

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

日本薬局方 セチリジン塩酸塩錠

セチリジン塩酸塩錠5mg「CH」

セチリジン塩酸塩錠10mg「CH」

Cetirizine Hydrochloride Tablets

剤形	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	錠 5mg：1錠中 日局 セチリジン塩酸塩 5mg を含有 錠 10mg：1錠中 日局 セチリジン塩酸塩 10mg を含有
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	製造販売承認年月日：2007年3月14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	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室 TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/

本IFは2024年3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。

(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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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I F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I F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、「I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I Fの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたI Fは、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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI F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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I F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

I F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。I F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I F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、I F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	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	8
1. 開発の経緯	1	9. 溶出性	8
2. 製品の治療学的特性	1	10. 容器・包装	13
3. 製品の製剤学的特性	1	(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	13
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	13
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	13
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	13
(2)流通・使用上の制限事項	1	11. 別途提供される資材類	13
6. RMPの概要	1	12. その他	13
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	14
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	14
(1)和名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	14
(2)洋名	2	3. 用法及び用量	14
(3)名称の由来	2	(1)用法及び用量の解説	14
2. 一般名	2	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	14
(1)和名（命名法）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	14
(2)洋名（命名法）	2	5. 臨床成績	15
(3)ステム（stem）	2	(1)臨床データパッケージ	15
3. 構造式又は示性式	2	(2)臨床薬理試験	15
4. 分子式及び分子量	2	(3)用量反応探索試験	15
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(4)検証的試験	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	1)有効性検証試験	15
III. 有効成分に関する項目	4	2)安全性試験	18
1. 物理化学的性質	4	(5)患者・病態別試験	18
(1)外観・性状	4	(6)治療的使用	18
(2)溶解性	4	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	18
(3)吸湿性	4	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	18
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	4	(7)その他	18
(5)酸塩基解離定数	4	VI. 薬効薬理に関する項目	19
(6)分配係数	4	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	19
(7)その他の主な示性値	4	2. 薬理作用	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(1)作用部位・作用機序	19
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	(2)薬効を裏付ける試験成績	19
IV. 製剤に関する項目	5	(3)作用発現時間・持続時間	19
1. 剤形	5	VII. 薬物動態に関する項目	20
(1)剤形の区別	5	1. 血中濃度の推移	20
(2)製剤の外観及び性状	5	(1)治療上有効な血中濃度	20
(3)識別コード	5	(2)臨床試験で確認された血中濃度	20
(4)製剤の物性	5	(3)中毒域	22
(5)その他	5	(4)食事・併用薬の影響	22
2. 製剤の組成	5	2. 薬物速度論的パラメータ	22
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	5	(1)解析方法	22
(2)電解質等の濃度	5	(2)吸収速度定数	22
(3)熱量	5	(3)消失速度定数	22
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	8		

(4)クリアランス	22	(1)臨床使用に基づく情報	30
(5)分布容積	22	(2)非臨床試験に基づく情報	30
(6)その他	22		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	22	IX. 非臨床試験に関する項目	31
(1)解析方法	22	1. 薬理試験	31
(2)パラメータ変動要因	22	(1)薬効薬理試験	31
4. 吸収	22	(2)安全性薬理試験	31
5. 分布	23	(3)その他の薬理試験	31
(1)血液－脳関門通過性	23	2. 毒性試験	31
(2)血液－胎盤関門通過性	23	(1)単回投与毒性試験	31
(3)乳汁への移行性	23	(2)反復投与毒性試験	31
(4)髄液への移行性	23	(3)遺伝毒性試験	31
(5)その他の組織への移行性	23	(4)がん原性試験	31
(6)血漿蛋白結合率	23	(5)生殖発生毒性試験	31
6. 代謝	23	(6)局所刺激性試験	31
(1)代謝部位及び代謝経路	23	(7)その他の特殊毒性	31
(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	23	X. 管理的事項に関する項目	32
(3)初回通過効果の有無及びその割合	23	1. 規制区分	32
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	23	2. 有効期間	32
7. 排泄	23	3. 包装状態での貯法	32
8. トランスポーターに関する情報	23	4. 取扱い上の注意	32
9. 透析等による除去率	24	5. 患者向け資材	32
10. 特定の背景を有する患者	24	6. 同一成分・同効薬	32
11. その他	25	7. 国際誕生年月日	32
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	26	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	32
1. 警告内容とその理由	26	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	32
2. 禁忌内容とその理由	26	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	32
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	26	11. 再審査期間	33
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	26	12. 投薬期間制限に関する情報	33
5. 重要な基本的注意とその理由	26	13. 各種コード	33
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	26	14. 保険給付上の注意	33
(1)合併症・既往歴等のある患者	26	X I. 文献	34
(2)腎機能障害患者	26	1. 引用文献	34
(3)肝機能障害患者	27	2. その他の参考文献	35
(4)生殖能を有する者	27	X II. 参考資料	36
(5)妊婦	27	1. 主な外国での発売状況	36
(6)授乳婦	27	2. 海外における臨床支援情報	36
(7)小児等	27	X III. 備考	37
(8)高齢者	27	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
7. 相互作用	27	(1)粉碎	37
(1)併用禁忌とその理由	27	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	39
(2)併用注意とその理由	27	2. その他の関連資料	39
8. 副作用	28		
(1)重大な副作用と初期症状	28		
(2)その他の副作用	28		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	29		
10. 過量投与	29		
11. 適用上の注意	30		
12. その他の注意	30		

略語表

略語	略語内容
Al-P	アルカリホスファターゼ (Alkaline phosphatase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
AUC	血漿中濃度-時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC ₀₋₂₄	投与 24 時間までの AUC (AUC from zero to 24 hours)
BUN	血中尿素窒素 (Blood urea nitrogen)
Cmax	最高血漿中濃度 (Maximum plasma concentration)
CYP	チトクローム P450 (Cytochrome P450)
γ-GTP	γ-グルタミルトランスぺプチターゼ (γ-Glutamyl transpeptidase)
kel	消失速度定数 (Elimination rate constant)
LDH	乳酸脱水素酵素 (Lactate dehydrogenase)
RH	相対湿度 (Relative humidity)
S.D.	標準偏差 (Standard deviation)
T _{1/2}	消失半減期 (Elimination half-life)
Tmax	最高血漿中濃度到達時間 (Time to maximum plasma concentration)

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 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

長生堂製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2007 年 3 月に承認を得て、2007 年 7 月発売に至った。

その後、セチリジン塩酸塩錠 5mg「CH」については 2013 年 9 月に一部変更承認され、7 歳以上 15 歳未満の小児への効能・効果及び用法・用量が追加された。

2. 製品の治療学的特性

(1) 本剤は、持続性選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤で、成人においては、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、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）に伴うそう痒症に対し効果が認められている。（〔V.1.効能又は効果〕の項参照）

(2) 成人は 1 日 1 回、小児は 1 日 2 回投与で効果が得られる。（〔V.3.用法及び用量〕の項参照）

(3) 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、血小板減少があらわれることがある。（〔VIII.8.（1）重大な副作用と初期症状〕の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

特になし

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	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 「CH」

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」

(2) 洋名

Cetirizine Hydrochloride Tablets 5mg “CH”

Cetirizine Hydrochloride Tablets 10mg “CH”

(3) 名称の由来

一般的名称+剤形+含量+「CH」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(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)

セチリジン塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

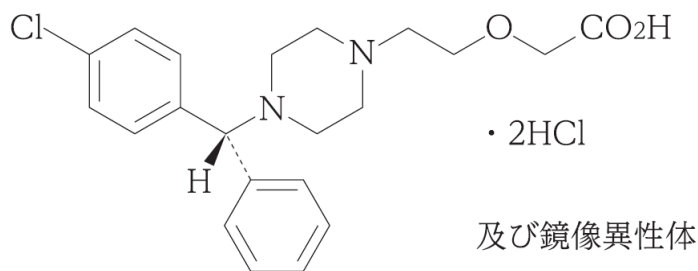
Cetirizine Hydrochloride (JAN)

Cetirizine (INN)

(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



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 (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

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。

溶解度（37℃）¹⁾：pH1.2：1g/mL 以上、pH4.0：1g/mL 以上、
pH6.8：1g/mL 以上、水：1g/mL 以上

(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¹⁾

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

旋光性：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

有効成分の確認試験法

日局「セチリジン塩酸塩」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）

(3) 塩化物の定性反応

有効成分の定量法

日局「セチリジン塩酸塩」の定量法による。

0.1mol/L 水酸化ナトリウム液による滴定（電位差滴定法）


IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

〔1. (2) 製剤の外観及び性状〕の項参照

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」
色調・剤形		白色のフィルムコーティング錠	
外形			
大きさ	直径	6.1mm	7.1mm
	厚さ	2.9mm	3.0mm
重量		88mg	120mg

(3) 識別コード

錠 5mg

錠剤本体、PTP シート：ch121

錠 10mg

錠剤本体、PTP シート：ch120

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(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

有効成分（活性成分）の含量

錠 5mg：1 錠中 日局 セチリジン塩酸塩 5mg 含有

錠 10mg：1 錠中 日局 セチリジン塩酸塩 10mg 含有

添加剤

錠 5mg	錠 10mg
乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、タルク、ヒプロメロース、酸化チタン、ヒドロキシプロピルセルロース	

(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

錠 5mg²⁾

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP 包装 + アルミピロー	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	—	—	適合
	定量試験	100.1%	100.0%	100.6%	99.6%
	純度試験	開始時から 6 ヶ月後までほとんど変化を認めず			
	溶出試験	100.4%	100.8%	99.1%	98.5%

錠 10mg³⁾

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP 包装 + アルミピロー	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	—	—	適合
	定量試験	100.5%	100.3%	99.7%	100.1%
	純度試験	開始時から 6 ヶ月後までほとんど変化を認めず			
	溶出試験	98.1%	97.7%	97.5%	99.3%

(2) 長期安定性試験

錠 5mg⁴⁾

長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3年
最終包装製品 (PTP包装)	性状	適合	適合
	確認試験	—	適合
	含量均一性試験	—	適合
	溶出試験	99.4%	96.0%
	定量試験	—	98.6%

錠 10mg⁵⁾

長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3年
最終包装製品 (PTP包装)	性状	適合	適合
	確認試験	—	適合
	含量均一性試験	—	適合
	溶出試験	99.8%	97.4%
	定量試験	—	98.1%

(3) 無包装状態での安定性試験

錠 5mg⁶⁾

保存条件	保存期間	結果
温度（40℃、遮光・気密容器）	3ヵ月	変化なし（◎）
湿度（30℃、5%RH、遮光・開放）	3ヵ月	変化なし（◎）
光（120万lux・hr、気密容器）	50日	変化なし（◎）

錠 10mg⁷⁾

保存条件	保存期間	結果
温度（40℃、遮光・気密容器）	3ヵ月	変化なし（◎）
湿度（30℃、75%RH、遮光・開放）	3ヵ月	変化あり※1（規格内）（○）
光（120万lux・hr、気密容器）	50日	変化なし（◎）

※1 硬度

試験項目：外観、含量、硬度、崩壊性、溶出性

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（平成 11 年 8 月 20 日（社）日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会）の評価分類基準（下記）に準じる。

◎：すべての測定項目において変化を認めなかった。

（外観：変化をほとんど認めない。含量：3%未満の低下。硬度：30%未満の変化。
崩壊性・溶出性：規格値内。）

○：いずれかの測定項目で「規格内」の変化を認めた。

（外観：わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：3%以上の低下で、規格値内。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 以上。）

△：いずれかの測定項目で「規格外」の変化を認めた。

（外観：形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している。含量：規格値外。
硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 未満。崩壊性・溶出性：規格値外。）

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）

該当資料なし

9. 溶出性

(1) 溶出規格

錠 5mg

日本薬局方医薬品各条 セチリジン塩酸塩錠溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条件：回転数 50rpm

試験液 水

結果：15 分間 85%以上

錠 10mg

日本薬局方医薬品各条 セチリジン塩酸塩錠溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条件：回転数 50rpm

試験液 水

結果：30 分間 80%以上

(2) 生物学的同等性試験における溶出試験結果

錠 5mg⁸⁾

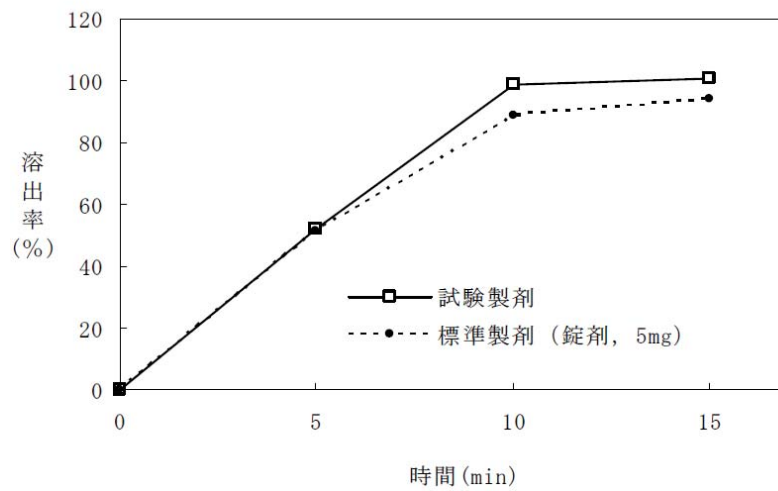
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）」に従い、ジルテック錠 5 との溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH4.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH1.2/100rpm

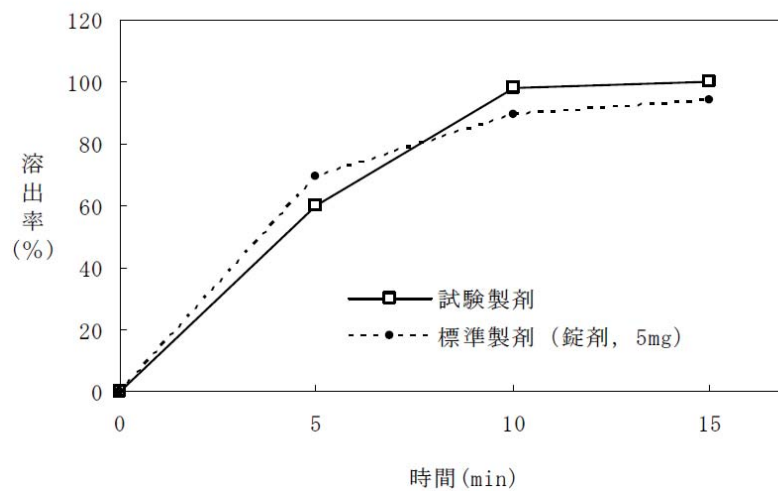
[判定基準]

①～⑤：試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。又は、15分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

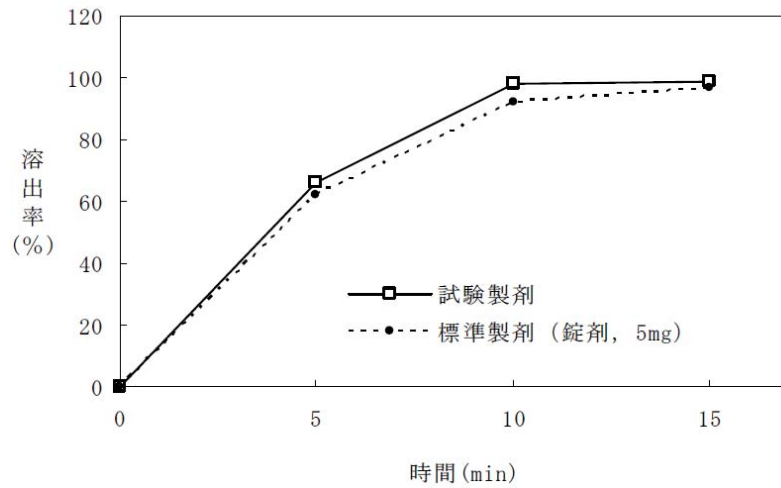
①pH1.2、50rpm



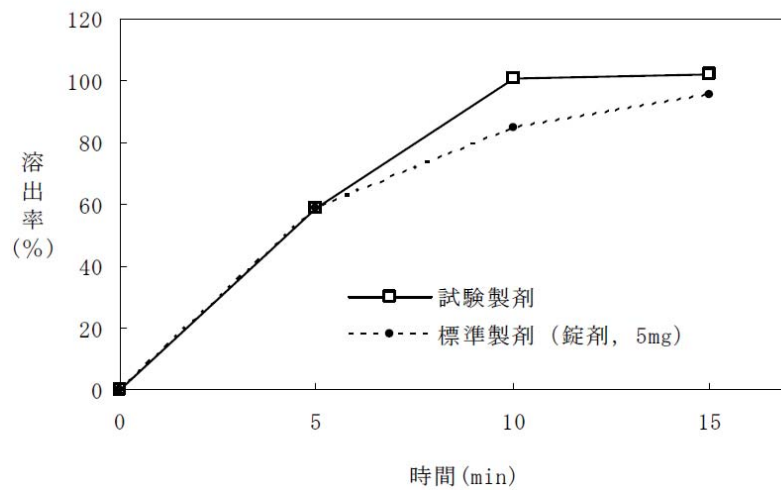
②pH4.0、50rpm



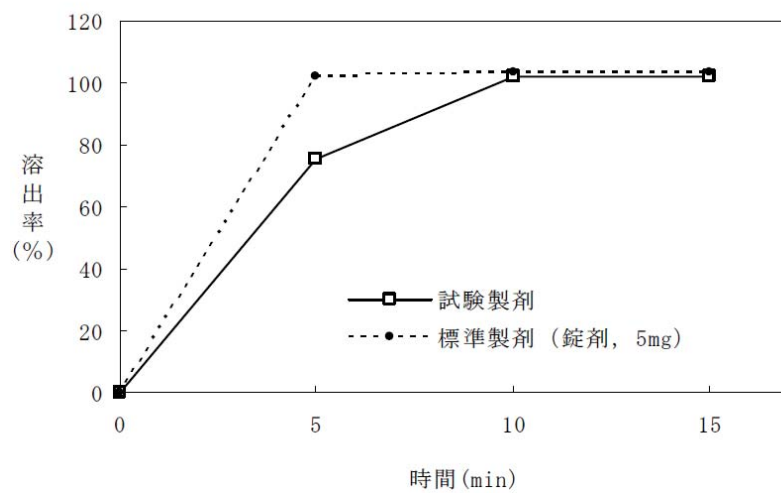
③pH6.8、50rpm



④水、50rpm



⑤pH1.2、100rpm



錠 10mg⁹⁾

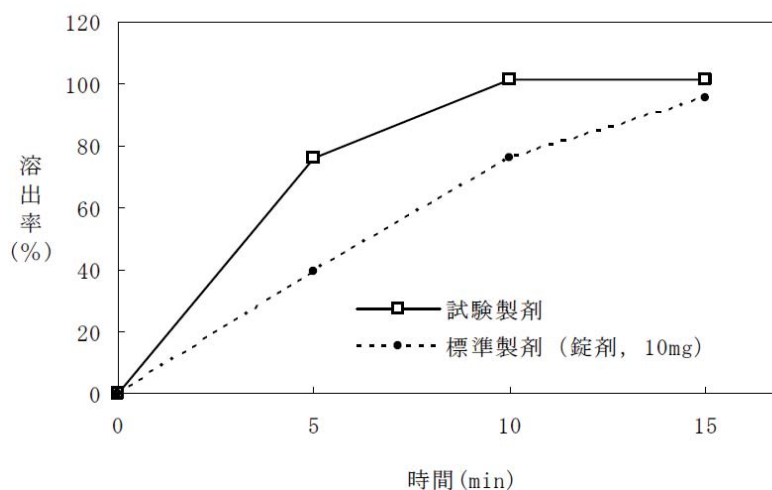
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）」に従い、ジルテック錠 10 との溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH3.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH3.0/100rpm

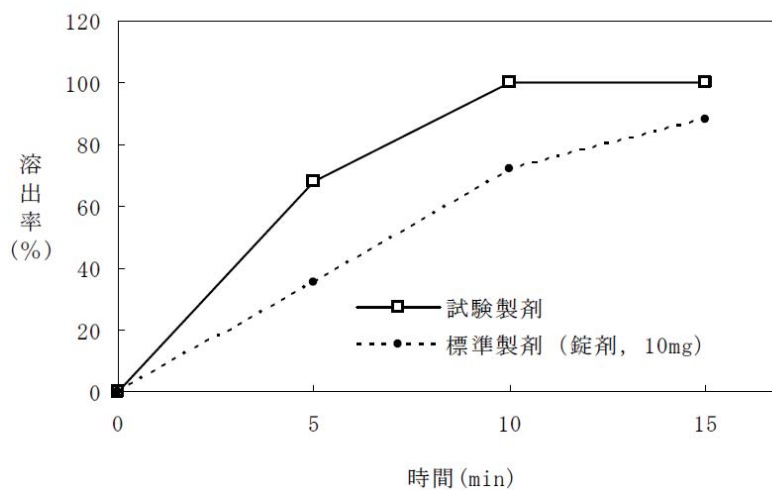
[判定基準]

①～⑤：試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は、15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

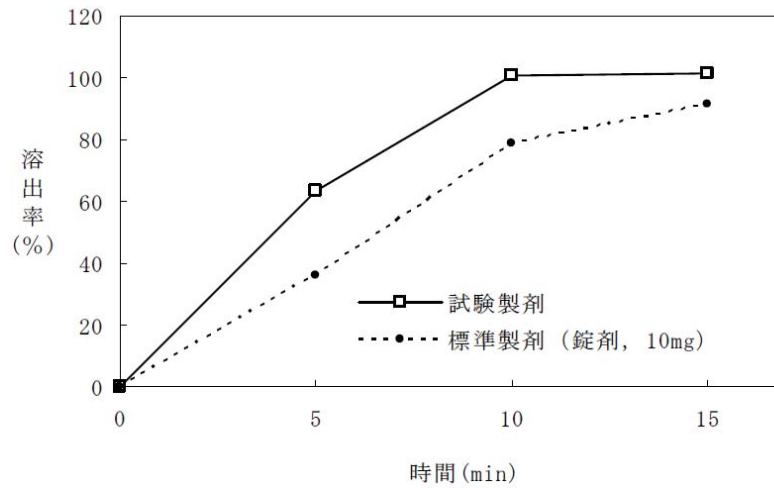
①pH1.2、50rpm



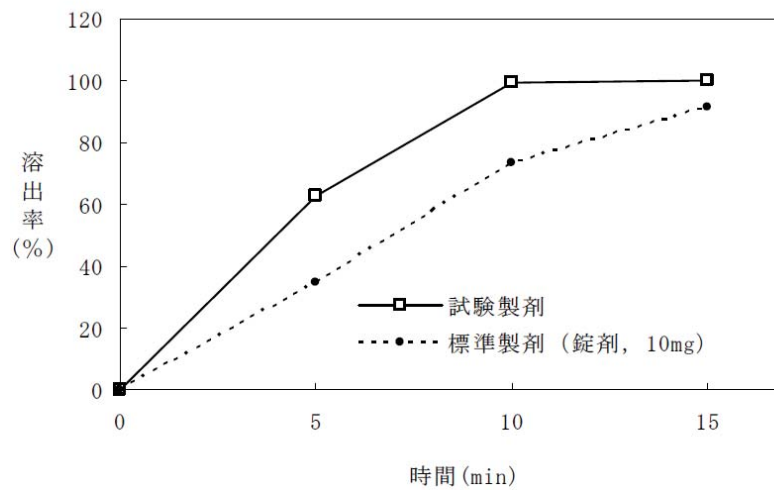
②pH3.0、50rpm



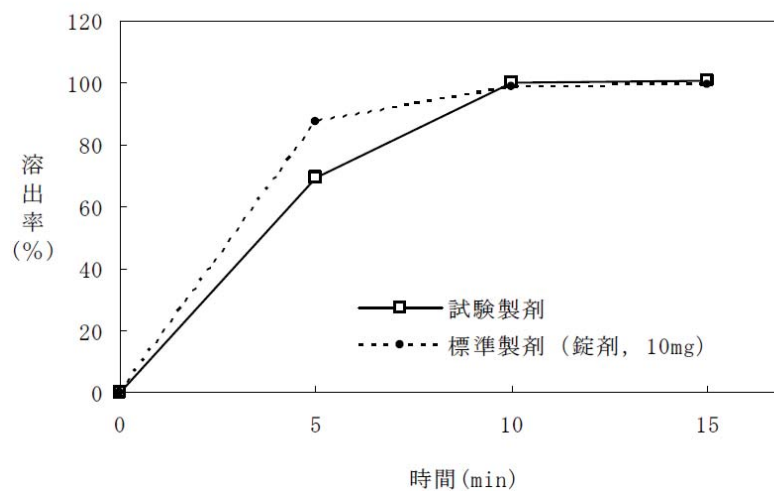
③pH6.8、50rpm



④水、50rpm



⑤pH3.0、100rpm



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

22. 包装

〈セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) ×10]

〈セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) ×10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

錠 5mg

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・ポリエチレンラミネートフィルム)、紙箱

錠 10mg

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・ポリエチレンラミネートフィルム)、紙箱

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、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]

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

①無作為化並行用量反応試験

〈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¹⁰⁾。

〈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¹¹⁾。

②比較試験

〈アレルギー性鼻炎〉

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¹²⁾。

〈蕁麻疹〉

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、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¹³⁾。

〈アレルギー性鼻炎〉

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¹⁴⁾。

全治療評価期間における総合鼻症状スコア^{a)}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 ^{b)}	
		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 ^{c)} (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 ^{c)}		95%信頼区間 ^{c)}		p 値
	0.60		[0.15 ~ 1.05]		p = 0.0087

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¹⁴⁾。

〈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¹⁵⁾。

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 ^{a)}	ベースライン評価期間	全治療評価期間	変化量 ^{b)}	
		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 ^{c)} (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 ^{c)}		95%信頼区間 ^{c)}	
		-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¹⁵⁾。

③一般臨床試験

〈蕁麻疹〉

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。

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¹⁶⁾。

〈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¹⁷⁾。

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¹⁸⁾。

〈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¹⁹⁾。

(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^{15, 18～20)}。

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¹⁴⁾。

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

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。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・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。

(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²¹⁾。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）^{22, 23)}。

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）²⁴⁾、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）²⁵⁾。

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）^{26, 27)}。

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²⁸⁾。

(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 (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²⁹⁾。

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

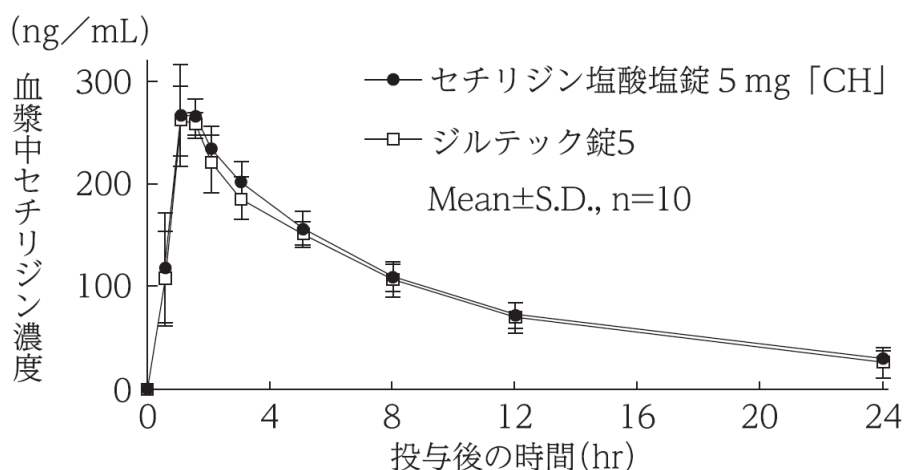
日本人の通年性アレルギー性鼻炎患児又は皮膚疾患患児を対象とした臨床試験 5 試験、570 例から得られた血清中濃度値 994 点を用い、母集団薬物動態解析 (非線形混合効果モデル法、NONMEM) を行った。その結果、体重が共変量として認められ、2～6 歳の小児 (本年齢層における体重の中央値: 18.0kg) の全身クリアランス (CL/F) は 1.64L/hr、分布容積 (V/F) は 11.9L、7～14 歳の小児 (同: 31.0kg) の CL/F は 2.11L/hr、V/F は 17.7L と推定された。また、セチリジン塩酸塩錠 2.5mg 1 日 2 回投与時の定常状態時最低血清中濃度 (Css min) 及び最高血清中濃度 (Css max) は、それぞれ 58±25ng/mL 及び 214±50ng/mL (平均±標準偏差^{注)}、以下同様) と推定され、セチリジン塩酸塩錠 5mg 1 日 2 回投与時の Css min 及び Css max は、それぞれ 100±40ng/mL 及び 308±74ng/mL と推定された³⁰⁾。

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

生物学的同等性試験

錠 5mg

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」とジルテック錠 5 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2 錠 (セチリジン塩酸塩として 10mg) 健康成人男子に空腹時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 (0.80) ～ 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³¹⁾。



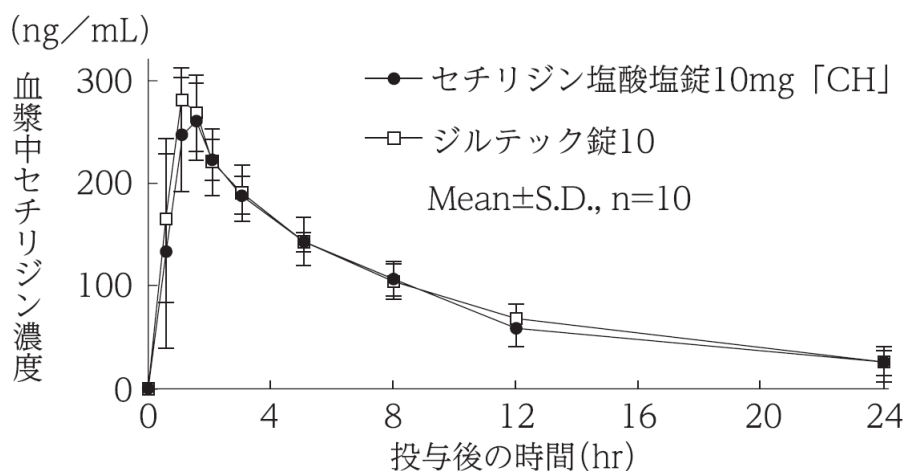
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」	2289.2±259.8	284.2±26.4	1.3±0.3	8.1±1.2
ジルテック錠 5	2183.0±331.6	273.6±23.8	1.3±0.3	7.6±1.8

(Mean±S.D., n = 10)

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。

錠 10mg

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」 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）健康成人男子に空腹時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 (0.80) ～ 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³²⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
セチリジン塩酸塩錠 10mg「CH」	2091.6±275.5	274.2±40.7	1.4±0.2	8.1±3.5
ジルテック錠 10	2208.8±363.4	297.3±29.8	1.3±0.3	7.8±1.6

(Mean±S.D., n = 10)

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

錠 5mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 (2 錠、n=10)

kel (hr⁻¹) : 0.08683±0.0122

錠 10mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 (1 錠、n=10)

kel (hr⁻¹) : 0.0968±0.02989

(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

¹⁴C 標識-セチリジン 0.1、1 及び 10 μg/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)³³⁾。

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、血漿中に酸化的脱アルキル体がわずかに認められた²⁹⁾。

(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²⁹⁾。

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 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³⁴⁾（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
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³⁵⁾（外国人データ）。[2.2、7.1、9.2.1、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³⁴⁾ 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³⁶⁾（外国人データ）。[7.2、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³⁴⁾（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 _{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、9.2.1、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。

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、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]

(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]

(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、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）

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

	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	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

アレルギー皮膚反応を抑制するため、アレルギー皮膚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。

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、更には穿孔をお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

- (1) 製剤：該当しない
- (2) 有効成分：劇薬

2. 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

設定されていない

5. 患者向け資材

- ・くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ジルテック[®]錠5、ジルテック[®]錠10、ジルテック[®]ドライシロップ1.25%
同効薬：オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩等

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「CH」	2007年3月14日	21900AMX00288000	2007年7月6日	2007年7月6日
セチリジン塩酸塩錠10mg「CH」	2007年3月14日	21900AMX00281000	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

錠5mg

効能・効果及び用法・用量追加承認年月日：2013年9月26日

内容：小児における効能・効果及び用法・用量の追加

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。

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 コード
セチリジン塩酸塩錠 5mg「CH」	4490020F1012	4490020F1047	117974302	620005456
セチリジン塩酸塩錠 10mg「CH」	4490020F2019	4490020F2043	117991002	620005484

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) 医療用医薬品品質情報集 (オレンジブック) No.27 (平成 19 年 1 月版、厚生労働省医薬食品局)
- 2) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」の加速試験)
- 3) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」の加速試験)
- 4) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」の長期保存試験)
- 5) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」の長期保存試験)
- 6) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」の無包装状態での安定性試験)
- 7) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」の無包装状態での安定性試験)
- 8) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」の溶出試験)
- 9) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」の溶出試験)
- 10) 奥田 稔 他：耳鼻咽喉科展望 1994 ; 37 : 754-779
- 11) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 2107-2129
- 12) 奥田 稔 他：耳鼻咽喉科展望 1995 ; 38 : 116-136
- 13) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 2131-2145
- 14) 斎藤博久：臨床医薬 2010 ; 26 : 141-154
- 15) 中川秀己 他：臨床医薬 2010 ; 26 : 155-167
- 16) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 2163-2173
- 17) 吉田彦太郎 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 2147-2162
- 18) 斎藤博久 他：臨床医薬 2010 ; 26 : 127-139
- 19) 中川秀己 他：臨床医薬 2010 ; 26 : 169-181
- 20) 小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験 (ジルテック錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.3)
- 21) Advenier C, et al. : J Allergy Clin Immunol. 1991 ; 88 : 104-113
- 22) Simons F E R, et al. : J Allergy Clin Immunol. 1990 ; 86 : 540-547
- 23) Braunstein G, et al. : Br J Clin Pharmacol. 1992 ; 33 : 445-448
- 24) 内田昌子 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 1795-1812
- 25) Snyder S H, et al. : Ann Allergy. 1987 ; 59 : 4-8
- 26) Okada C, et al. : Int Arch Allergy Immunol. 1994 ; 103 : 384-390
- 27) Fadel R, et al. : Clin Allergy. 1987 ; 17 : 373-379
- 28) Fabre J M, et al. : Allergy. 1995 ; 50 : 362-365
- 29) 笹 征史 他：臨床薬理 1995 ; 26 : 509-522
- 30) 日本人小児を対象とした母集団薬物動態解析 (ジルテック錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.2.2)
- 31) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」の生物学的同等性試験)
- 32) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」の生物学的同等性試験)
- 33) 水野佳子 他：基礎と臨床 1994 ; 28 : 1951-1961
- 34) Matzke G R, et al. : Ann Allergy. 1987 ; 59 : 25-30
- 35) Awni W M, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 1990 ; 38 : 67-69

36) Simons F E R, et al. : J Clin Pharmacol. 1993 ; 33 : 949-954

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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

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

1. 保存条件

温度に対する安定性試験：40±2°C/60±5%RH、30日〔遮光・気密容器〕

湿度に対する安定性試験：25±2°C/75±5%RH、30日〔遮光・開放〕

光に対する安定性試験：120万lx・hr〔シャーレ+ラップ〕※

※1000lx/hr 25±2°C/60±5%RH

2. 試験項目

性状、定量試験

3. 試験結果

錠 5mg

試験項目		性状	定量試験 (%) (残存率 (%))
製剤の規格 (参考) (粉砕前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	100.5 (100.0)
①温度	15日	変化なし	100.5 (100.0)
	30日	変化なし	100.6 (100.1)
②湿度	15日	変化なし	99.8 (99.3)
	30日	変化なし	100.9 (100.4)
③光	30万lx・hr	黄白色の粉末	88.8 (88.4)
	60万lx・hr	黄白色の粉末	80.4 (80.0)
	120万lx・hr	黄白色の粉末	64.7 (64.4)

(1) 白色のフィルムコーティング錠

(2) 表示量の95.0～105.0%

錠 10mg

試験項目		性状	定量試験 (%) (残存率 (%))
製剤の規格 (参考) (粉碎前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	100.8 (100.0)
①温度	15 日	変化なし	101.4 (100.6)
	30 日	変化なし	101.1 (100.3)
②湿度	15 日	変化なし	101.3 (100.5)
	30 日	変化なし	101.2 (100.4)
③光	30 万 lx·hr	黄白色の粉末	90.8 (90.1)
	60 万 lx·hr	黄白色の粉末	82.2 (81.5)
	120 万 lx·hr	黄白色の粉末	69.0 (68.5)

(1) 白色のフィルムコーティング錠

(2) 表示量の 95.0 ~ 105.0%

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

1. 試験方法

崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブ（8Fr.）の通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。

2. 試験結果

崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」	5 分以内に崩壊・懸濁した。
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」	10 分以内に崩壊・懸濁した。

通過性試験結果

品目名	通過性
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「CH」	8Fr.のチューブを通過した。
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「CH」	8Fr.のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし

Memo

Memo

