

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 2008 に準拠して作成

H₁ブロッカー点眼剤

レボカバスタチン塩酸塩点眼液**0.025%**「三和」
LEVOCABASTINE HYDROCHLORIDE
 (レボカバスタチン塩酸塩点眼液) Ophthalmic Solutions 0.025% “SANWA”

剤形	懸濁性点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL 中レボカバスタチン塩酸塩 0.27mg (レボカバスタチンとして 0.25mg) を含有する
一般名	和名：レボカバスタチン塩酸塩 (JAN) 洋名：Levocabastine hydrochloride (JAN, USAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2008年3月17日 薬価基準収載年月日：2008年7月4日 発売年月日：2008年7月8日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：株式会社三和化学研究所
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	株式会社三和化学研究所 コンタクトセンター TEL 0120-19-8130 FAX (052) 950-1305 医療関係者向けホームページ http://med.skk-net.com/

本 IF は 2013 年 8 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

Ⅰ F 利用の手引きの概要—日本病院薬剤師会—

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、Ⅰ F と略す）の位置付け並びにⅠ F 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会においてⅠ F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たなⅠ F 記載要領が策定された。

2. Ⅰ F とは

Ⅰ F は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式〕

- ①規格は A 4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②Ⅰ F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「Ⅰ F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

〔Ⅰ F の作成〕

- ①Ⅰ F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②Ⅰ F に記載する項目及び配列は日病薬が策定したⅠ F 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのⅠ F の主旨に沿って必要な情報が記載される。

④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

①「IF 記載要領 2008」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。

②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。

③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。（2008 年 9 月）

目 次

I. 概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命令法）	2
6. 慣用名，別名，略名，記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	5
4. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	5
5. 製剤の各種条件下における安定性	5
6. 溶解後の安定性	5
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5
8. 溶出性	5
9. 生物学的試験法	6
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	6
11. 製剤中の有効成分の定量法	6
12. 力価	6
13. 混入する可能性のある夾雑物	6
14. 治療上注意が必要な容器に関する情報	6
15. 刺激性	6
16. その他	6
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
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	8
2. 薬理作用	8

VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	11
2. 薬物速度論的パラメータ	11
3. 吸収	12
4. 分布	12
5. 代謝	12
6. 排泄	12
7. 透析等による除去率	13
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	14
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	14
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
5. 慎重投与内容とその理由	14
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14
7. 相互作用	14
8. 副作用	14
9. 高齢者への投与	15
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	15
11. 小児等への投与	15
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
13. 過量投与	15
14. 適用上の注意	16
15. その他の注意	16
16. その他	16
IX. 非臨床試験に関する項目	
1. 薬理試験	17
2. 毒性試験	17
X. 管理的事項に関する項目	
1. 規制区分	18
2. 有効期間又は使用期限	18
3. 貯法・保存条件	18
4. 薬剤取扱い上の注意点	18
5. 承認条件等	18
6. 包装	18
7. 容器の材質	18
8. 同一成分・同効薬	19
9. 国際誕生年月日	19
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
11. 薬価基準収載年月日	19
12. 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	19
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	19

14. 再審査期間	19
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
16. 各種コード	19
17. 保険給付上の注意	19
X I. 文献	
1. 引用文献	20
2. その他の参考文献	20
X II. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21
X III. 備考	
その他の関連資料	22

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レボカバスチン塩酸塩は強力なヒスタミン H_1 受容体拮抗作用を有する薬物で、アレルギー性結膜炎に対して優れた改善効果を示すことが見出されており、臨床で広く用いられている。動物実験でも、モルモットを用いたヒスタミン並びにアレルギー性結膜炎に対して、ケトチフェンフェマル酸塩とほぼ同程度の効果を示すことが報告されている¹⁾。

レボカバスチン塩酸塩点眼液0.025%「三和」は、株式会社三和化学研究所より眼への刺激を抑えた点眼液を目指し後発医薬品として開発した。平成17年3月31日付薬食発第0331015号厚生労働省医薬食品局長通知「医薬品の承認申請について」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、2008年7月8日に発売された製剤である。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) H_1 ブロッカーであるレボカバスチン塩酸塩の後発医薬品の点眼剤である。
- (2) 浸透圧比が涙液とほぼ同じ約 1.0 である。（「IV. 1. (5) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等」の項参照）
- (3) 防腐剤濃度を必要最低限に抑えている。
- (4) 重大な副作用としてショック、アナフィラキシーがあらわれることがある。（「VIII. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

II. 名称に関する項目

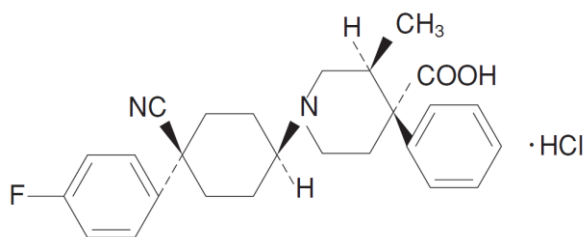
1. 販売名

- (1) 和名：レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025% 「三和」
- (2) 洋名：LEVOCABASTINE HYDROCHLORIDE Ophthalmic Solutions 0.025% “SANWA”
- (3) 名称の由来：有効成分名より命名

2. 一般名

- (1) 和名（命名法）：レボカバスチン塩酸塩（JAN）
- (2) 洋名（命名法）：levocabastine hydrochloride (JAN, USAN)、levocabastine (INN)
- (3) ステム：-astine 抗ヒスタミン薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₆H₂₉FN₂O₂ · HCl

分子量：456.98

5. 化学名（命名法）

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

6. 慣用名，別名，略名，記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

79516-68-0

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色もしくはほとんど白色の粉末

(2) 溶解性

溶媒名	本品 1g を溶かすのに要する溶媒量	溶解性
ギ酸	10mL 以上 30mL 未満	やや溶けやすい
メタノール	30mL 以上 100mL 未満	やや溶けにくい
エタノール (95)	1000mL 以上 10000mL 未満	極めて溶けにくい
水	10000mL 以上	ほとんど溶けない
無水酢酸	10000mL 以上	ほとんど溶けない
2-プロパノール	10000mL 以上	ほとんど溶けない
ジエチルエーテル	10000mL 以上	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

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

比旋光度： $[\alpha]_D^{20} = -102 \sim -106^\circ$ （乾燥物換算、0.250g、メタノール、25.0mL、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

(1) 溶解反応

(2) 紫外可視吸光度測定法

(3) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）

(4) 旋光度試験

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

点眼

(2) 剤型の区別, 規格及び性状

剤型：水性懸濁点眼液

規格：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。

性状：レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025% 「三和」は無菌懸濁性点眼剤である。振り混ぜるとき、白濁する。

(3) 製剤の物性

粒子径：レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025% 「三和」をよく振り混ぜ、日局参考情報レーザー一回析法による粉体粒度測定法により試験を行うとき、平均粒子径は $10\mu\text{m}$ 以下であり、個々の粒子径は $25\mu\text{m}$ 以下である。粒子の大きさは最長径とする。

(4) 識別コード

なし

(5) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等

pH : 6.0~8.0

浸透圧比 : 0.9~1.1

(6) 無菌の有無

無菌製剤

2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025% 「三和」は、1mL 中にレボカバスチン塩酸塩 0.27mg (レボカバスチンとして 0.25mg) を含有する製剤である。

(2) 添加物

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、塩酸、水酸化ナトリウムを含有する。

(3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」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。

5. 製剤の各種条件下における安定性²⁾

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
加速試験	40±1℃ 75±5%RH	6 ヶ月	最終包装製品	変化なし

試験項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性微粒子、粒子径、無菌、定量

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」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。

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）³⁾

レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」と他の点眼液を併用した場合、結晶の析出、pH、浸透圧比の変化、有効成分の分解など、安全性、有効性に影響を及ぼす懸念がある。そこで、併用または配合の可能性が高いと予想される点眼薬を選択し、配合変化試験を実施した。

試験製剤：レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」

対象製剤：フルメトロン点眼液 0.1%、リンデロン点眼・点耳・点鼻液 0.1%、ゼペリン点眼液 0.1%、クラビット点眼液 0.5%、インタール点眼液 2%、リザベン点眼液 0.5%、ニフラン点眼液 0.1%、キサラタン点眼液 0.005%、チモプトール点眼液 0.5%、ジクロード点眼液 0.1%

測定項目：外観、pH、浸透圧比、含量（混合直後に対する残存率）

保存条件：室温保存

保存期間：混合直後、30 分後、1 時間後、3 時間後、6 時間後、24 時間後

試験方法：試験製剤及び対象製剤を正確に 1:1 の割合で混合し、各測定ポイントにてサンプリングした後、試験を行う。試験方法はレボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」の規格試験に準じる。

結果：レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」は対象製剤と配合したものについて、外観、pH、浸透圧比、含量のいずれにおいても変化は認められず、配合変化は生じないと推察された。

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当資料なし

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

12. 力価

該当資料なし

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

14. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

15. 刺激性⁴⁾

日本白色種雌性ウサギにレボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」を1回 100 μ L、30分間隔で10回連続点眼し、Draize の評価基準に従って眼粘膜に対する刺激性について評価を行ったところ、刺激性の反応は全く観察されず、無刺激物と判定され、ウサギ眼粘膜に対する刺激性がないものと判断された。

16. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

アレルギー性結膜炎

2. 用法及び用量

1回1～2滴を1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

クロモグリク酸ナトリウム、アンレキサノクス、ペミロラストカリウム、トラニラスト、ケトチフェンフマル酸塩、イブジラスト、オロパタジン塩酸塩

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁵⁾

作用部位：眼結膜

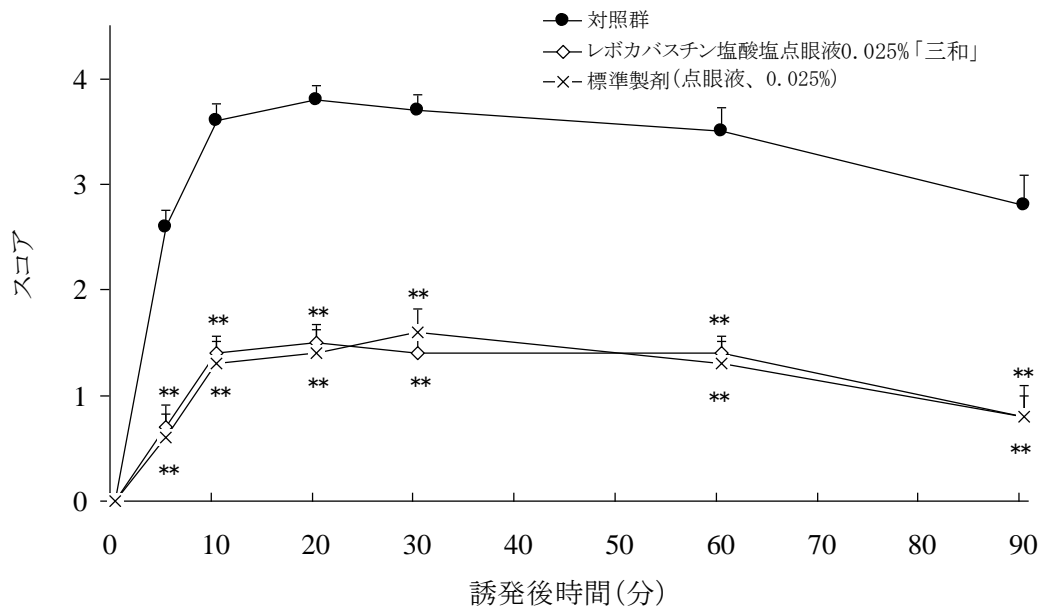
作用機序：ヒスタミンが三叉神経や毛細血管の H_1 受容体に結合するのを阻害してアレルギー結膜炎の諸症状を改善する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績⁶⁾

1) モルモットにおける抗原誘発結膜炎モデルに対する作用（モルモット）

OVAと不活性化百日咳菌含有生理食塩液によって感作させたモルモットに対し、惹起の15分前にレボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「三和」及び標準製剤（点眼液、0.025%）をモルモットの両眼に25 μ Lずつ単回投与し、結膜炎症状のスコア変化、結膜浮腫の測定を行った。その結果、レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「三和」は標準製剤と有意な差は認められず、生物学的に同等であることが確認された。また、両剤と対照群では有意な差が認められた。

結膜炎症状のスコア変化（モルモット）



スコア

0：症状なし

1：軽度の充血

2：強度の充血

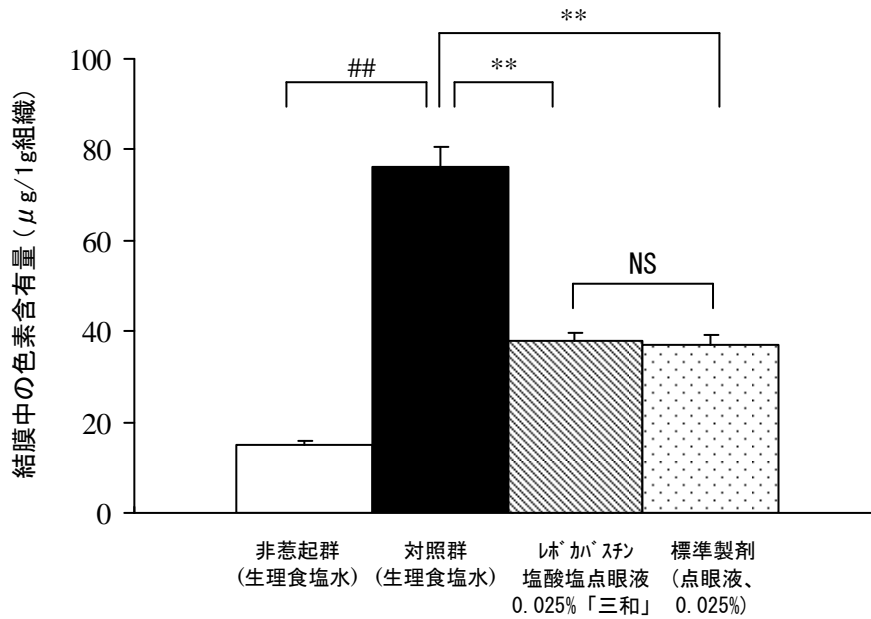
3：強度の充血および軽度の浮腫

4：強度の浮腫

**：p<0.01 (vs 対照群)、Mean±S.E.、n=10

(Student の t 検定)

結膜浮腫の測定 (モルモット)

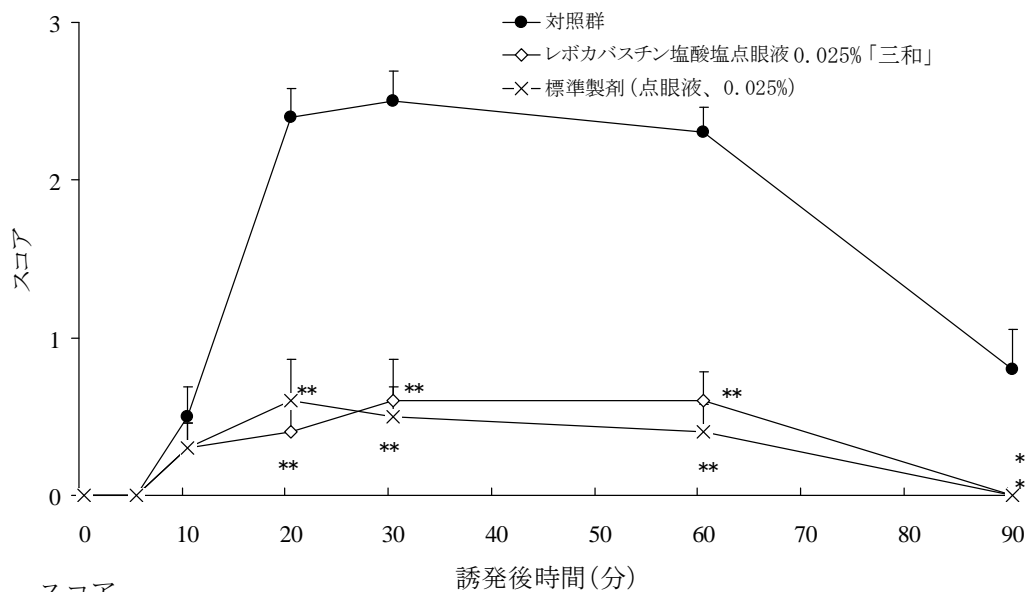


##: p<0.01, **: p<0.01, NS: No Significant, Mean±S.E., n=10
(Studentのt検定またはAspin-Welchの検定)

2) ラットにおける抗原誘発結膜炎モデルに対する作用 (ラット)

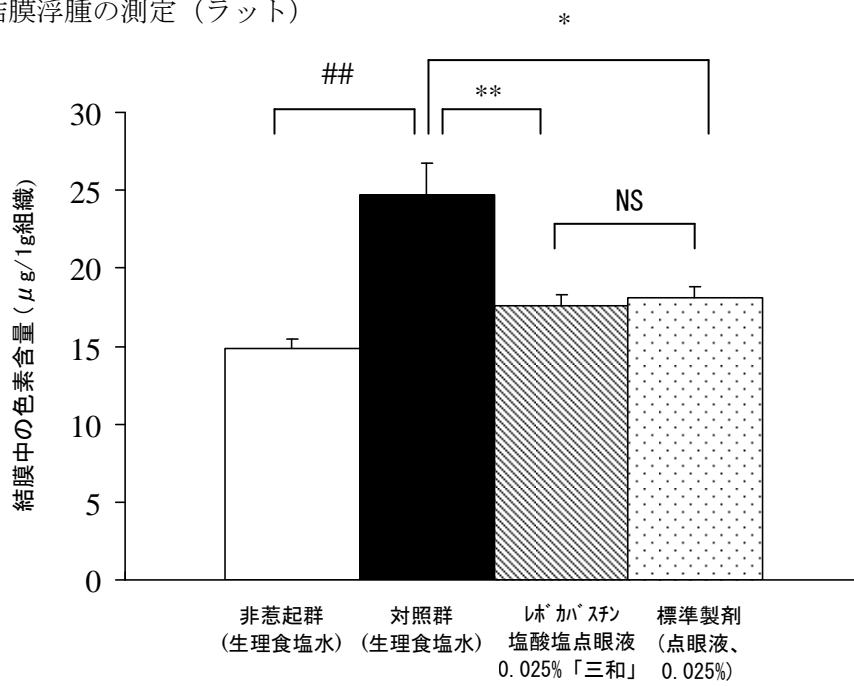
DNP-Ascarisと不活性化百日咳菌含有生理食塩水によって感作させたラットに対し、レボカバチン塩酸塩点眼液0.025%「三和」及び標準製剤(点眼液、0.025%)を25μLずつ1日2回7日間投与し、最終投与の20分後に惹起させ、結膜炎症状のスコア変化、結膜浮腫の測定を行った。その結果、レボカバチン塩酸塩点眼液0.025%「三和」は標準製剤と有意な差は認められず、生物学的に同等であることが確認された。また、両剤と対照群では有意な差が認められた。

結膜炎症状のスコア変化 (ラット)



*: p<0.05, **: p<0.01 (vs 対照群), Mean±S.E., n=8
(Studentのt検定またはAspin-Welchの検定)

結膜浮腫の測定 (ラット)



##: $p < 0.01$ 、*: $p < 0.05$ 、**: $p < 0.01$ 、NS: No Significant、Mean \pm S.E.、 $n=8$
(Studentのt検定またはAspin-Welchの検定)

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「VIII. 7. 相互作用」の項参照

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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. 10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与」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

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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用時の点眼は避けること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

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

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

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。

(3) 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) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 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

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

9. 高齢者への投与

該当資料なし

10. 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、レボカバチン大量経口投与により、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。

11. 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)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

(1) 投与経路

点眼用にのみ使用すること。

(2) 投与时

- 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。

15. 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。

16. その他

該当資料なし

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」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

「IV. 15. 刺激性」の項参照

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「三和」 該当しない

有効成分：レボカバスチン塩酸塩 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後3年（外装およびラベルに表示の使用期限内に使用すること）

3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱いについて

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) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

取扱い上の注意：小児の手の届かない所に保管すること。

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。

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用時の点眼は避けること。（「VIII. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照）

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

5mL×5本（一包装につき携帯袋5袋が封入）

7. 容器の材質

キャップ：ポリエチレン

点眼容器：ポリエチレン

中 栓：ポリエチレン

ラベル：ポリエチレンテレフタレート

携帯用袋：ポリエチレン

個装箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：リボスチン点眼液 0.025%

同 効 薬：クロモグリク酸ナトリウム、アンレキサノクス、ペミロラストカリウム、トラニラスト、ケトチフェンフマル酸塩、イブジラスト、オロパタジン塩酸塩

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2008年3月17日

承認番号：22000AMX01421000

11. 薬価基準収載年月日

2008年7月4日

12. 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

該当しない

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT 番号	厚生労働省薬価基準収載 医薬品コード	レセプト電算コード
レボカバスチン塩酸塩 点眼液 0.025%「三和」	118793901	1319746Q1061	620008273

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 南和寿 他：あたらしい眼科 19(6) :787, 2002
- 2) (株) 三和化学研究所 社内資料 (安定性試験)
- 3) (株) 三和化学研究所 社内資料 (配合変化試験)
- 4) (株) 三和化学研究所 社内資料 (ウサギ眼刺激性試験)
- 5) 高村悦子：眼科 46(5) : 659, 2004 J521293
- 6) (株) 三和化学研究所 社内資料 (生物学的同等性試験)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

- (1) 本剤と同一製剤は外国で発売されていない。
- (2) レボカバスチン塩酸塩製剤としては、各国で販売されている。

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリアの分類）

本邦における使用上の注意「妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリアの分類とは異なる。

<使用上の注意> 「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、レボカバスチン大量経口投与により、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。

	分類
オーストラリアの分類： An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy	B3 (2013年7月現在)

参考：分類の概要

<オーストラリアの分類：An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy>

B3 : 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 have shown evidence of an increased occurrence of fetal damage, the significance of which is considered uncertain in humans.

[妊婦および妊娠可能年齢の女性への使用経験はまだ限られているが、この薬による奇形やヒト胎児への直接・関節的有害作用の発生頻度増加は観察されていない。

動物を用いた研究では、胎児への障害の発生が増えるという証拠が得られている。しかし、このことがヒトに関してもつ意義ははっきりしていない。]

XⅢ. 備考

その他の関連資料

該当資料なし