

日本標準商品分類番号	871319
承認番号	22000AMX01306000
薬価収載	2008年7月
販売開始	2008年7月

貯 法：室温保存
使用期限：外箱及びラベルに記載(製造後3年)

H₁ブロッカー点眼剤

※(指定医薬品の削除) レボカバスチン点眼液0.025%「TS」

LEVOCABASTINE OPHTHALMIC SUSPENSION 0.025%「TS」

レボカバスチン塩酸塩懸濁点眼液

【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】

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)
添加物	ホウ酸、トロメタモール、ポリソルベート80、ヒプロメロース、D-マンニトール、プロピレングリコール、グリセリン、ベンザルコニウム塩化物、エドト酸ナトリウム水和物、クエン酸水和物、塩化ナトリウム
剤形	水性懸濁点眼剤
色	白色
pH	6.0~8.0
その他	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装着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。

種類	頻度	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
免疫系		血管神経性浮腫
皮膚		接触皮膚炎、蕁麻疹
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。
- 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：点眼用により使用すること。
- (2) 投 与 時：1) 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よう指導す
ること。
2) 点眼したときに液が眼瞼皮膚等につい
た場合は、すぐにふき取るよう指導す
ること。
3) 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
意するよう指導すること。

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。

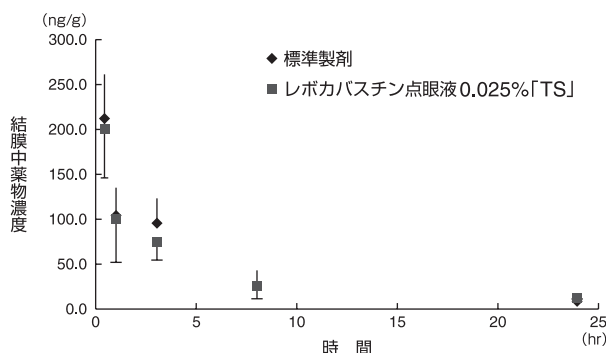
※※【薬物動態】

〈生物学的同等性試験〉

家兔結膜中における薬物滞留性

日本白色家兔に本剤あるいは標準製剤を点眼後0.5、1、3、8及
び24時間に眼瞼結膜を摘出し結膜中薬物濃度を測定した。結膜
中の薬物濃度は、本剤の点眼0.5時間後に最高値(199.19ng/g)
を示した後、一次速度式に従って徐々に消失した。本剤と標準
製剤の値を用いてStudentのt検定にて統計解析を行った結果、
いずれの測定点においても両剤の間に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。

結膜中のレボカバスチン塩酸塩濃度



n=4~5、平均値±標準誤差

【薬効薬理】

※※〈生物学的同等性試験〉¹⁾

(1)ラット実験的アレルギー性結膜炎モデルに対する作用

抗卵白アルブミンラット血清をラット結膜下に注射することにより感作し、48時間後に卵白アルブミン／エバンスブルー溶液を静脈内投与し結膜にアレルギー反応を惹起した。惹起30分後に眼球結膜及び眼瞼結膜を摘出し、組織中漏出色素量を血管透過性の指標とし評価した。本剤及び標準製剤において得られた値を用いて90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ ($= -0.09691 \sim 0.09691$)の範囲内にあることから両剤の生物学的同等性が確認された。

試験製剤	例数	組織内色素量(吸光度)
レボカバステチン点眼液0.025%「TS」	10	0.1414 ± 0.0041**
標準製剤(点眼液、0.025%)	10	0.1393 ± 0.0069**
基剤	20	0.2397 ± 0.0083

**p<0.01 (Dunnnettの多重比較検定、対基剤)、平均値±標準誤差

(2)モルモットヒスタミン誘発結膜炎モデルに対する作用

ヒスタミン溶液をモルモット眼瞼結膜嚢に投与し実験的結膜炎を惹起した。本剤あるいは標準製剤を惹起15分前に点眼投与することにより予防効果を検証し、惹起後5分及び10分に2回点眼することにより治療効果を検証した。結膜炎の程度を肉眼的に観察し、基準に従いスコア化することで評価した。基剤のスコア値に対する本剤及び標準製剤のスコア値の比率より結膜炎抑制率を算出し、それらの値を用いて90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、予防効果、治療効果共に $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ ($= -0.09691 \sim 0.09691$)の範囲内にあることから両剤の生物学的同等性が確認された。

予防効果(惹起の15分前に1回点眼)

試験製剤	例数	結膜炎抑制率(%)
レボカバステチン点眼液0.025%「TS」	8	70.4 ± 3.29
標準製剤(点眼液、0.025%)	8	67.1 ± 4.30

平均値±標準誤差

治療効果(惹起後5分及び10分に2回点眼)

試験製剤	例数	結膜炎抑制率(%)
レボカバステチン点眼液0.025%「TS」	14	41.8 ± 2.99
標準製剤(点眼液、0.025%)	14	41.8 ± 2.99

平均値±標準誤差

【有効成分に関する理化学的知見】

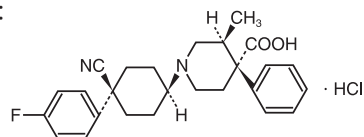
一般名：レボカバステチン塩酸塩

(levocabastine hydrochloride) [JAN]

化学名：(-)-(3*S*, 4*R*)-1-[*cis*-4-ciano-4-(4-fluorophenyl)

cyclohexyl]-3-methyl-4-phenylpiperidine-4-carboxylic acid monohydrochloride

構造式：



分子式：C₂₆H₂₉FN₂O₂ · 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、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】

〈安定性試験〉²⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、レボカバステチン点眼液0.025%「TS」は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。

【包装】

5mL×10本

【主要文献】

1)藤下繁人他：生物学的同等性試験(テイカ製薬 社内資料)

2)島谷隆夫他：安定性試験(テイカ製薬 社内資料)

【文献請求先】

〈文献請求先・製品情報お問合せ先〉

主要文献に記載の社内資料をご請求の場合は下記までお問合せください。

千寿製薬株式会社 カスタマーサポート室

〒541-0046 大阪市中央区平野町二丁目5番8号

TEL ☎0120-06-9618 FAX 06-6201-0577

受付時間 9:00~17:30(土、日、祝日を除く)

製造販売元 **テイカ製薬株式会社**
富山市荒川一丁目3番27号

発売元 **千寿製薬株式会社**
大阪市中央区平野町二丁目5番8号

販売 **武田薬品工業株式会社**
大阪市中央区道修町四丁目1番1号