割線入)	黄色		13.7(長径) 6.6(短径)	約 4.1	約 337	レボフロ 250 EP
レボフロキサシン錠 500mg「DSEP」	1錠中 レボフロキサシン水和物 (日局) 512.5mg (レボフロキサシン として 500mg)	フィルム コーティング錠 (楕円形・割線入)	うすい だいだい色		16.2(長径) 7.9(短径)	約 5.6	約 674	レボフロ 500 EP
レボフロキサシン細粒 10%「DSEP」	1g 中 レボフロキサシン水和物 (日局) 102.5mg (レボフロキサシン として 100mg)	コーティング 細粒 (味はわずかに 甘い)	淡黄白色 ～黄白色	—			—	—

(2) 製剤の物性

レボフロキサシン細粒 10%「DSEP」

粒度分布

18号通過 全量

18号通過 30号残留 10%以下

(3) 識別コード

レボフロキサシン錠 250mg「DSEP」：レボフロ 250 EP

レボフロキサシン錠 500mg「DSEP」：レボフロ 500 EP

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

レボフロキサシン錠 250mg「DSEP」：1錠中に日本薬局方レボフロキサシン水和物 256.2mg

(レボフロキサシンとして 250mg) を含有

レボフロキサシン錠 500mg「DSEP」：1錠中に日本薬局方レボフロキサシン水和物 512.5mg

(レボフロキサシンとして 500mg) を含有

レボフロキサシン細粒 10%「DSEP」：細粒 1g 中に日本薬局方レボフロキサシン水和物 102.5mg

(レボフロキサシンとして 100mg) を含有

(2) 添加物

レボフロキサシン錠 250mg「DSEP」：

結晶セルロース、カルメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、フマル酸ステアリルナトリウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、マクロゴール 6000、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

IV. 製剤に関する項目

レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」：

結晶セルロース、カルメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、フマル酸ステアリルナトリウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、マクロゴール 6000. 黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄、カルナウバロウ
レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」：

乳糖水和物、タルク、トウモロコシデンプン、酸化チタン、軽質無水ケイ酸、シヨ糖脂肪酸エステル、アスパルテーム (L-フェニルアラニン化合物)、香料、その他 2 成分

(3)その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

最終包装製品を用いたクラビット®錠、細粒の長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、3 年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」、レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」及びレボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」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。

レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」、錠 500mg 「DSEP」

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果	測定項目	
長期保存試験	25℃、60%RH	プラスチックボトル包装、PTP 包装	36 ヶ月	変化なし	性状 確認試験 製剤均一性 溶出性 含量	
加速試験	40℃、75%RH	プラスチックボトル包装、PTP 包装	6 ヶ月	変化なし	純度試験 乾燥減量 硬度 微生物限度試験	
苛酷試験	温度	50℃	PTP 包装	3 ヶ月	変化なし	性状 確認試験
	湿度	30℃、92%RH	シャーレ開放	2 ヶ月	乾燥減量増加 硬度低下	溶出性 含量 純度試験
	光	D65 ランプ	シャーレ開放	120 万 lx・hr	変化なし	乾燥減量 硬度

レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果	測定項目
長期保存試験	25℃、60%RH	プラスチックボトル包装、H.S.包装	36 ヶ月	変化なし	性状（外観） 確認試験 純度試験（類縁物質） 製剤均一性 溶出性 粒度 含量 乾燥減量 微生物限度試験

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

レボフロキサシン細粒 10%「DSEP」（5g）と配合が予想される 27 薬剤（1 回量の最大）について配合変化試験を実施した。

以下、薬剤名は試験実施当時のものである。

(1) 試験方法

1) 試験項目

外観（色調、流動性）、吸湿増量及び含量。

2) 保存条件

30℃、92%RH、7、14、30 日

25℃、75%RH、7、14、30 日

D65 ランプ（25℃、3500 lx）、10 万 lx・hr

3) 配合変化試験に使用した薬剤

アストミン散 10%、アスベリン散 10%、ゲファニール細粒 10%、日本薬局方ジアスターゼ、セルベックス細粒 10%、タカヂアスターゼ、トランサミン散 50%、トロペロン細粒 1%、ノイエル細粒 40%、日本薬局方パンクレアチン、ビオフェルミン R、ビスルボン細粒、フェノバルビタール散 10%、プレドニゾロン散 1%、ポンタール散、マーズレン-S 顆粒、ムコダイン細粒、メジコン散 10%、メプチン顆粒 0.01%、レフトーゼ顆粒 10%、ロキソニン細粒、ロペミン細粒 0.1%、アズノール細粒（1%）、ムコソルバン DS3%、PL 顆粒、カロナール細粒 50%及びペレックス顆粒

(2) 試験結果

30℃、92%RH では、日本薬局方ジアスターゼ、タカヂアスターゼ及びペレックス顆粒の 3 薬剤で流動性に変化が認められた。ただし、いずれも単独の薬剤で、色調、流動性又は吸湿増量に変化が認められた。また、D65 ランプでは、フェノバルビタール散 10%で色調に変化が認められ、単独の薬剤でも同様に色調の変化が認められた。なお、その他の薬剤並びにその他の保存条件では、色調、流動性、吸湿増量及び含量にいずれも変化が認められなかった。

変化が認められた薬剤

配合薬剤	保存条件	試験項目と変化の内容
日本薬局方ジアスターゼ	30℃、92%RH	流動性：開始時と比較して変化が認められた（14、30 日）※1
タカヂアスターゼ	30℃、92%RH	流動性：開始時と比較して変化が認められた（14、30 日）※1
ペレックス顆粒	30℃、92%RH	流動性：開始時と比較して変化が認められた（30 日）※2
フェノバルビタール散 10%	D65 ランプ 25℃、3500lx	色調：開始時と比較して変化が認められた（10 万 lx・hr）※3

※1：単独の薬剤で、色調、流動性及び吸湿増量に変化が認められた。

※2：単独の薬剤で、流動性及び吸湿増量に変化が認められた。

※3：単独の薬剤で、色調に変化が認められた。

7. 溶出性

公的溶出試験

レボフロキサシン錠 250mg「DSEP」、レボフロキサシン錠 500mg「DSEP」及びレボフロキサシン細粒 10%「DSEP」は、日本薬局方医薬品各条に定められたレボフロキサシン錠、レボフロキサシン細粒の溶出規格に適合していることが確認されている。

IV. 製剤に関する項目

溶出規格				
表示量	試験液	回転数	規定時間	溶出率
250mg	日本薬局方溶出試験第2液	50rpm	30分	80%以上
500mg	日本薬局方溶出試験第2液	50rpm	30分	80%以上
100mg/g	水	75rpm	90分	70%以上

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

<レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」、錠 500mg 「DSEP」>

日本薬局方レボフロキサシン錠の確認試験法による。

<レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」>

日本薬局方レボフロキサシン細粒の確認試験法による。

10. 製剤中の有効成分の定量法

<レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」、錠 500mg 「DSEP」>

日本薬局方レボフロキサシン錠の定量法による。

<レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」>

日本薬局方レボフロキサシン細粒の定量法による。

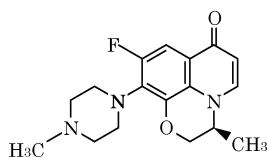
11. 力 価

該当しない

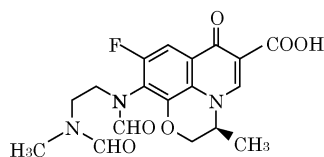
12. 混入する可能性のある夾雑物

製剤中に、0.1%以上混入する可能性のある類縁物質は光学異性体が検出されている。

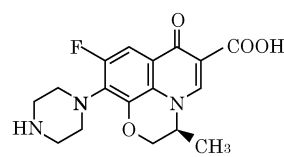
また、レボフロキサシン水和物の強制分解による生成物としては、以下の化合物が検出されている。



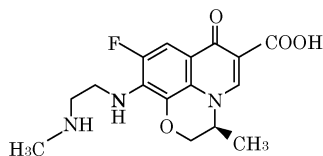
酸分解物脱炭酸体



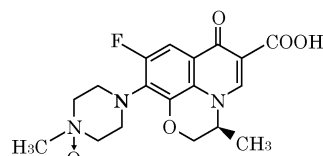
光分解物-1 ジホルミン体



光分解物-2 脱メチル体



光分解物-3 ジアミン体



光分解物-4 Nオキサイド体

13.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

14.その他

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、淋菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、炭疽菌、結核菌、大腸菌、赤痢菌、サルモネラ属、チフス菌、パラチフス菌、シトロバクター属、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、プロビデンシア属、ペスト菌、コレラ菌、インフルエンザ菌、緑膿菌、アシネトバクター属、レジオネラ属、ブルセラ属、野兔病菌、カンピロバクター属、ペプトストレプトコッカス属、アクネ菌、Q熱リケッチア（コクシエラ・ブルネティ）、トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）、肺炎クラミジア（クラミジア・ニューモニエ）、肺炎マイコプラズマ（マイコプラズマ・ニューモニエ）

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、ざ瘡（化膿性炎症を伴うもの）、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、前立腺炎（急性症、慢性症）、精巣上体炎（副睾丸炎）、尿道炎、子宮頸管炎、胆嚢炎、胆管炎、感染性腸炎、腸チフス、パラチフス、コレラ、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、炭疽、ブルセラ症、ペスト、野兔病、肺結核及びその他の結核症、Q熱

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、感染性腸炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」³⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

2. 用法及び用量

通常、成人にはレボフロキサシンとして1回 500mgを1日1回経口投与する。なお、疾患・症状に応じて適宜減量する。

肺結核及びその他の結核症については、原則として他の抗結核薬と併用すること。

腸チフス、パラチフスについては、レボフロキサシンとして1回 500mgを1日1回14日間経口投与する。

〈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. 本剤の500mg1日1回投与は、100mg1日3回投与に比べ耐性菌の出現を抑制することが期待できる。本剤の投与にあたり、用量調節時を含め錠 250mg 及び細粒 10%を用いる場合も分割投与は避け、必ず1日量を1回で投与すること（「薬効薬理」の項参照）。
3. 腸チフス、パラチフスについては、レボフロキサシンとして（注射剤より本剤に切り替えた場合には注射剤の投与期間も含め）14日間投与すること。
4. 炭疽の発症及び進展の抑制には、欧州医薬品庁（EMA）が60日間の投与を推奨している。
5. 長期投与が必要となる場合には、経過観察を十分に行うこと。

6. 腎機能低下患者では高い血中濃度が持続するので、下記の用法・用量を目安として、必要に応じて投与量を減じ、投与間隔をあけて投与することが望ましい（「薬物動態」の項参照）。

腎機能 Ccr(mL/min)	用法・用量
$20 \leq \text{Ccr} < 50$	初日 500mg を 1 回、2 日目以降 250mg を 1 日に 1 回投与する。
$\text{Ccr} < 20$	初日 500mg を 1 回、3 日目以降 250mg を 2 日に 1 回投与する。

3. 臨床成績

(1)臨床データパッケージ

該当資料なし

(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

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

ピリドンカルボン酸系化合物:シタフロキサシン(STFX)、オフロキサシン(OFLX)、ノルフロキサシン(NFLX)、塩酸シプロフロキサシン(CPFX)、ロメフロキサシン塩酸塩(LFLX)、トスフロキサシントシル酸塩水和物(TFLX)等

2. 薬理作用

(1)作用部位・作用機序

本剤は、ラセミ体であるオフロキサシンの一方の光学活性 *S*-($-$)体であるレボフロキサシンの水和物を含有するニューキノロン系経口抗菌剤である。

1) 抗菌作用⁴⁻¹⁴⁾

レボフロキサシンは嫌気性菌を含むグラム陽性菌群及びグラム陰性菌群に対し、広範囲な抗菌スペクトルを有し、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、ならびに大腸菌、クレブシエラ属、セラチア属、プロテウス族、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属を含む腸内細菌科、緑膿菌を含むブドウ糖非発酵グラム陰性菌群、淋菌、インフルエンザ菌、レジオネラ属、ペプトストレプトコッカス属、アクネ菌などに強力な抗菌活性を示した。また、炭疽菌、結核菌、ペスト菌、ブルセラ属、野兔病菌、Q熱リケッチア(コクシエラ・ブルネティ)、トラコーマクラミジア(クラミジア・トラコマティス)、肺炎クラミジア(クラミジア・ニューモニエ)、肺炎マイコプラズマ(マイコプラズマ・ニューモニエ)に対しても抗菌力を示した。

実験のマウス感染防御試験及び感染治療試験において、本剤は優れた防御及び治療効果を示した。

2) 作用機序^{4,6,15-20)}

本剤は、細菌のDNAジャイレース及びトポイソメラーゼIVに作用し、DNA複製を阻害する。DNAジャイレース及びトポイソメラーゼIV阻害活性はオフロキサシンの約2倍の強さであった。

抗菌作用は殺菌的であり、MIC付近の濃度で溶菌が認められた。

3) 耐性化に及ぼす用法・用量の影響²¹⁾

*In vitro*でヒト血中濃度推移を培地中に再現したモデルにおいて、500mg1日1回投与は100mg1日3回投与と比較して、肺炎球菌及び大腸菌の耐性菌出現を抑制した。

(2)薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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²²⁾

感染の部位、原因菌の感受性に依存する。

(2)最高血中濃度到達時間

健康成人男子単回投与時（1錠）

レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」：0.99±0.54 時間（n=40）

(3)臨床試験で確認された血中濃度

1) 健康成人

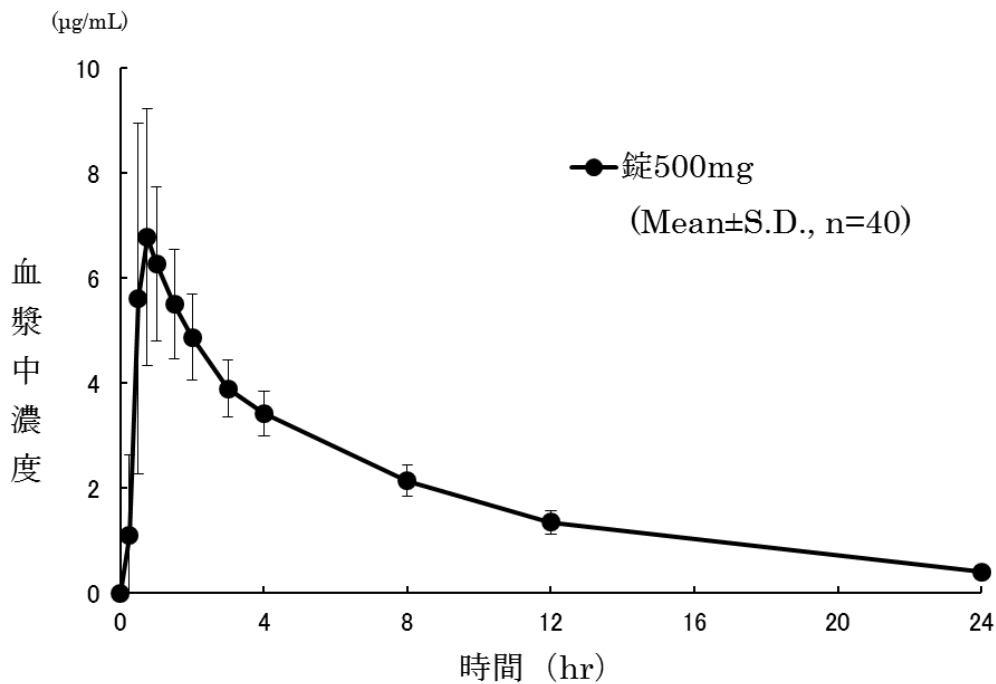
国内において健康成人にレボフロキサシン 500mg 錠 1 錠を空腹時に単回経口投与した場合、血漿中濃度推移及び薬物動態パラメータは次の通りであった。

レボフロキサシン 500mg 錠（1錠単回投与）

薬物動態パラメータ

	AUC _{0-72hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
レボフロキサシン 500mg 錠	50.86±6.46	8.04±1.98	0.99±0.54	7.89±1.04

(ノンコンパートメント解析、Mean±S.D., n=40)



血漿中レボフロキサシン濃度推移

＜参考＞点滴静注との比較

国内において健康成人にレボフロキサシン 500mg を単回経口投与した場合又は 60 分間で単回点滴静注した場合、薬物動態パラメータは、次のとおりであった。

(ノンコンパートメント解析、n=48、Mean±S.D.)

	被験者数	T _{max} (hr)	C _{max} (μg/mL)	t _{1/2} (hr)	AUC _{0-72hr} (μg・hr/mL)
500mg 経口投与	40	0.99±0.54	8.04±1.98	7.89±1.04	50.86±6.46
500mg 点滴静注	8	1.00±0.00	9.79±1.05	8.05±1.54	51.96±4.96

2) 腎機能障害患者

国内においてクレアチニンクリアランス値 (Ccr) により群分けし、レボフロキサシン 500mg を空腹時単回経口投与した場合、腎機能の低下に伴い血漿中濃度の生物学的半減期の延長、尿中濃度の低下及び尿中排泄率の低下が認められた。

(ノンコンパートメント解析、n=22、Mean±S.D.)

Ccr (mL/min)	患者数	t _{1/2} (hr)	AUC _{0-72hr} (μg・hr/mL)	尿中排泄率(%) (0~48hr)
50 ≤ Ccr	11	9.17 ± 1.28	81.74 ± 20.78	80.02 ± 6.08
20 ≤ Ccr < 50	7	15.88 ± 3.79	150.96 ± 18.03	56.39 ± 13.51
Ccr < 20	4	33.69 ± 14.57	250.66 ± 58.30	28.28 ± 11.83

(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

「VII.1.(3)臨床試験で確認された血中濃度 <参考>点滴静注との比較」の項を参照

(4)消失速度定数

該当資料なし

(5)クリアランス²²⁾

9.97±1.28 (L/h) (健康成人男子 40 例、500mg 錠 1 錠、空腹時単回経口投与)

(6)分布容積²²⁾

113.49±22.64 (L) (健康成人男子 40 例、500mg 錠 1 錠、空腹時単回経口投与)

(7)血漿蛋白結合率

レボフロキサシン 1~50 μg/mL の *in vitro* でのヒト血漿蛋白結合率は、限外ろ過法で約 26~36%であった。

3. 吸 収²²⁾

吸収部位

該当資料なし

＜参考：動物データ＞

¹⁴C-レボフロキサシン 5、20mg/kg をラットの消化管各部位に注入して吸収部位を検討した結果、¹⁴C-レボフロキサシンは小腸上部から主に吸収され、胃での吸収は極めて少なかった。

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

＜参考＞

「Ⅷ.10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)」の項を参照

(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

日本人における成績

患者にレボフロキサシンとして 500mg を単回経口投与した場合、口蓋扁桃（投与後 2.6～4.1 時間で対血漿濃度比：1.42～1.89）、前立腺（投与後 2.9～4.0 時間で対血漿濃度比：0.76～1.58）、耳漏（投与後 1～4 時間で対血漿濃度比：0.40～0.88）、上顎洞粘膜（投与後 2.3～5.8 時間で対血漿濃度比：0.89～2.29）、鼻汁（投与後 1～4 時間で対血漿濃度比：0.11～1.39）であり、高い移行性を示した。

なお、健康成人又は患者にレボフロキサシン水和物として 100mg 又は 200mg を単回経口投与した場合、皮膚（投与後 0.8～4 時間で対血清濃度比：平均 1.1）、唾液（対血清濃度比：約 0.7）、口蓋扁桃（対血清濃度比：約 2）、喀痰（対血清濃度比：0.8～1.1）、前立腺（投与後 1～6 時間で対血清濃度比：0.8～1.9）、前立腺液（投与後 1.5 時間で対血清濃度比：約 0.6）、胆嚢（対血清濃度比：0.3～4.2）、房水（投与後 2～9 時間で対血清濃度比：0.14～0.31）、涙液（100mg 投与で最高濃度 0.61 μ g/mL）、耳漏（投与後 2 時間で対血清濃度比：0.6）、上顎洞粘膜（投与後 2～6 時間で対血清濃度比：1.1～1.9）、女性性器（100mg 投与後 3～4 時間で 0.6～2.1 μ g/g）であった。

5. 代 謝

(1)代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

＜参考＞

1) 尿中代謝物

国内において健康成人にレボフロキサシン水和物として 100mg を単回経口投与した場合、投与後 24 時間までの累積尿中排泄率は、未変化体が投与量の 79.6%、脱メチル体が 1.75%、*N*-オキサイドが 1.63%であった。

2) 胆汁中代謝物²³⁾

国内において患者にレボフロキサシン水和物として 100mg 単回経口投与後 2～3.5 時間での胆嚢胆汁中グル

VII. 薬物動態に関する項目

クロン酸抱合体濃度は 0.05~0.44 $\mu\text{g/mL}$ であり、未変化体に対する割合は 3.9~25.8%であった。また、胆管胆汁中にもほぼ同程度のグルクロン酸抱合体が認められた。

(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²²⁾

脱メチル体はレボフロキサシンと菌種によって同等ないし 1/64 倍の抗菌活性を示し、*N*-オキサイドはグラム陰性菌の一部に対して弱い活性を示した。一方、脱炭酸体には抗菌活性はほとんど認められなかった。

(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

主に腎臓である。（「VII.5.(1)代謝部位及び代謝経路」の項 参照）

健康成人にレボフロキサシン水和物 100mg を単回投与し、定量的な腎排泄挙動の解析を行った。その結果、尿細管最大分泌速度 (V_{\max}) は 0.42 $\mu\text{mol/min}$ 、Michaelis 定数 (K_m) は 0.52 $\mu\text{mol/L}$ 、尿細管再吸収率 (R) は 0.15 であった。したがって、レボフロキサシンは糸球体ろ過及び能動的尿細管分泌過程により排泄されるとともに、一部は尿細管より再吸収されることが示された。²⁴⁾

(2)排泄率

国内において健康成人にレボフロキサシンとして 500mg を単回経口投与した場合、投与後 0~24 時間の尿中濃度は、138.8~877.7 $\mu\text{g/mL}$ であり、投与後 72 時間までに投与量の 83.76%が未変化体として尿中に排泄された。

また、健康成人にレボフロキサシン水和物として 200mg を食後投与した場合、糞中には投与後 72 時間で投与量の 3.9%が未変化体として排泄された。²⁵⁾

(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

血液透析又は CAPD は、体内からのレボフロキサシン除去への影響は少ないと報告があり^{25,26)}、透析後の追加投与は不要と考えられる。

(1)血液透析²⁶⁾

血液透析患者計 23 例にレボフロキサシン水和物を投与、4 時間透析後の平均除去率は 36.9%であった。レボフロキサシン水和物 100mg 単回投与時の半減期：非透析時 55.4 \pm 19.8 時間、透析時 5.9 \pm 1.9 時間、2 種類のダイアライザーFB-130U（セルローストリアセテート膜）と PS-1.3UW（ポリスルホン膜）の間で有意な差は認められず、レボフロキサシンの透析性についてダイアライザーによる差異はないものと思われた。

(2)腹膜透析²⁷⁾

腹膜透析患者 6 例（男性 3 例、女性 3 例、50 歳～70 歳、慢性、糖尿病性腎糸球体硬化症、高血圧性腎硬化症）

透析期間：51±26.6 カ月（26～96 カ月）

クレアチニンクリアランス値：平均 5.4±0.36mL/min（4.8～5.8mL/min）

レボフロキサシン水和物投与量：初日…100mg×3 回/日（食後）、2 日目以降…100mg×1 回/日（朝）

結果：全身クリアランス（CL_{tot}/F）：22.6±7.34mL/min

腹膜クリアランス（CL_{pd}）：3.42±0.831mL/min

分布容積（Vd/F）：76.3±21.9mL/min

血漿遊離画分（fuB）：69.7±13.76%

結論：腹膜透析患者において、本剤の腹膜クリアランスは全身クリアランスの約 17%であった。

(3)直接血液灌流

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）

1. 本剤の成分又はオフロキサシンに対し過敏症の既往歴のある患者
2. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
3. 小児等（「小児等への投与」及び「その他の注意」の項参照）

ただし、妊娠又は妊娠している可能性のある婦人及び小児等に対しては、炭疽等の重篤な疾患に限り、治療上の有益性を考慮して投与すること。

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

＜効能・効果に関連する使用上の注意＞

咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、感染性腸炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」³⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

＜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. 本剤の 500mg1 日 1 回投与は、100mg1 日 3 回投与に比べ耐性菌の出現を抑制することが期待できる。本剤の投与にあたり、用量調節時を含め錠 250mg 及び細粒 10%を用いる場合も分割投与は避け、必ず 1 日量を 1 回で投与すること（「薬効薬理」の項参照）。
3. 腸チフス、パラチフスについては、レボフロキサシンとして（注射剤より本剤に切り替えた場合には注射剤の投与期間も含め）14 日間投与すること。
4. 炭疽の発症及び進展の抑制には、欧州医薬品庁（EMA）が 60 日間の投与を推奨している。
5. 長期投与が必要となる場合には、経過観察を十分に行うこと。
6. 腎機能低下患者では高い血中濃度が持続するので、下記の用法・用量を目安として、必要に応じて投与量を減じ、投与間隔をあけて投与することが望ましい（「薬物動態」の項参照）。

腎機能 Ccr (mL/min)	用法・用量
20 ≤ Ccr < 50	初日 500mg を 1 回、2 日目以降 250mg を 1 日に 1 回投与する。
Ccr < 20	初日 500mg を 1 回、3 日目以降 250mg を 2 日に 1 回投与する。

5. 慎重投与内容とその理由

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 高度の腎機能障害のある患者 [高い血中濃度の持続が認められている（「用法・用量に関連する使用上の注意」、「薬物動態」の項参照）。]
- (2) てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者 [痙攣を起こすことがある。]
- (3) キノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者
- (4) 重篤な心疾患（不整脈、虚血性心疾患等）のある患者 [QT 延長を起こすことがある。]
- (5) 重症筋無力症の患者 [症状を悪化させることがある。]
- (6) 大動脈瘤又は大動脈解離を合併している患者、大動脈瘤又は大動脈解離の既往、家族歴若しくはリスク因子（マルファン症候群等）を有する患者 [海外の疫学研究において、フルオロキノロン系抗菌薬投与後に大動脈瘤及び大動脈解離の発生リスクが増加したとの報告がある（「重要な基本的注意」、「重大な副作用」の項参照）。]
- (7) 高齢者 [臍障害があらわれやすいとの報告がある（「高齢者への投与」の項参照）。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

2. 重要な基本的注意

- (1) 他の抗結核薬との併用により、重篤な肝障害があらわれることがあるので、併用する場合は定期的に肝機能検査を行うこと。
- (2) 意識障害等があらわれることがあるので、自動車の運転等、危険を伴う機械の操作に従事する際には注意するよう患者に十分に説明すること。
- (3) 大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、観察を十分に行うとともに、腹部、胸部又は背部に痛み等の症状があらわれた場合には直ちに医師の診察を受けるよう患者に指導すること。大動脈瘤又は大動脈解離を合併している患者、大動脈瘤又は大動脈解離の既往、家族歴若しくはリスク因子を有する患者では、必要に応じて画像検査の実施も考慮すること（「慎重投与」、「重大な副作用」の項参照）。

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

3. 相互作用

併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
フェニル酢酸系又はプロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛薬 フルルビプロフェン等	痙攣を起こすおそれがある。	中枢神経における GABA _A 受容体への結合阻害が増強されると考えられている。
アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸薬等、鉄剤	本剤の効果が減弱されるおそれがある。これらの薬剤は本剤投与から 1～2 時間後に投与する。	これらの薬剤とキレートを形成し、本剤の吸収が低下すると考えられている。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

クマリン系抗凝固薬 ワルファリン	ワルファリンの作用を増強し、プロトロンビン時間の延長が認められたとの報告がある。	ワルファリンの肝代謝を抑制、又は蛋白結合部位での置換により遊離ワルファリンが増加する等と考えられている。
QT 延長を起こすことが知られている薬剤 デラマニド等	QT 延長を起こすおそれがある。	併用により QT 延長作用が相加的に増加するおそれがある。
副腎皮質ホルモン剤（経口剤及び注射剤） プレドニゾン ヒドロコルチゾン 等	臍障害のリスクが増大するとの報告がある。これらの薬剤との併用は、治療上の有益性が危険性を上回る場合のみとすること。	機序不明

8. 副作用

(1)副作用の概要

4. 副作用

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

4. 副作用

(1)重大な副作用

- 1) ショック（0.01%未満）、アナフィラキシー（頻度不明^{注1)}）：ショック、アナフィラキシー（初期症状：紅斑、悪寒、呼吸困難等）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し、適切な処置を行うこと。
- 2) 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明^{注1)}）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明^{注1)}）：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群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し、適切な処置を行うこと。
- 3) 痙攣（0.01%未満）：痙攣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し、適切な処置を行うこと。
- 4) QT 延長（頻度不明^{注1)}）、心室頻拍（Torsades de pointes を含む）（頻度不明^{注1)}）：QT 延長、心室頻拍（Torsades de pointes を含む）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し、適切な処置を行うこと。
- 5) 急性腎障害（0.01%未満）、間質性腎炎（頻度不明^{注1)}）：急性腎障害、間質性腎炎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し、適切な処置を行うこと。
- 6) 劇症肝炎（頻度不明^{注1)}）、肝機能障害（0.01%未満）、黄疸（頻度不明^{注1)}）：劇症肝炎、肝機能障害、黄疸（初期症状：嘔気・嘔吐、食欲不振、倦怠感、そう痒等）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し、適切な処置を行うこと。
- 7) 汎血球減少症（頻度不明^{注1)}）、無顆粒球症（頻度不明^{注1)}）、溶血性貧血（頻度不明^{注1)}）、血小板減少（0.01%未満）：汎血球減少症、無顆粒球症（初期症状：発熱、咽頭痛、倦怠感等）、ヘモグロビン尿等を伴う溶血性貧血、血小板減少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し、適切な処置を行うこと。

- 8) **間質性肺炎（頻度不明^{注1)}）、好酸球性肺炎（頻度不明^{注1)}）**：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎、好酸球性肺炎があらわれることがあるので、このような症状が認められた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤投与等の適切な処置を行うこと。
- 9) **偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明^{注1)}）**：偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがあるので、腹痛、頻回の下痢等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。
- 10) **横紋筋融解症（頻度不明^{注1)}）**：筋肉痛、脱力感、CK（CPK）上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等を特徴とし、急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症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し、適切な処置を行うこと。
- 11) **低血糖（頻度不明^{注1)}）**：低血糖があらわれることがあり、低血糖性昏睡に至る例も報告されているので、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し、適切な処置を行うこと。糖尿病患者（特にスルホニルウレア系薬剤やインスリン製剤等を投与している患者）、腎機能障害患者、高齢者であらわれやすい。
- 12) **アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害（頻度不明^{注1)}）**：アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害があらわれることがあるので、腱周辺の痛み、浮腫、発赤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。臓器移植の既往のある患者であらわれやすい。
- 13) **錯乱、せん妄、抑うつ等の精神症状（頻度不明^{注1)}）**：錯乱、せん妄、抑うつ等の精神症状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し、適切な処置を行うこと。
- 14) **過敏性血管炎（頻度不明^{注1)}）**：過敏性血管炎があらわれることがあるので、発熱、腹痛、関節痛、紫斑、斑状丘疹や、皮膚生検で白血球破碎性血管炎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。
- 15) **重症筋無力症の悪化（頻度不明^{注1)}）**：重症筋無力症の患者で症状の悪化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し、適切な処置を行うこと。
- 16) **大動脈瘤、大動脈解離（頻度不明^{注2)}）**：大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと（「慎重投与」、「重要な基本的注意」の項参照）。
- 17) **末梢神経障害（頻度不明^{注1)}）**：末梢神経障害があらわれることがあるので、しびれ、筋力低下、痛み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。

注 1) 自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明

注 2) 海外での疫学研究における報告のため頻度不明

(3)その他の副作用

4. 副作用			
(2) その他の副作用			
下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。			
	0.1～0.5%未満	0.1%未満	頻度不明 ^{注1)}
過 敏 症	発疹	そう痒症、蕁麻疹、光線過敏症	
精神神経系	不眠、めまい、頭痛	傾眠、しびれ感、振戦、ぼんやり、幻覚、意識障害	錐体外路障害
泌 尿 器		クレアチニン上昇、血尿、BUN 上昇、尿蛋白陽性、頻尿、尿閉	無尿
肝 臓	AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、LDH 上昇、肝機能異常	ALP 上昇、 γ -GTP 上昇、血中ビリルビン増加	
血 液	白血球数減少、好酸球数増加	好中球数減少、リンパ球数減少、血小板数減少、貧血	
消 化 器	悪心、嘔吐、下痢、腹部不快感、腹痛	食欲不振、消化不良、口渇、腹部膨満、胃腸障害、便秘、口内炎、舌炎	
感 覚 器		耳鳴、味覚異常、味覚消失、視覚異常	無嗅覚、嗅覚錯誤
循 環 器		動悸	低血圧、頻脈
そ の 他		CK (CPK) 上昇、関節痛 ^{注3)} 、胸部不快感、倦怠感、四肢痛、咽喉乾燥、尿中ブドウ糖陽性、高血糖、熱感、浮腫、筋肉痛、脱力感、発熱、関節障害、発汗	胸痛

注1) 自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明
 注3) 結核患者での使用において91例中4例(4.4%)に関節痛が認められたとの報告がある。

(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）

1. 本剤の成分又はオフロキサシンに対し過敏症の既往歴のある患者

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (3)キノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者

4. 副作用

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。

(1) 重大な副作用

- 1) ショック、（0.01%未満）アナフィラキシー（頻度不明^{注1)}）：ショック、アナフィラキシー（初期症状：紅斑、悪寒、呼吸困難等）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し、適切な処置を行うこと。
- 2) 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明^{注1)}）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群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し、適切な処置を行うこと。

注1) 自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明

4. 副作用

(2) その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.1～0.5%未満	0.1%未満	頻度不明 ^{注1)}
過 敏 症	発疹	そう痒症、蕁麻疹、光線過敏症	

注1) 自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明

9. 高齢者への投与

5. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄される（「薬物動態」の項参照）が、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので投与量ならびに投与間隔に留意し、慎重に投与すること（「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照）。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔オフロキサシンでヒト母乳中へ移行することが報告されている。〕

11. 小児等への投与

7. 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ので、投与しないこと（「その他の注意」の項参照）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

8. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

15. その他の注意

9. その他の注意

動物実験〔幼若犬、若い成犬（13ヵ月齢）、幼若ラット〕で関節異常が認められている。

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

レボフロキサシン錠 250mg「DSEP」、錠 500mg「DSEP」及び細粒 10%「DSEP」は薬理や毒性等を明らかにする基礎実験を実施していない。

本章における記載はクラビット錠 250mg、錠 500mg 及び細粒 10%のインタビューフォームから引用した。

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²⁸⁾

マウス、ラット、モルモット、ウサギ、ネコ、イヌを用いて中枢神経系、呼吸循環器系、自律神経系、消化器系、摘出臓器その他に及ぼす影響について検討した結果、臨床上特に問題となる著明な作用は認められなかった。

(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²⁹⁾

LD₅₀ 値

(mg/kg)

投与経路	動物種 性	マウス		ラット		イヌ	サル
		雄	雌	雄	雌	雌	雌
経口		1881	1803	1478	1507	—	>250
静脈内 ^{*1}		261	315	413	398	>195 ^{*2}	—

※1：無水物としての投与量、※2：概略の致死量

(2)反復投与毒性試験

1) 4 週間投与（ラット、サル）

ラット及びサルに 4 週間経口投与し、一般状態、血液、尿、臓器などを調べた。ラットに 50、200、800mg/kg 投与した場合、50 及び 200mg/kg では特に投与に関連する毒性学的変化は認められなかったが、800mg/kg では好中球の減少と随伴した骨髄 M/E の上昇（雌のみ）、肝の軽度な小葉辺縁性肝細胞空胞化、微少な肝細胞の過形成、肢の関節表面における軽度の変性性変化の兆候がみられた（最大無作用量 200mg/kg/日）。サルに 10、30、100mg/kg を 4 週間経口投与した場合、10 及び 30mg/kg では特に投与に関連する毒性学的変化は認められなかったが、100mg/kg では流涎、下痢、体重の軽度減少、尿 pH の低下が認められた（最大無作用量 30mg/kg/日）。

2) 26 週間投与（ラット、サル）³⁰⁾

ラット及びサルに 26 週間経口投与し、一般状態、血液、尿、臓器を調べた。ラットに 20、80、320mg/kg 投与した場合、20mg/kg では特に投与に関連する変化は認められなかったが、80 及び 320mg/kg では流涎、尿 pH の高値、盲腸重量の増加が認められた（最大無作用量 20mg/kg/日）。サルに 10、25、62.5mg/kg を 26 週間経口投与した結果、いずれの用量でも毒性学的変化は認められなかった（最大無作用量 62.5mg/kg/日）。

(3)生殖発生毒性試験³¹⁾

1) 妊娠前・妊娠初期（ラット）

ラット経口投与では10、60、360mg/kgの用量で雌雄の生殖能力、胎仔への影響は認められなかった。

2) 器官形成期（ラット、ウサギ）

ラット経口投与で10、90mg/kgの用量では胎仔に対する影響は認められなかったが、810mg/kgの用量で胎仔に発育抑制及び骨格変異の出現率の増加が認められた。しかし、いずれの用量においても催奇形作用は認められなかった。母動物において10、90、810mg/kgの用量で分娩、哺育に対する影響は認められなかった。また、ウサギ経口投与でも5、16、50mg/kgの用量で胚・胎仔致死作用、胎仔に対する発育抑制作用及び催奇形作用は認められなかった。

3) 周産期・授乳期（ラット）

ラット経口投与では10、60、360mg/kgの用量で母動物の分娩、哺育行動及び出生後の仔への影響は認められなかった。

(4)その他の特殊毒性

1) 抗原性（モルモット、マウス、ウサギ）³²⁾

モルモットでの全身性アナフィラキシー誘発性及び特異抗体産生の有無、マウスでのIgE抗体産生の有無及びウサギ特異抗体産生の有無について検討した。モルモット及びウサギにおいて、免疫原性及びアレルギー誘発原性を示さなかった。マウスにおいて免疫原性は示さなかったが、アレルギー誘発原性が認められた。このアレルギー誘発原性はレボフロキサシンの誘発用量（静脈内投与）を2.5mg/kg以下とした場合、認められなかった。

2) 変異原性（*in vitro*、マウス、ラット）³³⁾

*in vitro*及びマウスで検討した結果、チャイニーズ・ハムスター培養細胞を用いた染色体異常試験及び姉妹染色分体交換（SCE）試験では陽性の成績が得られたが、同じ指標をマウスで検討すると、小核試験及び骨髄SCE試験で陰性であった。さらに、復帰突然変異試験、突然変異誘発試験、HGPRT試験、ラット不定期DNA合成試験ならびに優性致死試験でも陰性であった。

3) がん原性（ラット）

混餌によるラット2年間がん原性試験では、腫瘍発生頻度、前癌病変数及び腫瘍の発現時期について投薬による影響は認められなかった。さらに、ラットを用いた多臓器二段階発がんモデルによるがん原性評価試験でも、腫瘍発生頻度及び前癌病変数の増加は認められず、多数の臓器に対する発がん促進作用を示さないことが明らかとなり、がん原性を持たないことが示唆された。

4) 腎に対する影響（ウサギ）³⁴⁾

ウサギに10日間経口投与し、腎の各種機能検査及び形態学的検査を行った結果、30、120mg/kgの用量で異常は認められなかった。

5) 眼に対する影響（ラット）³⁵⁾

ラットに2週間経口投与し、眼科的検査、眼の病理学的検査を行った結果、100mg/kgの用量で異常は認められなかった。

6) 聴器に対する影響（ラット）³⁵⁾

ラットに2週間経口投与し、聴覚検査、聴器の光頭的及び走査電頭的検査を行った結果、100mg/kgの用量で異常は認められなかった。

7) 関節に対する影響（イヌ、ラット）²²⁾

幼若イヌ（4ヵ月齢）、若い成熟イヌ（13ヵ月齢）に7日間経口投与し関節毒性を検討した結果、それぞれ10、40mg/kg以上の用量で関節軟骨の水疱及びびらんの形成が認められた。成熟イヌ（18ヵ月齢）に14日間静脈内投与した結果、30mg/kgで関節毒性は認められなかった。

幼若ラット（3～4週齢）に7日間経口投与し関節毒性を検討した結果、100mg/kgまでの用量では異常は認められなかったが、300mg/kg以上の用量で上腕骨滑車及び／又は大腿骨顆の関節軟骨に、肉眼的には水疱形成、組織学的には関節軟骨中間層の空洞形成が認められた。

8) 光毒性（マウス）³⁶⁾

マウスに単回経口投与し長波長紫外線（320～400nm）を24時間照射して耳介厚の変化を検討した結果、200mg/kgでは変化はなかったが、800mg/kgでは有意に増加した。

9) 腸管毒性（ラット）

ラットにレボフロキサシン水和物10及び50mgと乾燥水酸化アルミニウムゲル（40、200mg/kg）あるいは酸化マグネシウム（20、100mg/kg）を7日間併用経口投与しても腸管に対し有害な作用は認められなかった。

10) フェンブフェンとの相互作用（マウス）³⁷⁾

レボフロキサシン水和物100、200、400、800mg/kgとフェンブフェンの200、400mg/kgをマウスに単回併用経口投与し、急性毒性の相互作用を調べた結果、フェンブフェン400mg/kgと本剤800mg/kg（臨床最高用量の約200倍量）で強直性痙攣を示し呼吸停止により死亡した。

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

レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」、レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」：室温保存

レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」（H.S.）：室温保存

レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」（プラスチックボトル）：室温、遮光保存

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

該当資料なし

(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）

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

「Ⅷ.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」及び「Ⅷ.14.適用上の注意」の項を参照

(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

レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」：（プラスチックボトル）	100錠
（PTP）	100錠
	500錠
レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」：（プラスチックボトル）	100錠
（PTP）	50錠（5錠×10）
	100錠（5錠×20）
	500錠（5錠×100）
レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」：（プラスチックボトル）	100g
（H.S.）	2.5g×100

※：レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」は光による着色変化を防止するために H.S.（ヒートシール分包）は着色フィルム、ボトル包装はプラスチックボトル（着色）とした（なお、ボトル包装は開封後の品質保証を目的に、遮光保存表示をした）。

7. 容器の材質

レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」、錠 500mg 「DSEP」

プラスチックボトル包装：ポリプロピレン（PP）キャップ、高密度ポリエチレン（HDPE）プラスチック
ボトル

PTP 包装：ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔

レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」

プラスチックボトル包装：ポリプロピレン（PP）キャップ、環状オレフィンコポリマー（COC）プラスチック
ボトル（茶色）

H.S.包装：ポリエチレンテレフタレート（PET）、ポリエチレンラミネートフィルム（茶色）

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：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（第一三共株式会社）

クラビット点眼液 0.5%、クラビット点眼液 1.5%（参天製薬株式会社）

同効薬：シタフロキサシン、オフロキサシン、ノルフロキサシン、塩酸シプロフロキサシン、ロメフロキ
サシン塩酸塩、トスフロキサシントシル酸塩水和物等

9. 国際誕生年月日²⁾

1993 年 10 月

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
レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」	2014 年 8 月 15 日	22600AMX01118000
レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」	2014 年 8 月 15 日	22600AMX01119000
レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」	2014 年 8 月 15 日	22600AMX01120000

11. 薬価基準収載年月日

2014 年 12 月 12 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

○「効能又は効果」、「用法及び用量」の一部変更承認年月日：2015 年 8 月 24 日

追加・変更内容：

【効能・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、淋菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、炭疽菌、結核菌、大腸菌、赤痢菌、サルモネラ属、チフス菌、パラチフス菌、シトロバクター属、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、プロビデンシア属、ペスト菌、コレラ菌、インフルエンザ菌、緑膿菌、アシネトバクター属、レジオネラ属、ブルセラ属、野兔病菌、カンピロバクター属、ペプトストレプトコッカス属、アクネ菌、Q 熱リケッチア（コクシエラ・ブルネティ）、トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）、肺炎クラミジア（クラミジア・ニューモニエ）、肺炎マイコプラズマ（マイコプラズマ・ニューモニエ）

（_____：追加部分）

X. 管理的事項に関する項目

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、ざ瘡（化膿性炎症を伴うもの）、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、前立腺炎（急性症、慢性症）、精巣上体炎（副睾丸炎）、尿道炎、子宮頸管炎、胆嚢炎、胆管炎、感染性腸炎、腸チフス、パラチフス、コレラ、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、炭疽、ブルセラ症、ペスト、野兔病、肺結核及びその他の結核症、Q熱

【用法・用量】

通常、成人にはレボフロキサシンとして1回500mgを1日1回経口投与する。なお、疾患・症状に応じて適宜減量する。

肺結核及びその他の結核症については、原則として他の抗結核薬と併用すること。

腸チフス、パラチフスについては、レボフロキサシンとして1回500mgを1日1回14日間経口投与する。

(_____ : 追加部分)

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

本剤は厚生労働大臣の定める「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

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
レボフロキサシン錠 250mg 「DSEP」	123708501	6241013F2055	622370801
レボフロキサシン錠 500mg 「DSEP」	123709201	6241013F3051	622370901
レボフロキサシン細粒 10% 「DSEP」	123710801	6241013C2032	622371001

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) 中上博秋ほか：化学療法の領域 1994;10(6):1121-1127
- 2) (財)日本公定書協会編、医療用医薬品 品質情報集 2006;No.25:171
- 3) 厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 4) Une T, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1988;32(9):1336-1340
- 5) Tanaka M, et al. : J Antimicrob Chemother. 1990;26(5):659-666
- 6) Fujimoto T, et al. : Chemotherapy 1990;36:268-276
- 7) 五島瑛智子ほか：Chemotherapy 1992;40(S-3):14-26
- 8) 渡辺邦友ほか：Chemotherapy 1992;40(S-3):57-63
- 9) 西野武志ほか：Chemotherapy 1992;40(S-3):36-50
- 10) Frean JA, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1996;40(11):2646-2647
- 11) Ikäheimo I, et al. : J Antimicrob Chemother. 2000;46(2):287-290
- 12) Trujillano-Martin I, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1999;43(1):194-195
- 13) Maurin M, et al. : J Antimicrob Chemother. 1997;39(6):725-730
- 14) 社内資料：新鮮臨床分離結核菌（多剤耐性結核菌を含む）に対する抗菌活性
- 15) Imamura M, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1987;31(2):325-327
- 16) Hoshino K, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1991;35(2):309-312
- 17) Hoshino K, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1994;38(11):2623-2627
- 18) Tanaka M, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1991;35(7):1489-1491
- 19) Tanaka M, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1997;41(11):2362-2366
- 20) Tanaka M, et al. : Arzneimittelforschung 1989;39(II)(7):750-754
- 21) 神田裕子ほか：日本化学療法学会雑誌 2009;57(1):1-14
- 22) 日本薬局方医薬品情報 2011;2170, じほう
- 23) 谷村 弘ほか：Jpn J Antibiot. 1992;45(5):557-568
- 24) 神谷 晃ほか：Chemotherapy 1992;40(Suppl 3):196-202
- 25) Nakashima M, et al. : 臨床薬理 1992;23(2):515-520
- 26) 梅田 優ほか：日本透析医学会雑誌 1997;30(2):109-115
- 27) Kanamori M, et al. : 臨床薬理 2001;32(3):91-99
- 28) Takasuna K, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:408-418
- 29) Kato M, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:365-366
- 30) Kato M, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:367-373
- 31) Watanabe T, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:374-377
- 32) Wagai N, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:385-389
- 33) Shimada H, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:378-385
- 34) Inage F, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:395-397
- 35) Nomura M, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:398-403
- 36) Wagai N, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:404-405
- 37) Furuhashi K, et al. : Arzneimittelforschung 1992;42(I)3a:406-408

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〕
第一三共エスファ株式会社 お客様相談室
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1
TEL:0120-100-601