

## 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

蛍光眼底造影剤

**フルオレサイト® 静注 500mg**  
**FLUORESCITE® Intravenous Injection 500mg**

フルオレセイン注射液

剤形	注射剤
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	1 バイアル (5mL) 中にフルオレセイン 500mg を含有
一般名	和名：フルオレセイン 洋名：fluorescein
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：2007 年 3 月 22 日 薬価基準収載年月日：2007 年 6 月 15 日 販売開始年月日：1978 年 9 月 1 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：ノバルティス ファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ノバルティス ファーマ株式会社 ノバルティスダイレクト TEL：0120-003-293 受付時間：月～金 9:00～17:30（祝日及び当社休日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://drs-net.novartis.co.jp/">https://drs-net.novartis.co.jp/</a>

本 IF は 2023 年 10 月改訂の電子化された添付文書（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。

専用アプリ「添文ナビ®」で GS1 バーコードを読み取ることにより、最新の電子添文等を閲覧できます。



001714987443374512

## 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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI F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I F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、I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI F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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I F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「X II. 参考資料」、「X III. 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

I F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。I F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・表現には薬機法の広告規則や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、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I F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、I F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) 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	4
I-1 開発の経緯	1	(2) 包装	4
I-2 製品の治療学的特性	1	(3) 予備容量	4
I-3 製品の製剤学的特性	1	(4) 容器の材質	5
I-4 適正使用に関して周知すべき特性	1	IV-11 別途提供される資材類	5
I-5 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	IV-12 その他	5
(1) 承認条件	1	V. 治療に関する項目	6
(2) 流通・使用上の制限事項	1	V-1 効能又は効果	6
I-6 RMPの概要	1	V-2 効能又は効果に関連する注意	6
II. 名称に関する項目	2	V-3 用法及び用量	6
II-1 販売名	2	(1) 用法及び用量の解説	6
(1) 和名	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	6
(2) 洋名	2	V-4 用法及び用量に関連する注意	6
(3) 名称の由来	2	V-5 臨床成績	6
II-2 一般名	2	(1) 臨床データパッケージ	6
(1) 和名 (命名法)	2	(2) 臨床薬理試験	6
(2) 洋名 (命名法)	2	(3) 用量反応探索試験	6
(3) ステム	2	(4) 検証的試験	6
II-3 構造式又は示性式	2	1) 有効性検証試験	6
II-4 分子式及び分子量	2	2) 安全性試験	6
II-5 化学名 (命名法) 又は本質	2	(5) 患者・病態別試験	6
II-6 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(6) 治療的使用	6
III. 有効成分に関する項目	3	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	7
III-1 物理化学的性質	3	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	7
(1) 外観・性状	3	(7) その他	7
(2) 溶解性	3	VI. 薬効薬理に関する項目	8
(3) 吸湿性	3	VI-1 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	8
(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点	3	VI-2 薬理作用	8
(5) 酸塩基解離定数	3	(1) 作用部位・作用機序	8
(6) 分配係数	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	8
(7) その他の主な示性値	3	(3) 作用発現時間・持続時間	8
III-2 有効成分の各種条件下における安定性	3	VII. 薬物動態に関する項目	9
III-3 有効成分の確認試験法、定量法	3	VII-1 血中濃度の推移	9
IV. 製剤に関する項目	4	(1) 治療上有効な血中濃度	9
IV-1 剤形	4	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	9
(1) 剤形の区別	4	(3) 中毒域	9
(2) 製剤の外観及び性状	4	(4) 食事・併用薬の影響	9
(3) 識別コード	4	VII-2 薬物速度論的パラメータ	9
(4) 製剤の物性	4	(1) 解析方法	9
(5) その他	4	(2) 吸収速度定数	9
IV-2 製剤の組成	4	(3) 消失速度定数	9
(1) 有効成分 (活性成分) の含量及び添加剤	4	(4) クリアランス	9
(2) 電解質等の濃度	4	(5) 分布容積	9
(3) 熱量	4	(6) その他	9
IV-3 添付溶解液の組成及び容量	4	VII-3 母集団 (ポピュレーション) 解析	10
IV-4 力価	4	(1) 解析方法	10
IV-5 混入する可能性のある夾雑物	4	(2) パラメータ変動要因	10
IV-6 製剤の各種条件下における安定性	4	VII-4 吸収	10
IV-7 調製法及び溶解後の安定性	4		
IV-8 他剤との配合変化 (物理化学的变化)	4		
IV-9 溶出性	4		
IV-10 容器・包装	4		

VII-5	分布	10	(6) 局所刺激性試験	15
	(1) 血液-脳関門通過性	10	(7) その他の特殊毒性	15
	(2) 血液-胎盤関門通過性	10		
	(3) 乳汁への移行性	10	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	16
	(4) 髄液への移行性	10	X-1 規制区分	16
	(5) その他の組織への移行性	10	X-2 有効期間	16
	(6) 血漿蛋白結合率	10	X-3 包装状態での貯法	16
VII-6	代謝	10	X-4 取扱い上の注意	16
	(1) 代謝部位及び代謝経路	10	X-5 患者向け資材	16
	(2) 代謝に関与する酵素 (CYP等) の分子種、寄与率	10	X-6 同一成分・同効薬	16
	(3) 初回通過効果の有無及びその割合	11	X-7 国際誕生年月日	16
	(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	11	X-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	16
VII-7	排泄	11	X-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	16
VII-8	トランスポーターに関する情報	11	X-10 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	16
VII-9	透析等による除去率	11	X-11 再審査期間	16
VII-10	特定の背景を有する患者	11	X-12 投薬期間制限に関する情報	16
VII-11	その他	11	X-13 各種コード	16
			X-14 保険給付上の注意	16
<b>VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目</b>		12	<b>XI. 文献</b>	17
VIII-1	警告内容とその理由	12	XI-1 引用文献	17
VIII-2	禁忌内容とその理由	12	XI-2 その他の参考文献	17
VIII-3	効能又は効果に関連する注意とその理由	12	<b>XII. 参考資料</b>	18
VIII-4	用法及び用量に関連する注意とその理由	12	XII-1 主な外国での発売状況	18
VIII-5	重要な基本的注意とその理由	12	XII-2 海外における臨床支援情報	18
VIII-6	特定の背景を有する患者に関する注意	12	<b>XIII. 備考</b>	20
	(1) 合併症・既往歴等のある患者	12	XIII-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	20
	(2) 腎機能障害患者	13	(1) 粉碎	20
	(3) 肝機能障害患者	13	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	20
	(4) 生殖能を有する者	13	XIII-2 その他の関連資料	20
	(5) 妊婦	13		
	(6) 授乳婦	13		
	(7) 小児等	13		
	(8) 高齢者	13		
VIII-7	相互作用	13		
	(1) 併用禁忌とその理由	13		
	(2) 併用注意とその理由	13		
VIII-8	副作用	13		
	(1) 重大な副作用と初期症状	13		
	(2) その他の副作用	14		
VIII-9	臨床検査結果に及ぼす影響	14		
VIII-10	過量投与	14		
VIII-11	適用上の注意	14		
VIII-12	その他の注意	14		
	(1) 臨床使用に基づく情報	14		
	(2) 非臨床試験に基づく情報	14		
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>		15		
IX-1	薬理試験	15		
	(1) 薬効薬理試験	15		
	(2) 安全性薬理試験	15		
	(3) その他の薬理試験	15		
IX-2	毒性試験	15		
	(1) 単回投与毒性試験	15		
	(2) 反復投与毒性試験	15		
	(3) 遺伝毒性試験	15		
	(4) がん原性試験	15		
	(5) 生殖発生毒性試験	15		

# I. 概要に関する項目

## I-1. 開発の経緯

Ehrlich (1882) は家兎にフルオレセインを静注し、この色素が前房に出現するのを観察した。蛍光眼底撮影については、Chao らが 1959 年ネコに試み、ヒトでは Novotony が、1961 年 2 種のフィルターを用い、蛍光のみを選択的に撮影した。それ以来、眼科領域で、特に網膜血管を形態学的に調べることにより、網膜血管障害（糖尿病性網膜症、中心性網膜炎、網膜静脈閉塞症など）の診断や機能検査に用いられ、他の眼科領域にも使用されてきている。発売時より眼科領域のほか、外科手術時の胆嚢等の診断及び内科領域に適応があったが、昭和 61 年 12 月の再評価結果により適応は「ぶどう膜・網膜・視神経等の疾患の診断」に限られた。

## I-2. 製品の治療学的特性

1. 蛍光を発する色素で、肘静脈内に注入後、網膜及び脈絡膜の血管に蛍光が出現する。蛍光眼底造影により、網膜血管の形態的病変を鮮明に捉えるとともに、連続撮像により、眼底の血行状態変化、微小血管系の壁透過性の変化及び眼底病巣と血管系関連性等を捉える。  
(「V-1. 効能又は効果」の項参照)
2. 国内で唯一フルオレセイン 10% を含有する蛍光眼底造影剤である。  
(「X-6. 同一成分・同効薬」)
3. 重大な副作用としてショック、アナフィラキシー、心停止が報告されている。  
(VIII-8.副作用(1)重大な副作用と初期症状の項参照)

## I-3. 製品の製剤学的特性

該当しない

## I-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
医薬品リスク管理計画 (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

## I-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

## I-6. RMPの概要

該当しない

## II. 名称に関する項目

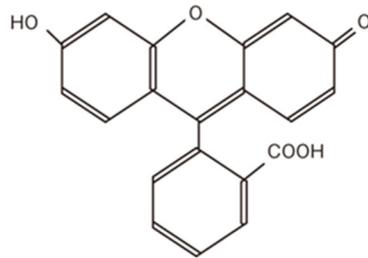
### II-1. 販売名

- (1) 和名 フルオレサイト® 静注 500mg
- (2) 洋名 FLUORESCITE® Intravenous Injection 500mg
- (3) 名称の由来 特になし

### II-2. 一般名

- (1) 和名 (命名法) フルオレセイン (JAN)
- (2) 洋名 (命名法) Fluorescein (JAN)
- (3) ステム 不明

### II-3. 構造式又は示性式



### II-4. 分子式及び分子量

分子式 :  $C_{20}H_{12}O_5$   
分子量 : 332.31

### II-5. 化学名 (命名法) 又は本質

3',6'-dihydroxyspiro[isobenzofuran-1(3H),9'-[9H]xanthen]-3-one (JAN)

### II-6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### Ⅲ-1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

だいたい色の粉末で、においはない。

(2) 溶解性

エタノール(95)又は水酸化ナトリウム試液に溶けやすく、水にほとんど溶けない。

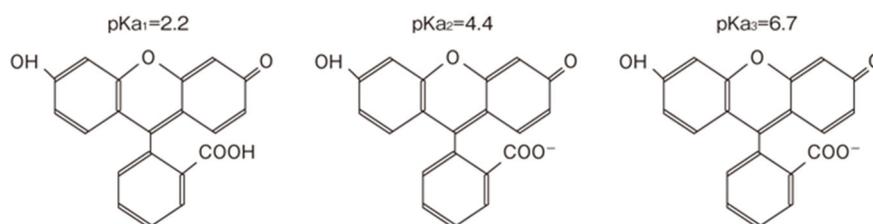
(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)、  
沸点、凝固点

融点：314～316℃

(5) 酸塩基解離定数



(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

Ⅲ-2. 有効成分の各種  
条件下における  
安定性

該当資料なし

Ⅲ-3. 有効成分の確認  
試験法、定量法

有効成分の確認試験法：

- (1) 蛍光試験：アルカリ性下で緑色の強い蛍光を現す
- (2) 呈色反応：水酸化ナトリウム試液に本品を加えた溶解液をろ紙に滴下する時、黄色を呈する。このろ紙を臭素ガス、アンモニアガスの順に接触させると赤色になる

定量法：

液体クロマトグラフィー

## IV. 製剤に関する項目

IV-1. 剤形	
(1) 剤形の区別	注射剤
(2) 製剤の外観及び性状	赤色～黄赤色澄明の注射液
(3) 識別コード	該当しない
(4) 製剤の物性	pH : 8.6～9.6 浸透圧比 : 約 2～3 (0.9%塩化ナトリウム液に対する比)
(5) その他	該当しない
IV-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 : 1 バイアル (5mL) 中、フルオレセイン 500mg を含有する。 添加剤 : 水酸化ナトリウム 150mg、pH 調節剤 2 成分 適量
(2) 電解質等の濃度	該当しない
(3) 熱量	該当しない
IV-3. 添付溶解液の組成及び容量	該当しない
IV-4. 力価	該当しない
IV-5. 混入する可能性のある夾雑物	該当資料なし
IV-6. 製剤の各種条件下における安定性	保存条件 : 無色バイアル入り、温度 40℃ 保存期間 : 9 週間 結果 : 性状、pH、浸透圧比、含量ともに変化は認められなかった
IV-7. 調製法及び溶解後の安定性	該当しない
IV-8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	該当資料なし（他剤との混合注射は、避けること。）
IV-9. 溶出性	該当しない
IV-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	特記事項なし
(2) 包装	5mL [12 バイアル]
(3) 予備容量	該当しない

(4) 容器の材質

バイアル：無色透明のガラス  
ゴ ム 栓：クロロブチルゴム

IV-11. 別途提供される資材  
類

該当しない

IV-12. その他

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

V-1. 効能又は効果	<p><b>4. 効能又は効果</b> ぶどう膜・網膜・視神経等の疾患の診断</p> <p>(解説) 本品は蛍光を発する色素で、肘静脈内に注入すると、網膜及び脈絡膜の血管に蛍光が出現することから、眼科領域で蛍光造影診断に用いられる。蛍光眼底造影により、網膜血管の形態的病変を鮮明に捉えるとともに、連続撮影により、眼底の血行状態の変化、微小血管系の壁透過性の変化、及び眼底病巣と血管系の関連性なども捉えることができる。<sup>1)</sup> 本品を肘静脈内に注入すると、9～14 秒後には網膜及び脈絡膜の血管に蛍光の出現が眼底カメラ下に観察される。この時に最初の撮影を行い、以後2～3秒ごとに連続撮影を行う。 本品による副作用の発現防止には、アレルギー歴の問診、全身病の有無、注射速度、その他の対策が検討されている。<sup>2)</sup></p>
V-2. 効能又は効果に関連する注意	<p><b>5. 効能又は効果に関連する注意</b> 5.1 慎重に適応を決定すること。また、他の方法による診断の可能性を検討すること。</p>
V-3. 用法及び用量	<p><b>6. 用法及び用量</b> フルオレセインとして、通常 200～500mg を肘静脈に注射する。</p>
(1) 用法及び用量の解説	該当資料なし
(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	該当資料なし
V-4. 用法及び用量に関する注意	<p><b>7. 用法及び用量に関連する注意</b> 7.1 本剤は静脈内にのみ使用し、髄腔内への使用は重篤な副作用が発現する可能性があるので使用しないこと。</p>
V-5. 臨床成績	該当資料なし
(1) 臨床データパッケージ	該当しない
(2) 臨床薬理試験	該当しない
(3) 用量反応探索試験	該当しない
(4) 検証的試験	該当しない
1) 有効性検証試験	該当しない
2) 安全性試験	該当しない
(5) 患者・病態別試験	該当しない
(6) 治療的使用	

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

VI-1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	フルオレセインナトリウム 注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。
VI-2. 薬理作用	本品には薬理作用がなく、眼科領域で蛍光造影診断用医薬品として使用される。
(1) 作用部位・作用機序	該当しない
(2) 薬効を裏付ける試験成績	該当しない
(3) 作用発現時間・持続時間	該当しない

## VII. 薬物動態に関する項目

### VII-1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な  
血中濃度

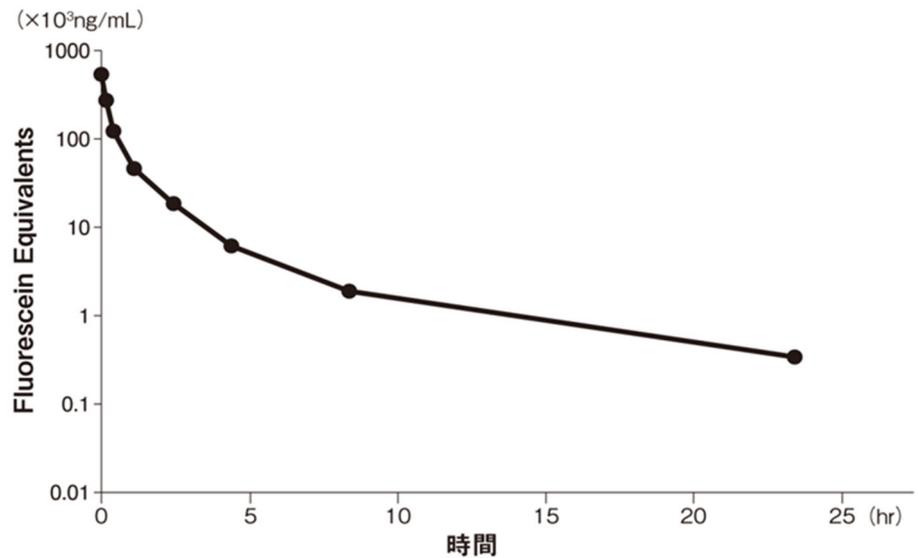
該当しない

(2) 臨床試験で確認され  
た血中濃度

<参考：外国人データ<sup>3)</sup>>

健常人にフルオレセインナトリウム 14mg/kg を静注投与したところ、血漿中濃度は下図のように推移し、フルオレセインの消失半減期 (T<sub>1/2</sub>) はα相で6.46分、β相で47.4分、γ相で301分であった。

▼フルオレセインの血漿中濃度



(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当しない

### VII-2. 薬物速度論的 パラメータ

(1) 解析方法

ノンコンパートメントモデル解析

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

<参考：外国人データ<sup>4)</sup>>

139mL/min (フルオレセイン 0.5mmol/L 静注投与時)

(5) 分布容積

<参考：外国人データ<sup>4)</sup>>

36.8L/70kg (フルオレセイン 0.5mmol/L 静注投与時)

(6) その他

該当資料なし

VII-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

VII-4. 吸収 該当資料なし

<参考：外国人データ<sup>3)</sup>>  
 健常人にフルオレセインナトリウム 14mg/kg を静脈内投与した結果、AUC は 11,000±1,900 μg·min/mL eq. であった。

VII-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 <参考<sup>5,6)</sup>>  
 妊娠しているハツカネズミに 5%および 10%フルオレセインナトリウム 500mg/kg を静注後、直ちに開腹してみると胎盤、羊水、胎仔ともに染色されていた。また、ラット及びウサギに 10%フルオレセインナトリウムを 100mg/kg 静注した実験では、胎仔内濃度は投与後速やかに上昇し、妊娠が進むにつれてフルオレセイン濃度が高くなる傾向にあった。

(3) 乳汁への移行性 成人女性に 10%フルオレセインナトリウム 5mL を静注したところ、6 時間後に最高乳汁中濃度（372ng/mL）に達し、半減期は約 62 時間であった。<sup>7)</sup>

(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 <参考<sup>8)</sup>>  
 白色家兎にフルオレセイン 20 μmol/kg を耳静脈から投与し、血液および前眼部組織内濃度を投与 30 分、5 時間後に測定した。

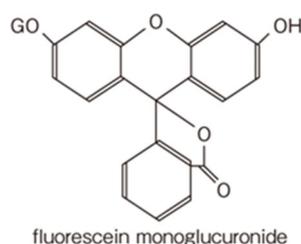
(単位：μmol/kg)

	血漿	角膜	房水	虹彩・毛様体	前部強膜
30分	1.64	0.30	0.33	2.64	2.12
5時間	0.0005	0.26	0.03	0.06	0.21

(6) 血漿蛋白結合率 85%が血漿蛋白と結合する。<sup>9)</sup>

VII-6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路 フルオレセインは静注投与後、肝臓でグルクロン酸抱合を受け、フルオレセインモノグルクロニドに代謝される。<sup>3,10,11)</sup>



(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率 β-グルクロニダーゼ<sup>10,11)</sup>

(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
VII-7. 排泄	<p>(1) 排泄部位  &lt;参考：外国人データ<sup>4)</sup>&gt;  フルオレセイン 0.5mmol/L を静注投与したところ、大部分が尿中に、一部は胆汁中に排泄された。</p> <p>(2) 排泄率  &lt;参考<sup>12)</sup>&gt;  雄ラットにフルオレセイン 3mg/kg を静注投与後 2 時間における排泄率は、尿中に 19.5～40.3%、胆汁中に 9.1～19.4%であった。</p> <p>(3) 排泄速度  該当資料なし</p>
VII-8. トランスポーターに関する情報	該当資料なし
VII-9. 透析等による除去率	<p>(1) 腹膜透析  該当資料なし</p> <p>(2) 血液透析  透析患者にフルオレサイト静注 500mg による蛍光眼底造影後、速やかに血液透析を開始した。血中濃度は透析 4 時間後で透析前値の 17.5%、5 時間で 14%に低下した。またクリアランスは 1 時間値約 20.2mL/min、2 時間値約 30.8mL/min であった。<sup>13)</sup></p> <p>(3) 直接血液灌流  該当資料なし</p>
VII-10. 特定の背景を有する患者	該当資料なし
VII-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

VIII-1. 警告内容とその理由	<p>1. 警告</p> <p>1.1 ショック等の重篤な副作用があらわれることがある。 [8.1、11.1.1 参照]</p>
VIII-2. 禁忌内容とその理由	<p>2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）</p> <p>2.1 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者</p> <p>2.2 全身衰弱の患者 [全身状態がさらに悪化し、重篤な副作用が発現するおそれがある。]</p> <p>2.3 重篤な糖尿病の患者 [重篤な副作用が発現するおそれがある。]</p> <p>2.4 重篤な心疾患のある患者 [重篤な副作用が発現するおそれがある。]</p> <p>2.5 重篤な脳血流障害のある患者 [重篤な副作用が発現するおそれがある。]</p> <p>2.6 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5 参照]</p> <p>2.7 肝硬変の患者 [9.3.1 参照]</p>
VIII-3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	「V-2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。
VIII-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」を参照すること。
VIII-5. 重要な基本的注意とその理由	<p>8. 重要な基本的注意</p> <p>8.1 本剤の投与により、まれにショック、アナフィラキシー等の重篤な過敏症状があらわれることがあるので、投与に際しては以下の点に留意すること<sup>2)</sup>。 [1.1、11.1.1 参照]</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・十分に問診を行うこと。</li> <li>・患者の全身状態の観察を十分に行い、投与時または撮影時に異常が生じた場合、直ちに中止し、適切な処置を行うこと。なお検査終了後にも副作用の発現の可能性をあることを患者に説明した上で、異常が認められた場合には、担当医師に連絡するよう指示するなど適切な対応をとること。</li> <li>・投与量はできるだけ必要最小量にとどめること。</li> <li>・検査中は血管確保をしておく等、常時直ちに救急処置のとれる準備をしておくことが望ましい。</li> </ul> <p>8.2 皮内反応を実施した場合、その結果が陽性の患者においては、過敏症状があらわれるおそれがあるため、診断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。なお、陰性の場合であっても過敏症状があらわれることがある。</p>
VIII-6. 特定の背景を有する患者に関する注意	<p>9. 特定の背景を有する患者に関する注意</p> <p>9.1 合併症・既往歴等のある患者</p> <p>9.1.1 褐色細胞腫又はパラガングリオーマ若しくは心疾患の疑いのある患者</p> <p>診断上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。血圧の急激な変動を起し、重篤な副作用が発現するおそれがある。</p> <p>9.1.2 重症喘息、肺気腫、呼吸器感染症の患者</p> <p>症状を増悪させるおそれがある。</p> <p>9.1.3 アレルギー素因のある患者</p> <p>9.1.4 重篤な高血圧症の患者</p> <p>血圧の変動を起すおそれがある</p>

(解説)

9.1.1 「褐色細胞腫・パラガングリオーマ診療ガイドライン 2018」(日本内分泌学会「悪性褐色細胞腫の実態調査と診療指針の作成」委員会編集)において、従来、褐色細胞腫とパラガングリオーマの総称として慣用的に用いられてきた「褐色細胞腫」について、新たに「褐色細胞腫・パラガングリオーマ」と定義されたため、2023年10月に「パラガングリオーマ」の記載を追記した。

(2) 腎機能障害患者

**9.2 腎機能障害患者**

主たる排泄経路は腎臓であるので、排泄遅延から血中濃度が上昇するおそれがある

(3) 肝機能障害患者

**9.3 肝機能障害患者**

**9.3.1 肝硬変のある患者**

投与しないこと。重篤な副作用が発現するおそれがある。[2.7 参照]

**9.3.2 肝障害のある患者**

一部肝臓から胆汁中に排泄され、症状を増悪させるおそれがある。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

**9.5 妊婦**

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。[2.6 参照]

(6) 授乳婦

**9.6 授乳婦**

授乳しないことが望ましい。ヒト母乳中への移行が報告されている。

(7) 小児等

**9.7 小児等**

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

**9.8 高齢者**

診断上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。特に必要とする場合には、患者の状態を十分に観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

**VIII-7. 相互作用**

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

**VIII-8. 副作用**

**11. 副作用**

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

**11.1 重大な副作用**

**11.1.1 ショック(0.1%未満)、アナフィラキシー(頻度不明)**

発赤、そう痒感、胸内苦悶、血圧低下、顔面蒼白、脈拍異常、呼吸困難、意識消失等の症状があらわれることがある。[1.1、8.1 参照]

**11.1.2 心停止(頻度不明)**

患者の全身状態の観察を十分に行い、異常が生じた場合は、直ちに心マッサージ、アドレナリン等のカテコールアミン投与等の蘇生処置を行うこと。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
種類/頻度	5%以上又は 頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
消化器	悪心、 腹痛	嘔吐	
過敏症	そう痒症、 潮紅、 紅斑	蕁麻疹、 発疹	光線過敏症等
精神神経系	意識消失、 めまい		頭痛
その他	尿の黄褐色着 色、皮膚の一過 性の黄変、血圧 低下、 血圧上昇、 咳嗽、 咽喉刺激感、熱 感		注射部位の血栓 性静脈炎

注) 発現頻度は文献、自発報告等を参考に集計した。

(1) 項目別副作用発現頻度率及び臨床検査値異常一覧  
該当資料なし

(2) 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

VIII-9. 臨床検査結果に及ぼす影響

本品は蛍光物質であるため、蛍光物質を用いた検査では検査値を変動させる可能性がある。

<参考：外国人データ<sup>14)</sup>>

5%フルオレセイン溶液 10mL 又は 10%溶液 5～7mL を静注後 30 秒及び 2 分後の血糖値が、2～10mg/100mL 減少した。

VIII-10. 過量投与

該当資料なし

VIII-11. 適用上の注意

<p>14. 適用上の注意</p> <p>14.1 薬剤投与前の注意 バイアルは使用前にゴム栓部をエタノール綿等で清拭して使用すること。</p> <p>14.2 薬剤投与時の注意</p> <p>14.2.1 他剤との混合注射は、避けること。</p> <p>14.2.2 本剤が血管外に漏れると疼痛を起こすので、なるべく太い静脈を選び、注意して投与すること。</p>
--

VIII-12. その他の注意

該当資料なし

(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

### IX-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) 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

### IX-2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験 雄マウス静脈内注射 LD<sub>50</sub>1,130mg/kg
- (2) 反復投与毒性試験 ラットに 100mg/kg 以下の 72 時間ごとの静脈内投与で 28 日間検討した結果、異常は認められなかった。
- (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 妊娠しているハツカネズミに 5%及び 10%フルオレセインナトリウム 500mg/kg を静注した実験では、催奇形作用及び致死作用は認められなかった。<sup>7)</sup>
- (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

X-1. 規制区分	製 剤：処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注) 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										
X-2. 有効期間	3年										
X-3. 包装状態での貯法	室温保存										
X-4. 取扱い上の注意	設定されていない										
X-5. 患者向け資料	患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり										
X-6. 同一成分・同効薬	同一成分：フローレス眼検査用試験紙 0.7mg 同効薬：該当なし										
X-7. 国際誕生年月日	1971年11月 チェコスロバキア										
X-8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準記載年月日、販売開始年月日	<table style="width: 100%; border: none;"> <tr> <td style="width: 40%;"></td> <td style="width: 30%; text-align: center;">製造販売承認年月日</td> <td style="width: 30%; text-align: center;">承認番号</td> </tr> <tr> <td>フルオレサイト® 静注500mg</td> <td style="text-align: center;">2007年3月22日</td> <td style="text-align: center;">21900AMX00762000</td> </tr> <tr> <td>フルオレサイト®注射液1号</td> <td style="text-align: center;">1977年9月29日</td> <td style="text-align: center;">15200AMY00274000</td> </tr> </table> <p>薬価基準記載年月日：            フルオレサイト® 注射液1号（アンプル製剤）1978年9月1日            フルオレサイト® 注射液1号（バイアル製剤）2005年7月8日（容器変更）            フルオレサイト® 静注 500mg 2007年6月15日（販売名変更）</p>		製造販売承認年月日	承認番号	フルオレサイト® 静注500mg	2007年3月22日	21900AMX00762000	フルオレサイト®注射液1号	1977年9月29日	15200AMY00274000	
	製造販売承認年月日	承認番号									
フルオレサイト® 静注500mg	2007年3月22日	21900AMX00762000									
フルオレサイト®注射液1号	1977年9月29日	15200AMY00274000									
X-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	2005年7月8日 承認事項一部変更（容器の変更）										
X-10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	再評価結果公表年月日：1986年（昭和61年）12月3日 内容：（1）有効であることが実証されているもの ぶどう膜・網膜・視神経等の疾患の診断 （2）有効と判定する根拠がないもの 外科手術時の胆嚢・胆管・嵌頓ヘルニア・脳腫瘍・硬膜外血腫等の診断、内科領域：胃腸機能及び血液循環状態の診断										
X-11. 再審査期間	該当しない										
X-12. 投薬期間制限に関する情報	該当しない										
X-13. 各種コード	<table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse; text-align: center;"> <thead> <tr> <th style="width: 15%;">販売名</th> <th style="width: 20%;">厚生労働省薬価基準記載医薬品コード</th> <th style="width: 20%;">個別医薬品コード (YJコード)</th> <th style="width: 15%;">HOT (13桁)番号</th> <th style="width: 30%;">レセプト電算処理コード</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>フルオレサイト静注500mg</td> <td>7290402A2035</td> <td>7290402A2035</td> <td>1170160020101</td> <td>620005210</td> </tr> </tbody> </table>	販売名	厚生労働省薬価基準記載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (13桁)番号	レセプト電算処理コード	フルオレサイト静注500mg	7290402A2035	7290402A2035	1170160020101	620005210
販売名	厚生労働省薬価基準記載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (13桁)番号	レセプト電算処理コード							
フルオレサイト静注500mg	7290402A2035	7290402A2035	1170160020101	620005210							
X-14. 保険給付上の注意	該当しない										

## XI. 文献

### X I -1. 引用文献

- |  | 社内文献 No.   |
|--|------------|
| 1) 第十七改正 日本薬局方解説書 2016: C-4611 廣川書店  | [20200400] |
| 2) 宇山昌延 ほか：日本眼科学会雑誌 1983; 87(4): 300-305   | [20161030] |
| 3) Blair, N.P. et al. : Invest. Ophthalmol. Vis. Sci. 1986; 27(7): 1107-1114 (PMID : 3721789)        | [20161031] |
| 4) Barry, R.E. et al. : Arzneimittel-Forschung (Drug Research) 1985; 35(3): 644-648 (PMID : 4039592) | [20161035] |
| 5) 白井正一郎 ほか：日本眼科紀要 1975; 26(2): 132-136  | [20190162] |
| 6) 藤井治：東邦医学会雑誌 1986; 32(5, 6): 609-622   | [20190163] |
| 7) Maguire, A.M. et al. : Arch. Ophthalmol. 1988; 106(6): 718-719 (PMID : 3369981)                   | [20160861] |
| 8) 白矢勝一 ほか：眼科臨床医報 1989; 83(8): 1657-1659   | [20190164] |
| 9) Brubaker, R.F. et al. : Arch. Ophthalmol. 1982; 100(4): 625-630 (PMID : 7073582)                  | [20161032] |
| 10) Chahal, P.S. et al. : Invest. Ophthalmol. Vis. Sci. 1985; 26(5): 764-768 (PMID : 3997424)        | [20161033] |
| 11) Chen, S.C. et al. : Chem. Pharm. Bull. 1980; 28(5): 1403-1407 (PMID : 7408043)                   | [20161034] |
| 12) Webb, J.M. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 1962; 137(-): 141-146 (PMID : 14005410)             | [20161036] |
| 13) 梅田優 ほか：日本透析療法学会雑誌 1993; 26(3): 319-322   | [20160857] |
| 14) Chazan, B.I. et al. : Ann. Ophthalmol. 1971; 3(1): 42 (PMID : 5163947)                           | [20190165] |

### X I -2. その他の参考文献

「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意」9.1.1に関する参考資料  
日本内分泌学会「悪性褐色細胞腫の実態調査と診療指針の作成」委員会編集：  
褐色細胞腫・パラガングリオーマ診療ガイドライン 2018  
[https://minds.jcqh.or.jp/docs/gl\\_pdf/G0001079/4/Pheochromocytoma\\_parganglioma.pdf](https://minds.jcqh.or.jp/docs/gl_pdf/G0001079/4/Pheochromocytoma_parganglioma.pdf) (2023/09/25 アクセス)

## XII. 参考資料

### X II-1. 主な外国での発売状況

2022年10月時点で、Alcon Laboratories社のFluorescein製剤（注射剤）がアメリカ、オーストラリア、ニュージーランドにて承認されている。

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

**4. 効能又は効果**  
ぶどう膜・網膜・視神経等の疾患の診断

**6. 用法及び用量**  
フルオレセインとして、通常 200～500mg を肘静脈に注射する。  
海外の承認内容については、各国の最新の添付文書を確認すること。

米国の添付文書（2021年11月改訂）の概略

販売名	FLUORESCITE®
剤形・規格	Injection: 500 mg/5 mL (100 mg/mL) in a single-dose vial
販売企業名	Alcon Laboratories, Inc.
承認年	1976年
効能又は効果	FLUORESCITE® Injection 10% is indicated in diagnostic fluorescein angiography or angioscopy of the retina and iris vasculature.
用法及び用量	<b>2.1 Dosing</b> <u>Adult Dose</u> The normal adult dose of FLUORESCITE® Injection 10% (100 mg/mL) is 500 mg via intravenous (IV) administration. <u>Pediatric Dose</u> For children, the dose should be calculated on the basis of 7.7 mg for each kg of actual body weight (or 35 mg for each 10 pounds of body weight) up to a maximum of 500 mg via IV administration.

### X II-2. 海外における臨床支援情報

#### 1) 妊婦への投与に関する情報

本邦における本剤の特定の背景を有する患者に関する注意「生殖能を有する者、妊婦、授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、米国添付文書や豪ADEC分類とは異なる。

**9.5 妊婦**  
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。 [2.6 参照]

**9.6 授乳婦**  
授乳しないことが望ましい。ヒト母乳中への移行が報告されている<sup>7)</sup>。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2021年11月)	<b>8.1 Pregnancy</b> <u>Risk Summary</u> There is insufficient data with the use of fluorescein in pregnant women to inform a drug-associated risk. Adequate animal reproduction studies have not been conducted with fluorescein. Fluorescein should only be given to a pregnant woman if clearly needed. The background risk of major birth defects and miscarriage for the indicated population is unknown; however, in the U.S. general population, the estimated background risk of major birth defects is 2%-4% and of miscarriage is 15% 20% of clinically recognized pregnancies.

	<p><u>Data</u> <i>Animal Data</i> Intravenous administration of a single dose of fluorescein to pregnant rats resulted in rapid distribution into the amniotic fluid and fetus.</p> <p><b>8.2 Lactation</b> <u>Risk Summary</u> Fluorescein injection has been demonstrated to be transferred into human milk for up to 4 days following IV administration.</p>
--	---

	分類
オーストラリアの分類 (Australian categorisation system for prescribing medicines in pregnancy)	B2 (2023年9月)

<参考>オーストラリアの分類の概要 : Australian categorisation system for prescribing medicines in pregnancy  
 Category B2 : Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.  
 Studies in animals are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

2) 小児等への投与に関する海外情報

本邦における本剤の特定の背景を有する患者に関する注意「小児等」の項の記載は以下のとおりであり、米国添付文書及びEU 共通の添付文書とは異なる。

<p>9.7 小児等 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。</p>
---

出典	記載内容
米国の添付文書 (2021年11月)	<p><b>8.4 Pediatric Use</b> Pediatric patients have been included in clinical studies. No overall differences in safety or effectiveness have been observed between pediatric and adult patients.</p>

## XIII. 備考

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

**ノバルティス ファーマ株式会社**  
東京都港区虎ノ門 1-23-1