

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

持続性選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」 セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

Cetirizine Hydrochloride Tablets 5mg "IWAKI"

Cetirizine Hydrochloride Tablets 10mg "IWAKI"

(日本薬局方 セチリジン塩酸塩錠)

剤形	錠剤(フィルムコーティング錠)		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	日局 セチリジン塩酸塩含量 セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」:1錠中 5mg セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」:1錠中 10mg		
一般名	和名:セチリジン塩酸塩 洋名:Cetirizine Hydrochloride		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日		セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」
	製造販売承認年月日	2007年3月15日	
	薬価基準収載年月日	2007年7月6日	
	販売開始年月日	2007年7月6日	
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元:岩城製薬株式会社		
医薬情報担当者の 連絡先			
問い合わせ窓口	学術グループ TEL:03-6626-6251 FAX:03-6626-6261 受付時間:9:00~17:00 (12:00~13:00 休憩) 土、日、祝日、当社休日を除く 医療機関向けホームページ https://www.iwakiseiyaku.co.jp/medical.html		

本IFは2023年7月改訂の電子化された添付文書(電子添文)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て、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・表現には薬機法の広告規則や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、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を活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. 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……………2
6. RMPの概要……………2

II. 名称に関する項目

1. 販売名……………3
2. 一般名……………3
3. 構造式又は示性式……………3
4. 分子式及び分子量……………3
5. 化学名(命名法)又は本質……………3
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号……………3

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………4
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………4
3. 有効成分の確認試験法, 定量法……………4

IV. 製剤に関する項目

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

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果……………13
2. 効能又は効果に関連する注意……………13
3. 用法及び用量……………13
4. 用法及び用量に関連する注意……………13
5. 臨床成績……………14

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……………18
2. 薬理作用……………18

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移……………19
2. 薬物速度論的パラメータ……………22
3. 母集団(ポピュレーション)解析……………23
4. 吸収……………23
5. 分布……………23
6. 代謝……………24
7. 排泄……………24
8. トランスポーターに関する情報……………24
9. 透析等による除去率……………24
10. 特定の背景を有する患者……………24
11. その他……………25

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……………26
2. 禁忌内容とその理由……………26
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………26
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………26
5. 重要な基本的注意とその理由……………26
6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………26
7. 相互作用……………27
8. 副作用……………28
9. 臨床検査結果に及ぼす影響……………29
10. 過量投与……………30
11. 適用上の注意……………30
12. その他の注意……………30

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験31
2. 毒性試験31

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分32
2. 有効期間32
3. 包装状態での貯法32
4. 取扱い上の注意32
5. 患者向け資材32
6. 同一成分・同効薬32
7. 国際誕生年月日32
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33
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33
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその
内容33
11. 再審査期間33
12. 投薬期間制限に関する情報33
13. 各種コード34
14. 保険給付上の注意34

XI. 文献

1. 引用文献35
2. その他の参考文献36

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況37
2. 海外における臨床支援情報37

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38
2. その他の関連資料38

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

セチリジン塩酸塩は、ベルギーにおいて開発された抗アレルギー製剤(第二世代の抗ヒスタミン薬)である。アレルギー性鼻炎や蕁麻疹の治療薬として、ヨーロッパ、アメリカを初めとし、世界で広く使用されている。

当社では、後発医薬品として開発を企画し、2007年3月に承認を取得、同年7月セチリジン塩酸塩錠5mg及び10mg「イワキ」として発売を開始した。

本製品は診療報酬上の後発医薬品に該当する。

2. 製品の治療学的特性

- (1) H₁ 受容体拮抗作用機序のアレルギー性疾患治療剤である。成人においてはアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症に、小児においてはアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒に適応症を持つ。
- (2) 通常、成人では1日1回、小児では1日2回(1回5mg)の経口投与となっている。「V. 3. 用法及び用量」の項参照)
- (3) 本剤の成分及び、ピペラジン誘導体(レボセチリジン、ヒドロキシジンを含む)に対し過敏症の既往歴のある患者、重度の腎障害(クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満)の患者に使用しないこと(「VIII. 2. 禁忌内容とその理由」参照)
- (4) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、痙攣、肝機能障害、黄疸、血小板減少が報告されている。「VIII. 8. 副作用」の項参照)
- (5) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。「VIII. 5. 重要な基本的注意とその理由」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

フィルムコーティング錠

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料、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	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

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」・セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

(2) 洋名

Cetirizine Hydrochloride Tablets 5mg / 10mg “IWAKI”

(3) 名称の由来

一般名＋規格＋製造販売会社略称

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

セチリジン塩酸塩 (JAN)

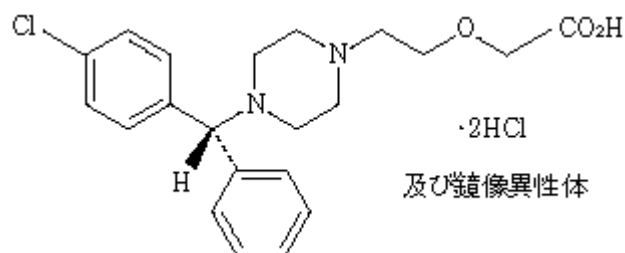
(2) 洋名(命名法)

Cetirizine Hydrochloride (JAN)

(3) ステム(stem)

diphenylmethyl piperazine derivatives: -izine (-yzine)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: $C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot 2HCl$

分子量: 461.81

5. 化学名(命名法)又は本質

2-(2-{4-[(*RS*)-(4-Chlorophenyl)(phenyl)methyl]piperazin-1-yl}ethoxy)acetic acid dihydrochloride

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくい。0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

(参考)¹⁾

1g は、水 1mL 未満、エタノール(99.5)約 950mL に溶ける。メタノールにはやや溶けやすく約 30mL に溶ける。

(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 (参考:実測値) pK_{a1} :2.85(滴定法) pK_{a2} :8.33(滴定法)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

吸光度:231nm 付近に吸収の極大を示し、237nm における $E_{1cm}^{1\%}$ は約 370 である。

旋光性:水溶液(1→10)は旋光性を示さない。

無臭で味は僅かに苦い。

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:日局「セチリジン塩酸塩」による。

定量法:日局「セチリジン塩酸塩」による。

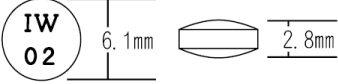
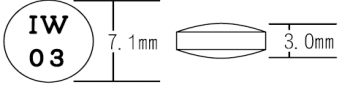
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠剤(フィルムコーティング錠)

(2) 製剤の外観及び性状

製剤	性状
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	白色のフィルムコーティング錠 
セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」	白色のフィルムコーティング錠 

(3) 識別コード

[セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」]

コード種別	コード
錠剤	刻印: IW 02 (割線無し)
PTP	表面: CT5 裏面: セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」

[セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」]

コード種別	コード
錠剤	刻印: IW 03 (割線無し)
PTP	表面: CT10 裏面: セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

(4) 製剤の物性

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」、セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

日局 製剤均一性試験法「含量均一性試験」により試験するとき適合する。

溶出規格: 以下の溶出規格を満たす。

試験方法: 日局溶出試験法(パドル法)

条件: 回転数 50 rpm

試験液: 水 900mL

溶出規格: 5mg 錠 15 分 85%以上、10mg 錠 30 分 80%以上

IV. 製剤に関する項目

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

[セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」]

有効成分(1錠中)	日局セチリジン塩酸塩 5mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、カルナウバロウ

[セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」]

有効成分(1錠中)	日局セチリジン塩酸塩 10mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、プロピレングリコール、酸化チタン、青色2号

(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

(1) 加速試験²⁾

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」の PTP における加速試験(40℃、相対湿度 75%、6ヵ月)、及び

IV. 製剤に関する項目

セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」の PTP-アルミピロー(アルミニウムと塩化ビニルフィルム)包装を用いた加速試験(40°C、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であった。セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」及びセチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」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。

加速試験結果

[セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」](n=9)

容器	項目	試験開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP	外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	含量均一性	適合	適合	適合	適合
	確認試験	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	溶出試験	適合	適合	適合	適合
	含量(%) 残存率(%)	99.7 (100.0)	100.3 (100.7)	100.0 (100.4)	100.2 (100.6)
ポリエチレン (参考)容器	外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	含量均一性	適合	適合	適合	適合
	確認試験	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	溶出試験	適合	適合	適合	適合
	含量(%) 残存率(%)	99.9 (100.0)	99.9 (100.0)	100.1 (100.2)	100.0 (100.1)

※試験方法は、本製剤の規格試験、及び局方一般試験法に準ずる。

[セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」](n=9)

容器	項目	試験開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP (アルミピロー)	外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	含量均一性	適合	適合	適合	適合
	確認試験	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	崩壊試験	適合	適合	適合	適合
	溶出試験	適合	適合	適合	適合
	含量(%) 残存率(%)	98.2 (100.0)	98.6 (100.9)	98.1 (99.9)	98.2 (99.9)

※試験方法は、本製剤の規格試験、及び局方一般試験法に準ずる。

(2) 各種条件下における安定性³⁾

1) 試験条件:40°C75%RH で保存

剤形	包装	試験期間	概要
錠剤	PTP	6 ヶ月	<ul style="list-style-type: none"> ・5mg 錠は、試験期間内において、品質上の大きな問題は認められなかった。 ・10mg 錠は溶出挙動に遅延が見られた。最終包装製品を用いた加速試験ではアルミピロー包装で異常が見られなかったことから吸湿の影響
	褐色ガラス瓶	6 ヶ月	
	無包装	8 週間	
	薬包紙	8 週間	

IV. 製剤に関する項目

	調剤用フィルム袋	8週間	響を受けていると考えられる。防湿対策が最良の管理方法であるが、25°Cの試験では溶出挙動には問題がないことから室温で保存であれば問題がないと考えられる。
粉碎品	無包装	8週間	・5mg錠は無包装で含量のわずかな低下、性状の変化が見られ、調剤用フィルム包装の場合、含量のわずかな低下が見られた。
	薬包紙	8週間	
	調剤用フィルム袋	8週間	・10mg錠では全ての条件で含量のわずかな低下、性状の変化が見られた。

2) 試験条件: 25°C75%RH で保存

剤形	包装	試験期間	概要
錠剤	PTP	6ヶ月	・試験期間内において、品質上の大きな問題は認められなかった。
	褐色ガラス瓶	6ヶ月	
	無包装	2ヶ月	
	薬包紙	2ヶ月	
	調剤用フィルム袋	2ヶ月	
粉碎品	無包装	2ヶ月	
	薬包紙	2ヶ月	
	調剤用フィルム袋	2ヶ月	

3) 試験条件: 光照射、60万(lx・hr)又は120万(lx・hr)

剤形	包装	概要
錠剤	PTP	・5mg錠はわずかな含量低下が見られたが品質上の大きな問題は認められなかった。 ・10mg錠は品質上の大きな問題は認められなかった。
	褐色ガラス瓶	
	無包装	
	薬包紙	
	調剤用フィルム袋	
粉碎品	無包装	・全ての包装条件について着色が見られた。
	薬包紙	
	調剤用フィルム袋	

4) まとめ

錠剤は、いずれの包装形態においても湿度や温度による影響は少ないと考えられる。高温にならず、強度の光に長時間曝されるようなことのない、例えば薬局等での適切な管理下と

IV. 製剤に関する項目

いった環境であれば、どの包装形態であっても試験した期間内での品質は問題ないものと判断した。粉碎品の保管は光に対する注意が必要であり、長期にわたって保管すべきではないことが示唆された。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない（参考）簡易懸濁法について「XIII. 備考 (2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性」の項参照

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

9. 溶出性

16.8 その他

セチリジン塩酸塩錠 5 mg 「イワキ」及びセチリジン塩酸塩錠 10 mg 「イワキ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたセチリジン塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている⁴⁾。

(1) 溶出試験

[セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」][セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」]

試験方法: 日局溶出試験法(パドル法)

条 件: 回転数 50 rpm

試験液: 水 900mL

溶出規格: 5mg 錠 15 分 85%以上 10mg 錠 30 分 80%以上

(2) 生物学的同等性試験における溶出曲線⁴⁾

セチリジン塩酸塩錠 5mg および 10mg「イワキ」と標準製剤について pH1.2、3.0、6.8 及び水の 4 条件について後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインにおける溶出試験(V.溶出試験 3.試験条件 2)「中性又は塩基性薬物を含む製剤、コーティング製剤」を行い、その溶出パターンを比較したところ、溶出挙動の同等性が確認された。

1) 試験条件等

試験条件	パドル法(日局(JP13)溶出試験法第2法) 攪拌速度: 50rpm pH1.2 について 100rpm 試験液量: 900mL 試験液の温度: 37°C 試験数: 一条件につき 12 ベッセル	
溶出液	pH1.2 (日局(JP13)崩壊試験液の第一液)	pH6.8 (日局(JP13)崩壊試験液の第二液)
	pH3.0(薄めた McIlvaine 緩衝液)	水(日局精製水)
定量法	液体クロマトグラフィー	

2) 溶出結果

[セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」]

試験液 pH1.2、pH4.0、pH6.8 及び水において標準製剤およびセチリジン塩酸塩錠 5mg「イワ

IV. 製剤に関する項目

キ」ともに 15 分以内に 85%以上が溶出した。

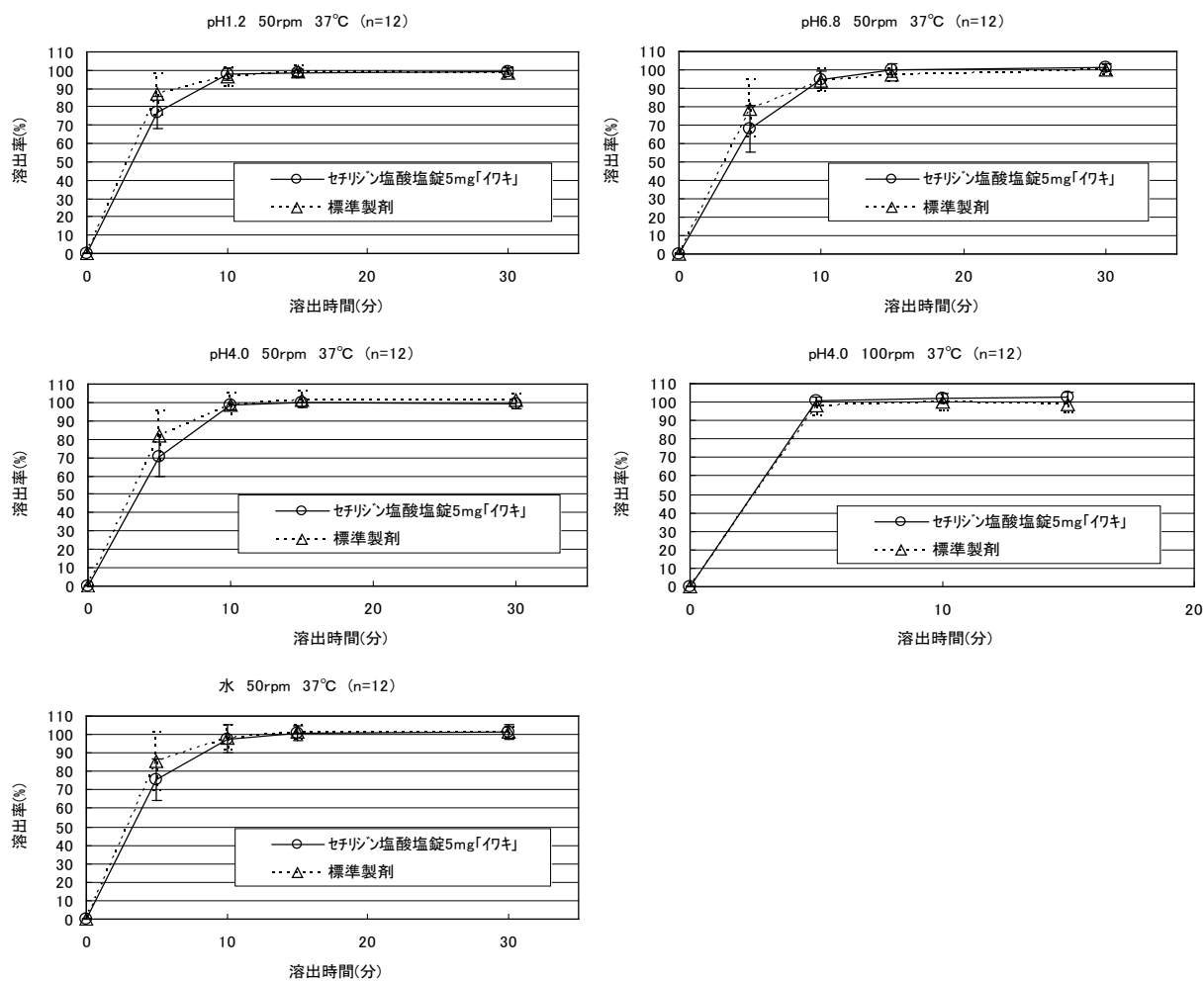
以上の結果から後発医薬品のガイドライン「溶出挙動の類似性の判定」において判定し、本試験におけるセチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」の溶出挙動は標準製剤と同等であると判断した。

[セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」]

試験液 pH1.2、pH4.0、pH6.8 及び水においてセチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」は 15 分以内に 85%以上が溶出した。標準製剤は試験液 pH1.2、pH4.0、pH6.8 において 15 分以内に 85%以上が溶出したが、水においては 15 分～30 分以内に 85%が溶出した。後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに従い求めた f_2 関数の値は 53.4(水)であり、45 以上であった。以上の結果から後発医薬品のガイドライン「溶出挙動の類似性の判定」において判定し、本試験におけるセチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」の溶出挙動は標準製剤と同等であると判断した。

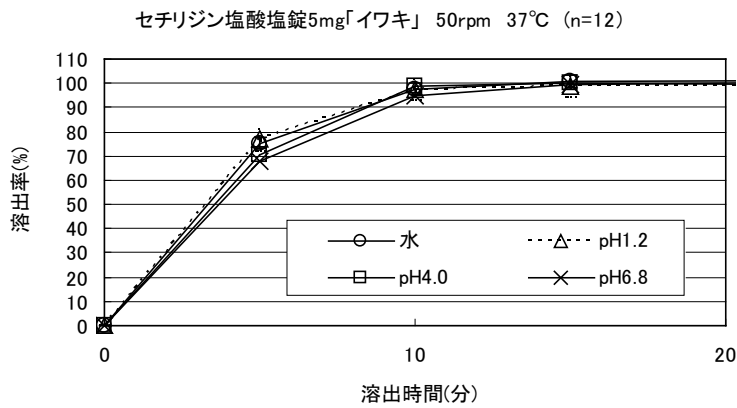
3) 溶出結果グラフ

[セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」]

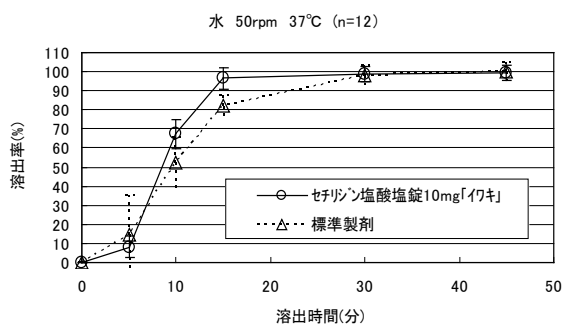
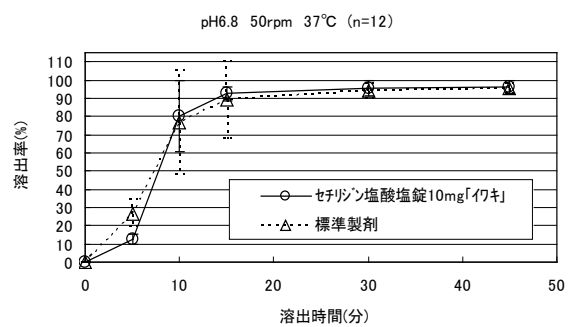
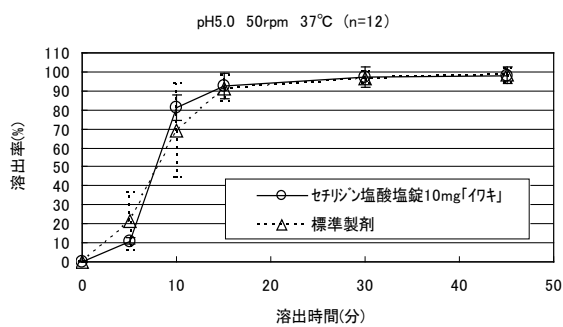
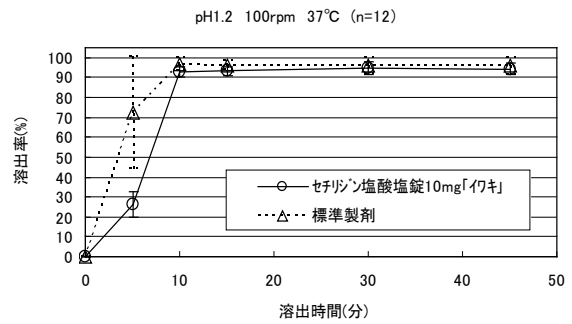
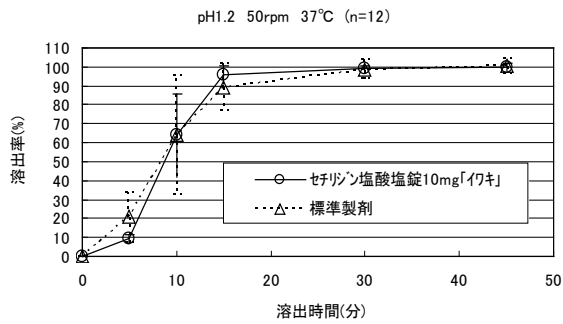


IV. 製剤に関する項目

(参考) 各溶出液における挙動

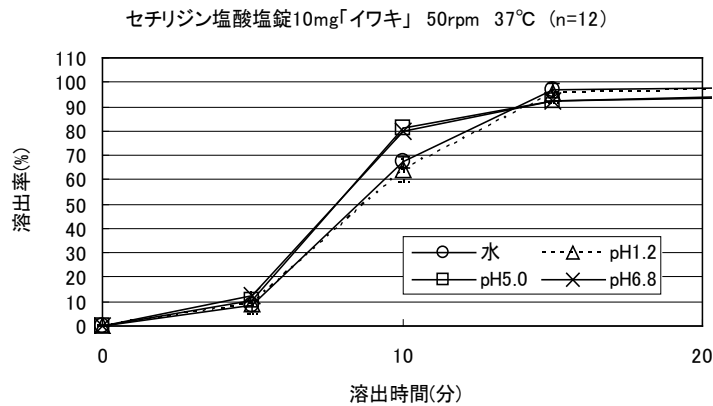


[セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」]



IV. 製剤に関する項目

(参考)各溶出液における挙動



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

製品	包装単位
セチリジン塩酸塩錠 5 mg「イワキ」	100 錠[10 錠(PTP) × 10]
セチリジン塩酸塩錠 10 mg「イワキ」	100 錠[10 錠(PTP) × 10]、500 錠[10 錠(PTP) × 50]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP:ポリ塩化ビニル アルミニウム

アルミピロー:ポリ塩化ビニル アルミニウム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

〔成人〕

○アレルギー性鼻炎

○蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症

〔小児〕

○アレルギー性鼻炎

○蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

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

6. 用法及び用量

〈10mg 錠〉

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として1回10mgを1日1回、就寝前に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は1日20mgとする。

〈5mg 錠〉

〔成人〕

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として1回10mgを1日1回、就寝前に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は1日20mgとする。

〔小児〕

通常、7歳以上15歳未満の小児にはセチリジン塩酸塩として1回5mgを1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。

(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

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 腎機能障害患者では、血中濃度半減期の延長が認められ、血中濃度が増大するため、クレアチンクリアランスに応じて、下表のとおり投与量の調節が必要である。[2.2 参照]，[9.2.1 参照]，[9.2.2 参照]，[16.6.1 参照]

成人患者の腎機能に対応する用法・用量の目安

	クレアチンクリアランス (mL/min)			
	≥80	50~79	30~49	10~29
推奨用量	10mgを1日1回	10mgを1日1回	5mgを1日1回	5mgを2日に1回

腎機能障害を有する小児患者では、各患者の腎クリアランスと体重を考慮して、個別に用量

を調整すること。

7.2 重度の肝機能障害患者では、低用量（例えば通常用量の半量）から投与を開始するなど慎重に投与すること。[9.3 参照]，[16.6.2 参照]

7.3 高齢者では、低用量（例えば 5mg）から投与を開始するなど慎重に投与すること。[9.8 参照]，[16.6.3 参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(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

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.1 国内後期第Ⅱ試験（二重盲検比較試験、成人）

セチリジン塩酸塩 10mg を 1 日 1 回 2 週間投与したとき、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は 53.8%（21/39 例）であった⁵⁾。

副作用発現頻度は 13.0%（6/46 例）であり、主な副作用は眠気 4.3%（2/46 例）であった。

17.1.2 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

セチリジン塩酸塩 10mg を 1 日 1 回 4 週間投与したとき、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は 47.9%（45/94 例）であった⁶⁾。

副作用発現頻度は 5.5%（6/110 例）であり、主な副作用は眠気 3.6%（4/110 例）であった。

17.1.3 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、小児）

セチリジン塩酸塩ドライシロップ [2 歳以上 7 歳未満：1 回 0.2g（セチリジン塩酸塩として 2.5mg）を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 5mg）を 1 日 2 回] あるいはプラセボを 2 週間投与した。総合鼻症状スコア（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感）の変化量（解析対象 122 例）を下表に示した。その結果から、プラセボに対する本薬の優越性が検証された⁷⁾。

（続く）

V. 治療に関する項目

(続き)					
全治療評価期間における総合鼻症状スコア ^{注1)} の変化量					
群	例数	ベースライン 評価期間	全治療 評価期間	変化量 ^{注2)}	
		平均値 (標準偏差)	平均値 (標準偏差)	平均値 (標準偏差)	調整済み平均値 ^{注3)} (標準誤差)
セチリジン 塩酸塩	122	6.66 (1.26)	4.79 (1.96)	1.87 (1.79)	1.85 (0.18)
プラセボ	117	6.84 (1.52)	5.51 (2.04)	1.33 (1.79)	1.25 (0.18)

セチリジン塩酸塩 vs プラセボ	点推定値 ^{注3)} 0.60	95%信頼区間 ^{注3)} [0.15~1.05]	p 値 p=0.0087
---------------------	-----------------------------	---------------------------------------	-----------------

注1) 総合鼻症状スコアが10を超える患児は組入れから除外
注2) 変化量 = {ベースライン評価期間 (治験薬投与開始日の前3日間) - 全治療評価期間}
注3) ベースライン評価期間スコア及び年齢層を共変量とした共分散分析により算出

副作用発現頻度は9.8% (12/122例) であり、主な副作用はALT増加5.7% (7/122例)、AST増加1.6% (2/122例)であった。

17.1.4 国内第Ⅲ相試験 (一般臨床試験、小児)
セチリジン塩酸塩ドライシロップ [2歳以上7歳未満: 1回0.2g (セチリジン塩酸塩として2.5mg) を1日2回、7歳以上15歳未満: 1回0.4g (セチリジン塩酸塩として5mg) を1日2回] を12週間投与した。総合鼻症状スコアのベースライン評価期間からの変化量の推移 (平均値±標準偏差、解析対象36例) は、投与4週時: 2.81±2.62、投与8週時: 3.66±2.75、投与12週時: 3.40±3.01 であり、効果は投与終了時まで減弱することなく、安定していた⁸⁾。
副作用発現頻度は2.8% (1/36例) であり、主な副作用は白血球数増加2.8% (1/36例) であった。

〈蕁麻疹〉

17.1.5 国内後期第Ⅱ相試験 (二重盲検比較試験、成人)
セチリジン塩酸塩10mgを1日1回投与したとき、投与3日後、投与1週間後及び投与2週間後における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、47.9% (34/71例)、64.9% (48/74例) 及び71.6% (48/67例) であった⁹⁾。
副作用発現頻度は10.8% (9/83例) であり、主な副作用は眠気4.8% (4/83例) であった。

17.1.6 国内第Ⅲ相試験 (二重盲検比較試験、成人)
セチリジン塩酸塩10mgを1日1回投与したとき、投与3日後、投与1週間後及び投与2週間後における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、56.4% (53/94例)、71.3% (77/108例) 及び82.2% (88/107例) であった¹⁰⁾。
副作用発現頻度は15.9% (21/132例) であり、主な副作用は眠気10.6% (14/132例) であ

V. 治療に関する項目

あった。

17.1.7 国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験、成人）

セチリジン塩酸塩 10mg を 1 日 1 回投与したとき、投与 3 日後、投与 1 週間後及び投与 2 週間における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、46.7% (14/30 例)、53.2% (33/62 例) 及び 72.9% (43/59 例) であった¹¹⁾。

副作用発現頻度は 4.4% (3/68 例) であり、主な副作用は眠気 2.9% (2/68 例) であった。

〈湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症〉

17.1.8 国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験、成人）

セチリジン塩酸塩 10mg を 1 日 1 回 2 週間投与したとき、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は、湿疹・皮膚炎群で 65.9% (81/123 例)、痒疹群で 57.7% (30/52 例)、皮膚そう痒症で 74.5% (41/55 例) であった¹²⁾。

副作用発現頻度は全体で 5.5% (13/236 例) であり、主な副作用は眠気 3.4% (8/236 例) であった。

〈蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒〉

17.1.9 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、小児）

アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験において、セチリジン塩酸塩ドライシロップ [3 歳以上 7 歳未満：1 回 0.2g (セチリジン塩酸塩として 2.5mg) を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 0.4g (セチリジン塩酸塩として 5mg) を 1 日 2 回] あるいはケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ [3 歳以上 7 歳未満：1 回 0.6g (ケトチフェンとして 0.6mg) を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 1g (ケトチフェンとして 1mg) を 1 日 2 回] を 2 週間投与した。そう痒の重症度の変化量（解析対象 134 例）を下表に示した。その結果から、ケトチフェンフマル酸塩に対する本薬の非劣性が検証された¹³⁾。

全治療評価期間におけるそう痒の重症度の変化量

群	例数 ^{注4)}	ベースライン 評価期間	全治療 評価期間	変化量 ^{注5)}	
		平均値 (標準偏差)	平均値 (標準偏差)	平均値 (標準偏差)	調整済み平均 値 ^{注6)} (標準誤差)
セチリジン 塩酸塩	134	2.41 (0.52)	1.96 (0.64)	0.45 (0.67)	0.43 (0.05)
ケトチフェン フマル酸塩	126	2.40 (0.52)	1.88 (0.63)	0.52 (0.62)	0.51 (0.05)

セチリジン塩酸塩 vs ケトチフェンフマル酸塩	点推定値 ^{注6)}	95%信頼区間 ^{注6)}
	-0.08	[-0.22~0.06]

注 4) 変化量が算出可能な被験者数

注 5) 変化量 = {ベースライン評価期間（治験薬投与開始日の前 3 日間） - 全治療評価期間}

注 6) ベースライン評価期間のそう痒の重症度及び年齢層を共変量とした共分散分析により算出

副作用発現頻度は 2.7% (4/148 例) であり、主な副作用は傾眠 1.4% (2/148 例) であっ

V. 治療に関する項目

た。

17.1.10 国内第Ⅲ相試験(一般臨床試験、小児)

蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症を対象とした試験において、セチリジン塩酸塩ドライシロップ [2歳以上7歳未満：1回 0.2g (セチリジン塩酸塩として 2.5mg) を1日2回、7歳以上15歳未満：1回 0.4g (セチリジン塩酸塩として 5mg) を1日2回] を12週間投与した。そう痒の重症度の治療期開始日からの変化量の推移 (平均値±標準偏差) は、投与4週時：0.83±0.79、投与8週時：0.97±0.90、投与12週時：1.03±0.90であり、効果は投与終了時まで減弱することなく、安定していた¹⁴⁾。副作用発現頻度は1.4% (1/73例) であり、傾眠1例であった。

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

該当しない

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

17.3 その他

17.3.1 眠気に対する影響 (小児)

国内4つの小児臨床試験の併合解析の結果、セチリジン塩酸塩の眠気の発現率は1.0% (5/480例) と低かった^{8,13~15)}。小児通年性アレルギー性鼻炎に対するプラセボを対照とした二重盲検比較試験の結果、セチリジン塩酸塩の眠気の発現率は1.0%未満 (1/122例) であり、プラセボ (0/117例) と同程度であった⁷⁾。

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

抗アレルギー用薬。特に、ヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

1) 作用部位

鼻や皮膚のヒスタミン H₁ 受容体、肥満細胞をはじめとするアレルギー反応性細胞

2) 作用機序

18.1 作用機序

ヒスタミン H₁ 受容体に選択的に結合することにより、ヒスタミンの作用を阻害する。

(参考)

抗ヒスタミン作用(H₁ 受容体遮断作用)、及び肥満細胞からのロイコトリエン遊離抑制、プロスタグランジン D₂ 遊離抑制作用を併せ持つ。古典的な抗ヒスタミン薬と異なり、抗コリン作用はほとんどない。またヒスタミン H₂、ドパミン、セロトニンの各受容体に対する親和性は低く、中枢神経系におけるヒスタミン H₁ 受容体への影響が少ないとされる。¹⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用

摘出臓器(ヒト気管支平滑筋)のヒスタミン反応を濃度依存的に抑制した¹⁶⁾。また、ヒスタミン誘発皮膚反応及びヒスタミン誘発鼻症状を抑制し、その作用は速効的かつ持続的であった(ヒト)^{17,18)}。

ヒスタミン H₂、ドパミン、アセチルコリン、セロトニンの各受容体に対する親和性は低く(ラット、モルモット)¹⁹⁾、中枢神経系におけるヒスタミン H₁ 受容体への影響が少ない(ラット)²⁰⁾。

18.3 好酸球に対する作用

好酸球に対し *in vitro* 及び *in vivo* において遊走抑制を示し、好酸球活性化の指標であるスーパーオキシド産生を抑制した(ヒト)^{21,22)}。

18.4 メディエーター遊離抑制作用

ヒト肺切片からのロイコトリエン及びプロスタグランジン D₂ 遊離を抑制した²³⁾。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 成人

健康成人にセチリジン塩酸塩錠 10mg を単回経口投与した場合、速やかに吸収され、投与約 1.4 時間後に最高血漿中濃度 (Cmax) 214.5ng/mL に達し、血漿中濃度消失半減期は約 7 時間であった。また、20mg を単回経口投与した場合、投与量の増加に伴って Cmax の上昇、AUC の増大が認められた。健康成人に 1 日 1 回 20mg を 7 日間連続経口投与した場合、蓄積性は認められなかった²⁴⁾。

成人におけるセチリジン塩酸塩錠単回投与時の薬物動態パラメータ

投与量	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (mg・hr/L)
10mg	1.44±0.18	214.5±12.5	6.73±0.81	2.0±0.1
20mg	1.50±0.13	438.1±39.5	6.79±0.66	3.9±0.3

(平均値±標準誤差、n=8)

16.1.2 小児

日本人の通年性アレルギー性鼻炎患児又は皮膚疾患患児を対象とした臨床試験 5 試験、570 例から得られた血清中濃度値 994 点を用い、母集団薬物動態解析 (非線形混合効果モデル法、NONMEM) を行った。その結果、体重が共変量として認められ、2~6 歳の小児 (本年齢層における体重の中央値: 18.0kg) の全身クリアランス (CL/F) は 1.64L/hr、分布容積 (V/F) は 11.9L、7~14 歳の小児 (同: 31.0kg) の CL/F は 2.11L/hr、V/F は 17.7L と推定された。また、セチリジン塩酸塩 2.5mg 1 日 2 回投与時の定常状態時最低血清中濃度 (C_{ss} min) 及び最高血清中濃度 (C_{ss} max) は、それぞれ 58±25ng/mL 及び 214±50ng/mL (平均±標準偏差^{註)}、以下同様) と推定され、セチリジン塩酸塩 5mg 1 日 2 回投与時の C_{ss} min 及び C_{ss} max は、それぞれ 100±40ng/mL 及び 308±74ng/mL と推定された²⁵⁾。

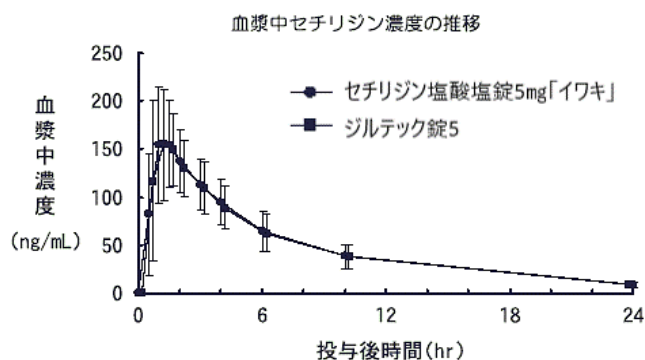
注) 1000 例の血清中濃度推移をシミュレーションしたときの推定値

VII. 薬物動態に関する項目

16.1.3 生物学的同等性試験

〈セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」〉

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」とジルテック錠 5 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（セチリジン塩酸塩として 5mg）健康成人男子 20 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された²⁶⁾。



薬物動態パラメータ

製剤\パラメータ	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL)
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	1.3±0.4	167.1±47.1	6.4±0.9	1152.5±321.4
ジルテック錠 5	1.2±0.6	172.8±56.3	6.9±0.8	1140.5±303.8

(平均±標準偏差、n=20)

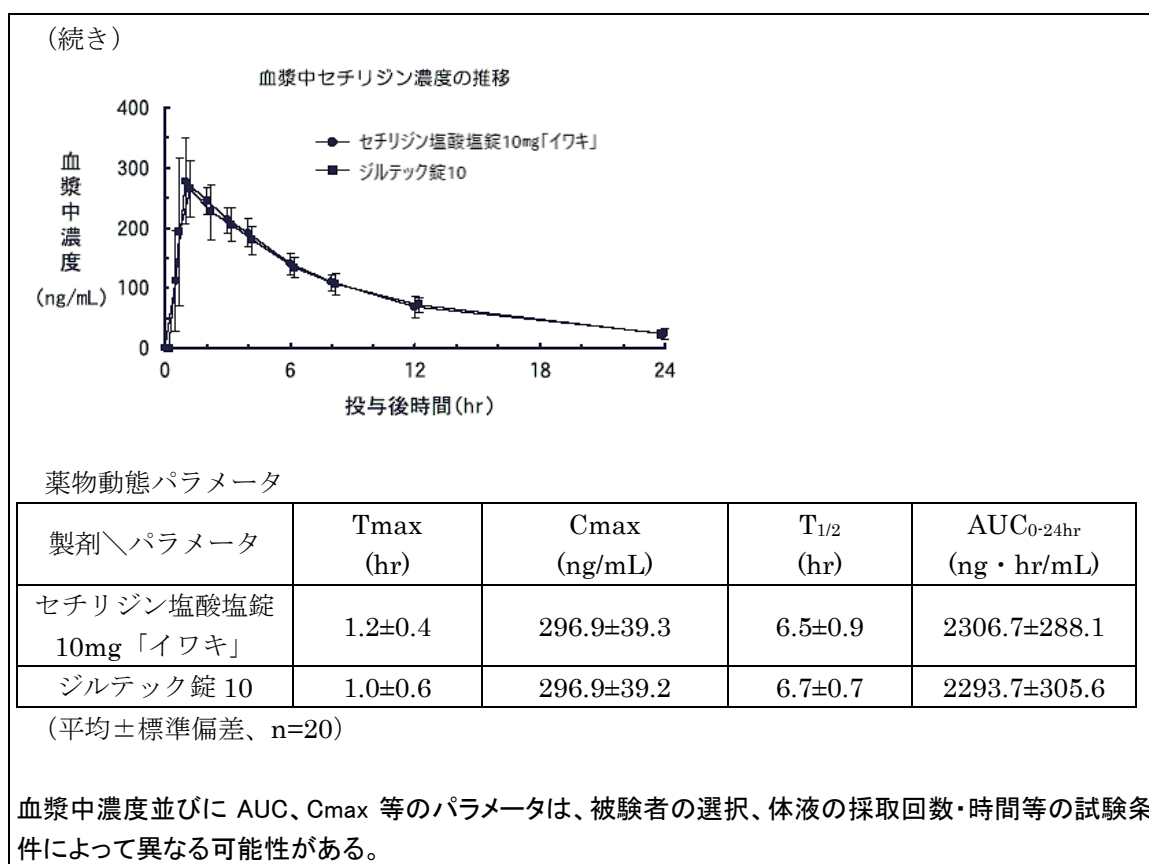
血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

〈セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」〉

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」とジルテック錠 10 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（セチリジン塩酸塩として 10mg）健康成人男子 20 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された²⁶⁾。

(続く)

VII. 薬物動態に関する項目



生物学的同等性試験の詳細情報 (治験デザイン等)

試験概要	ガイドライン等	<ul style="list-style-type: none"> 後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日医薬審第487号)(改正平成13年5月31日医薬審第786号)に基づいて実施した。 本治験はGCPを遵守して実施した。 					
	試験方法	<ul style="list-style-type: none"> 2剤2期のクロスオーバー試験 血漿中の塩酸セチリジン濃度の薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。 					
試験方法	被験者	<ul style="list-style-type: none"> 健康成人男子 5mg錠: BMI18.4~23.9 10mg錠: BMI18.9~25.3 					
	投与量及び投与方法	<ul style="list-style-type: none"> 単回投与 (第I期と第II期間の休薬期間 5mg錠で6日間、6mg錠で5日間) 試験製剤及び標準製剤を1錠、空腹時に水150mLとともに単回経口投与した。 <table border="1"> <thead> <tr> <th>試験製剤</th> <th>標準製剤</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>セチリジン塩酸塩錠5mg「イワキ」</td> <td>標準製剤(セチリジン塩酸塩として5mg)</td> </tr> <tr> <td>セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」</td> <td>標準製剤(セチリジン塩酸塩として10mg)</td> </tr> </tbody> </table>	試験製剤	標準製剤	セチリジン塩酸塩錠5mg「イワキ」	標準製剤(セチリジン塩酸塩として5mg)	セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」
試験製剤	標準製剤						
セチリジン塩酸塩錠5mg「イワキ」	標準製剤(セチリジン塩酸塩として5mg)						
セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」	標準製剤(セチリジン塩酸塩として10mg)						

VII. 薬物動態に関する項目

	被験者数	5mg 錠:20 例 10mg 錠:20 例
	体液の採取方法及び測定方法	<ul style="list-style-type: none"> • 体液の採取時間 投与前、投与後 30 分、1 時間、2 時間、3 時間、4 時間、6 時間、8 時間、10 時間(5mg 錠)または 12 時間(10mg 錠)、24 時間の 10 ポイント • 採取体液等: 静脈血 • 測定方法 5mg 錠: GC-MS 10mg 錠: HPLC
同等性	試験結果	• 本試験における各パラメータの平均値 標準偏差を「1)試験結果の概要」に記載
	同等性の要約	<p>セチリジン塩酸塩 5mg 錠「イワキ」</p> <p>• 本試験の結果、セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」と標準製剤との平均値の差の 90%信頼区間は AUC_t では $\log(0.91) \sim \log(1.11)$、$C_{max}$ では $\log(0.88) \sim \log(1.08)$ であった。従って「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」で示されている同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ に適合したことから、セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」は標準製剤と生物学的に同等であると判断した。</p> <p>セチリジン塩酸塩 10mg 錠「イワキ」</p> <p>• 本試験の結果、セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」と標準製剤との平均値の差の 90%信頼区間は AUC_t では $\log(0.97) \sim \log(1.05)$、$C_{max}$ では $\log(0.96) \sim \log(1.05)$ であった。従って「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」で示されている同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ に適合したことから、セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」は標準製剤と生物学的に同等であると判断した。</p>

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(参考)[血清中濃度:生物学的同等性試験]は服用前 12 時間、服用後 4 時間の絶食試験である。(「VII. 1 (2) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

(参考)アトピー性皮膚炎診療ガイドラインにおいて、10mg では非鎮静性の薬剤とされる。^{2)参考}

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

(参考)動物実験(ラット)で胎盤を通過することが報告されている。(「VIII. 6. 妊婦」の項参照)

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(参考)ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。(「VIII. 6. 授乳婦」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

(6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

16.3.1 血漿蛋白結合率

¹⁴C 標識-セチリジン 0.1、1 及び 10 μ g/mL 濃度の *in vitro* におけるヒト血漿蛋白との結合率は、平均 92% (90.7~92.5%) であった (平衡透析法)²⁷⁾。

VII. 薬物動態に関する項目

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人に1日1回セチリジン塩酸塩 20mg を7日間連続経口投与した場合、血漿中に酸化脱アルキル体がわずかに認められた²⁴⁾。

(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

16.5 排泄

健康成人にセチリジン塩酸塩 10mg 又は 20mg を単回経口投与した場合、24時間後までに投与量の約50%が未変化体として尿中に排泄された。また、健康成人に1日1回20mgを7日間連続経口投与した場合、未変化体の1日投与量に対する尿中排泄率は、1日目は24時間後までに約58%、7日目は約70%であった²⁴⁾。

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

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス：7～60mL/min）にセチリジン塩酸塩 10mg を単回経口投与した場合、腎機能正常者に比べ血清中濃度は持続し、血清中濃度消失半減期の延長が認められた²⁸⁾（外国人データ）。

腎機能障害患者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

クレアチニン クリアランス (mL/min)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (mg・hr/L)
>90	0.9±0.2	313±45	7.4±3.0	2.7±0.4
31～60	1.1±0.2	356±64	19.2±3.3	6.9±1.8

VII. 薬物動態に関する項目

7~30	2.2±1.1	357±172	20.9±4.4	10.7±2.4
------	---------	---------	----------	----------

(平均値±標準偏差、n=5)

また、血液透析患者 (n=5) にセチリジン塩酸塩 10mg を透析開始 3 時間前に経口投与した場合、血清中濃度消失半減期は平均 19.3 時間で延長が認められた²⁹⁾ (外国人データ)。[2.2 参照] , [7.1 参照] , [9.2.1 参照] , [9.2.2 参照]

16.6.2 肝機能障害患者での体内動態

原発性胆汁性肝硬変患者にセチリジン塩酸塩 10mg を単回経口投与した場合、肝機能正常成人²⁸⁾ に比べ、血清中濃度消失半減期の延長、Cmax の上昇、AUC の増大が認められた³⁰⁾ (外国人データ)。[7.2 参照] , [9.3 参照]

肝機能障害患者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

投与量 (被験者、例数)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (mg・hr/L)
10mg (肝機能正常成人、n=14)	1.0±0.5	384±103	7.4±1.6	3.3±0.9
10mg (原発性胆汁性肝硬変患者、n=6)	1.0±0.4	498±118	13.8±1.8	6.4±1.6

(平均値±標準偏差)

16.6.3 高齢者

高齢者 (年齢：平均 77 歳、クレアチニンクリアランス：平均 53mL/min) にセチリジン塩酸塩 10mg を単回経口投与した場合、成人 (年齢：平均 53 歳、クレアチニンクリアランス：平均 87mL/min) に比べ、血清中濃度消失半減期の延長と Cmax の上昇が認められ、これらの薬物動態パラメータの変化は、腎機能の低下によるものと考えられた²⁸⁾ (外国人データ)。[7.3 参照] , [9.8 参照]

高齢者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

投与量 (被験者、例数)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (mg・hr/L)
10mg (成人、n=14)	1.0±0.5	384±103	7.4±1.6	3.3±0.9
10mg (高齢者、n=16)	0.9±0.3	460±59	11.8±5.4	5.6±1.8

(平均値±標準偏差)

11. その他

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

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)

2.1 本剤の成分又はピペラジン誘導体(レボセチリジン、ヒドロキシジンを含む)に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 重度の腎機能障害(クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満)のある患者 [7.1 参照], [9.2.1 参照], [16.6.1 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

「Ⅴ. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。

8.2 効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.3 季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

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

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者
痙攣を発現するおそれがある。[11.1.2 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重度の腎機能障害患者(クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満)

投与しないこと。高い血中濃度が持続するおそれがある。[2.2 参照], [7.1 参照], [16.6.1 参照]

9.2.2 中等度又は軽度の腎機能障害患者(クレアチニンクリアランス 10mL/min 以上 60mL/min 以下)

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

高い血中濃度が持続するおそれがある。[7.1 参照] , [16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

高い血中濃度が持続するおそれがある。[7.2 参照] , [16.6.2 参照]

(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）で胎盤を通過することが報告されている。

(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。
ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

9.7.1 2歳以上7歳未満の小児に対してはセチリジン塩酸塩ドライシロップを投与すること。

9.7.2 低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

慎重に投与し、異常が認められた場合は減量又は休薬するなど適切な処置を行うこと。腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがある。[7.3 参照] , [16.6.3 参照]

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)

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
テオフィリン	テオフィリンの薬物動態に変化はないが、本剤の曝露量の増加が報告されている。	機序は明らかではないが、本剤のクリアランスが 16%減少する。
リトナビル	本剤の曝露量の増加 (40%) 及びリトナビルの曝露量のわずかな変化 (-11%) が報告されている。	リトナビルにより本剤の腎排泄が阻害される可能性が考えられる。
中枢神経抑制剤 アルコール	中枢神経系に影響を与える可能性がある。	中枢神経抑制作用が増強される可能性がある。
ピルシカイニド塩酸塩水和物	両剤の血中濃度が上昇し、ピルシカイニド塩酸塩水和物の副作用が発現したとの報告がある。	機序は明らかではない。

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（いずれも頻度不明）

ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等）があらわれることがある。

11.1.2 痙攣（頻度不明）

[9.1.1 参照]

11.1.3 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

AST、ALT、 γ -GTP、LDH、Al-P の上昇等の肝機能障害（初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等）、黄疸があらわれることがある。

11.1.4 血小板減少（頻度不明）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

種類\頻度	0.1%～5%未満	0.1%未満	頻度不明
精神神経系	眠気、倦怠感	頭痛、頭重感、ふらふら感、しびれ感、めまい、浮遊感	不眠、振戦、抑うつ、激越、攻撃性、無力症、錯感覚、幻覚、不随意運動、意識消失、健忘、自殺念慮、悪夢

(続く)

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(続き)

種類\頻度	0.1%~5%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器	口渇、嘔気、食欲不振	胃不快感、下痢、消化不良、腹痛、腹部不快感、胃痛、口唇炎、便秘、口唇乾燥感、嘔吐、味覚異常、口内炎	腹部膨満感、食欲亢進
循環器		動悸、血圧上昇、不整脈(房室ブロック、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍、心房細動)	
血液	好酸球増多	好中球減少、リンパ球増多、白血球増多、白血球減少、単球増多、血小板増加、血小板減少	
過敏症		発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、そう痒感、血管浮腫	多形紅斑
眼		結膜充血、霧視	眼球回転発作
肝臓	ALT 上昇、AST 上昇、総ビリルビン上昇	Al-P 上昇	
腎臓・泌尿器		尿蛋白、BUN 上昇、尿糖、ウロビリノーゲンの異常、頻尿、血尿	排尿困難、遺尿、尿閉
その他		耳鳴、月経異常、胸痛、ほてり、息苦しさ	関節痛、手足のこわばり、嗅覚異常、鼻出血、脱毛、咳嗽、体重増加、筋肉痛

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

アレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン皮内反応検査を実施する 3~5 日前より本剤の投与を中止することが望ましい。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

錯乱、散瞳、落ち着きのなさ、鎮静、傾眠、昏迷、尿閉があらわれることがある。

13.2 処置

本剤の特異的な解毒剤はなく、また本剤は透析で除去されない。

(参考)¹⁾参考

一般的に、抗ヒスタミン薬の中毒症状として、中枢神経系の興奮、興奮後の抑制あるいは初めからの抑制作用がある。幼小児では興奮が先行し、次に抑制状態、成人では中枢神経抑制が見られることが多い。具体的症状は、『8. 副作用』の項目を参考とする。対応は、薬品を体外に排出する措置(胃洗浄、吸着剤、下剤、透析など)、対症療法および支持療法となる。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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

該当しない

2. 有効期間

有効期間:3年

(参考)安定性試験

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、外観及び含量等は規格の範囲内であり、セチリジン塩酸塩錠5mg「イワキ」及びセチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」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。(IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性)

3. 包装状態での貯法

気密容器・室温保存

4. 取扱い上の注意

該当しない

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

6. 同一成分・同効薬

(1) 同一成分薬

ジルテック錠(5mg、10mg)・ジルテックドライシロップ(1.25%)

(2) 同効薬

レボセチリジン塩酸塩、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オキサトミド、ケトチフェンフマル酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬

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。

7. 国際誕生年月日

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

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

販売名	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
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	2007年3月15日	21900AMX00553000	2007年7月6日	2007年7月6日
セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」	2007年3月15日	21900AMX00546000	2007年7月6日	2007年7月6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

(1) セチリジン塩酸塩錠 5 mg「イワキ」

一部変更承認年月日:2014年4月1日

効能・効果追加

[小児]

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒

用法・用量追加

[小児]

通常、7歳以上15歳未満の小児にはセチリジン塩酸塩として1回5mgを1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。

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

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

13. 各種コード

販売名	包装	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 番号 (13桁)	レセプト電算 処理システム 用コード
セチリジン塩酸塩 錠 5 mg「イワキ」	PTP100T	4490020F1012	4490020F1187	1179675010101	620005446
セチリジン塩酸塩 錠 10 mg「イワキ」	PTP100T	4490020F2019	4490020F2183	1179842010101	620005474
	PTP500T			1179842010102	

14. 保険給付上の注意

該当しない

なお、本剤は診療報酬上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 第18改正 日本薬局方解説書
- 2) 岩城製薬株式会社 社内資料(加速試験)
- 3) 岩城製薬株式会社 社内資料(各種条件下での安定性)
- 4) 岩城製薬株式会社 社内資料(溶出試験)
- 5) 奥田 稔 他:耳鼻咽喉科展望 1994;37:754-779
- 6) 奥田 稔 他:耳鼻咽喉科展望 1995;38:116-136
- 7) 斎藤博久:臨床医薬 2010;26:141-154
- 8) 斎藤博久 他:臨床医薬 2010;26:127-139
- 9) 吉田彦太郎 他:基礎と臨床 1994;28:2107-2129
- 10) 吉田彦太郎 他:基礎と臨床 1994;28:2131-2145
- 11) 吉田彦太郎 他:基礎と臨床 1994;28:2163-2173
- 12) 吉田彦太郎 他:基礎と臨床 1994;28:2147-2162
- 13) 中川秀己 他:臨床医薬 2010;26:155-167
- 14) 中川秀己 他:臨床医薬 2010;26:169-181
- 15) 小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験(ジルテックドライシロップ/錠:2009年4月22日承認、申請資料概要2.7.6.3)
- 16) Advenier C, et al.:J Allergy Clin Immunol. 1991;88:104-113
- 17) Simons F E R, et al.:J Allergy Clin Immunol. 1990;86:540-547
- 18) Braunstein G, et al.:Br J Clin Pharmacol. 1992;33:445-448
- 19) 内田昌子 他:基礎と臨床 1994;28:1795-1812
- 20) Snyder S H, et al.:Ann Allergy. 1987;59:4-8
- 21) Okada C, et al.:Int Arch Allergy Immunol. 1994;103:384-390
- 22) Fadel R, et al.:Clin Allergy. 1987;17:373-379
- 23) Fabre J M, et al.:Allergy. 1995;50:362-365
- 24) 笹 征史 他:臨床薬理 1995;26:509-522
- 25) 日本人小児を対象とした母集団薬物動態解析(ジルテックドライシロップ/錠:2009年4月22日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 26) 岩城製薬株式会社 社内資料(生物学的同等性試験)
- 27) 水野佳子 他:基礎と臨床 1994;28:1951-1961
- 28) Matzke G R, et al.:Ann Allergy. 1987;59:25-30
- 29) Awani W M, et al.:Eur J Clin Pharmacol. 1990;38:67-69
- 30) Simons F E R, et al.:J Clin Pharmacol. 1993;33:949-954

2. その他の参考文献

- 1) 参考 急性中毒情報ファイル 第4版 廣川書店
- 2) 参考 アトピー性皮膚炎診療ガイドライン: 日本皮膚科学会誌 2021;131(13):2691-2777

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

Zirtek(アメリカ、EU)

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

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

本項の情報に関する注意:本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

(参考)簡易懸濁法試験 次ページ

2. その他の関連資料

該当資料なし

XIII. 備考

(参考)セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」 簡易懸濁法試験

[試験方法]

シリンジのピストン部を抜き取り、シリンジ内に錠剤をそのまま 1 個入れてピストンを戻し、シリンジに 55°Cの精製水 20mL を吸い取り、筒先に蓋をして 5 分間自然放置した。5 分後にシリンジを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察する。5 分後に崩壊しない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊懸濁しない場合は、この方法を中止する。中止した製品は、錠剤 1 個を薬包紙に包み、上から乳棒で数回叩いて破壊後、上述と同様の操作を行う。得られた懸濁液を経管栄養用カテーテル(8Fr.チューブ)の注入端より、約 2~3mL/sec の速度で注入し、通過性を観察する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端(注入端)を 30cm の高さにセットする。注入後に適量の水を注入してチューブ内を洗うとき、チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

[判定]

- (1) 錠剤を約 55°Cの精製水に入れ、5 分または 10 分放置後に攪拌した時の崩壊状況

製品	放置時間	判定
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	5 分	△
	10 分	○

※判定基準

○:完全崩壊またはディスペンサーに吸い取り可能

×:投与困難

△:時間をかければ完全崩壊しそうな状況、またはフィルム残存等によりチューブを閉塞する危険性がある

—:簡易懸濁法対象外

- (2) 簡易懸濁法を適用可否の総合判定

製品	判定
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	適 1

※判定基準

適 1:10 分以内に崩壊・懸濁し、8Fr.チューブを通過する

適 2:錠剤のコーティングを破壊すれば、10 分以内に崩壊・懸濁し、8Fr.チューブを通過

不適:簡易懸濁法では経管投与に適さない

[考察]

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」について簡易懸濁法の適否を検討した結果、錠剤のまま 10 分以内に 8Fr.チューブを通過し、通過性に問題はないと判断された。

[注意]

簡易懸濁法とは、錠剤やカプセルを開封せずにそのまま約 55°Cの温湯に入れて最長 10 分間自然放冷し、崩壊懸濁させて経管投与する方法です(内服薬 経管投与ハンドブック 2001 年 じほ

う)。本試験は、約 55°Cの温湯に入れて放冷した場合の崩壊の観察と、経管投与のシミュレーションから製剤が物理的に簡易懸濁法に適しているかどうかを判断したものであり、本使用法の有効性・安全性・品質の保証、および使用を推奨するものではありません。

(参考)セチリジン塩酸塩錠 10 mg「イワキ」 簡易懸濁法試験

[試験方法]

シリンジのピストン部を抜き取り 2、シリンジ内に錠剤を 1 個入れてピストンを戻し、これに 55°Cとした精製水 20mL を吸い取り、筒先に蓋をして 5 分間自然放置した。5 分後にシリンジを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察する。5 分後に崩壊しない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行う。

得られた懸濁液を経管栄養用カテーテル (8Fr.チューブ) の注入端より約 2~3mL/sec の速度で注入し、通過性を観察する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端 (注入端) を 30cm の高さにセットする。注入後に適量の水を注入してチューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

[判定]

(1) 錠剤を約 55°Cの精製水に入れ、5 分または 10 分放置後に攪拌した時の崩壊状況

製品	放置時間	判定
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	5 分	△
	10 分	○

※判定基準

○:完全崩壊またはディスペンサーに吸い取り可能

×:投与困難

△:時間をかければ完全崩壊しそうな状況、またはフィルム残存等によりチューブを閉塞する危険性がある

—:簡易懸濁法対象外

(2) 簡易懸濁法を適用可否の総合判定

製品	判定
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	適 1

※判定基準

適 1:10 分以内に崩壊・懸濁し、8Fr.チューブを通過する

適 2:錠剤のコーティングを破壊すれば、10 分以内に崩壊・懸濁し、8Fr.チューブを通過

不適:簡易懸濁法では経管投与に適さない

[考察]

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」について簡易懸濁法の適否を検討した結果、錠剤のまま 10 分以内に 8Fr.チューブを通過し、通過性に問題はないと判断された。

XIII. 備考

[注意]

簡易懸濁法とは、錠剤やカプセルを開封せずにそのまま約 55°Cの温湯に入れて最長 10 分間自然放冷し、崩壊懸濁させて経管投与する方法です(内服薬 経管投与ハンドブック 2001 年 じほう)。本試験は、約 55°Cの温湯に入れて放冷した場合の崩壊の観察と、経管投与のシミュレーションから製剤が物理的に簡易懸濁法に適しているかどうかを判断したものであり、本使用法の有効性・安全性・品質の保証、および使用を推奨するものではありません。

以上