医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

処方箋医薬品注)

広範囲経口抗菌製剤

日本薬局方 レボフロキサシン錠

レボフロキサシン錠250mg「CH」
レボフロキサシン錠500mg「CH」

Levofloxacin Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品　注）注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠 250mg： 1 錠中　日局　レボフロキサシン水和物 256.2mg を含有 （レボフロキサシンとして 250mg） 錠 500mg： 1 錠中　日局　レボフロキサシン水和物 512.5mg を含有 （レボフロキサシンとして 500mg）
一般名	和名：レボフロキサシン水和物 洋名：Levofloxacin Hydrate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2014 年　8 月 15 日 薬価基準収載年月日：2014 年 12 月 12 日 販 売 開 始 年 月 日：2014 年 12 月 12 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社　お客さま相談室 TEL 0120-893-170　FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/

本 IF は 2025 年 6 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

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

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要　－日本病院薬剤師会－

（2020 年 4 月改訂）

1．医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として，医療用医薬品添付文書（以下，添付文書）がある．医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には，添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり，製薬企業の医薬情報担当者（以下，MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている．この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下，ＩＦと略す）が誕生した．

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

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

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

2．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し，医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な，医薬品の品質管理のための情報，処方設計のための情報，調剤のための情報，医薬品の適正使用のための情報，薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として，日病薬が記載要領を策定し，薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる．

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し，一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される．ただし，製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はＩＦの記載事項とはならない．言い換えると，製薬企業から提供されたＩＦは，利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに，必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている．

ＩＦの提供は電子データを基本とし，製薬企業での製本は必須ではない．

3．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは，ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている．

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってＩＦを作成・提供するが，ＩＦの原点を踏まえ，医療現場に不足している情報やＩＦ作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ，ＩＦの利用性を高める必要がある．また，随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては，ＩＦが改訂されるまでの間は，製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等，あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに，ＩＦの使用にあたっては，最新の添付文書をＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある．

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5．臨床成績」や「XII．参考資料」，「XIII．備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり，その取り扱いには十分留意すべきである.

4．利用に際しての留意点

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

目次

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

Ⅱ．名称に関する項目……3
1．販売名……3
(1)和名……3
(2)洋名……3
(3)名称の由来……3
2．一般名……3
(1)和名（命名法）……3
(2)洋名（命名法）……3
(3)ステム（ｓｔｅｍ）……3
3．構造式又は示性式……3
4．分子式及び分子量……3
5．化学名（命名法）又は本質……3
6．慣用名、別名、略号、記号番号……4

Ⅲ．有効成分に関する項目……5
1．物理化学的性質……5
(1)外観・性状……5
(2)溶解性……5
(3)吸湿性……5
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点……5
(5)酸塩基解離定数……5
(6)分配係数……5
(7)その他の主な示性値……5
2．有効成分の各種条件下における安定性……5
3．有効成分の確認試験法、定量法……5

Ⅳ．製剤に関する項目……6
1．剤形……6
(1)剤形の区別……6
(2)製剤の外観及び性状……6
(3)識別コード……6
(4)製剤の物性……6
(5)その他……6
2．製剤の組成……6
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤……6
(2)電解質等の濃度……7
(3)熱量……7
3．添付溶解液の組成及び容量……7
4．力価……7
5．混入する可能性のある夾雑物……7
6．製剤の各種条件下における安定性……8
7．調製法及び溶解後の安定性……9
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）……9
9．溶出性……9
10．容器・包装……14
(1)注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報……14
(2)包装……14
(3)予備容量……14
(4)容器の材質……14
11．別途提供される資材類……14
12．その他……14

Ⅴ．治療に関する項目……15
1．効能又は効果……15
2．効能又は効果に関連する注意……15
3．用法及び用量……15
(1)用法及び用量の解説……15
(2)用法及び用量の設定経緯・根拠……16
4．用法及び用量に関連する注意……16
5．臨床成績……16
(1)臨床データパッケージ……16
(2)臨床薬理試験……16
(3)用量反応探索試験……16
(4)検証的試験……16
1)有効性検証試験……16
2)安全性試験……21
(5)患者・病態別試験……21
(6)治療的使用……21
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……21
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……22
(7)その他……22

Ⅵ．薬効薬理に関する項目……23
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群……23
2．薬理作用……23
(1)作用部位・作用機序……23
(2)薬効を裏付ける試験成績……23
(3)作用発現時間・持続時間……23

Ⅶ．薬物動態に関する項目……24
1．血中濃度の推移……24
(1)治療上有効な血中濃度……24
(2)臨床試験で確認された血中濃度……24
(3)中毒域……24
(4)食事・併用薬の影響……25
2．薬物速度論的パラメータ……25
(1)解析方法……25
(2)吸収速度定数……25
(3)消失速度定数……25

(4)クリアランス……25
(5)分布容積……25
(6)その他……25
3. 母集団（ポピュレーション）解析……25
(1)解析方法……25
(2)パラメータ変動要因……25
4. 吸収……25
5. 分布……26
(1)血液－脳関門通過性……26
(2)血液－胎盤関門通過性……26
(3)乳汁への移行性……26
(4)髄液への移行性……26
(5)その他の組織への移行性……26
(6)血漿蛋白結合率……26
6. 代謝……27
(1)代謝部位及び代謝経路……27
(2)代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率……27
(3)初回通過効果の有無及びその割合……27
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率……27
7. 排泄……27
8. トランスポーターに関する情報……27
9. 透析等による除去率……27
10. 特定の背景を有する患者……28
11. その他……28

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目……29
1. 警告内容とその理由……29
2. 禁忌内容とその理由……29
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……29
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……29
5. 重要な基本的注意とその理由……29
6. 特定の背景を有する患者に関する注意……30
(1)合併症・既往歴等のある患者……30
(2)腎機能障害患者……30
(3)肝機能障害患者……30
(4)生殖能を有する者……30
(5)妊婦……30
(6)授乳婦……30
(7)小児等……31
(8)高齢者……31
7. 相互作用……31
(1)併用禁忌とその理由……31
(2)併用注意とその理由……31
8. 副作用……32
(1)重大な副作用と初期症状……32
(2)その他の副作用……33
9. 臨床検査結果に及ぼす影響……33
10. 過量投与……33
11. 適用上の注意……34
12. その他の注意……34
(1)臨床使用に基づく情報……34
(2)非臨床試験に基づく情報……34

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目……35
1. 薬理試験……35
(1)薬効薬理試験……35
(2)安全性薬理試験……35
(3)その他の薬理試験……35
2. 毒性試験……35
(1)単回投与毒性試験……35
(2)反復投与毒性試験……35
(3)遺伝毒性試験……35
(4)がん原性試験……35
(5)生殖発生毒性試験……35
(6)局所刺激性試験……35
(7)その他の特殊毒性……35

Ⅹ. 管理的事項に関する項目……36
1. 規制区分……36
2. 有効期間……36
3. 包装状態での貯法……36
4. 取扱い上の注意……36
5. 患者向け資材……36
6. 同一成分・同効薬……36
7. 国際誕生年月日……36
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日……36
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容……37
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容……37
11. 再審査期間……37
12. 投薬期間制限に関する情報……37
13. 各種コード……37
14. 保険給付上の注意……37

ＸＩ. 文献……38
1. 引用文献……38
2. その他の参考文献……40

ＸＩＩ. 参考資料……41
1. 主な外国での発売状況……41
2. 海外における臨床支援情報……41

ＸＩＩＩ. 備考……42
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報……42
(1)粉砕……42
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性……43
2. その他の関連資料……43

略語表

略語	略語内容
ALP	アルカリホスファターゼ（Alkaline phosphatase）
AUC	血漿中濃度－時間曲線下面積 （Area under the plasma concentration-time curve）
$AUC_{0\text{-}24}$	投与 24 時間後までの AUC（AUC from zero to 24 hours）
$AUC_{0\text{-}72hr}$	投与 72 時間後までの AUC（AUC from zero to 72 hours）
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ（Aspartate aminotransferase）
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ（Alanine aminotransferase）
BUN	血中尿素窒素（Blood urea nitrogen）
Cmax	最高血漿中濃度（Maximum plasma concentration）
CK	クレアチンキナーゼ（Creatine kinase）
γ-GTP	γ-グルタミルトランスペプチターゼ（γ-Glutamyl transpeptidase）
kel	消失速度定数（Elimination rate constant）
LDH	乳酸脱水素酵素（Lactate dehydrogenase）
RH	相対湿度（Relative humidity）
S.D.	標準偏差（Standard deviation）
$T_{1/2}$	消失半減期（Elimination half-life）
Tmax	最高血漿中濃度到達時間（Time to maximum plasma concentration）

Ⅰ. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、レボフロキサシン水和物を有効成分とする広範囲経口抗菌製剤である。
長生堂製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2014 年 8 月に承認を得て、2014 年 12 月発売に至った。
その後、2016 年 2 月に一部変更承認され、「＜適応菌種＞結核菌、＜適応症＞肺結核及びその他の結核症」の効能・効果、「肺結核及びその他の結核症」に対する用法・用量が追加された。

2. 製品の治療学的特性

(1) 本剤は、キノロン系の広範囲経口抗菌製剤で、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、野兎病菌、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）に抗菌活性を示し、これらの細菌による感染症に対し効果が認められている。（〔V.1.効能又は効果〕の項参照）

(2) 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（Torsade 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、末梢神経障害があらわれることがある。（〔Ⅷ.8.（1）重大な副作用と初期症状〕の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

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

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

レボフロキサシン錠 250mg「CH」
レボフロキサシン錠 500mg「CH」

(2) 洋名

Levofloxacin Tablets 250mg “CH”
Levofloxacin Tablets 500mg “CH”

(3) 名称の由来

一般的名称＋剤形＋含量＋「CH」
〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

レボフロキサシン水和物（JAN）

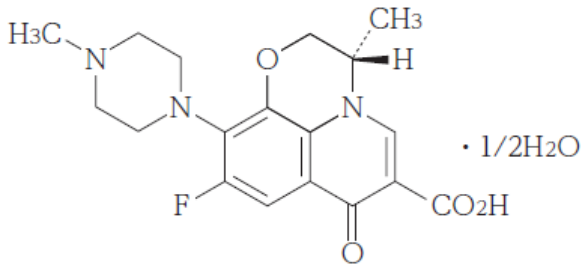
(2) 洋名（命名法）

Levofloxacin Hydrate（JAN）
Levofloxacin（INN）

(3) ステム（ｓｔｅｍ）

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：$C_{18}H_{20}FN_3O_4$・$1/2H_2O$
分子量：370.38

5. 化学名（命名法）又は本質

(3*S*)-9-Fluoro-3-methyl-10-(4-methylpiperazin-1-yl)-7-oxo-2,3-dihydro-7*H*-pyrido[1,2,3-*de*][1,4]benzoxazine-6-carboxylic acid hemihydrate（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：レボフロキサシン

略号：LVFX

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

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。
溶解度（37℃）：pH1.2：55.74mg/mL、pH3.0：37.15mg/mL、
pH4.0：28.85mg/mL、pH5.0：23.60mg/mL、
pH6.8：13.99mg/mL、水：19.28mg/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)]

pKa_1：6.11（カルボキシル基、滴定法）
pKa_2：8.18（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〔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、定量法

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。
(1) 紫外可視吸光度測定法
(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

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。
電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸による滴定）

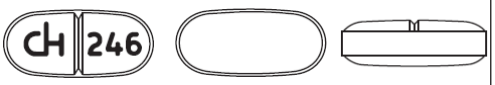
Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

〔1.（2）製剤の外観及び性状〕の項参照

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		レボフロキサシン錠 250mg「CH」	レボフロキサシン錠 500mg「CH」
色調・剤形		黄色の割線入り フィルムコーティング錠	うすいだいだい色の割線入り フィルムコーティング錠
外形			
大きさ	長径	13.7mm	18.2mm
	短径	6.7mm	8.2mm
	厚さ	4.2mm	5.1mm
重量		337mg	674mg

(3) 識別コード

錠 250mg

錠剤本体、PTP シート：ch245

錠 500mg

錠剤本体、PTP シート：ch246

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分（活性成分）の含量

錠 250mg：1 錠中　日局　レボフロキサシン水和物 256.2mg 含有
（レボフロキサシンとして 250mg）

錠 500mg：1 錠中　日局　レボフロキサシン水和物 512.5mg 含有
（レボフロキサシンとして 500mg）

添加剤

錠 250mg	錠 500mg
結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、フマル酸ステアリルナトリウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、タルク、黄色三二酸化鉄	結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、フマル酸ステアリルナトリウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、タルク、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

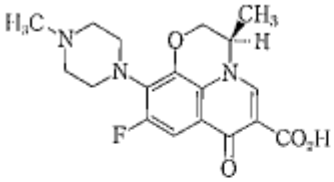
該当しない

4. 力価

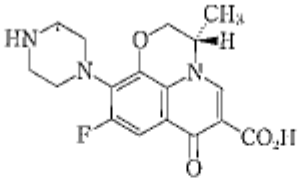
該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

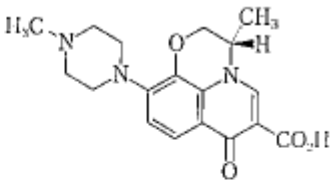
混在する可能性のある類縁物質としては、次の〔1〕～〔5〕がある[2)]。



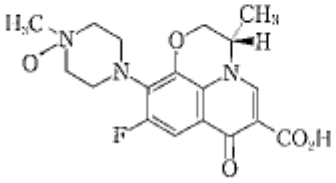
〔1〕鏡像異性体



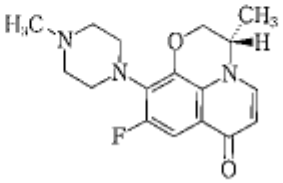
〔2〕脱メチル体



〔3〕脱フッ素体



〔4〕*N*-オキシド体



〔5〕脱炭酸体

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

錠 250mg[3)]

加速試験（40℃、 相対湿度 75%、6 ヵ月）の結果、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヵ月	3 ヵ月	6 ヵ月
PTP 包装	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量均一性試験	適合	−	−	適合
	溶出試験	98.3%	96.2%	94.5%	95.2%
	定量試験	100.7%	101.5%	101.7%	100.1%

錠 500mg[4)]

加速試験（40℃、 相対湿度 75%、6 ヵ月）の結果、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヵ月	3 ヵ月	6 ヵ月
PTP 包装	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量均一性試験	適合	−	−	適合
	溶出試験	97.5%	95.6%	94.9%	95.0%
	定量試験	100.9%	100.3%	100.4%	100.5%

(2) 無包装状態での安定性試験

保存条件

①温度：40℃、3 ヵ月〔遮光・気密容器〕

②湿度：25℃/75%RH、3 ヵ月〔遮光・開放〕

③光：60 万 lux・hr（1000lux/hr・25 日）〔シャーレにラップをし保存〕

錠 250mg[5)]

	外観	溶出性	含量	硬度	評価
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎

錠 500mg[6)]

	外観	溶出性	含量	硬度	評価
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（平成 11 年 8 月 20 日（社）日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会）の評価分類基準（下記）に準じる。

◎：すべての測定項目において変化を認めなかった。
（外観：変化をほとんど認めない。溶出性：規格値内。含量：3%未満の低下。硬度：30%未満の変化。）

○：いずれかの測定項目で「規格内」の変化を認めた。
（外観：わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：3%以上の低下で、規格値内。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 以上。）

△：いずれかの測定項目で「規格外」の変化を認めた。
（外観：形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している。溶出性：規格値外。含量：規格値外。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 未満。）

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

9. 溶出性

（1）溶出規格

錠 250mg

日本薬局方医薬品各条　レボフロキサシン錠溶出規格に適合する。
試験法：日局溶出試験法（パドル法）
条　件：回転数　50rpm
　　試験液　pH6.8（溶出試験第 2 液）
結　果：30 分間　80%以上

錠 500mg

日本薬局方医薬品各条　レボフロキサシン錠溶出規格に適合する。
試験法：日局溶出試験法（パドル法）
条　件：回転数　50rpm
　　試験液　pH6.8（溶出試験第 2 液）
結　果：30 分間　80%以上

(2) 生物学的同等性試験における溶出試験結果

錠 250mg[7)]

「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号)」に従い、レボフロキサシン錠 500mg「CH」を標準製剤として溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH4.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH1.2/100rpm

[判定基準]

a) 平均溶出率

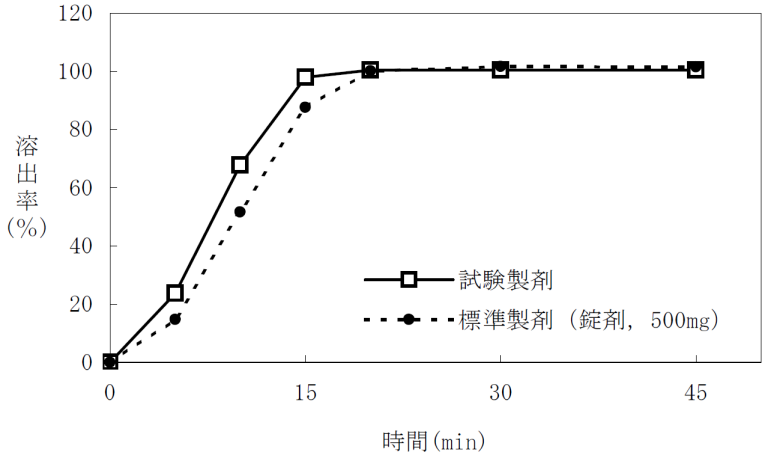
①②③⑤：試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。

④：標準製剤の平均溶出率が約 60%及び 85%となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又は f 2 関数の値が 50 以上である。

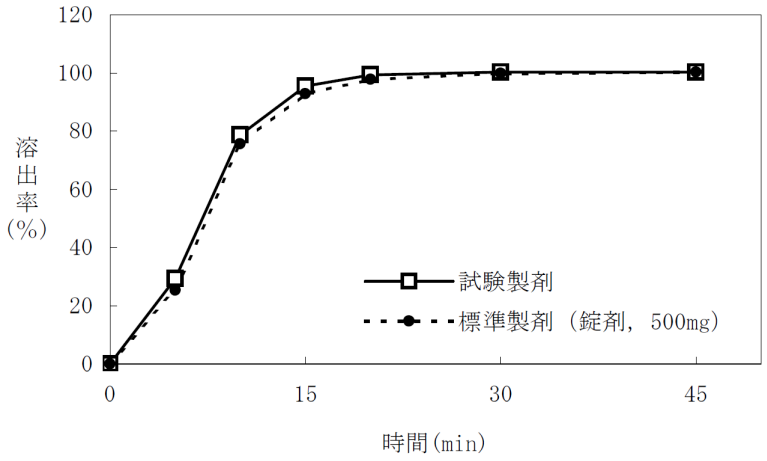
b) 個々の溶出率

①～⑤：最終比較時点において、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

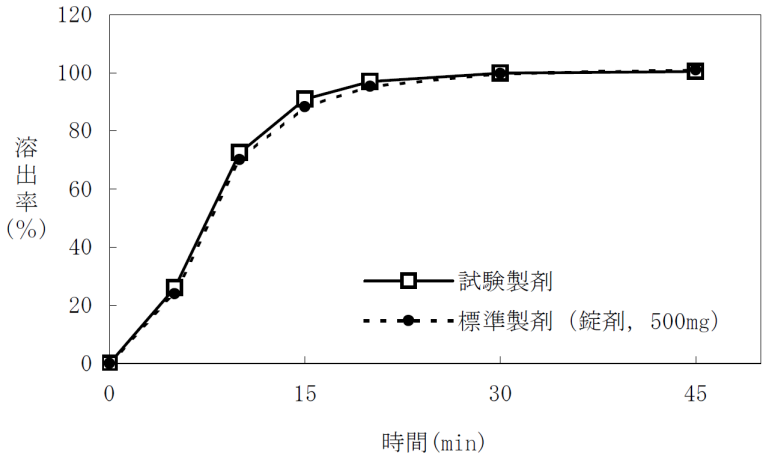
①pH1.2, 50rpm



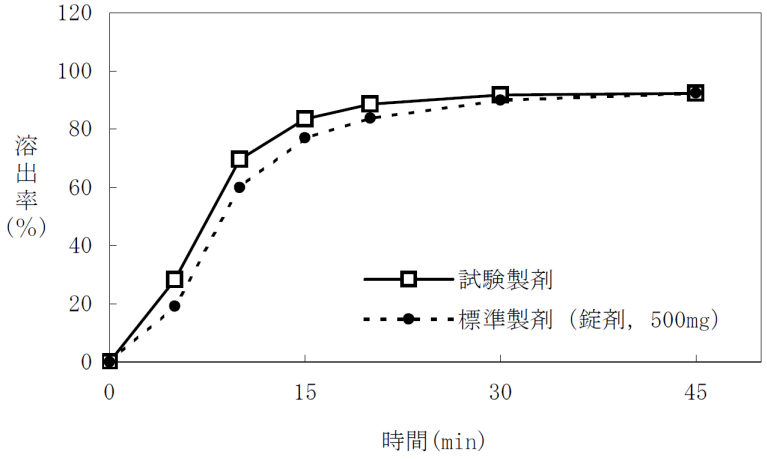
②pH4.0, 50rpm



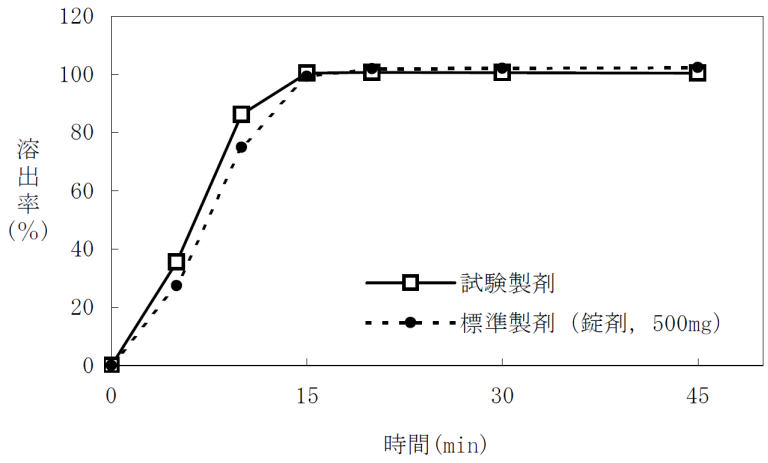
③pH6.8, 50rpm



④　水 , 50rpm



⑤pH1.2, 100rpm



錠 500mg[8)]

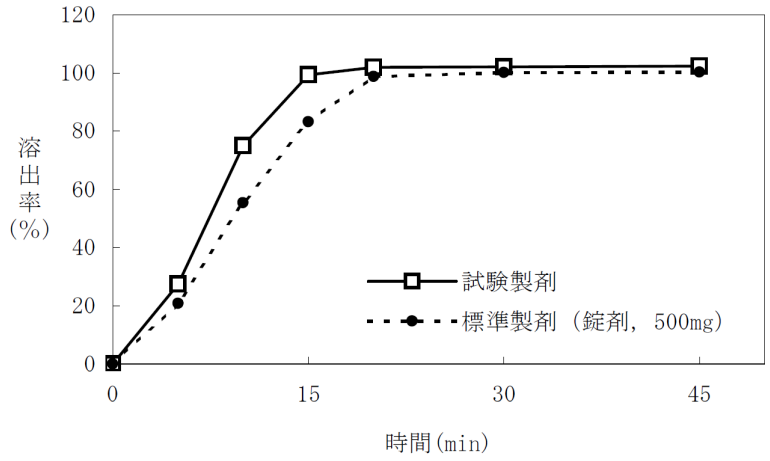
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号)」に従い、クラビット錠 500mg を標準製剤として溶出挙動の類似性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は類似していると判断された。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH3.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH1.2/100rpm

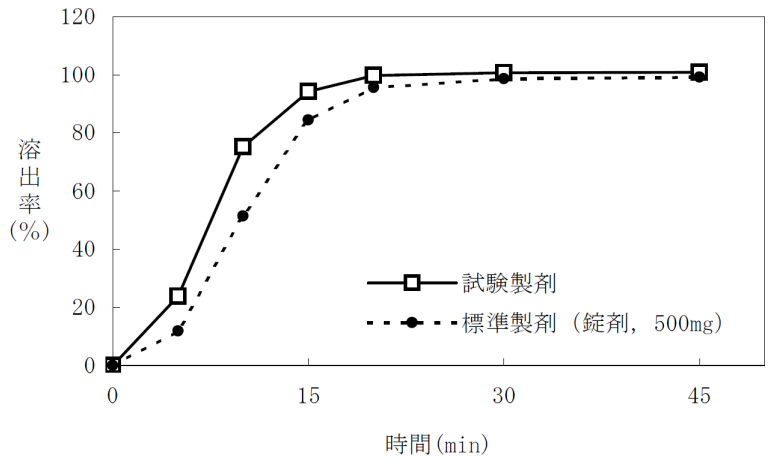
[判定基準]

①～⑤：標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f 2 関数の値が 42 以上である。

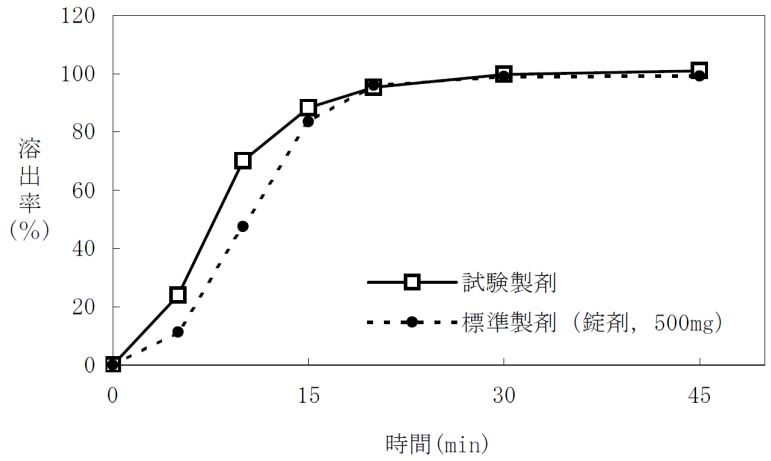
①pH1.2, 50rpm



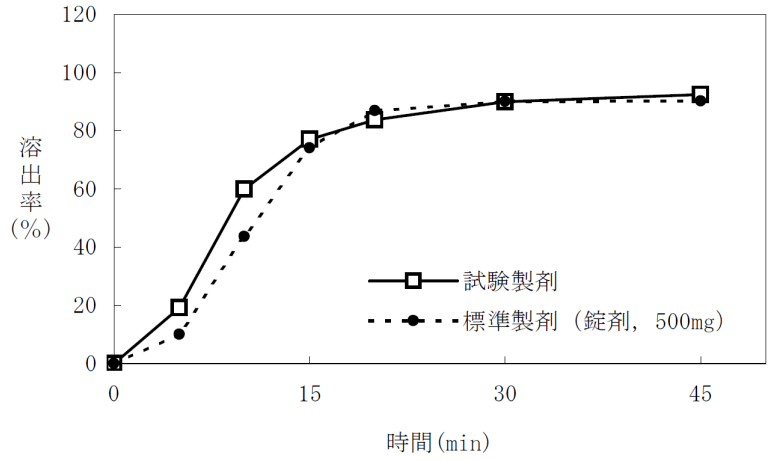
②pH3.0, 50rpm



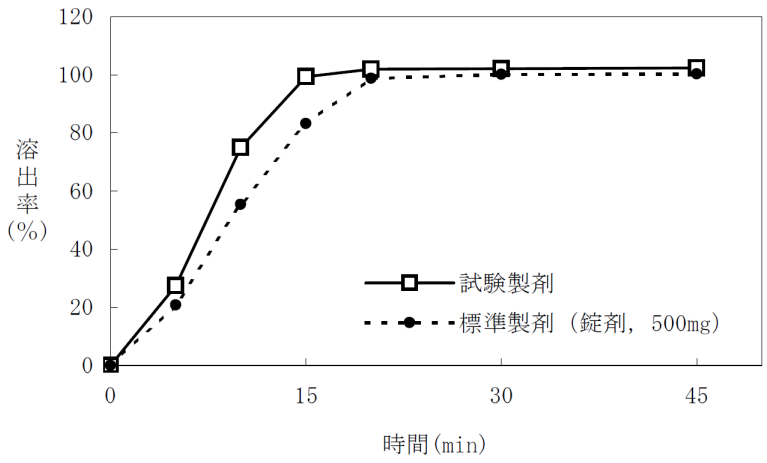
③pH6.8, 50rpm



④ 水 , 50rpm



⑤pH1.2, 100rpm



10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

22. 包装

〈レボフロキサシン錠 250mg「CH」〉

100 錠［10 錠（PTP）×10］

〈レボフロキサシン錠 500mg「CH」〉

50 錠［5 錠（PTP）×10］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

錠 250mg

PTP（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）、紙箱

錠 500mg

PTP（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

Ⅴ. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

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、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、野兎病菌、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、野兎病、肺結核及びその他の結核症、Q 熱

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

〈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〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」[9] 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。

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、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。

(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

7. 用法及び用量に関連する注意

〈効能共通〉

7.1 耐性菌の出現を抑制するため、用量調節時を含め分割投与は避け、必ず1日量を1回で投与すること。[18.3 参照]

7.2 腎機能低下患者では高い血中濃度が持続するので、次の用法及び用量を目安として、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。[9.2、9.8.2、16.6.1 参照]

腎機能クレアチニンクリアランス（CLcr）値（mL/min）	用法及び用量
20≦CLcr＜50	初日500mgを1回、2日目以降250mgを1日に1回投与する。
CLcr＜20	初日500mgを1回、3日目以降250mgを2日に1回投与する。

〈腸チフス、パラチフス〉

7.3 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。

〈炭疽〉

7.4 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. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.1 有効性及び安全性に関する試験

国内・海外で実施された各科領域の各種感染症に対する経口剤の臨床試験の概要は次のとおりである。

なお、炭疽、ブルセラ症、ペスト、野兎病、肺結核及びその他の結核症、Q熱に対する臨床試験は国内外とも実施されていない。

〈急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染〉

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

成人の市中肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、又は急性気管支炎に対するレボフロキサシン（500mg×1 回/日）の非盲検試験におけるブドウ球菌属、肺炎球菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、クレブシエラ属、インフルエンザ菌等による呼吸器感染症に対する有効率は次のとおりである[10)]。

疾患名	有効症例/総症例	有効率（%）
急性気管支炎	14/14	100
肺炎	94/101[注1)]	93.1
慢性呼吸器病変の二次感染	28/28	100
計	136/143	95.1

注 1) クラミジア肺炎に対する有効率は 100%（1/1 例）、マイコプラズマ肺炎に対する有効率は 100%（15/15 例）であった。

副作用発現頻度は 39.5%（60/152 例）であった。主な副作用は悪心 7.9%（12/152 例）、好酸球数増加 7.2%（11/152 例）、嘔吐、下痢、頭痛が各 5.3%（8/152 例）であった[10)]。

17.1.2 海外第Ⅲ相試験

下気道感染症（市中肺炎、慢性気管支炎の急性増悪）に対するレボフロキサシン（500mg×1 回/日）の非盲検試験（中国）におけるブドウ球菌属、肺炎球菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、クレブシエラ属、インフルエンザ菌、緑膿菌等による呼吸器感染症に対する有効率は次のとおりである[11)]。

疾患名	有効症例/総症例	有効率（%）
肺炎	348/357[注2)]	97.5
慢性呼吸器病変の二次感染	399/411[注3)]	97.1
計	747/768	97.3

注 2) レジオネラ肺炎に対する有効率は 100%（3/3 例）、クラミジア肺炎に対する有効率は 100%（3/3 例）、マイコプラズマ肺炎に対する有効率は 100%（48/48 例）であった。

注 3) 慢性気管支炎の急性増悪

副作用発現頻度は 31.4%（277/883 例）であった。主な副作用は浮動性めまい、白血球数減少が各 4.2%（37/883 例）、不眠症 3.5%（31/883 例）であった[11)]。

17.1.3 国内第Ⅲ相試験

国内の市中肺炎患者を対象としたテリスロマイシンの実薬対照二重盲検比較試験においてレボフロキサシンが対照薬として使用され、レジオネラ肺炎に対するレボフロキサシン 100mg×3 回/日[注5)]投与の有効率は 100%（6/6 例）であった[12)]。

17.1.4 海外第Ⅲ相試験

海外のレジオネラによる市中肺炎患者を対象とした臨床試験において、レボフロキサシン500～750mg×1回/日[注5)]投与の有効率は93.0%（66/71例）であった[13)]。

〈膀胱炎、腎盂腎炎〉

17.1.5 国内第Ⅲ相試験

複雑性尿路感染症患者に対するレボフロキサシン（500mg×1回/日）の非盲検試験におけるブドウ球菌属、腸球菌属、大腸菌、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、緑膿菌等による尿路感染症に対する有効率は次のとおりである[14)]。

疾患名	有効症例/総症例	有効率（%）
膀胱炎	120/142	84.5
腎盂腎炎	11/15	73.3
計	131/157	83.4

副作用発現頻度は17.8%（33/185例）であった。主な副作用は下痢3.8%（7/185例）、消化不良2.2%（4/185例）、浮動性めまい、血中クレアチンホスホキナーゼ増加が各1.6%（3/185例）であった[14)]。

17.1.6 海外第Ⅲ相試験

尿路感染症（急性単純性下部尿路感染症、急性腎盂腎炎、反復性尿路感染症、複雑性尿路感染症）に対するレボフロキサシン（500mg×1回/日）の非盲検試験（中国）におけるブドウ球菌属、腸球菌属、大腸菌、クレブシエラ属、エンテロバクター属、プロテウス属等による尿路感染症に対する有効率は次のとおりである[11)]。

疾患名	有効症例/総症例	有効率（%）
膀胱炎	76/86	88.4
腎盂腎炎	70/78	89.7
計	146/164	89.0

副作用発現頻度は24.9%（90/362例）であった。主な副作用は浮動性めまい4.4%（16/362例）、悪心4.1%（15/362例）、血中乳酸脱水素酵素増加3.9%（14/362例）であった[11)]。

〈子宮頸管炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎〉

17.1.7 国内第Ⅲ相試験

子宮内感染、子宮付属器炎、バルトリン腺炎、子宮頸管炎患者に対するレボフロキサシン水和物の非盲検試験におけるブドウ球菌属、大腸菌、トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）等による産婦人科領域感染症に対する有効率は次のとおりである[15)]。

疾患名	（参考）100～200mg×3 注5)	
	有効症例/総症例	有効率（%）
子宮頸管炎	29/31	93.5
バルトリン腺炎	49/50	98.0
子宮内感染	58/61	95.1
子宮付属器炎	35/41	85.4
計	171/183	93.4

500mg×1 回/日の用法及び用量における日本及び海外の臨床試験データはない。

〈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、胆嚢炎、胆管炎〉

17.1.8 国内第Ⅲ相試験

皮膚科領域感染症患者に対するレボフロキサシン水和物の臨床試験において、ブドウ球菌属等による皮膚科領域感染症（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）に対する有効率は次のとおりである[16]。

疾患名		（参考）100～200mg×3 注5)	
		有効症例/総症例	有効率（%）
皮膚科領域感染症		390/436	89.4
	表在性皮膚感染症（毛のう炎等） ざ瘡（化膿性炎症を伴うもの）	71/85	83.5
	深在性皮膚感染症（せつ、せつ腫症等）	142/153	92.8
	リンパ管・リンパ節炎	15/16	93.8
	慢性膿皮症（皮下膿瘍、汗腺炎等）	162/182	89.0

17.1.9 海外臨床試験

皮膚科領域感染症患者及び外科領域感染症患者に対するレボフロキサシン（500mg×1回/日）の臨床試験（欧米）において、ブドウ球菌属等による皮膚科領域感染症（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）、外科・整形外科領域感染症に対する有効率は次のとおりである[17]。

疾患名		有効症例/総症例	有効率（%）
皮膚科領域感染症		302/311 米国注4) 133/137 欧州注4)	97.1 米国注4) 97.1 欧州注4)
	表在性皮膚感染症（毛のう炎等） ざ瘡（化膿性炎症を伴うもの）		
	深在性皮膚感染症（せつ、せつ腫症等）		
	リンパ管・リンパ節炎		
	慢性膿皮症（皮下膿瘍、汗腺炎等）		
外科・整形外科領域感染症			
	外傷・熱傷及び手術創等の二次感染		

注 4) 単純性皮膚・皮膚組織感染症

17.1.10 国内第Ⅲ相試験

外科領域感染症患者に対するレボフロキサシン水和物の臨床試験において、外科・整形外科領域感染症、胆嚢炎・胆管炎に対する有効率は次のとおりである[18]。

疾患名		（参考）100～200mg×3[注5]	
		有効症例/総症例	有効率（%）
外科・整形外科領域感染症		146/181	80.7
	外傷・熱傷及び手術創等の二次感染	101/129	78.3
	乳腺炎	23/29	79.3
	肛門周囲膿瘍	22/23	95.7
胆嚢炎・胆管炎		19/26	73.1

胆嚢炎・胆管炎については500mg×1回/日の用法及び用量における日本及び海外の臨床試験データはない。

〈外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎〉

17.1.11 国内第Ⅲ相試験

外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎患者に対するレボフロキサシン水和物の非盲検試験におけるブドウ球菌属、緑膿菌等による耳鼻咽喉科領域感染症に対する有効率は次のとおりである[19]。

疾患名	（参考）100～200mg×3[注5]	
	有効症例/総症例	有効率（%）
外耳炎	23/30	76.7
中耳炎	111/150	74.0
副鼻腔炎	52/68	76.5
化膿性唾液腺炎	9/11	81.8
計	195/259	75.3

500mg×1回/日の用法及び用量における日本及び海外の臨床試験データはない。

〈涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎〉

17.1.12 国内第Ⅲ相試験

細菌性眼感染症患者に対するレボフロキサシン水和物の非盲検試験におけるブドウ球菌属等による眼科領域感染症に対する有効率は次のとおりである[20]。

疾患名	（参考）100～200mg×3[注5]	
	有効症例/総症例	有効率（%）
涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎	68/70	97.1

500mg×1回/日の用法及び用量における日本及び海外の臨床試験データはない。

〈感染性腸炎、腸チフス、コレラ〉

17.1.13 国内第Ⅲ相試験

感染性腸炎患者に対するレボフロキサシン水和物の非盲検試験における赤痢菌、サルモネラ属、カンピロバクター属等による腸管感染症に対する有効率は次のとおりである[21]。

疾患名	（参考）100～200mg×3 注5)	
	有効症例/総症例	有効率（%）
感染性腸炎	115/119	96.6
腸チフス	1/1	100
コレラ	3/3	100
計	119/123	96.7

500mg×1 回/日の用法及び用量における日本及び海外の臨床試験データはない。

〈歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎〉

17.1.14 国内第Ⅲ相試験

歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎患者に対するレボフロキサシン水和物の非盲検試験におけるレンサ球菌属等による歯科・口腔外科領域感染症に対する有効率は次のとおりである[22]。

疾患名	（参考）100～200mg×3 注5)	
	有効症例/総症例	有効率（%）
歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎	171/205	83.4

500mg×1 回/日の用法及び用量における日本及び海外の臨床試験データはない。

注 5) 本剤の承認された用法及び用量は、レボフロキサシンとして 500mg 1 日 1 回である。

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

17.2.1 呼吸器感染症（急性咽頭・扁桃炎）

急性咽頭・扁桃炎の成人患者にレボフロキサシン 500mg 1 日 1 回投与し、疾患重症度、局所所見及び臨床的症状よりレボフロキサシンの有効性を検討した。投与終了 7 日後の臨床効果（治癒率）は 95.0%（19/20 例）であった[23]。

17.2.2 尿路・性器感染症

尿路・性器感染症（急性単純性膀胱炎、複雑性膀胱炎、非淋菌性尿道炎（クラミジア・トラコマティス性）、急性細菌性前立腺炎及び急性精巣上体炎（細菌性及びクラミジア・トラコマティス性））を対象にレボフロキサシン 500mg を 1 日 1 回投与し、有効性及び安全性を検討した。

各疾患の有効率は、急性単純性膀胱炎 97.4%（37/38 例）、複雑性膀胱炎 82.9%（29/35 例）、非淋菌性尿道炎 84.8%（28/33 例）、急性細菌性前立腺炎 100%（2/2 例）、急性精巣上体炎 80%（4/5 例）であった[24]。

17.2.3 産婦人科領域感染症

レボフロキサシン 500mg1 日 1 回 7 日間経口投与し、非淋菌性子宮頸管炎（クラミジア・トラコマティス性）及び子宮内感染に対する有効性及び安全性を検討した。各疾患の

有効率は、非淋菌性子宮頸管炎（クラミジア・トラコマティス性）94.4%（17/18 例）、子宮内感染 94.7%（18/19 例）であった[25]。

17.2.4 耳鼻咽喉科領域感染症

中耳炎・副鼻腔炎の成人患者にレボフロキサシン 500mg1 日 1 回投与し、上顎洞粘膜内への移行性及び有効性を検討した。各疾患の有効率は、中耳炎 100.0%（13/13 例）、副鼻腔炎 85.9%（73/85 例）であった[26]。

2）承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

（7）その他

該当資料なし

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

キノロン系抗菌薬（ピリドンカルボン酸系合成抗菌薬）

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

レボフロキサシン錠は、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製剤で、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[27～32]。抗菌作用は殺菌的であり[27,33]、MIC付近の濃度で溶菌が認められた[34]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗菌作用

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、プロテウス属、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、野兎病菌、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[27,33,35～46]。実験的マウス感染治療試験において、レボフロキサシンは優れた治療効果を示した[36]。

18.3 耐性化に及ぼす用法及び用量の影響

*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[47]。［7.1参照］

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

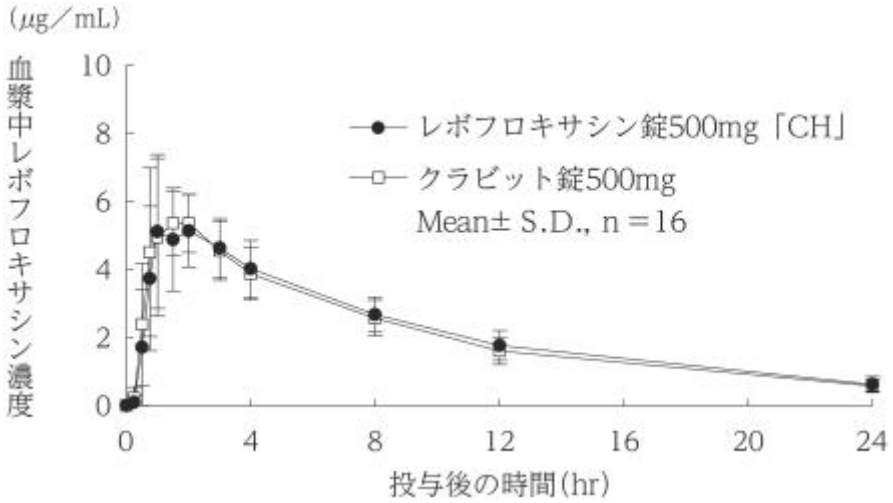
該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験

錠 500mg

レボフロキサシン錠 500mg「CH」とクラビット錠 500mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（レボフロキサシンとして 500mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中レボフロキサシン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された[48]。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}24}$ (μg・hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
レボフロキサシン錠 500mg「CH」	52.8±9.8	6.2±1.5	1.7±1.1	7.6±1.2
クラビット錠 500mg	51.2±9.2	6.6±1.4	1.6±0.6	7.4±1.0

（Mean±S.D.，n=16）

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

錠 250mg

レボフロキサシン錠 250mg「CH」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日：薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、レボフロキサシン錠 500mg「CH」を標準製剤としたとき、溶出挙動に基づき生物学的に同等とみなされた[7]。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

16.7.1 アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸薬等、鉄剤

レボフロキサシン 100mg[注)]単回経口投与時に、水酸化アルミニウム（1g）、硫酸鉄（160mg）又は酸化マグネシウム（500mg）を併用投与した場合、レボフロキサシンのバイオアベイラビリティーは単回投与に比較し、それぞれ 56%、81%及び 78%に減少した。また、Cmax も有意に低下した[49)]。[10.2 参照]

16.7.2 その他の薬剤

(1) シメチジン、プロベネシド

健康成人に、シメチジン 400mg を 1 日 2 回 7 日間又はプロベネシド 500mg を 1 日 4 回 7 日間投与し、4 日目にレボフロキサシン 500mg を空腹時単回経口投与した。シメチジン又はプロベネシドとの併用によりレボフロキサシンの $AUC_{0\text{-}72hr}$ はそれぞれ 27.0%及び 38.2%上昇し、$t_{1/2}$ はそれぞれ 30.5%及び 31.8%延長したが、Cmax に影響はみられなかった[50)]（外国人データ）。

注）本剤の承認された用量は、レボフロキサシンとして 500mg である。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

錠 500mg

健康成人男子空腹時単回経口投与（1 錠、n=16）

kel（hr^{-1}）：0.0930±0.0141

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

〔Ⅷ.6.（6）授乳婦〕の項参照

(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

16.3.1 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時間で対血漿中濃度比：1.42～1.89）、前立腺（投与後2.9～4.0時間で対血漿中濃度比：0.76～1.58）、耳漏（投与後1～4時間で対血漿中濃度比：0.40～0.88）、上顎洞粘膜（投与後2.3～5.8時間で対血漿中濃度比：0.89～2.29）、鼻汁（投与後1～4時間で対血漿中濃度比：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[注)]を単回経口投与した場合、皮膚（投与後0.8～4時間で対血清中濃度比：平均1.1）、唾液（対血清中濃度比：約0.7）、口蓋扁桃（対血清中濃度比：約2）、喀痰（対血清中濃度比：0.8～1.1）、前立腺（投与後1～6時間で対血清中濃度比：0.8～1.9）、前立腺液（投与後1.5～4時間で対血清中濃度比：約0.6）、房水（投与後2～9時間で対血清中濃度比：0.14～0.31）、涙液（100mg投与で最高濃度0.61μg/mL）、耳漏（投与後2時間で対血清中濃度比：0.6）、上顎洞粘膜（投与後2～6時間で対血清中濃度比：1.1～1.9）、女性性器（100mg投与後3～4時間で0.6～2.1μg/g）に移行性を示した[23, 24, 26, 51～54)]。

16.3.2 外国人における成績

健康成人又は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、炎症性滲出液（投与後0.5～24時間で対血漿中濃度比：0.2～1.5）、気管支粘膜（投与後0.5～8時間で対血漿中濃度比：0.9～1.8）、気管支肺胞洗浄液（投与後0.5～8時間で対血漿中濃度比：1.1～3.0）、肺マクロファージ（投与後0.5～24時間で対血漿中濃度比：4.1～18.9）、肺組織（投与後2.28～25.43時間で対血漿中濃度比：1.06～9.98）に移行性を示した[55)]。

(6) 血漿蛋白結合率

16.3.3 血漿蛋白結合率

レボフロキサシン1～50μg/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[56)]。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4.1 尿中代謝物

健康成人にレボフロキサシン水和物として100mg[注)]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-オキサイド体が1.63%であった[57)]。

16.4.2 胆汁中代謝物

患者4例にレボフロキサシン水和物として100mg[注)]を単回経口投与後2～3.5時間での胆嚢胆汁中グルクロン酸抱合体濃度は0.05～0.44μg/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[58)]。

注）本剤の承認された用量は、レボフロキサシンとして500mgである。

(2) 代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率

該当資料なし

(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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

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、138.8～877.7μg/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。レボフロキサシンは、主に未変化体の尿中排泄によって体内から消失する[59)]。

また、健康成人男性5例にレボフロキサシン水和物として200mg[注)]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[60)]。

注）本剤の承認された用量は、レボフロキサシンとして500mgである。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

CLcr 値により群分けし、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[61]。［7.2、9.2、9.8.2 参照］

（ノンコンパートメント解析、22 例、平均値±標準偏差）

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

11. その他

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）

〈効能共通〉

2.1 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［9.1.2 参照］

〈炭疽等の重篤な疾患以外〉

2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性［9.5.1 参照］

2.3 小児等［9.7.1 参照］

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〕の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

〔Ⅴ.4.用法及び用量に関連する注意〕の項参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

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。

8.2 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。

8.3 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。［9.1.5、11.1.16 参照］

8.4 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。

〈肺結核及びその他の結核症〉

8.5 他の抗結核薬との併用により、重篤な肝機能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。

8.6 本剤を含む抗結核薬による治療で、薬剤逆説反応を認めることがある。治療開始後に、既存の結核の悪化又は結核症状の新規発現を認めた場合は、薬剤感受性試験等に基づき投与継続の可否を判断すること。

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

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。

9.1.2 キノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者（ただし、本剤又はオフロキサシンに対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと）

［2.1 参照］

9.1.3 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。

9.1.4 重症筋無力症の患者

症状を悪化させることがある。

9.1.5 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／ロイス・ディーツ症候群等）を有する患者

必要に応じて画像検査の実施を考慮すること。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。［8.3、11.1.16 参照］

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

高い血中濃度の持続が認められている。なお、血液透析又は CAPD（持続的外来腹膜透析）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[62～64]、透析後の追加投与は不要と考えられる。［7.2、16.6.1 参照］

(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

〈炭疽等の重篤な疾患以外〉

9.5.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。動物実験（ラット）で胎児器官形成期の投与において、胚・胎児死亡率の増加、化骨遅延等の発育抑制作用及び骨格変異出現率の増加が認められている。［2.2、9.5.2 参照］

〈炭疽等の重篤な疾患〉

9.5.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性を考慮して投与すること。［9.5.1 参照］

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

〈炭疽等の重篤な疾患以外〉

9.7.1 投与しないこと。小児等を対象とした臨床試験は実施していない。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。［2.3、9.7.2 参照］

〈炭疽等の重篤な疾患〉

9.7.2 治療上の有益性を考慮して投与すること。［9.7.1 参照］

(8) 高齢者

9.8 高齢者

9.8.1 腱障害があらわれやすいとの報告がある。［11.1.12 参照］

9.8.2 投与量ならびに投与間隔に留意し、慎重に投与すること。本剤は、主として腎臓から排泄されるが、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。［7.2、16.6.1 参照］

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

10.2 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 水酸化アルミニウム、酸化マグネシウム、硫酸鉄等 ［16.7.1 参照］	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。
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。	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） プレドニゾロン ヒドロコルチゾン等	腱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。	機序は不明である。

8. 副作用

11. 副作用の共通の注意

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（頻度不明）、**アナフィラキシー**（頻度不明）

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。

11.1.2 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明）、**皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）**（頻度不明）

11.1.3 痙攣（頻度不明）

11.1.4 QT 延長（頻度不明）、**心室頻拍（Torsade de pointes を含む）**（頻度不明）

11.1.5 急性腎障害（頻度不明）、**間質性腎炎**（頻度不明）

11.1.6 劇症肝炎（頻度不明）、**肝機能障害**（頻度不明）、**黄疸**（頻度不明）

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。

11.1.7 汎血球減少症（頻度不明）、**無顆粒球症**（頻度不明）、**溶血性貧血**（頻度不明）、**血小板減少**（頻度不明）

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。

11.1.8 間質性肺炎（頻度不明）、**好酸球性肺炎**（頻度不明）

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。

11.1.9 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明）

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。

11.1.10 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 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。

11.1.11 低血糖（頻度不明）

低血糖性昏睡に至る例も報告されている。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。

11.1.12 アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害（頻度不明）

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。[9.8.1 参照]

11.1.13 錯乱（頻度不明）、**せん妄**（頻度不明）、**抑うつ等の精神症状**（頻度不明）

11.1.14 過敏性血管炎（頻度不明）

発熱、腹痛、関節痛、紫斑、斑状丘疹や、皮膚生検で白血球破砕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。

11.1.15 重症筋無力症の悪化（頻度不明）

11.1.16 大動脈瘤（頻度不明）、**大動脈解離**（頻度不明）

［8.3、9.1.5 参照］

11.1.17 末梢神経障害（頻度不明）

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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	1 ～ 5%未満	1%未満	頻度不明
過敏症	発疹	そう痒症	蕁麻疹、光線過敏症
精神神経系	めまい、不眠、頭痛	傾眠、振戦、意識障害	幻覚、錐体外路障害、ぼんやり、しびれ感
泌尿器		血尿、クレアチニン上昇	頻尿、尿閉、無尿、尿蛋白陽性、BUN 上昇
肝臓	ALT 上昇、LDH 上昇、AST 上昇	肝機能異常、γ-GTP 上昇、血中ビリルビン増加、ALP 上昇	
血液	白血球数減少、好酸球数増加、好中球数減少、血小板数減少	リンパ球数減少、貧血	
消化器	悪心、嘔吐、下痢、腹部不快感、食欲不振	腹痛、口渇、腹部膨満、胃腸障害、消化不良、便秘	口内炎、舌炎
感覚器		味覚異常、耳鳴	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		胸部不快感、CK 上昇、四肢痛、関節痛[注)]、咽喉乾燥、尿中ブドウ糖陽性、熱感、浮腫	高血糖、筋肉痛、発熱、関節障害、発汗、胸痛、脱力感、倦怠感

注）結核患者での使用において 4.4%（4/91 例）に関節痛が認められたとの報告がある。

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

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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

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〕の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

（1）製剤：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）有効成分：該当しない

2. 有効期間

有効期間：3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

・患者向医薬品ガイド：有り
・くすりのしおり：有り
・患者様用指導箋：有り
「レボフロキサシン錠 500mg/250mg「CH」服用される患者さまへ」
日本ジェネリック医療関係者向けホームページ：製品情報ページ〔患者さま向け指導箋〕参照
https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/

6. 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®点眼液 0.5%、クラビット®点眼液 1.5%、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

同効薬：オフロキサシン、シプロフロキサシン塩酸塩水和物、ノルフロキサシン等

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売 承認年月日	承認番号	薬価基準 収載年月日	販売開始年月日
レボフロキサシン錠 250mg「CH」	2014 年 8 月 15 日	22600AMX01131000	2014 年 12 月 12 日	2014 年 12 月 12 日
レボフロキサシン錠 500mg「CH」	2014 年 8 月 15 日	22600AMX01132000	2014 年 12 月 12 日	2014 年 12 月 12 日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

効能・効果及び用法・用量追加承認年月日：2016 年 2 月 3 日

内容：「＜適応菌種＞結核菌、＜適応症＞肺結核及びその他の結核症」の効能・効果、「肺結核及びその他の結核症」に対する用法・用量の追加

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJ コード）	HOT（9 桁）番号	レセプト電算コード
レボフロキサシン錠250mg「CH」	6241013F2047	6241013F2047	123791701	622379101
レボフロキサシン錠500mg「CH」	6241013F3043	6241013F3043	123792401	622379201

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

1) 医療用医薬品品質情報集（オレンジブック）No.25（平成 18 年3月版、厚生労働省医薬食品局）
2) 第十八改正日本薬局方解説書
3) 長生堂製薬株式会社　社内資料（レボフロキサシン錠 250mg「CH」の加速試験）
4) 長生堂製薬株式会社　社内資料（レボフロキサシン錠 500mg「CH」の加速試験）
5) 長生堂製薬株式会社　社内資料（レボフロキサシン錠 250mg「CH」の無包装状態の安定性試験）
6) 長生堂製薬株式会社　社内資料（レボフロキサシン錠 500mg「CH」の無包装状態の安定性試験）
7) 長生堂製薬株式会社　社内資料（レボフロキサシン錠 250mg「CH」の生物学的同等性試験（溶出試験））
8) 長生堂製薬株式会社　社内資料（レボフロキサシン錠 500mg「CH」の溶出試験）
9) 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
10) 呼吸器感染症を対象とした一般臨床試験（国内第Ⅲ相）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.12）
11) 下気道感染症および尿路感染症を対象とした臨床試験（海外第Ⅲ相）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.11）
12) 河野　茂ほか：日本化学療法学会雑誌. 2003；51（S-1）：255-278
13) Yu VL, et al.：Chest. 2004；125（6）：2135-2139
14) 複雑性尿路感染症を対象とした一般臨床試験（国内第Ⅲ相）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.13）
15) 国内第Ⅲ相試験（産婦人科領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
16) 国内第Ⅲ相試験（皮膚科領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
17) 海外臨床試験（皮膚科、外科領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
18) 国内第Ⅲ相試験（外科領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
19) 国内第Ⅲ相試験（耳鼻科領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
20) 国内第Ⅲ相試験（眼科領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
21) 国内第Ⅲ相試験（感染性腸炎領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
22) 国内第Ⅲ相試験（歯科・口腔外科領域）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
23) 山中　昇ほか：耳鼻咽喉科臨床. 2011；104（9）：657-666
24) 安田　満ほか：日本化学療法学会雑誌. 2011；59（6）：585-596
25) 三鴨廣繁ほか：Jpn J Antibiot. 2011；64（4）：217-228
26) 山中　昇ほか：耳鼻咽喉科臨床. 2011；104（8）：591-605
27) Fujimoto T, et al.：Chemotherapy. 1990；36：268-276

28) Imamura M, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1987 ; 31（2）: 325-327
29) Hoshino K, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1991 ; 35（2）: 309-312
30) Hoshino K, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1994 ; 38（11）: 2623-2627
31) Tanaka M, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1991 ; 35（7）: 1489-1491
32) Tanaka M, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1997 ; 41（11）: 2362-2366
33) Une T, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1988 ; 32（9）: 1336-1340
34) Tanaka M, et al. : Arzneimittel-Forsch/Drug Res. 1989 ; 39（Ⅱ）（7）: 750-754
35) *Legionella pneumophila* に対する *in vitro* 抗菌活性（クラビット錠：2006 年 2 月 23 日承認、審査報告書）
36) Tanaka M, et al. : J Antimicrob Chemother. 1990 ; 26（5）: 659-666
37) 五島瑳智子ほか：Chemotherapy. 1992 ; 40（S-3）: 14-26
38) 渡辺邦友ほか：Chemotherapy. 1992 ; 40（S-3）: 57-63
39) 西野武志ほか：Chemotherapy. 1992 ; 40（S-3）: 36-50
40) Frean JA, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1996 ; 40（11）: 2646-2647
41) Ikäheimo I, et al. : J Antimicrob Chemother. 2000 ; 46（2）: 287-290
42) Trujillano-Martin I, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1999 ; 43（1）: 194-195
43) Maurin M, et al. : J Antimicrob Chemother. 1997 ; 39（6）: 725-730
44) 臨床分離株に対する抗菌活性（クラビット点滴静注：2010 年 10 月 27 日承認、審査報告書）
45) 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（クラビット錠：2015 年 8 月 24 日承認、審査報告書）
46) 中尾偕主ほか：西日本泌尿器科. 1994 ; 56（4）: 461-464
47) 神田裕子ほか：日本化学療法学会雑誌. 2009 ; 57（1）: 1-14
48) 長生堂製薬株式会社　社内資料（レボフロキサシン錠 500mg「CH」の生物学的同等性試験）
49) Shiba K, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1992 ; 36（10）: 2270-2274
50) シメチジン、プロベネシドによる影響（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.6）
51) 分布（日本人）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3）
52) 分布（日本人）（クラビット錠・細粒：2002 年 3 月 15 日承認、審査報告書）
53) 山下真寿男ほか：Chemotherapy. 1992 ; 40（Suppl 3）: 203-209
54) 公文裕巳、大森弘之：西日本泌尿器科. 1992 ; 54（6）: 951-953
55) 分布（外国人）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
56) 血漿蛋白結合率（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
57) 尿中代謝物（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
58) 谷村　弘ほか：Jpn J Antibiot. 1992 ; 45（5）: 557-568
59) 尿中排泄（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.1）
60) Nakashima M, et al. : 臨床薬理. 1992 ; 23（2）: 515-520
61) 腎機能低下者を対象とした臨床薬理試験（国内第Ⅲ相）（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.4）
62) Effects of Renal Dysfunction（クラビット錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.4）
63) 梅田　優ほか：日本透析医学会雑誌. 1997 ; 30（2）: 109-115
64) Kanamori M, et al. : 臨床薬理. 2001 ; 32（3）: 91-99

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

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉砕

1. 保存条件
   25℃/75%RH、1ヶ月〔遮光・開放〕
2. 試験項目
   性状、定量試験
3. 試験結果

錠 250mg

試験項目	性状	定量試験
製剤の規格（参考） （粉砕前の状態）	(1)	(2)
試験開始時	淡黄白色の粉末	100.2%
2週間	変化なし	100.6%
1ヶ月	変化なし	99.4%

(1) 黄色の割線入りフィルムコーティング錠
(2) 表示量の 95.0 ～ 105.0%

錠 500mg

試験項目	性状	定量試験
製剤の規格（参考） （粉砕前の状態）	(1)	(2)
試験開始時	淡黄白色の粉末	99.7%
2週間	変化なし	101.6%
1ヶ月	変化なし	100.3%

(1) うすいだいだい色の割線入りフィルムコーティング錠
(2) 表示量の 95.0 ～ 105.0%

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

1. 試験方法

崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管栄養チューブの注入端より 2 ～ 3mL/秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄し、チューブの通過性を確認する。チューブサイズは 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr.、と通過するまで変更する。

2. 試験結果

崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
レボフロキサシン錠 250mg「CH」	5 分以内に崩壊・懸濁した。
レボフロキサシン錠 500mg「CH」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

通過性試験結果

品目名	通過性
レボフロキサシン錠 250mg「CH」	8Fr.のチューブを通過した。
レボフロキサシン錠 500mg「CH」	8Fr.のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし

Memo

Memo