

※※2017年6月改訂(第8版)
※2014年4月改訂

貯法：室温保存
使用期限：外箱、容器に記載あり(使用期間：3年)
取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照

日本標準商品分類番号

871319

承認番号	薬価収載	販売開始
22000AMX01420	2008年7月	2008年7月

アレルギー性結膜炎治療剤<レボカバスチン塩酸塩>製剤

レボカバスチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」

LEVOCABASTINE HYDROCHLORIDE OPHTHALMIC SOLUTION 0.025%「WAKAMOTO」

〔禁忌(次の患者には投与しないこと)〕
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

〔組成・性状〕

販売名	レボカバスチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」
剤形	点眼剤
成分・含量 (1mL中)	レボカバスチン塩酸塩0.27mg(レボカバスチンとして0.25mg)を含有する。 添加物としてエデト酸ナトリウム水和物、濃ベンザルコニウム塩化物液50、ヒプロメロース、ポリソルベート80、グリセリン、リン酸水素ナトリウム水和物、リン酸二水素ナトリウム、pH調節剤を含有する。
pH	6.0~8.0
浸透圧比	0.9~1.1(生理食塩液に対する比)
性状	白色懸濁の無菌製剤

〔効能・効果〕

○アレルギー性結膜炎

〔用法・用量〕

1回1~2滴を1日4回(朝、昼、夕方及び就寝前)点眼する。

〔使用上の注意〕

1. 重要な基本的注意

本剤はベンザルコニウム塩化物を含有するため、含水性ソフトコンタクトレンズ着用時の点眼は避けること。

2. 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
オキシメタゾリン	本剤の吸収が低下する可能性がある。	機序不明

3. 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。(再審査対象外)

(1) 重大な副作用(頻度不明)

ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシー(呼吸困難、顔面浮腫等)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) その他の副作用

	頻度不明
眼	眼瞼炎、眼刺激、角膜上皮障害(角膜びらん、点状表層角膜炎等)、結膜充血、霧視(感)、そう痒感、結膜炎、眼脂、眼球乾燥感、羞明、流涙、眼瞼浮腫、眼痛
免疫系	血管神経性浮腫
皮膚	接触皮膚炎、蕁麻疹
循環器	動悸
精神神経系	頭痛、眠気

4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔動物実験(ラット)で、レボカバスチン80mg/kg経口投与(臨床投与量の33000倍以上に相当)により、胎児死亡及び催奇形性(多指、水頭、過剰中足骨及び無眼球)が報告されている。〕

(2) ヒト母乳中へ移行することが報告されているので、授乳中の婦人への投与は避け、やむを得ず投与する場合は授乳を中止させること。

5. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

6. 適用上の注意

(1) 投与経路 点眼用にのみ使用すること。

(2) 薬剤交付時 次のことを患者へ指導すること。

1) 原則として結膜嚢内に点眼し、1~5分間閉眼と共に涙嚢部を圧迫すること。

2) 本剤は懸濁液のため、使用の際にはその都度容器をよく振盪すること。

3) 点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。

4) 点眼のとき、液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。

7. その他の注意

本剤の保存剤であるベンザルコニウム塩化物による過敏症が知られている。

〔薬効薬理〕

ラット及びモルモットの実験的アレルギー性結膜炎モデルにおいて、本剤又は生理食塩液を点眼した結果、本剤は生理食塩液に比べて有意に結膜炎症状(充血、浮腫)及び結膜の血管透過性亢進を抑制した¹⁾。

生物学的同等性試験

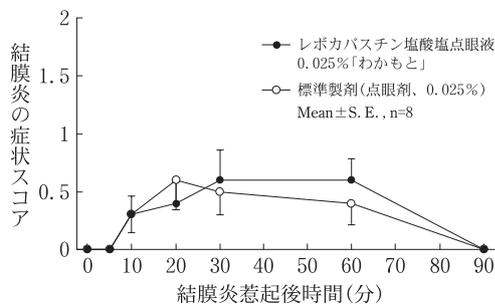
ラット及びモルモットの実験的アレルギー性結膜炎モデルにおける結膜炎の症状スコア、結膜の血管色素漏出を結膜炎抑制作用の指標とし、本剤及び標準製剤について得られた結膜炎の症状スコア、結膜の血管色素漏出量をStudentのt検定にて統計解析を行った。その結果、有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

(1) ラット実験的アレルギー性結膜炎モデル

1) 結膜炎の症状スコア

	結膜炎惹起後時間(分)					
	5	10	20	30	60	90
レボカバスチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」	0±0	0.3±0.16	0.4±0.18	0.6±0.26	0.6±0.18	0±0
標準製剤(点眼剤、0.025%)	0±0	0.3±0.16	0.6±0.26	0.5±0.19	0.4±0.18	0±0

(Mean ± S. E., n=8)



2) 結膜の血管色素漏出量

	血管色素漏出量 ($\mu\text{g}/\text{lg tissue}$)
レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」	17.6 \pm 0.8
標準製剤(点眼剤、0.025%)	18.1 \pm 0.8

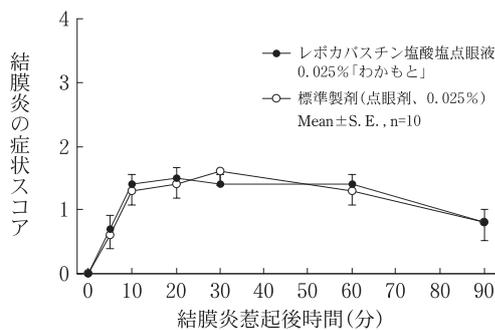
(Mean \pm S. E., n=8)

(2) モルモット実験的アレルギー性結膜炎モデル

1) 結膜炎の症状スコア

	結膜炎惹起後時間(分)					
	5	10	20	30	60	90
レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」	0.7 \pm 0.21	1.4 \pm 0.16	1.5 \pm 0.17	1.4 \pm 0.16	1.4 \pm 0.16	0.8 \pm 0.29
標準製剤(点眼剤、0.025%)	0.6 \pm 0.22	1.3 \pm 0.21	1.4 \pm 0.22	1.6 \pm 0.22	1.3 \pm 0.21	0.8 \pm 0.20

(Mean \pm S. E., n=10)



2) 結膜の血管色素漏出量

	血管色素漏出量 ($\mu\text{g}/\text{lg tissue}$)
レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」	37.8 \pm 2.0
標準製剤(点眼剤、0.025%)	37.0 \pm 2.4

(Mean \pm S. E., n=10)

症状スコア、血管色素漏出量のパラメータは、被験個体の選択、症状観察回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

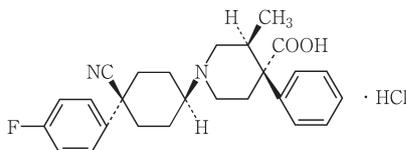
[有効成分に関する理化学的知見]

一般名 レボカバステチン塩酸塩

(Levocabastine Hydrochloride) (JAN)

化学名 (-)-(3S,4R)-1-[cis-4-cyano-4-(4-fluorophenyl)cyclohexyl]-3-methyl-4-phenylpiperidine-4-carboxylic acid monohydrochloride

構造式



分子式 $\text{C}_{26}\text{H}_{29}\text{FN}_2\text{O}_2 \cdot \text{HCl}$

分子量 456.98

性状 本品は白色もしくはほとんど白色の粉末である。本品はギ酸にやや溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)に極めて溶けにくく、水、無水酢酸、2-プロパノール又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

[取扱い上の注意]

1. 本剤は、保管の仕方によっては振り混ぜても粒子が分散しにくくなる場合があるので、上向きに保管すること。
2. 小児の手の届かない所に保管すること。

3. 安定性試験

長期保存試験(25 \pm 1 $^{\circ}\text{C}$ 、相対湿度60 \pm 5 %、3年)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確認された²⁾。

[包装]

レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」
5 mL \times 10本

[主要文献]

- 1) レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」の研究報告〔生物学的同等性試験〕(社内資料)
- 2) レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」の研究報告〔長期安定性試験〕(社内資料)

※※ [文献請求先]

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション
〒103-8330 東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号
TEL 03-3279-0379
FAX 03-3279-1272

※製造販売元
わかもと製薬株式会社
東京都中央区日本橋本町二丁目2番2号

①-1 2017.6