

貯法：室温保存
有効期間：3年

緑内障・高眼圧症治療剤
レボブノロール塩酸塩点眼液

承認番号 22000AMX01068000
販売開始 2008年7月

レボブノロール塩酸塩点眼液0.5%「ニッテン」

Levobunolol Hydrochloride Ophthalmic Solution

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)
- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 気管支喘息又はその既往歴のある患者、気管支痙攣又は重篤な慢性閉塞性肺疾患のある患者[喘息発作の誘発・増悪がみられるおそれがある。][11.1.2 参照]
- 2.3 コントロール不十分な心不全、洞性徐脈、房室ブロック(第Ⅱ、Ⅲ度)又は心原性ショックのある患者[これらの症状を増悪させるおそれがある。][11.1.3 参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	レボブノロール塩酸塩点眼液0.5%「ニッテン」
有効成分	1mL中 レボブノロール塩酸塩 5.0mg
添加剤	ホウ酸、ホウ砂、ポリソルベート80、ベンザルコニウム塩化物、pH調節剤

3.2 製剤の性状

販売名	レボブノロール塩酸塩点眼液0.5%「ニッテン」
pH	5.5~7.5
浸透圧比	0.9~1.1
性状	無色～微だいたい色澄明、無菌水性点眼剤

4. 効能又は効果

緑内障、高眼圧症

6. 用法及び用量

通常、1回1滴を1日1回点眼する。十分な眼圧下降効果が持続しない場合は1回1滴、1日2回まで点眼可能である。

7. 用法及び用量に関連する注意

1日1回又は2回点眼において、1回2滴以上を点眼しても効果は変わらないため、過量点眼にならないように注意すること。

8. 重要な基本的注意

全身的に吸収される可能性があり、β-遮断剤全身投与時と同様の副作用があらわれるおそれがあるため、留意すること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 うっ血性心不全のある患者

うっ血性心不全の症状を増悪させるおそれがある。[11.1.3 参照]

9.1.2 コントロール不十分な糖尿病患者

低血糖症の徴候や症状をマスクするおそれがある。

9.1.3 糖尿病性ケトアシドーシス及び代謝性アシドーシスのある患者

アシドーシスによる心筋収縮力の抑制を増強するおそれがある。

9.1.4 甲状腺中毒症の疑いのある患者

ある種の甲状腺機能亢進症の臨床的徴候(例えば頻脈)をマスクするおそれがある。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。[15.2 参照]

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

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。

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下していることが多い。

10. 相互作用

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
アドレナリン ジベフリン塩酸塩	散瞳が起こる可能性がある。	機序不明
カテコールアミン枯 渇剤 レセルピン等	交感神経系に対し、過剰の抑制を来すことがあり、低血圧、徐脈を生じ、眩暈、失神、起立性低血圧を起こすことがある。	カテコールアミンの枯渇を起こす薬剤は、β-遮断作用を相加的に増強する可能性がある。
β-遮断剤(全身投与) アテノロール プロプラノロール 塩酸塩 メトプロロール等	眼内圧あるいはβ-遮断剤の全身的な作用が増強されることがある。	作用が相加的にあらわれることがある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジギタリス製剤 ジゴキシン ジギトキシン等	房室伝導時間を更に延長することがある。	相加的に作用を増強する可能性がある。
カルシウム拮抗剤 ベラパミル塩酸塩 ジルチアゼム塩酸塩等	房室伝導障害、左室不全、低血圧を起こすおそれがある。	相互に作用が増強される。
フェノチアジン関連化合物 クロルプロマジン等	血圧降下を引き起こす可能性がある。	代謝を阻害する。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 眼類天疱瘡(頻度不明)

結膜充血、角膜上皮障害、乾性角結膜炎、結膜萎縮、睫毛内反、眼瞼眼球癒着等が発現することがある。

11.1.2 気管支痙攣、呼吸困難、呼吸不全、喘息発作(いずれも頻度不明)

β-受容体遮断による気管支平滑筋収縮作用により、気管支痙攣、呼吸困難、呼吸不全があらわれることがある。[2.2 参照]

11.1.3 心ブロック、うっ血性心不全、心停止(いずれも頻度不明)

β-受容体遮断による陰性変時・変力作用により、心ブロック、うっ血性心不全、心停止があらわれることがある。[2.3、9.1.1 参照]

11.1.4 脳虚血、脳血管障害(いずれも頻度不明)

11.1.5 失神(頻度不明)

11.1.6 全身性エリテマトーデス(頻度不明)

11.2 その他の副作用

	0.1~5%未満
眼	しみる、眼痛、角膜炎、結膜充血、眼瞼炎、霧視、そう痒感、眼瞼発赤
循環器	徐脈、右脚ブロック
精神神経系	頭痛、めまい

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

- 患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。
- ・薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
 - ・点眼に際しては、原則として仰臥位をとり、患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1~5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
 - ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 アレルギー性結膜炎等に罹患している患者に対する使用経験は少なく、安全性は確立していない。

15.1.2 本剤の添加物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。

15.2 非臨床試験に基づく情報

ウサギ催奇形性試験において、臨床用量の200倍又は700倍に相当する量を投与すると、胎児毒性(吸収胚数の増加が確認される)が認められた。[9.5 参照]

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

0.5%レボブノロール塩酸塩を健康成人(n=6)の片眼に1滴単回点眼した結果、1及び2時間後の採血ポイントにおいて、血漿中濃度は検出限界(1.0ng/mL)未満であった。¹⁾

16.1.2 反復投与

0.5%レボブノロール塩酸塩を健康成人(n=6)の両眼に1日1滴ずつ6日間点眼した結果、全ての採血ポイントにおいて、血漿中濃度は検出限界(0.5ng/mL)未満であった。²⁾

16.2 吸収

0.5%¹⁴C-レボブノロール塩酸塩点眼液を白色ウサギに単回点眼したところ、速やかに眼内に移行した。放射能濃度は外眼部組織である結膜、瞬膜及び角膜で点眼後10分に、前眼部組織である房水及び虹彩・毛様体で点眼後30分に最高に達した。³⁾

16.3 分布

0.5%¹⁴C-レボブノロール塩酸塩点眼液を白色ウサギに単回点眼した後、前眼部組織で確認された放射能は、点眼後4時間には最高値の10%

