

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%「TOA」

Levocabastine Hydrochloride Ophthalmic Solution 0.025%「TOA」

レボカバスタチン塩酸塩点眼液

貯法	室温保存
使用期限	外箱及びラベルに表示(3年)
注意	取扱い上の注意の項参照

承認番号	22000AMX01069000
薬価収載	2008年7月
販売開始	2008年7月

【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	レボカバスタチン塩酸塩点眼液0.025%「TOA」
有効成分	レボカバスタチン塩酸塩
含量(1 mL中)	0.27mg (レボカバスタチンとして0.25mg)
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、pH調節剤
剤形	水性懸濁点眼剤(無菌製剤)
pH	6.0~8.0
浸透圧比	0.9~1.1
性状	白色の懸濁性点眼剤

【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ため、副作用発現頻度は不明である。

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

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、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、レボカバスタチン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

点眼用のみ使用すること。

2) 投与時

- 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。
- 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。
- 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。

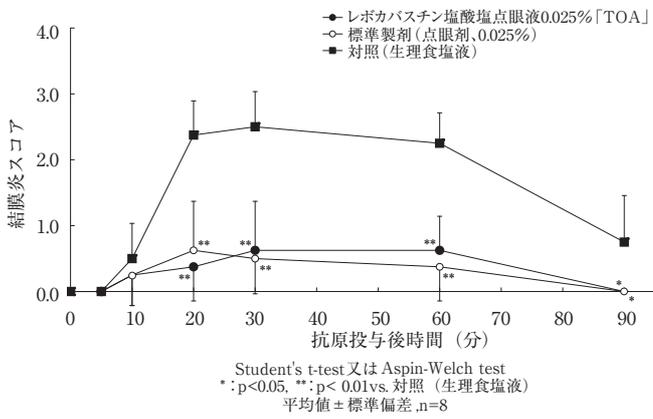
【薬効薬理】

<生物学的同等性試験>¹⁾

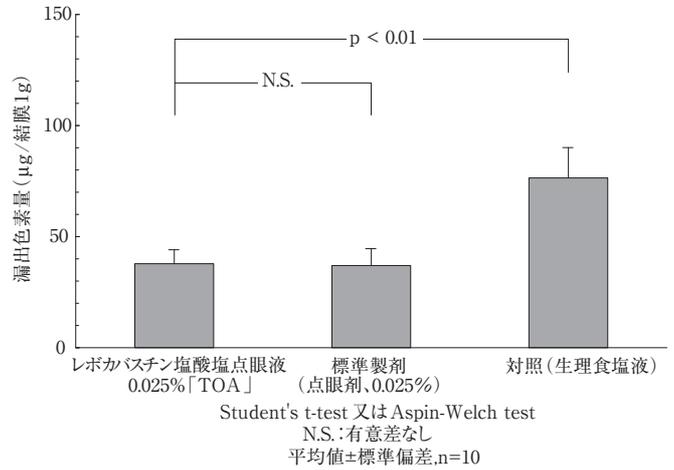
1. ラット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対する効果

ラット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対して、レボカバスタチン塩酸塩点眼液0.025%「TOA」及び標準製剤(点眼剤、0.025%)の結膜炎及び結膜浮腫抑制作用をそれぞれ比較した。両剤及び対照(生理食塩液)を初回感作翌日より両眼に25µLずつ1日2回(午前、午後)、7日間、計14回点眼投与した。最終日は抗原惹起20分前に投与し、その後の抗原惹起による結膜充血及び腫脹の状態を各測定時点で観察し、結膜炎スコアを付け、そのスコアを指標として結膜炎抑制作用を評価した。また、抗原惹起5分前にエバンスブルー含有生理食塩液を尾静脈内投与し、その後の抗原惹起による結膜からの漏出色素量を指標として結膜浮腫抑制作用を評価した。その結果、両剤ともに対照に対し、結膜炎スコア及び結膜1g当たりの漏出色素量に有意な差が認められ、両剤間では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。

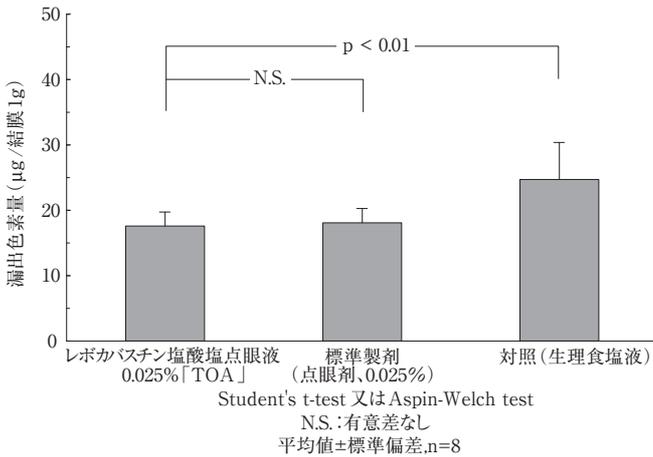
ラット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対する結膜炎抑制作用



モルモット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対する結膜浮腫抑制作用

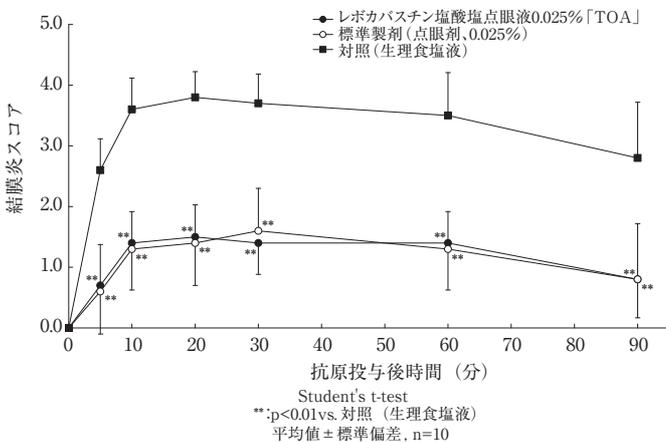


ラット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対する結膜浮腫抑制作用



2. モルモット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対する効果
 モルモット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対して、レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「TOA」及び標準製剤 (点眼剤, 0.025%) の結膜炎及び結膜浮腫抑制作用をそれぞれ比較した。両剤及び対照 (生理食塩液) を感作2週間後、両眼に25 μLずつ抗原惹起15分前に単回点眼投与した。その後の抗原惹起による結膜充血及び腫脹の状態を各測定時点で観察し、結膜炎スコアを付け、そのスコアを指標として結膜炎抑制作用を評価した。また、抗原惹起5分前に Evans blue 含有生理食塩液を下肢末梢静脈内投与し、その後の抗原惹起による結膜からの漏出色素量を指標として結膜浮腫抑制作用を評価した。その結果、両剤ともに対照に対し、結膜炎スコア及び結膜1g当たりの漏出色素量に有意な差が認められ、両剤間では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。

モルモット抗原誘発アレルギー性結膜炎モデルに対する結膜炎抑制作用



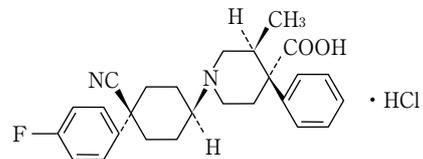
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：レボカバステチン塩酸塩

(Levocabastine Hydrochloride)

化学名：(-)-(3*S*, 4*R*)-1-[*cis*-4-cyano-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：レボカバステチン塩酸塩は白色もしくはほとんど白色の粉末である。

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。

<安定性試験>²⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験 (25℃、60%RH、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。

【包装】

- 5 mL×5本
- 5 mL×10本
- 5 mL×50本

【主要文献】

- 1) 東亜薬品株式会社：レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「TOA」の生物学的同等性試験 (社内資料)
- 2) 東亜薬品株式会社：レボカバステチン塩酸塩点眼液0.025%「TOA」の安定性試験 (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下さい。

日東メディック株式会社 おくすり相談窓口
 〒104-0033 東京都中央区新川1-17-24
 電話：03-3523-0345
 FAX：03-3523-0346

発売元
日東メディック株式会社
 富山県富山市八尾町保内1-14-1

製造販売元
東亜薬品株式会社
 富山県富山市水橋開発277番10