

**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 H<sub>1</sub> 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤  
日本薬局方 セチリジン塩酸塩錠  
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」  
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」  
Cetirizine Hydrochloride Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	なし
規格・含量	錠 5mg：1 錠中セチリジン塩酸塩 5mg 錠 10mg：1 錠中セチリジン塩酸塩 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	製造販売承認：2007 年 3 月 14 日 薬価基準収載：2007 年 7 月 6 日 販売開始：2007 年 7 月 6 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>

本 IF は 2023 年 8 月改訂（第 1 版）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（<https://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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>17</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ...	17
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 薬理作用.....	17
3. 製品の製剤学的特性.....	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>18</b>
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	1. 血中濃度の推移.....	18
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	2. 薬物速度論的パラメータ.....	21
6. RMP の概要.....	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	21
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	4. 吸収.....	21
1. 販売名.....	2	5. 分布.....	21
2. 一般名.....	2	6. 代謝.....	21
3. 構造式又は示性式.....	2	7. 排泄.....	22
4. 分子式及び分子量.....	2	8. トランスポーターに関する情報.....	22
5. 化学名（命名法）又は本質.....	2	9. 透析等による除去率.....	22
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	2	10. 特定の背景を有する患者.....	22
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	11. その他.....	23
1. 物理化学的性質.....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>24</b>
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3	1. 警告内容とその理由.....	24
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	3	2. 禁忌内容とその理由.....	24
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>4</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	24
1. 剤形.....	4	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	24
2. 製剤の組成.....	4	5. 重要な基本的注意とその理由.....	24
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	4	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	24
4. 力価.....	5	7. 相互作用.....	26
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	5	8. 副作用.....	27
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	5	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	28
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	9	10. 過量投与.....	29
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	9	11. 適用上の注意.....	29
9. 溶出性.....	9	12. その他の注意.....	29
10. 容器・包装.....	12	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>29</b>
11. 別途提供される資材類.....	12	1. 薬理試験.....	30
12. その他.....	12	2. 毒性試験.....	30
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>13</b>	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>31</b>
1. 効能又は効果.....	13	1. 規制区分.....	31
2. 効能又は効果に関連する注意.....	13	2. 有効期間.....	31
3. 用法及び用量.....	13	3. 包装状態での貯法.....	31
4. 用法及び用量に関連する注意.....	13	4. 取扱い上の注意点.....	31
5. 臨床成績.....	13	5. 患者向け資材.....	31

## 略語表

6.	同一成分・同効薬.....	31
7.	国際誕生年月日 .....	31
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.....	31
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.....	31
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	31
11.	再審査期間 .....	32
12.	投薬期間制限に関する情報.....	32
13.	各種コード .....	32
14.	保険給付上の注意 .....	32
<b>X I.</b>	<b>文献</b> .....	<b>33</b>
1.	引用文献 .....	33
2.	その他の参考文献.....	34
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b> .....	<b>35</b>
1.	主な外国での発売状況.....	35
2.	海外における臨床支援情報 .....	36
<b>X III.</b>	<b>備考</b> .....	<b>37</b>
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.....	37
2.	その他の関連資料.....	39

略語	略語内容
HPLC	高速液体クロマトグラフィー
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
Tmax	最高血中濃度到達時間
t <sub>1/2</sub>	消失半減期
S.D.	標準偏差

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、セチリジン塩酸塩を有効成分とする持続性選択 H<sub>1</sub> 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

「セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工）」及び「セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工）」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2007年3月14日に承認を取得、2007年7月6日に販売を開始した。(薬食発第 0331015号(平成17年3月31日)に基づき承認申請)

2013年9月2日付で、セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工)」に「小児」に関する効能又は効果、用法及び用量が追加承認された。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、セチリジン塩酸塩を有効成分とする持続性選択 H<sub>1</sub> 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。
- (2) 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)

### 3. 製品の製剤学的特性

- (1) PTP シートは、ピッチコントロールを行い、1錠ごとに成分名、含量を表示した。
- (2) PTP シートは、ウラ面に「抗アレルギー薬」を表記した。

### 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

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」

#### (2) 洋名

Cetirizine Hydrochloride Tablets

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 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）

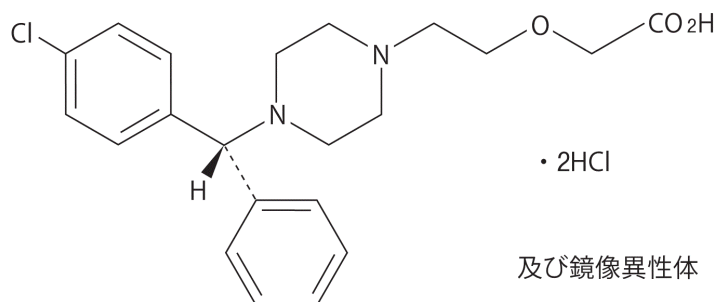
Cetirizine Hydrochloride（JAN）

#### (3) ステム（stem）

ジフェニルメチルピペラジン誘導体：-izine

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>3</sub>・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  
(IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

### 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。(本品は、無臭で、味は僅かに苦い。)

##### (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。

##### (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

水溶液 (1→10) は旋光性を示さない。

#### 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

##### (1) 確認試験法

###### 1) 紫外可視吸光度測定法

本品の塩酸試液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 2) 赤外吸収スペクトル測定法

塩化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 3) 定性反応

本品の水溶液は塩化物の定性反応を呈する。

##### (2) 定量法

###### 電位差滴定法

本品を、アセトン、水混液に溶かし、水酸化ナトリウム液で滴定する。











#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名		セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」
剤形		フィルムコーティング錠	
色調		白色	
外形	表面		
	裏面		
	側面		
直径 (mm)		6.0	7.0
厚さ (mm)		2.8	2.9
質量 (mg)		88	119
本体コード		<i>n</i> 311	<i>n</i> 312
包装コード		 311	 312

###### (3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

###### (4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (5) その他

該当資料なし

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分 (活性成分) の含量及び添加剤

販売名	セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」
有効成分	1錠中 セチリジン塩酸塩 5mg	1錠中 セチリジン塩酸塩 10mg
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ポビドン、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、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ	

###### (2) 電解質等の濃度

該当資料なし

###### (3) 熱量

該当資料なし

##### 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<sup>1)</sup>

(1) 加速試験

◇セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」 加速試験 (40℃、75%RH) [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	IK0601 IK0701	適合	適合	適合	適合
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	IK0601 IK0701	適合	—	—	適合
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) ＜15.0%以下＞	IK0601 IK0701	5.2 6.0	—	—	4.6 6.9
溶出性 (%) ＜15 分、85%以上＞	IK0601 IK0701	99.9～106.4 97.8～104.7	98.0～104.7 102.5～106.9	99.1～103.6 98.6～100.8	99.7～105.3 100.8～104.2
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	IK0601 IK0701	96.9 98.2	97.1 100.5	97.4 98.5	98.1 98.6

※：表示量に対する含有率 (%)

◇セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」 加速試験 (40℃、75%RH) [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	DK2401 DK2501 JK3101	適合	適合	適合	適合
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	DK2401 DK2501 JK3101	適合	—	—	適合
製剤均一性 (%) 含量均一性試験 ＜15.0%以下＞	DK2401 DK2501 JK3101	4.7 3.2 1.9	—	—	3.7 5.9 5.8
溶出性 (%) ＜30 分、80%以上＞	DK2401 DK2501 JK3101	102.8～105.5 101.1～103.9 97.5～105.1	98.0～101.9 98.6～ 99.7 98.6～101.4	95.2～101.4 96.3～101.4 96.9～101.4	99.1～101.9 93.3～ 97.0 97.4～101.9
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	DK2401 DK2501 JK3101	100.6 97.9 97.5	98.3 95.2 99.0	96.4 98.7 96.7	96.6 97.7 96.5

※：表示量に対する含有率 (%)

## (2) 長期保存試験

◇セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」 長期保存試験 (25℃、60%RH) [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	12 ヶ月	24 ヶ月	36 ヶ月
性状 <白色のフィルム コーティング錠>	GO3101				
	HO2301	適合	適合	適合	適合
	HO2401				
確認試験 (呈色試験、紫外可視吸光度 測定法)	GO3101				
	HO2301	適合	適合	適合	適合
	HO2401				
溶出性 (%) <15 分、85%以上>	GO3101	100.2~107.7	93.7~102.8	98.5~101.9	96.8~102.2
	HO2301	95.9~101.3	98.0~100.6	90.7~101.9	94.6~103.3
	HO2401	94.8~99.7	84.6 <sup>※1</sup> ~99.6	98.5~101.3	95.7~102.8
含量 (%) <sup>※2</sup> <95.0~105.0%>	GO3101	100.9	101.6	98.0	100.4
	HO2301	99.1	99.1	96.8	97.2
	HO2401	100.5	98.4	97.6	99.3

※1：整数判定で適合

※2：表示量に対する含有率 (%)

◇セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」 長期保存試験 (25℃、60%RH) [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	12 ヶ月	24 ヶ月	36 ヶ月
性状 <白色のフィルム コーティング錠>	HO0201				
	HO2501	適合	適合	適合	適合
	HO2601				
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	HO0201				
	HO2501	適合	適合	適合	適合
	HO2601				
溶出性 (%) <30 分、80%以上>	HO0201	100.2~104.9	94.5~101.9	98.6~105.2	100.1~103.9
	HO2501	100.2~101.7	95.3~102.8	103.0~110.7	99.5~106.6
	HO2601	98.6~103.9	94.3~99.0	102.4~105.8	99.0~106.0
含量 (%) <sup>*</sup> <95.0~105.0%>	HO0201	99.6	100.7	97.3	98.7
	HO2501	101.2	101.1	99.0	100.4
	HO2601	99.9	96.4	100.2	99.0

※：表示量に対する含有率 (%)

## (3) 無包装の安定性試験

試験期間：2010/11/24～2011/3/18

◇セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 カ月	3 カ月
性状 n=10 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	JT0901	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	わずかに茶色味 がかかる
溶出性 (%) n=6 ＜15 分、85%以上＞	JT0901	95.1～100.1	87.8～103.7	79.0～104.1 <sup>※2</sup>	95.9～105.7
含量 (%) <sup>※1</sup> n=3 ＜95.0～105.0%＞	JT0901	96.8～97.9	97.1～100.8	95.4～98.4	96.2～98.5
(参考値) 硬度 (N) n=10	JT0901	66～80	67～77	64～72	60～71

※1：表示量に対する含有率 (%) ※2：10/12 錠適合のため、規格に適合した。

◇セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」 無包装 (25℃、75%RH) [遮光、開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 カ月	3 カ月
性状 n=10 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	JT0901	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	ごくわずかに茶 色味がかかる
溶出性 (%) n=6 ＜15 分、85%以上＞	JT0901	95.1～100.1	79.8～102.4 <sup>※2</sup>	81.2～100.8 <sup>※2</sup>	86.1～101.3
含量 (%) <sup>※1</sup> n=3 ＜95.0～105.0%＞	JT0901	96.8～97.9	96.2～100.3	98.3～99.6	97.9～100.7
(参考値) 硬度 (N) n=10	JT0901	66～80	50～58	45～53	51～54

※1：表示量に対する含有率 (%) ※2：10/12 錠適合のため、規格に適合した。

◇セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」 無包装 室温、曝光 [D65 光源 (1600Lx)、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	JT0901	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
溶出性 (%) n=6 ＜15 分、85%以上＞	JT0901	95.1～100.1	77.4～101.9 <sup>※2</sup>	82.4～104.7 <sup>※2</sup>	94.1～100.2
含量 (%) <sup>※1</sup> n=3 ＜95.0～105.0%＞	JT0901	96.8～97.9	99.0～100.3	98.8～100.9	97.3～98.6
(参考値) 硬度 (N) n=10	JT0901	66～80	59～73	51～65	53～63

※1：表示量に対する含有率 (%) ※2：10/12 錠適合のため、規格に適合した。

試験期間：2007/5/18～2007/11/5

◇セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 n=3 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	HO260	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	HO260	適合	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜30分、80%以上＞	HO260	98.8～109.0	101.1～112.4	98.9～102.4	99.6～103.6	98.3～103.1
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	HO260	97.9～99.7	99.4～100.4	98.3～99.3	99.5～100.1	97.8～98.9
(参考値) 硬度 (N) n=10	HO260	80～105	87～115	88～107	87～108	92～109

※1：各々の類縁物質；0.5%以下、類縁物質の合計；1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

◇セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」 無包装 (25℃、75%RH) [遮光、開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 n=3 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	HO260	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	HO260	適合	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜30分、80%以上＞	HO260	98.8～109.0	99.8～105.6	98.4～103.6	101.8～105.4	72.8～102.4※3
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	HO260	97.9～99.7	99.5～103.3	101.1～100.5	99.2～101.3	100.1～100.4
(参考値) 硬度 (N) n=10	HO260	80～105	60～65	55～63	58～65	51～59

※1：各々の類縁物質；0.5%以下、類縁物質の合計；1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

※3：11/12錠適合のため、規格に適合した。

◇セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」 無包装 室温、曝光 [D65 光源 (約 1600Lx)、開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=3 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	HO260	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	HO260	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜30 分、80%以上＞	HO260	98.8～109.0	102.6～104.5	99.9～106.7	100.8～102.3
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	HO260	97.9～99.7	99.2～101.0	98.8～100.4	99.1～100.5
(参考値) 硬度 (N) n=10	HO260	80～105	86～102	79～93	83～92

※1：各々の類縁物質；0.5%以下、類縁物質の合計；1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

## 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（物理化学的变化）

該当しない

## 9. 溶出性

### (1) 溶出規格

セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」及びセチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」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。

(試験液に水を用い、パドル法により、50rpm で試験を行う。)

### 溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
5mg	15 分	85%以上
10mg	30 分	80%以上

(2) 溶出試験<sup>2)</sup>

<セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審  
査発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

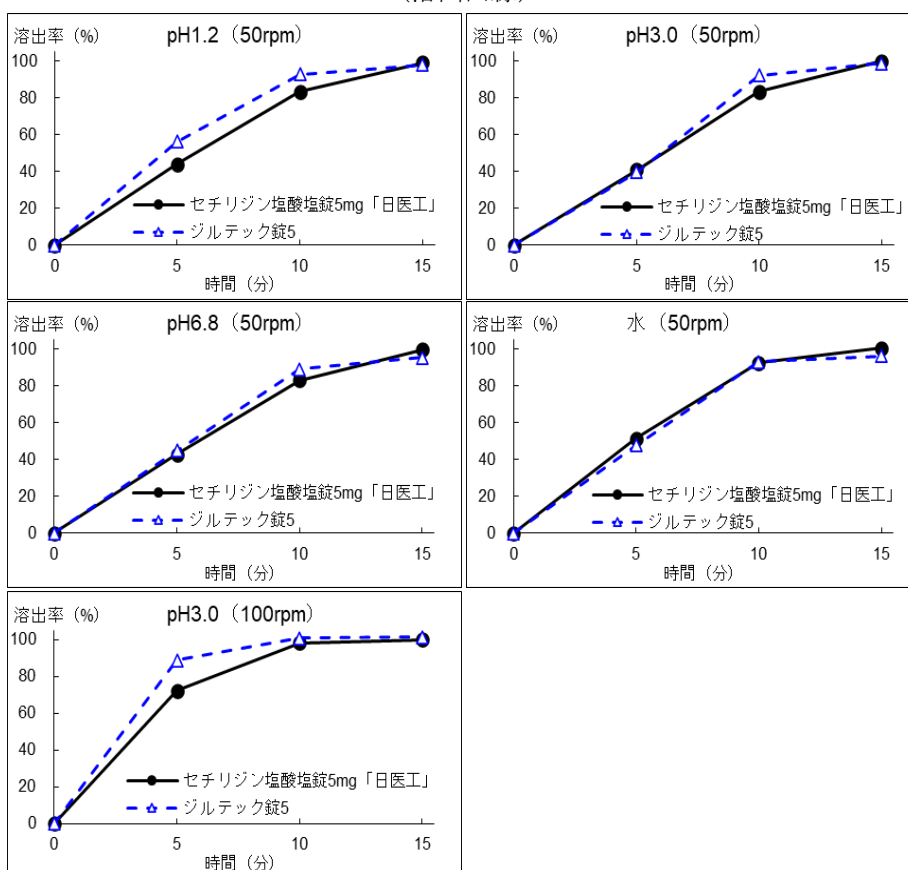
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH3.0、pH6.8、水）、100rpm（pH3.0）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH3.0（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH3.0（100rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（ジルテック錠 5）と比較した結果、全ての試験液において「後発  
医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

<セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審  
査発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

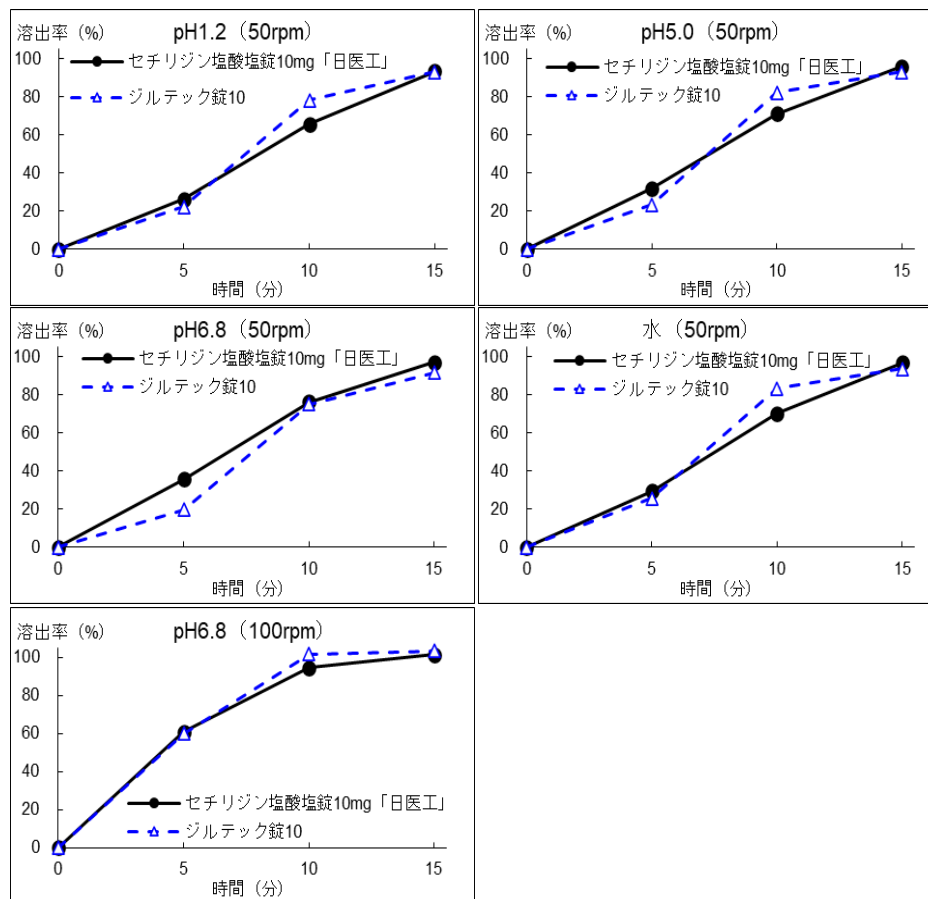
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH5.0、pH6.8、水）、100rpm（pH6.8）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH5.0（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（100rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（ジルテック錠 10）と比較した結果、全ての試験液において「後発  
医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)



## 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

〈セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」〉

100 錠 [10 錠×10 ; PTP]

〈セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」〉

100 錠 [10 錠×10 ; PTP]

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTP : ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー : アルミニウム・ポリエチレン複合フィルム

## 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

## 12. その他

該当記載事項なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 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

##### 〈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、クレアチニ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、9.2.1、9.2.2、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

	クレアチニンクリアランス (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、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、16.6.3 参照]

（解説）

7.1 企業中核データシート（CCDS）に基づいて記載した。

## 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

##### 〈アレルギー性鼻炎〉

#### 17.1.1 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 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。

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<sup>3)</sup>。

#### 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。

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<sup>4)</sup>。

#### 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。

全治療評価期間における総合鼻症状スコア<sup>a)</sup>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 <sup>b)</sup>	
		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 <sup>c)</sup> (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 <sup>c)</sup>	95%信頼区間 <sup>c)</sup>	p 値
		0.60	[0.15~1.05]

a) 総合鼻症状スコアが 10 を超える患児は組入れから除外

b) 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}

c) 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<sup>5)</sup>。

## 〈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 週後及び投与 2 週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。

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<sup>6)</sup>。

### 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 週後及び投与 2 週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。

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）であった<sup>7)</sup>。

### 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 週後及び投与 2 週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、46.7%（14/30 例）、53.2%（33/62 例）及び 72.9%（43/59 例）であった。

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<sup>8)</sup>。

## 〈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。

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<sup>9)</sup>。

## 〈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。

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 <sup>a)</sup>	ベースライン 評価期間	全治療 評価期間	変化量 <sup>b)</sup>	
		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 <sup>c)</sup> (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 <sup>c)</sup>	95%信頼区間 <sup>c)</sup>
	-0.08	[-0.22~0.06]

- a) 変化量が算出可能な被験者数
- b) 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}
- c) 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）であった<sup>10)</sup>。

## 2) 安全性試験

### 〈アレルギー性鼻炎〉

#### 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。

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<sup>11)</sup>。

### 〈蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒〉

#### 17.1.10 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。

副作用発現頻度は1.4%（1/73例）であり、傾眠1例であった<sup>12)</sup>。

## (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

### 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<sup>10)、11)、13)</sup>。

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<sup>5)</sup>。

## 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

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 H<sub>1</sub> 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。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

ヒスタミン H<sub>1</sub> 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<sup>14)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 ヒスタミン H<sub>1</sub> 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<sup>15)</sup>。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<sup>16)</sup>、<sup>17)</sup>。

ヒスタミン H<sub>2</sub>、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）<sup>18)</sup>、中枢神経系におけるヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体への影響が少ない（ラット）<sup>19)</sup>。

##### 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）<sup>20)</sup>、<sup>21)</sup>。

##### 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 D<sub>2</sub> 遊離を抑制した<sup>22)</sup>。

#### (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

##### 16.1.1 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 (C<sub>max</sub>) 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 C<sub>max</sub> 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<sup>2,3)</sup>。

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	T <sub>max</sub> (hr)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>1/2</sub> (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<sub>ss min</sub>) 及び最高血清中濃度 (C<sub>ss max</sub>) は、それぞれ 58±25ng/mL 及び 214±50ng/mL (平均±標準偏差<sup>注)</sup>、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<sub>ss min</sub> 及び C<sub>ss max</sub> は、それぞれ 100±40ng/mL 及び 308±74ng/mL と推定された<sup>2,4)</sup>。

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

### 16.1.3 生物学的同等性試験<sup>2,5)</sup>

<セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」>

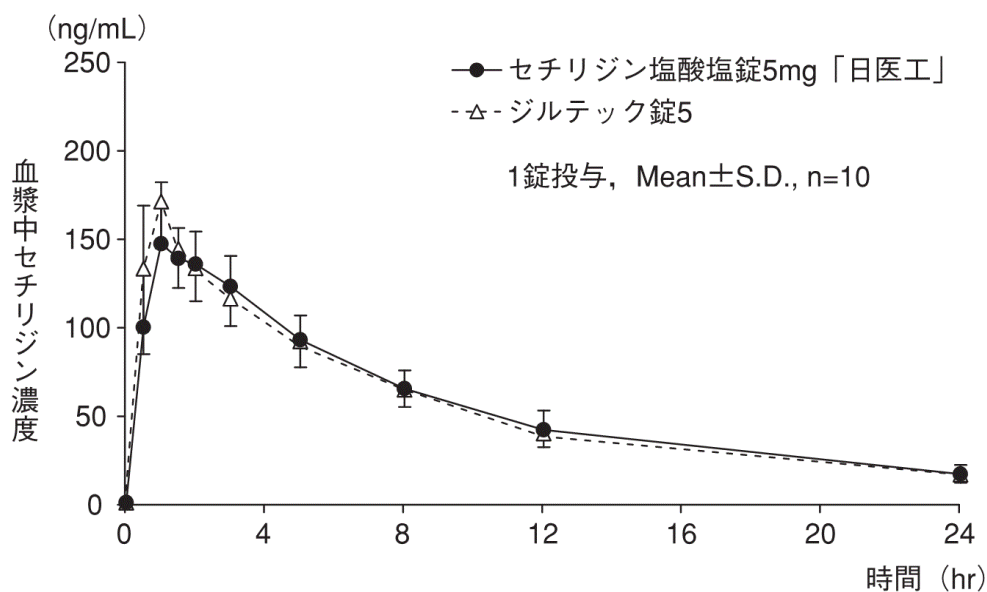
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」及びジルテック錠 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）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中セチリジン濃度を測定し、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。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→24</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」	1357±192	164.2±38.2	1.30±0.48	8.05±1.29
ジルテック錠 5	1353±201	178.2±24.8	0.90±0.21	7.86±1.15

(1 錠投与、Mean±S.D., n=10)



血漿中薬物濃度推移

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「日医工」>

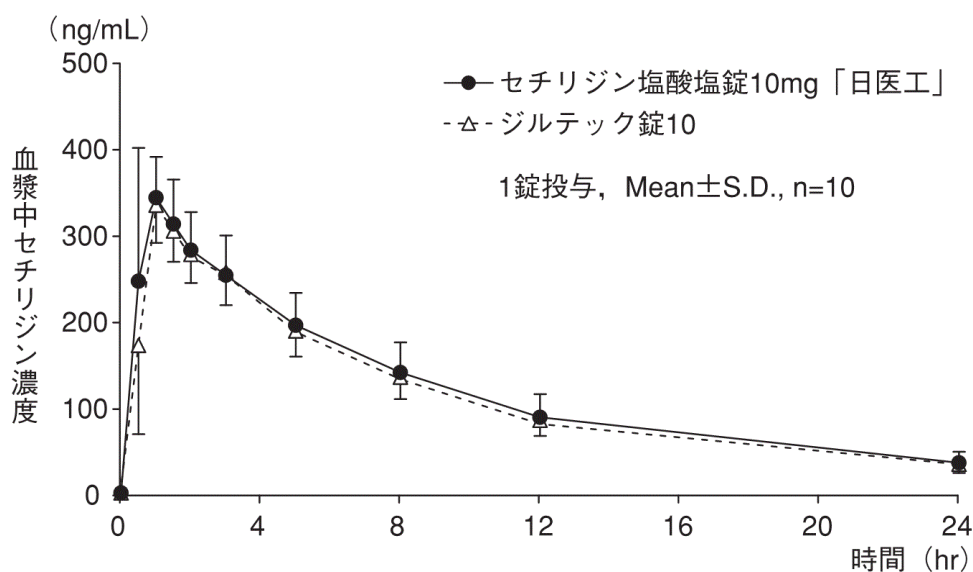
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）

セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」及びジルテック錠 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）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中セチリジン濃度を測定し、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。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→24</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」	2916±576	381.2±57.0	0.90±0.32	7.85±1.17
ジルテック錠 10	2803±436	341.2±35.8	1.25±0.68	8.04±0.84

(1 錠投与、Mean±S.D., n=10)



血漿中薬物濃度推移

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

(「Ⅷ. 7. 相互作用」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

### (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

## 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

（「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照）

### (3) 乳汁への移行性

（「VIII. 6. (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

#### 16.3.1 血漿蛋白結合率

<sup>14</sup>C 標識-セチリジン 0.1、1 及び 10  $\mu$ 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)<sup>2,6)</sup>。

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

### (2) 代謝に関する酵素（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

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、血漿中に酸化的脱アルキル体がわずかに認められた<sup>23)</sup>。

#### 7. 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<sup>23)</sup>。

#### 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

(「Ⅷ. 10. 過量投与」の項参照)

#### 10. 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<sup>27)</sup>(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 <sub>1/2</sub> (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
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<sup>28)</sup>(外国人データ)。<sup>[2.2、7.1、9.2.1、9.2.2 参照]</sup>

##### 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<sup>27)</sup>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<sup>29)</sup>(外国人データ)。<sup>[7.2、9.3 参照]</sup>

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 <sub>1/2</sub> (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<sup>27)</sup>（外国人データ）。[7.3、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 <sub>1/2</sub> (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、9.2.1、16.6.1 参照]

（解説）

類薬及び企業中核データシート（CCDS）の記載を踏まえ、追記及び記載を整備した。

2.2 腎機能障害患者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て腎機能障害患者では、セチリジン塩酸塩の  $AUC_{0-\infty}$  は約 1.5～1.7 倍増加し、 $T_{1/2}$  は約 1.1～3.1 倍に延長した結果が認められている（外国人データ）。そのため、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）に対して、本剤の投与は禁忌と設定した。

### 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、好発季節を考慮して、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。

（解説）

8.3 花粉症の初期治療における注意事項である日本アレルギー学会監修の「アレルギー疾患治療ガイドライン」（1995年改訂版）に基づいて記載した。ガイドラインには、「花粉飛散 1～2 週間前より遊離抑制薬または新抗ヒスタミン薬で治療を開始し、季節終了まで続ける」との記載がある。

### 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]

（解説）

2008年4月、企業中核データシート（CCDS）に「てんかん患者及び痙攣の危険性がある患者の使用に際しては、慎重投与が望ましい」と追記されたことに基づいて記載した。痙攣については、外国

で本剤との関連性が疑われた症例が報告されている。一般に、ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗作用のある薬剤は、中枢神経刺激作用を示すことがあり、痙攣や発作が出現することがあること、これらは特に小児、てんかん患者等でみられると報告されている<sup>30)</sup>、<sup>31)</sup>。

本剤投与中に異常がみられた場合は、本剤の投与を中止し適切な処置を行う必要がある。

(「Ⅷ. 8. 副作用 (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照。)

## (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、7.1、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)

高い血中濃度が持続するおそれがある。[7.1、16.6.1 参照]

(解説)

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 (10mgカプセル1カプセル) 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 (T<sub>1/2</sub>) の延長が認められている (外国人データ)<sup>32)</sup>。

腎機能障害のある患者では、クレアチニンクリアランスに応じて投与量の調節が必要である。

なお、重度の腎機能障害 (クレアチニンクリアランス10mL/min未満) のある患者への投与は禁忌である。高い血中濃度が持続するおそれがある。

(「Ⅶ. 10. 特定の背景を有する患者」の項参照)

## (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、16.6.2 参照]

(解説)

原発性胆汁性肝硬変患者にセチリジン塩酸塩10mg (10mg錠1錠) を単回経口投与した場合、肝機能正常成人に比べ、血清中濃度消失半減期 (T<sub>1/2</sub>) の延長、最高血清中濃度 (C<sub>max</sub>) の上昇、血清中濃度時間曲線下面積 (AUC) の増大が認められている (外国人データ)<sup>33)</sup>。

また、アルコール性肝硬変あるいは壊死後肝硬変 (postnecrotic liver cirrhosis) 患者及び慢性胆汁うっ滞性肝疾患 (原発性胆汁性肝硬変、膵癌性総胆管圧迫) 患者にセチリジン塩酸塩20mgを単回経口投与した場合、T<sub>1/2</sub>の延長とAUCの増大が認められている<sup>34)</sup>。

これらの成績から、高度の肝機能障害のある患者では、低用量 (例えば通常量の半量) から投与を開始するなど慎重な投与が必要である。

(「Ⅶ. 10. 特定の背景を有する患者」の項参照。)

## (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。

(解説)

ラット及びウサギにおける妊娠前・妊娠初期投与試験、器官形成期投与試験及び周産期・授乳期投与試験では、母動物、胎児及び出生児ともに特記すべき異常は認められていない<sup>35)</sup>。

臨床的には、胎児の器官形成期にセチリジン塩酸塩を服用した妊婦39例を対象としたプロスペクティブ・コホート・スタディー (prospective cohort study) において、本剤投与は催奇形性のリスクを増大させないとの外国における報告があり<sup>36)</sup>、また、現在までにヒトでの催奇形性を肯定する症例報告もない。

しかし、国内における承認時までの臨床試験では、妊婦又は妊娠している可能性のある女性は投与対象から除外されており、外国においても妊婦におけるデータは十分ではない。

従って、本剤の妊婦又は妊娠している可能性のある患者への適用は、有効性と安全性を考慮のうえ使用される必要がある。

## (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。

(解説)

分娩後9～11日のラットに10mg/kgを単回経口投与した場合、血漿中濃度とほぼ同様の乳汁中移行が認められた<sup>37)</sup>。イヌ (静脈内投与) でも同様であった。

ヒスタミンH1受容体拮抗作用のある薬剤は、一般に中枢神経系に対し興奮と抑制の両作用を示し、通常用量では抑制的に作用し眠気等がみられるが、過量投与により痙攣等の興奮作用があらわれることがある。特に、乳・幼児では中毒によって痙攣を起こすことが報告されている<sup>30)</sup>、<sup>31)</sup>ので、授乳中の患者には、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必要がある。

## (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、16.6.3 参照]

(解説)

(「VII. 10. 特定の背景を有する患者」の項参照)

## 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）		
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、 $\gamma$ -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）

(解説)

ショック、アナフィラキシーの初期症状としては「呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等」が、肝機能障害、黄疸の初期症状としては「全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等」が考えられる。



(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	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
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	ALP 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

アレルギー性皮膚炎を抑制するため、アレルギー性皮膚炎検査を実施する 3～5 日前より本剤の投与を中止することが望ましい。

(解説)

一般に抗ヒスタミン作用や免疫抑制作用のある薬剤はアレルギー反応を修飾するため、皮内テスト等を実施する場合は、これらの薬剤が投与されていない時期を選ぶか、あるいはアレルギーの皮内反応に影響しないよう投与を一時中止することが望ましい。

季節性アレルギー性鼻炎患者13例にセチリジン塩酸塩1日10mgを14日間投与し、投与終了後3、7及び14日目にヒスタミン皮内反応試験を行ったところ、投与終了後3日目にはヒスタミン誘発膨疹は

投与前値の約90%に回復し、皮内反応の抑制はみられなかった（外国人データ<sup>38)</sup>。

従って、アレルギー皮内反応検査を実施するときに必要な本剤の休薬期間については、季節性アレルギー性鼻炎患者における臨床試験成績より、3～5日間が必要である。

## 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。

## 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

(「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

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**

製 剤	セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」 セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」	なし
有効成分	セチリジン塩酸塩	劇薬 <sup>注)</sup>

注) 1錠中セチリジンとして 8.43mg 以下を含有するもの及び 1 容器中 1.06g 以下を含有するものは除かれる。

**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. 取扱い上の注意点**

設定されていない

**5. 患者向け資材**

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

**6. 同一成分・同効薬**

同一成分：ジルテック錠 5、ジルテック錠 10

**7. 国際誕生年月日**

不明

**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「日医工」	2007 年 3 月 14 日	21900AMX00297000	2007 年 7 月 6 日	2007 年 7 月 6 日
セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」	2007 年 3 月 14 日	21900AMX00298000	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**

< 効能又は効果追加、用法及び用量追加 >

販売名：セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」

追加年月日：2013 年 9 月 2 日

内容：

	新	旧
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	アレルギー性鼻炎 蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症

用法及び用量	[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。	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。	

(\_\_ : 追加・変更箇所)

**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、投薬期間に関する制限は定められていない。(「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由」の項参照)

**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
セチリジン塩酸塩錠 5mg「日医工」	4490020F1292	4490020F1292	117884501	620005467
セチリジン塩酸塩錠 10mg「日医工」	4490020F2299	4490020F2299	117885201	620005495

**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。

## X I. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出性試験
- 3) 奥田稔 他：耳鼻咽喉科展望. 1994 ; 37 (6) : 754-779
- 4) 奥田稔 他：耳鼻咽喉科展望. 1995 ; 38 (1) : 116-136
- 5) 斎藤博久：臨床医薬. 2010 ; 26 (2) : 141-154
- 6) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床. 1994 ; 28 (7) : 2107-2129
- 7) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床. 1994 ; 28 (7) : 2131-2145
- 8) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床. 1994 ; 28 (7) : 2163-2173
- 9) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床. 1994 ; 28 (7) : 2147-2162
- 10) 中川秀己 他：臨床医薬. 2010 ; 26 (2) : 155-167
- 11) 斎藤博久 他：臨床医薬. 2010 ; 26 (2) : 127-139
- 12) 中川秀己 他：臨床医薬. 2010 ; 26 (2) : 169-181
- 13) 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）
- 14) 非臨床試験の概要文及び概要表・緒言（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 2.6.1）
- 15) Advenier C., et al. : J. Allergy Clin. Immunol. 1991 ; 88 (1) : 104-113 (PMID: 1677016)
- 16) Simons F. E. R., et al. : J. Allergy Clin. Immunol. 1990 ; 86 (4 Pt 1) : 540-547 (PMID: 1977781)
- 17) Braunstein G., et al. : Br. J. Clin. Pharmacol. 1992 ; 33 (4) : 445-448 (PMID: 1349494)
- 18) 内田昌子 他：基礎と臨床. 1994 ; 28 (7) : 1795-1812
- 19) Snyder S. H., et al. : Ann. Allergy. 1987 ; 59 (6 Pt 2) : 4-8 (PMID: 2892448)
- 20) Okada C., et al. : Int. Arch. Allergy Immunol. 1994 ; 103 (4) : 384-390 (PMID: 8130652)
- 21) Fadel R., et al. : Clin. Allergy. 1987 ; 17 (4) : 373-379 (PMID: 2887304)
- 22) Fabre J. M., et al. : Allergy. 1995 ; 50 (4) : 362-365 (PMID: 7573821)
- 23) 笹征史 他：臨床薬理. 1995 ; 26 (2) : 509-522
- 24) 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）
- 25) 社内資料：生物学的同等性試験
- 26) 水野佳子 他：基礎と臨床. 1994 ; 28 (7) : 1951-1961
- 27) Matzke G. R., et al. : Ann. Allergy. 1987 ; 59 (6 Pt 2) : 25-30 (PMID: 2892446)
- 28) Awni W. M., et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol. 1990 ; 38 (1) : 67-69 (PMID: 1970299)
- 29) Simons F. E. R., et al. : J. Clin. Pharmacol. 1993 ; 33 (10) : 949-954 (PMID: 7693767)
- 30) 澤田康文 他：薬局1994 ; 45 : 2209-2216
- 31) 澤田康文 他：薬局1994 ; 45 : 2413-2415
- 32) Matzke G R, et al. : Ann Allergy. 1987 ; 59 : 25-30 (PMID : 2892446)
- 33) Simons F E R, et al. : J Clin Pharmacol. 1993 ; 33 : 949-954 (PMID : 7693767)
- 34) Horsmans Y, et al. : J. Clin Pharmacol. 1993 ; 33 : 929-932 (PMID : 8227463)
- 35) 上島みゆき 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 1887-1903
- 36) Einarson A, et al. : Ann Allergy Asthma Immunol. 1997 ; 78 : 183-186 (PMID : 9048526)
- 37) 水野佳子 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 1925-1944
- 38) Berkowitz R B, et al. : Ann Allergy Asthma Immunol. 1996 ; 76 : 363-368 (PMID : 8612120)

## 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

セチリジン塩酸塩の米国における発売状況は下記のとおりである。

なお、スイッチ OTC 薬として承認され、現在は OTC 薬として販売されている。

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

効能又は効果	用法及び用量
〔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	〈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。
〔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	〈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。

<DailyMed (USA)、2023年9月検索>

国名	米国
会社名	Johnson & Johnson Consumer Inc.
販売名	ZYRTEC ALLERGY- cetirizine hydrochloride tablet, film coated
剤形・規格	10 mg
<b>USES</b>	
temporarily relieves these symptoms due to hay fever or other upper respiratory allergies:	
<ul style="list-style-type: none"> <li>• runny nose</li> <li>• sneezing</li> <li>• itchy, watery eyes</li> <li>• itching of the nose or throat</li> </ul>	
<b>DIRECTIONS</b>	
adults and children 6 years and over	one 10 mg tablet once daily; do not take more than one 10 mg tablet in 24 hours. A 5 mg product may be appropriate for less severe symptoms.
adults 65 years and over	ask a doctor
children under 6 years of age	ask a doctor
consumers with liver or kidney disease	ask a doctor



## 2. 海外における臨床支援情報

### 妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

（「Ⅷ. 6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

	Drug Name	Category
オーストラリアの分類	cetirizine	B2

(2021年4月検索)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category B2：

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 are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

### 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

##### 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) 粉砕

##### 粉砕物の安定性試験

##### セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時白色の粉末であり、2 週後一部に塊を認めた。純度及び含量は規格内であった。

試験実施期間：2007/5/23～2007/9/28

● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光・開放]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=3	HO260	白色の粉末	白色の粉末 (一部塊)	白色の粉末 (一部塊)	白色の粉末 (一部塊)	白色の粉末 (一部塊)
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	HO260	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	HO260	99.4～100.1	99.7～100.5	99.0～99.6	100.7～101.3	99.8～100.9
(参考値) 重量変化 (%) n=1	HO260	—	2.21	2.98	3.14	3.15

※1：類縁物質①各々の類縁物質; 0.5%以下、②総類縁物質;1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2007/7/3

ロット番号：HO230

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「日医工」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

## セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」

### 1) 試験方法

#### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

#### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2007/7/3

ロット番号：HO250

### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「日医工」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし