2024年10月改訂（第9版）

日本標準商品分類番号　871319

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2018（2019年更新版）に準拠して作成

H_1ブロッカー点眼剤
レボカバスチン塩酸塩点眼液

レボカバスチン塩酸塩点眼液0.025%「わかもと」

LEVOCABASTINE HYDROCHLORIDE OPHTHALMIC SOLUTION「WAKAMOTO」

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL中レボカバスチン塩酸塩0.27mg（レボカバスチンとして0.25mg）
一般名	和名：レボカバスチン塩酸塩（JAN） 洋名：Levocabastine Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	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 販売開始年月日：2008年7月4日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：わかもと製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	わかもと製薬株式会社　メディカルインフォメーション TEL：03-3279-0379　FAX：03-3279-1272 医療関係者向けホームページ：https://www.wakamoto-pharm.co.jp/

本ＩＦは2024年1月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

（2020年４月改訂）

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、ＭＲ）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、ＩＦと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第２小委員会がＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第３小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領2008以降、ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のＩＦが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、ＩＦ記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はＩＦ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ＩＦは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

ＩＦの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索の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ＩＦを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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ＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。ＩＦは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、ＩＦを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目 1
1．開発の経緯 1
2．製品の治療学的特性 1
3．製品の製剤学的特性 1
4．適正使用に関して周知すべき特性 1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項 1
6．ＲＭＰの概要 1

II. 名称に関する項目 2
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（命名法）又は本質 2
6．慣用名、別名、略号、記号番号 2

III. 有効成分に関する項目 3
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、定量法 3

IV. 製剤に関する項目 4
1．剤形 4
2．製剤の組成 4
3．添付溶解液の組成及び容量 4
4．力価 4
5．混入する可能性のある夾雑物 4
6．製剤の各種条件下における安定性 5
7．調製法及び溶解後の安定性 5
8．他剤との配合変化（物理化学的変化） 5
9．溶出性 5
10．容器・包装 5
11．別途提供される資材類 6
12．その他 6

V. 治療に関する項目 7
1．効能又は効果 7
2．効能又は効果に関連する注意 7
3．用法及び用量 7
4．用法及び用量に関連する注意 7
5．臨床成績 7

VI. 薬効薬理に関する項目 8
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 11
1．血中濃度の推移 11
2．薬物速度論的パラメータ 11
3．母集団（ポピュレーション）解析 11
4．吸収 11
5．分布 12
6．代謝 12
7．排泄 12
8．トランスポーターに関する情報 12
9．透析等による除去率 12
10．特定の背景を有する患者 12
11．その他 13

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14
1．警告内容とその理由 14
2．禁忌内容とその理由 14
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 14
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 14
5．重要な基本的注意とその理由 14
6．特定の背景を有する患者に関する注意 14
7．相互作用 15
8．副作用 15
9．臨床検査結果に及ぼす影響 15
10．過量投与 15
11．適用上の注意 16
12．その他の注意 16

IX. 非臨床試験に関する項目 17
1．薬理試験 17
2．毒性試験 17

X. 管理的事項に関する項目 18
1．規制区分 18
2．有効期間 18
3．包装状態での貯法 18
4．取扱い上の注意 18
5．患者向け資材 18
6．同一成分・同効薬 18
7．国際誕生年月日 18
8．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 18
9．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 18
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 18
11．再審査期間 18
12．投薬期間制限に関する情報 18
13．各種コード 19
14．保険給付上の注意 19

XI. 文献 20
1．引用文献 20
2．その他の参考文献 20

XII. 参考資料 21
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

XIII. 備考 21
1．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 21
2．その他の関連資料 21

I. 概要に関する項目

１．開発の経緯

本剤はヒスタミンH_1受容体遮断作用を有するレボカバスチン塩酸塩を有効成分とする点眼剤であり、ラット及びモルモット実験的アレルギー性結膜炎モデルにおいて治療効果が認められ、2008年3月に製造販売承認を取得し、2008年7月の発売に至った。

２．製品の治療学的特性

(1) ヒスタミンH_1ブロッカーの点眼液である。

(2) レボカバスチン塩酸塩点眼液の後発医薬品である。

(3) 生物学的同等性試験により、リボスチン点眼液0.025％との同等性が確認されている。

（Ⅵ. 2.(2)薬効を裏付ける試験成績の項 参照）

(4) モルモット及びラットの実験的アレルギー性結膜炎モデルにおいて、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。

（Ⅵ. 2.(2)薬効を裏付ける試験成績の項 参照）

(5) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーが報告されている。主な副作用として、眼刺激、眼瞼炎、角膜上皮障害（角膜びらん、点状表層角膜炎等）などがあらわれることがある。

（Ⅷ. 8.副作用の項 参照）

３．製品の製剤学的特性

該当しない

４．適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1)承認条件

該当しない

(2)流通・使用上の制限事項

該当しない

６．ＲＭＰの概要

該当しない

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%「わかもと」

(2) 洋名

LEVOCABASTINE HYDROCHLORIDE OPHTHALMIC SOLUTION 0.025%「WAKAMOTO」

(3) 名称の由来

有効成分名、剤形、濃度及び製造販売会社名
（平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号に基づく）

２．一般名

(1) 和名（命名法）

レボカバスチン塩酸塩（JAN）

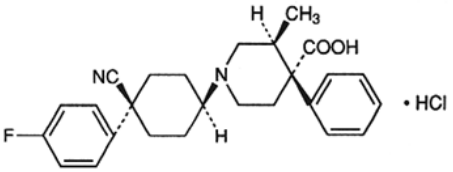
(2) 洋名（命名法）

Levocabastine Hydrochloride（JAN）
Levocabastine（INN）

(3) ステム

抗ヒスタミン剤：-astine

３．構造式又は示性式



４．分子式及び分子量

分子式：$C_{26}H_{29}FN_2O_2 \cdot HCl$
分子量：456.98

５．化学名（命名法）又は本質

(-)-(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、略号、記号番号

該当しない

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である。

(2) 溶解性

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
ギ酸	やや溶けやすい
メタノール	やや溶けにくい
エタノール（95）	極めて溶けにくい
水	ほとんど溶けない
無水酢酸	ほとんど溶けない
2－プロパノール	ほとんど溶けない
ジエチルエーテル	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

旋光度$[\alpha]_D^{20}$：－102～－106°（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、定量法

確認試験法：(1) 硝酸銀試液による沈殿反応及びアンモニア水による沈殿溶解
(2) 紫外可視光吸光度測定法
(3) 赤外吸収スペクトル法（塩化カリウム錠剤法）
(4) 旋光度測定法

定　量　法：電位差滴定法

IV．製剤に関する項目

１．剤形

(1) 剤形の区別

点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

振り混ぜるとき白濁、水性懸濁性の液

(3) 識別コード

該当しない

＜参考＞キャップの色：白色

(4) 製剤の物性

pH：6.0～8.0

浸透圧比：0.9～1.1

(5) その他

無菌製剤である

２．製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分	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）
添加剤	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水和物、pH調節剤

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

３．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

４．力価

該当しない

５．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

６．製剤の各種条件下における安定性

長期保存試験[1)]、加速試験[2)]、苛酷試験（熱[3)]、光[4)]）

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃、60%RH	36 ヵ月	最終包装	規格内
加速試験	40±1℃、75±5%RH	6 ヵ月	ポリエチレン製点眼容器（シュリンク有）	規格内
苛酷試験（熱）	5℃	6 ヵ月	ポリエチレン製点眼容器	規格内
	60℃	30 日		規格内
苛酷試験（光）	25℃、60%RH 白色蛍光灯 3000lx	120 万 lx･hr	ポリエチレン製点眼容器	規格内

測定項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性微粒子試験、粒子径試験、無菌試験*、含量

*：長期保存試験、加速試験のみ実施

開封後安定性試験（熱[5)]、光[6)]）

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
開封後安定性試験（熱）	5℃、湿度成り行き	1 ヵ月	ポリエチレン製点眼容器	規格内
	25℃、60%RH			規格内
	40℃、75%RH			規格内
開封後安定性試験（光）	25℃、60%RH 白色蛍光灯 3000lx	60 万 lx･hr	ポリエチレン製点眼容器	規格内

測定項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、不溶性微粒子試験、粒子径試験、含量、水分透過*、保存効力試験

*：開封後安定性試験（熱）のみ実施

７．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

９．溶出性

該当しない

10．容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

プラスチック点眼容器：5mL×10本

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ボ ト ル：ポリエチレン
中　　栓：ポリエチレン
キャップ：ポリエチレン
ラ ベ ル：ポリエチレンテレフタレート

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

1滴：約36μL

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．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

３．用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

1 回 1～2 滴を 1 日 4 回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

４．用法及び用量に関連する注意

設定されていない

５．臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

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

クロモグリク酸ナトリウム、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、アシタザノラスト水和物、オロパタジン塩酸塩

注意：関連のある化合物の効能・効果等は最新の添付文書を参照すること。

２. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ヒスタミンH_1受容体に特異的に働き、強力かつ持続的な拮抗作用を有し、アレルギー性結膜炎におけるそう痒感、充血、流涙などの諸症状を改善する[7)]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 抗ヒスタミン作用

①モルモットでのヒスタミン誘発による回腸及び気管の収縮を抑制する[8)、9)]（*in vitro*）

②モルモットでのヒスタミン静注致死及びヒスタミン吸入呼吸困難を抑制する[10)]（*in vivo*）。

③ラットでのcompound48/80 誘発致死を抑制する[11)]（*in vivo*）。

2) 実験的アレルギー性結膜炎モデルに対する作用

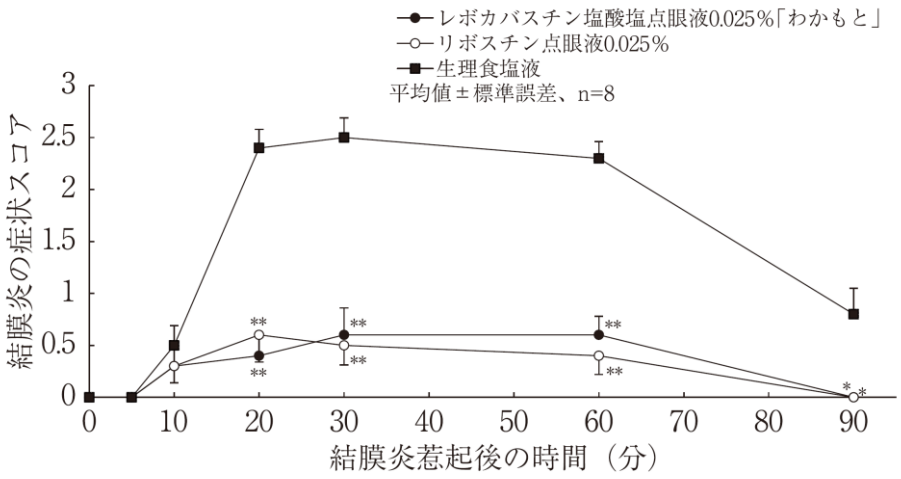
モルモット及びラットのアレルギー性結膜炎モデルにおいて、ヒスタミン及び抗原誘発による結膜炎症状（充血及び浮腫）、結膜の血管透過性亢進を抑制する[12)-15)]。

3) 好中球及び好酸球の遊走抑制作用（点眼投与）

ヒスタミン誘発によるモルモット結膜への好中球及び好酸球の遊走を抑制する[16)]（*in vivo*）。

4) 生物学的同等性試験

① ラットアレルギー性結膜炎モデルを用いて、本剤、リボスチン点眼液0.025％の結膜炎抑制作用及び結膜浮腫抑制作用を比較検討した。本剤、リボスチン点眼液0.025％又は対照（生理食塩液）をアレルギー反応惹起20分前に点眼し、惹起後の充血及び浮腫の状態をスコア化し評価した。また、アレルギー反応惹起前に尾静脈内投与したエバンスブルー含有生理食塩液の結膜からの漏出量を評価した。その結果、本剤は対照に対して結膜炎症スコア及び色素漏出量に有意差が認められ、リボスチン点眼液0.025％に対して有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された[17)]。



結膜炎の症状スコアの推移

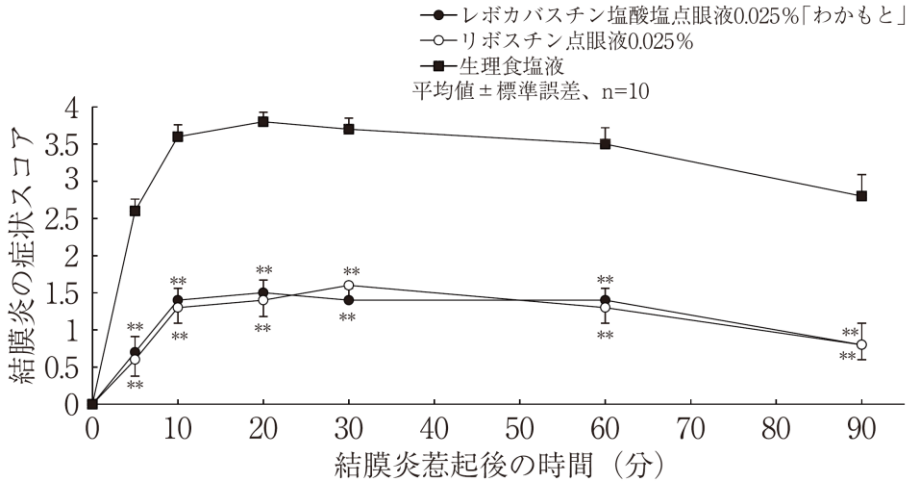
結膜からの色素漏出量

	色素漏出量 （μg/1g tissue）	抑制率（%）
生理食塩液	24.7±2.0	－
レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「わかもと」	17.6±0.8**	72
リボスチン点眼液0.025%	18.1±0.8*	67

*：P ＜ 0.05,**：P ＜ 0.01；Aspin-Welch test（vs 生理食塩液）

（平均値±標準誤差、n=8）

② モルモットアレルギー性結膜炎モデルを用いて、本剤、リボスチン点眼液0.025%の結膜炎抑制作用及び結膜浮腫抑制作用を比較検討した。本剤、リボスチン点眼液0.025%又は対照（生理食塩液）をアレルギー反応惹起20分前に点眼し、惹起後の充血及び浮腫の状態をスコア化し評価した。また、アレルギー反応惹起前に尾静脈内投与したエバンスブルー含有生理食塩液の結膜からの漏出量を評価した。その結果、本剤は対照に対して結膜炎症スコア及び色素漏出量に有意差が認められ、リボスチン点眼液0.025%に対して有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された[17]。



結膜炎の症状スコアの推移

結膜からの色素漏出量

	色素漏出量 （μg/1g tissue）	抑制率（%）
生理食塩液	76.4±4.3	－
レボカバスチン塩酸塩点眼液 0.025%「わかもと」	37.8±2.0**	63
リボスチン点眼液0.025%	37.0±2.4**	64

**：P ＜ 0.01；Student's t-test（vs 生理食塩液）

（平均値±標準誤差、n=10）

症状スコア、血管色素漏出量等のパラメータは、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。

(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

⑴ 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

⑵ 臨床試験で確認された血中濃度

反復投与

健康成人に0.05％レボカバスチン塩酸塩点眼液を両眼に1滴ずつ（レボカバスチン塩酸塩として30μg）6時間間隔で1日3回[注)]、11日間反復投与したとき、血漿中未変化体濃度は投与5日目には定常状態に達し、蓄積性は認められなかった。最終投与後のC_{max} は0.94ng/mL、消失半減期は約41時間であった[18)]。

⑶ 中毒域

該当資料なし

⑷ 食事・併用薬の影響

該当資料なし

２．薬物速度論的パラメータ

⑴ 解析方法

該当資料なし

⑵ 吸収速度定数

該当資料なし

⑶ 消失速度定数

該当資料なし

⑷ クリアランス

該当資料なし

⑸ 分布容積

該当資料なし

⑹ その他

該当資料なし

３．母集団（ポピュレーション）解析

⑴ 解析方法

該当資料なし

⑵ パラメータ変動要因

該当資料なし

４．吸収

該当資料なし

５．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

授乳婦に単回経口投与（ レボカバスチンとして0.5mg）[注)] したとき、母乳中への微量の移行がみられ、唾液中濃度と乳汁中濃度はほぼ等しかった[19)]（外国人データ）。

(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

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

６．代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

健康成人に^{3}H-レボカバスチン塩酸塩（レボカバスチンとして1mg）を単回経口投与[注)] したとき、尿中放射活性の大部分は未変化体であり、主代謝物はレボカバスチンのグルクロン酸抱合体であった[20)]（外国人データ）。

(2) 代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

７．排泄

健康成人に0.05％レボカバスチン塩酸塩点眼液を両眼に1滴ずつ（レボカバスチン塩酸塩として30μg）6時間間隔で1日3回[注)]、11日間反復投与したとき、最終投与後96時間までに総点眼量の約16％が未変化体として尿中へ排泄された[18)]。

８．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

９．透析等による除去率

該当資料なし

10．特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

注）本剤の濃度は0.025%であり、本剤の承認された用法及び用量は、「1回1～2滴を1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。」である。

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 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［15.1 参照］

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦
妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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[21]。

(6) 授乳婦

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。ヒト母乳中へ移行することが報告されている。［16.5.2 参照］

(7) 小児等

9.7 小児等
低出生体重児、新生児、乳児、幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

設定されていない

7．相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

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
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

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（頻度不明）

呼吸困難、顔面浮腫等があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.5%以上	0.5%未満	頻度不明
眼	眼刺激	眼瞼炎、眼脂、眼球乾燥感、羞明、そう痒感	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）、結膜炎、眼瞼浮腫、眼痛、流涙
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	

9．臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10．過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

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。

・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。
・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。
・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。
・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。

（解説）

・ベンザルコニウム塩化物がコンタクトレンズに影響する可能性がある。
・本剤は懸濁液のため、使用するときには、必ず容器を振盪する。
・点眼のとき、眼瞼にあふれた液をそのままにしておくと、皮膚に吸収されて感作される可能性がある。あふれた液は、清潔なガーゼやティッシュでふき取ること。
・容器の先端が直接目に触れると、眼脂や雑菌等により薬液が汚染される可能性がある。
・閉瞼及び涙嚢部の圧迫を行うことにより、薬液の鼻涙管への流出による鼻粘膜からの吸収を防ぎ、全身性の副作用発現の可能性を軽減するとともに、治療効果を高めるためである。
・複数の点眼剤を短い間隔で点眼すると、初めに点眼した薬剤が後から点眼した薬剤によって結膜嚢から流され、薬剤の有効性が低下する可能性がある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

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。［2.参照］

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項 参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

眼刺激性試験

白色ウサギに本剤を1回100μL、1日10回30分間隔で点眼し、角膜、結膜及び虹彩への刺激性を判定基準に従って最終点眼後96時間まで経時的に評価した結果、全観察期間を通して眼粘膜への刺激性は認められなかった[22)]。

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

１．規制区分

製　　剤：該当しない（処方箋医薬品以外の医薬品である）
有効成分：該当しない

２．有効期間

有効期間：3年

３．包装状態での貯法

室温保存

４．取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意
20.1 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。
20.2 小児の手の届かない所に保管すること。

５．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：なし

６．同一成分・同効薬

先発医薬品名：リボスチン点眼液0.025%

７．国際誕生年月日

該当資料なし

８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
2008年3月17日	22000AMX01420000	2008年7月4日	2008年7月4日

９．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

10．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

11．再審査期間

該当しない

12．投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13．各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJコード）	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
レボカバスチン塩酸塩点眼液0.025％「わかもと」	1319746Q1010	1319746Q1070	118294101	個別:620008275 統一:622907000

14．保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

１．引用文献

1) わかもと製薬株式会社　社内資料［長期保存試験］
2) わかもと製薬株式会社　社内資料［加速試験］
3) わかもと製薬株式会社　社内資料［苛酷試験（熱安定性）］
4) わかもと製薬株式会社　社内資料［苛酷試験（光安定性）］
5) わかもと製薬株式会社　社内資料［開封後安定性試験（熱安定性）］
6) わかもと製薬株式会社　社内資料［開封後安定性試験（光安定性）］
7) 作用機序（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要イ 1.（2）、ホ 2.）
8) Tasaka K, et al.：Arzneim.-Forsch. /Drug Res. 1993；43：1331-1337
9) ヒスタミンによる気管収縮に対する作用（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ホ 5.（1））
10) モルモットにおける塩酸レボカバスチンの*in vivo*での抗ヒスタミン作用、抗セロトニン作用及び抗コリン作用：対照薬との比較（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ホ 2.（1）.3））
11) Dechant KL, et al.：Drugs. 1991；41：202-224
12) Kamei C, et al.：J. Pharmacobio - Dyn. 1991；14：467-473
13) 亀井 千晃 他：あたらしい眼科. 1994；11：603-605
14) モルモットにおけるヒスタミン及び抗原誘発結膜炎に対するレボカバスチン局所投与の作用（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ホ 1.（2））
15) 実験的アレルギー性結膜炎に対する塩酸levocabastineの影響（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ホ 1.（3）.2）、（4）.2））
16) モルモットにおけるhistamine誘発による好中球および好酸球の結膜への浸潤に対する塩酸levocabastine点眼薬の作用（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ホ 1.（6））
17) わかもと製薬株式会社　社内資料［生物学的同等性試験］
18) 澤 充 他：薬理と治療. 1994；22：4697-4711
19) ヒト乳汁中へのlevocabastineの排泄（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ヘ 3.（1）.2）.③）
20) ヒトに単回経口投与したときのlevocabastineの吸収、排泄及び代謝（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ヘ 3.（1）.2）.①）
21) wistar 系ラットにおける胎児毒性及び催奇形性試験（segment II）帝王切開及び自然分娩試験並びに次世代試験 投与経路：強制経口投与（リボスチン点眼液0.025％：2000年9月22日承認、申請資料概要ニ 3. （2）.1））
22) わかもと製薬株式会社　社内資料［眼刺激性試験］

２．その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

１．主な外国での発売状況

該当しない

２．海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

１．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉砕

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

２．その他の関連資料

該当資料なし