

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2013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「NPI」

セチリジン塩酸塩錠10mg「NPI」

Cetirizine

| | |
|-------------------------------|--|
| 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 | セチリジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」： 1錠中（日局）セチリジン塩酸塩 5.0mg 含有 セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」： 1錠中（日局）セチリジン塩酸塩 10.0mg 含有 |
| 一般名 | 和名：セチリジン塩酸塩（JAN） 洋名：Cetirizine Hydrochloride（JAN） Cetirizine（INN） |
| 製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日 | 製造承認年月日：2007年7月11日 薬価基準収載年月日：2007年11月2日 発売年月日：2007年11月2日 |
| 開発・製造販売（輸入） ・提携・販売会社名 | 製造販売元：日本薬品工業株式会社 販売元：日本ケミファ株式会社 |
| 医薬情報担当者 の連絡先 | |
| 問い合わせ窓口 | 日本ケミファ株式会社 おくすり相談室 TEL.0120-47-9321 03-3863-1225/FAX.03-3861-9567 受付時間：8:45～17:30（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.nc-medical.com/ |

本IFは2016年10月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認下さい。

IF 利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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に審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式】

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体では、これに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意して作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

| | | | |
|-----------------------------|----|------------------------------------|----|
| I.概要に関する項目 | 1 | VII.安全性（使用上の注意等）に関する項目 | 15 |
| 1. 開発の経緯 | 1 | 1. 警告内容とその理由 | 15 |
| 2. 製品の治療学的・製剤学的特性 | 1 | 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） | 15 |
| II.名称に関する項目 | 2 | 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 | 15 |
| 1. 販売名 | 2 | 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 | 15 |
| 2. 一般名 | 2 | 5. 慎重投与内容とその理由 | 15 |
| 3. 構造式又は示性式 | 2 | 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 | 15 |
| 4. 分子式及び分子量 | 2 | 7. 相互作用 | 16 |
| 5. 化学名（命名法） | 2 | 8. 副作用 | 16 |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 | 2 | 9. 高齢者への投与 | 17 |
| 7. CAS登録番号 | 2 | 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 | 18 |
| III.有効成分に関する項目 | 3 | 11. 小児等への投与 | 18 |
| 1. 物理化学的性質 | 3 | 12. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 18 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 | 3 | 13. 過量投与 | 18 |
| 3. 有効成分の確認試験法 | 3 | 14. 適用上の注意 | 18 |
| 4. 有効成分の定量法 | 3 | 15. その他の注意 | 18 |
| IV.製剤に関する項目 | 4 | 16. その他 | 18 |
| 1. 剤形 | 4 | IX.非臨床試験に関する項目 | 19 |
| 2. 製剤の組成 | 4 | 1. 薬理試験 | 19 |
| 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 | 4 | 2. 毒性試験 | 19 |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性 | 5 | X.管理的事項に関する項目 | 20 |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性 | 5 | 1. 規制区分 | 20 |
| 6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） | 5 | 2. 有効期間又は使用期限 | 20 |
| 7. 溶出性 | 6 | 3. 貯法・保存条件 | 20 |
| 8. 生物学的試験法 | 8 | 4. 薬剤取扱い上の注意点 | 20 |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法 | 8 | 5. 承認条件等 | 20 |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法 | 8 | 6. 包装 | 20 |
| 11. 力価 | 8 | 7. 容器の材質 | 20 |
| 12. 混入する可能性のある夾雑物 | 8 | 8. 同一成分・同効薬 | 20 |
| 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 | 8 | 9. 国際誕生年月日 | 20 |
| 14. その他 | 8 | 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 | 20 |
| V.治療に関する項目 | 9 | 11. 薬価基準収載年月日 | 20 |
| 1. 効能又は効果 | 9 | 12. 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 | 20 |
| 2. 用法及び用量 | 9 | 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 | 21 |
| 3. 臨床成績 | 9 | 14. 再審査期間 | 21 |
| VI.薬効薬理に関する項目 | 11 | 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 | 21 |
| 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 | 11 | 16. 各種コード | 21 |
| 2. 薬理作用 | 11 | 17. 保険給付上の注意 | 21 |
| VII.薬物動態に関する項目 | 12 | X I.文献 | 22 |
| 1. 血中濃度の推移・測定法 | 12 | 1. 引用文献 | 22 |
| 2. 薬物速度論的パラメータ | 13 | 2. その他の参考文献 | 22 |
| 3. 吸収 | 14 | X II.参考資料 | 23 |
| 4. 分布 | 14 | 1. 主な外国での発売状況 | 23 |
| 5. 代謝 | 14 | 2. 海外における臨床支援情報 | 23 |
| 6. 排泄 | 14 | X III.備考 | 24 |
| 7. トランスポーターに関する情報 | 14 | その他の関連資料 | 24 |
| 8. 透析等による除去率 | 14 | | |

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

セチリジン塩酸塩錠は持続性選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では 1993 年に上市されている。

セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」・10mg「NPI」は、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、生物学的同等性試験、加速試験を実施し、2007 年 7 月に承認を得て、2007 年 11 月に上市した。

そして、2013 年 10 月にセチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」の小児に対する効能又は効果、用法及び用量が追加された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 成人で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、小児で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を有する。
- (2) 1 日 1 回投与の薬剤であるため、コンプライアンスの向上が期待できる。
- (3) 重大な副作用（16 頁参照）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（頻度不明）。

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「NPI」

セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」

(2) 洋名

Cetirizine

(3) 名称の由来

「有効成分」+「剤形」+「含量」+「屋号」より命名した。

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）

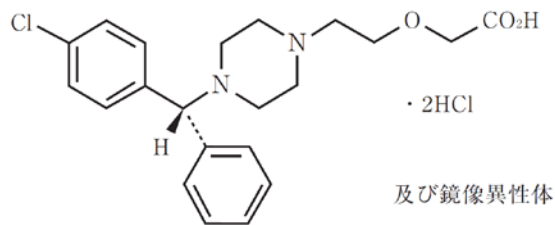
Cetirizine（INN）

(3) ステム

ジフェニルメチルピペラジン誘導体：-izine（-yzine）

3. 構造式又は示性式

構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃ · 2HCl

分子量：461.81

5. 化学名（命名法）

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

該当しない

7. CAS 登録番号

83881-52-1（Cetirizine Hydrochloride）

83881-51-0（Cetirizine）

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

(2) 溶解性

本品は 0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

1) 各種溶媒における溶解度

| 溶 媒 | 日局の溶解度表記 |
|--------------|----------|
| 水 | 極めて溶けやすい |
| エタノール (99.5) | 溶けにくい |

2) 各種 pH 溶媒における溶解度 (37℃)

| 各種pH | 溶解度 |
|-------|---------|
| 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

解離定数 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

旋光度：本品の水溶液(1→10)は旋光性を示さない。

比吸光度 $E_{1cm}^{1\%}$ (237nm) : 約 370 (塩酸試液溶液 (1→50,000))

2. 有効成分の各種条件下における安定性

水 : 0.02%溶液は、37℃、12 時間は安定である。

液性 (pH) : 0.02%溶液は、pH1~12、37℃、12 時間は安定である。

3. 有効成分の確認試験法

(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

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法







IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

区別：フィルムコーティング錠

性状：白色のフィルムコーティング錠

| 販売名 | 表面 | 裏面 | 側面 | 色調 |
|----------------------------|---|---|---|----|
| セチリジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」 |  |  |  | 白色 |
| 直径:6.1mm,厚さ:2.9mm,重量:88mg | | | | |
| セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」 |  |  |  | 白色 |
| 直径:7.1mm,厚さ:3.0mm,重量:119mg | | | | |

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

セチリジン塩酸塩錠 5 mg 「NPI」 : NPI 102

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」 : NPI 103

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

セチリジン塩酸塩錠 5 mg「NPI」 : 1 錠中（日局）セチリジン塩酸塩 5.0mg 含有

セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」 : 1 錠中（日局）セチリジン塩酸塩 10.0mg 含有

(2) 添加物

カルナウバロウ、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、乳糖水和物、ヒプロメロース、マクロゴール6000

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾²⁾³⁾

(1) セチリジン塩酸塩錠 5 mg「NPI」

| 試験名 | 保存条件 | 保存期間 | 保存形態 | 結果 |
|--------------|--------------------------|-------------------|------------|-----------------|
| 加速試験 | 40℃ 75%RH | 6ヵ月 | PTP包装 | 規格に適合 |
| 無包装 安定性試験 | 40℃ | 3ヵ月 | 遮光・気密ガラス瓶 | 規格に適合 |
| | 25℃ 75%RH | 3ヵ月 | 遮光・開放 | 規格に適合 |
| | 曝光量 1000lx 温湿度なりゆき | 25日 (60万lx・hr) | 気密ガラス瓶（無色） | わずかに着色 (微褐色) |
| 粉碎後 安定性試験 | 室内散乱光下、 温湿度なりゆき | 4週間 | シャーレ開放 | 規格に適合 |

試験項目：性状、確認試験、含量均一性、溶出試験、定量（加速試験）
性状、硬度、溶出、定量（無包装安定性試験）
含量（粉碎後安定性試験）

(2) セチリジン塩酸塩錠 10 mg「NPI」

| 試験名 | 保存条件 | 保存期間 | 保存形態 | 結果 |
|--------------|--------------------------|-------------------|------------|-----------------|
| 加速試験 | 40℃ 75%RH | 6ヵ月 | PTP包装 | 規格に適合 |
| 無包装 安定性試験 | 40℃ | 3ヵ月 | 遮光・気密ガラス瓶 | 規格に適合 |
| | 25℃ 75%RH | 3ヵ月 | 遮光・開放 | 規格に適合 |
| | 曝光量 1000lx 温湿度なりゆき | 25日 (60万lx・hr) | 気密ガラス瓶（無色） | わずかに着色 (微褐色) |
| 粉碎後 安定性試験 | 室内散乱光下、 温湿度なりゆき | 4週間 | シャーレ開放 | 規格に適合 |

試験項目：性状、確認試験、含量均一性、溶出試験、定量（加速試験）
性状、硬度、溶出、定量（無包装安定性試験）
含量（粉碎後安定性試験）

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

7. 溶出性⁴⁾

(1) 溶出挙動における類似性

本製剤は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 医薬審第786号）に準拠。

(方法) 日局溶出試験法 パドル法

試験条件： 回転数 50rpm、100rpm

試験液： 水、pH1.2、pH4.0、pH6.8 (5mg 製剤)

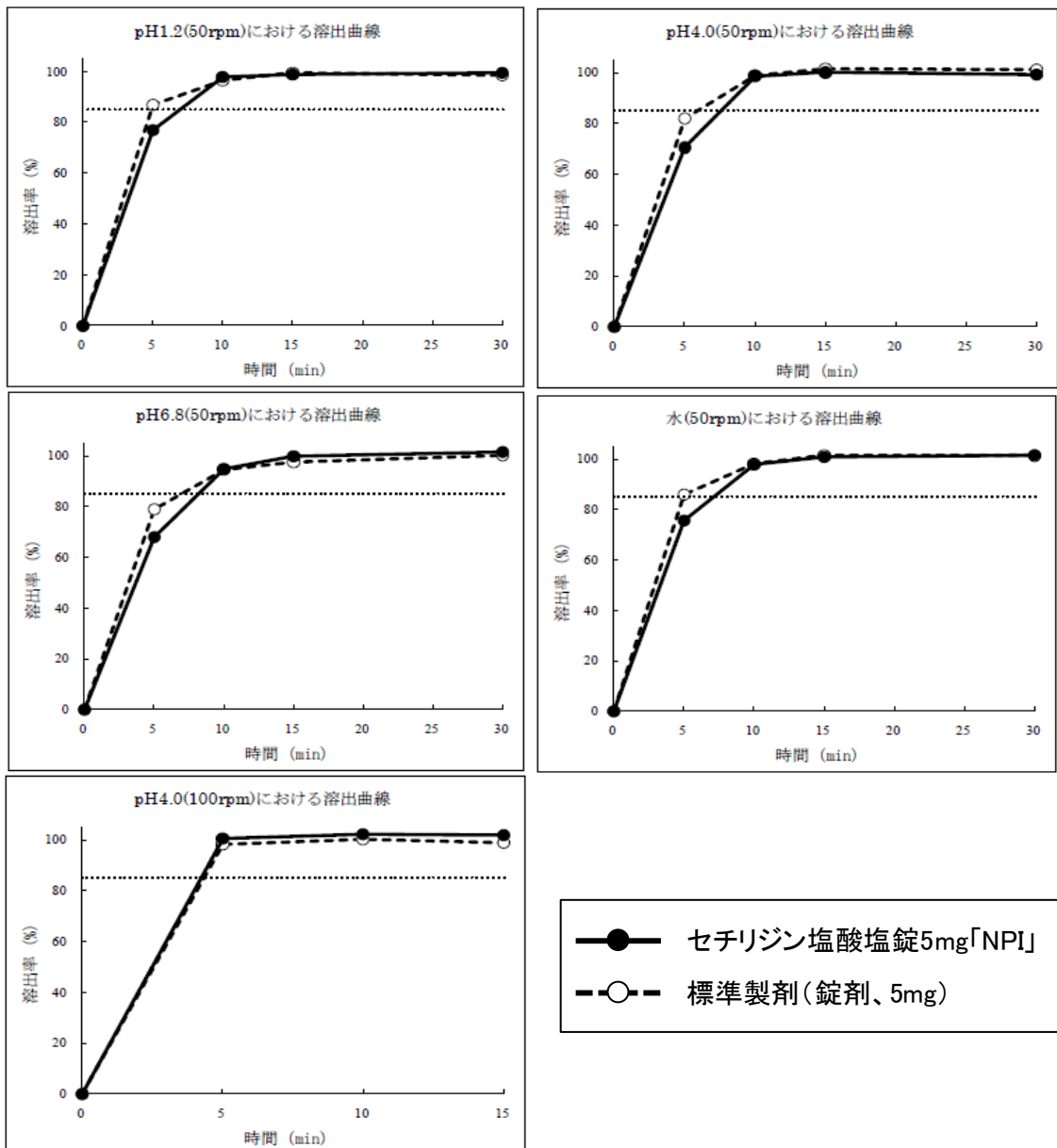
水、pH1.2、pH5.0、pH6.8 (10mg 製剤)

判定基準：

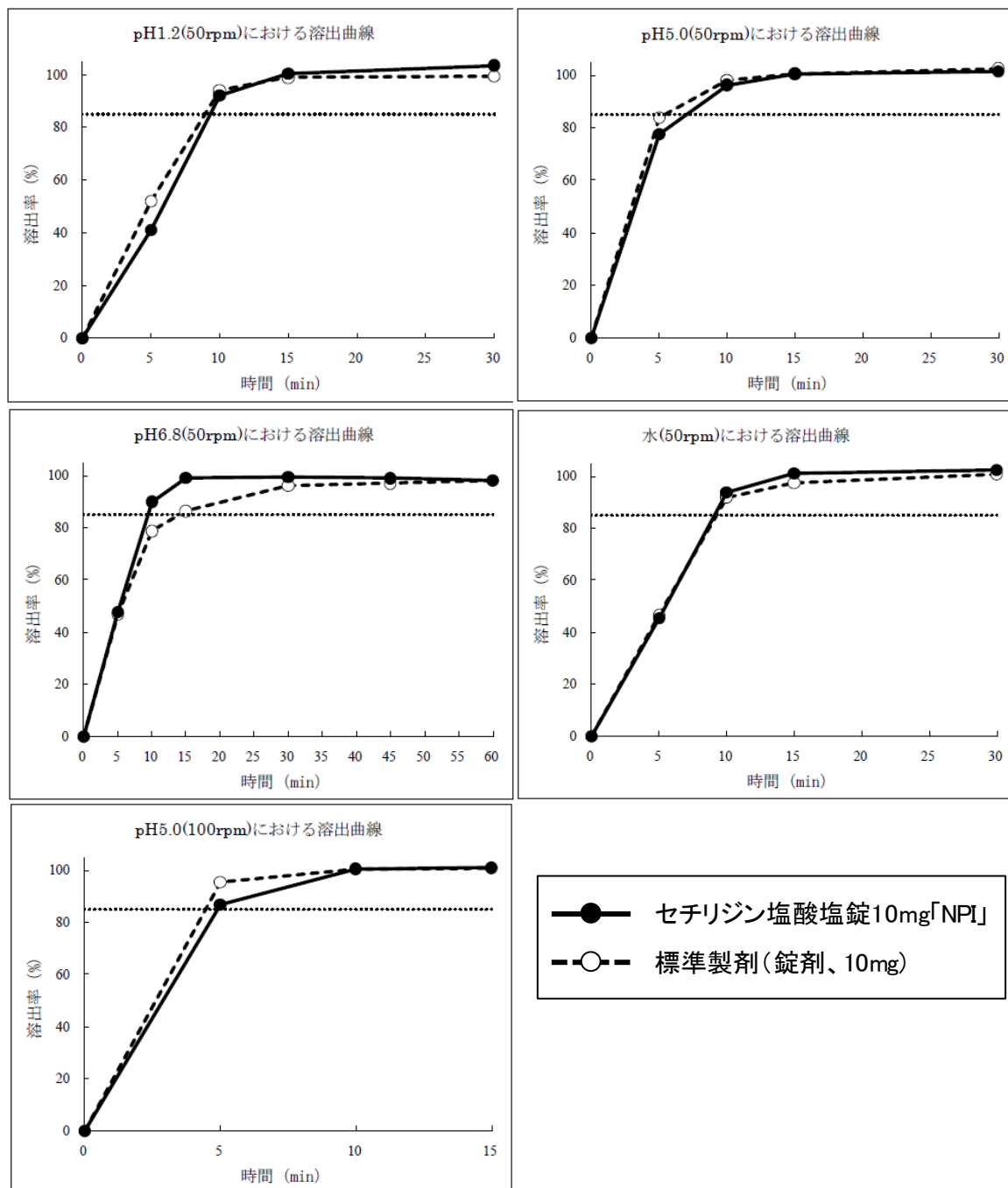
| 標準製剤溶出パターン | 判定基準 |
|--------------------------|--|
| 標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合 | 試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。又は、15分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。 |

(結果) すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と製剤学的に同等性を有することが確認された。

1) セチリジン塩酸塩錠5mg「NPI」



2) セチリジン塩酸塩錠10mg「NPI」



(2) 公的溶出規格への適合

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

(方法) 日局溶出試験法 パドル法

試験条件：回転数 50rpm

試験液：水(900mL)

(結果) 5mg 錠：15 分間の溶出率が 85%以上のとき適合する。

10mg 錠：30 分間の溶出率が 80%以上のとき適合する。

8. 生物学的試験法
該当しない
9. 製剤中の有効成分の確認試験法
紫外可視吸光度測定法
10. 製剤中の有効成分の定量法
液体クロマトグラフィー
11. 力価
該当しない
12. 混入する可能性のある夾雑物
該当資料なし
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報
該当しない
14. その他

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. 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。

〈用法及び用量に関連する使用上の注意〉

腎障害患者では、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。

なお、クレアチニンクリアランスが10mL/min未満の患者への投与は禁忌である。

成人患者の腎機能に対応する用法及び用量の目安（外国人データ）

| | 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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）
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試験の概要
該当資料なし

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、ベボタスチンベシル酸塩、ロラタジン、デスロラタジン、ビラスチン等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁵⁾

セチリジン塩酸塩は、抗ヒスタミン薬 (H₁ 受容体遮断薬) であるが、ロイコトリエン及びプロスタグランジン D₂ の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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間⁶⁾

「VII-1-(3).臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

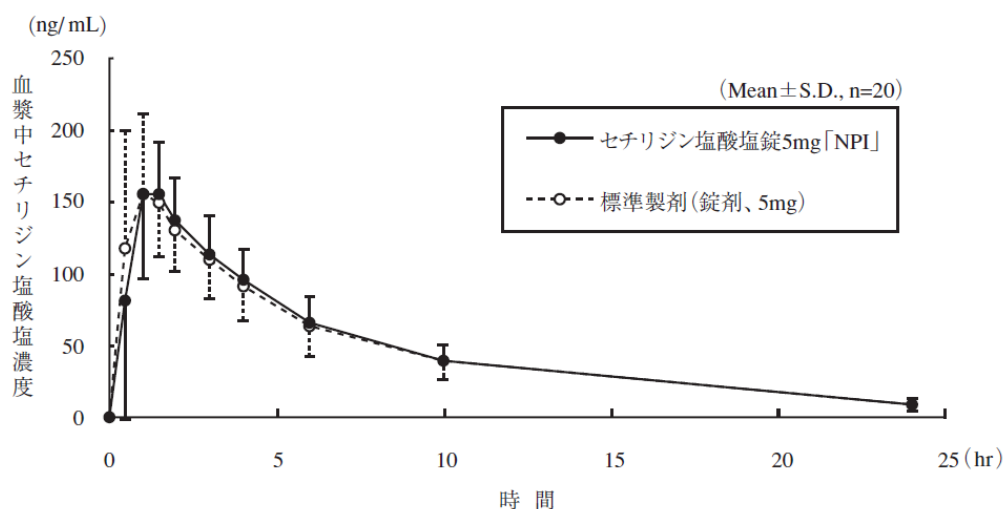
(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁶⁾

生物学的同等性試験

本製剤は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日付医薬審発第786号）に準拠。

セチリジン塩酸塩錠5mg「NPI」又はセチリジン塩酸塩錠10mg「NPI」とそれぞれの標準製剤を、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5mg又はセチリジン塩酸塩10mg）健康成人男子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）～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。

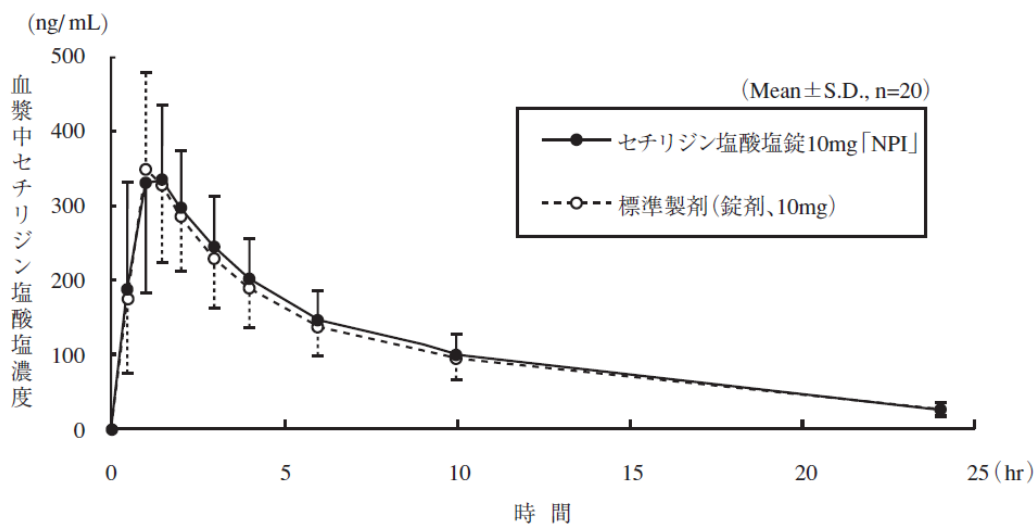
1) セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」



| 製剤名 | 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「NPI」 | 1152.45 ±321.41 | 167.06 ±47.11 | 1.25 ±0.41 | 6.38 ±0.94 |
| 標準製剤 (錠剤、5mg) | 1140.52 ±303.82 | 172.84 ±56.34 | 1.18 ±0.57 | 6.89 ±0.80 |

(n=20、Mean ± S.D.)

2) セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」



| 製剤名 | 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 「NPI」 | 2665.40 ± 740.22 | 365.86 ± 104.73 | 1.18 ± 0.37 | 6.82 ± 0.83 |
| 標準製剤 (錠剤、10mg) | 2523.93 ± 677.20 | 366.99 ± 106.38 | 1.13 ± 0.36 | 6.96 ± 0.93 |

(n=20、Mean ± S.D.)

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

動物実験（ラット、イヌ）で乳汁中へ移行することが報告されている。

(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

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

本剤は、主として腎臓から排泄される。

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

本剤は透析で除去されない。

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

●禁忌（次の患者には投与しないこと）

- (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) 重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者
[高い血中濃度が持続するおそれがある。]

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 腎障害のある患者
[高い血中濃度が持続するおそれがある。（「VIII-4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由」の項参照）]
- (2) 肝障害のある患者
[高い血中濃度が持続するおそれがある。]
- (3) 高齢者
[高い血中濃度が持続するおそれがある（「VIII-9. 高齢者への投与」の項参照）。]
- (4) 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。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (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。
- (2) 本剤を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。
- (3) 本剤の使用により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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

| 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 | 併用により、テオフィリンの薬物動態に変化はないが、セチリジン塩酸塩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、セチリジン塩酸塩のクリアランスが16%減少する。 |
| リトナビル | 併用により、セチリジン塩酸塩の曝露量の増加（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。 | リトナビルによりセチリジン塩酸塩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ため、中枢神経抑制剤あるいはアルコールと併用する際は注意すること。 | 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 | 併用により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

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

1) ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

2) 痙攣

異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

3) 肝機能障害、黄疸

AST (GOT)、ALT (GPT)、 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ので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4) 血小板減少

血小板減少があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

| その他の副作用 | |
|---|--|
| 次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。 | |
| | 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 (GPT) 上昇、AST (GOT) 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 |

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

●禁忌（次の患者には投与しないこと）

- (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

| 副作用 | |
|---|------------------------------|
| (2) 重大な副作用（頻度不明） | |
| 1) ショック、アナフィラキシー ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。 | |
| (3) その他の副作用 | |
| 次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。 | |
| | 頻度不明 |
| 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 |

9. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では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ので、低用量（例えば 5mg）から投与を開始するなど慎重に投与し、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。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。
[動物実験（ラット）で胎盤を通過することが報告されている。]
- (2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。
[ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。]

11. 小児等への投与

- (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1.25%を投与すること。
- (2) 低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の幼児に対する安全性は確立していない（国内における使用経験が少ない）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルギー皮内反応を抑制するため、アレルギー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。

13. 過量投与

徴候、症状：本剤の過量投与により錯乱、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。
処置：必要に応じ対症療法を行うこと。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。

14. 適用上の注意

薬剤交付時：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報告されている。]

15. その他の注意

該当しない

16. その他

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」参照）
- (2) 副次的薬理試験
該当資料なし
- (3) 安全性薬理試験
該当資料なし
- (4) 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) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
- (4) 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 5 mg 「NPI」・10mg 「NPI」 規制区分なし
有効成分：セチリジン塩酸塩 劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

密閉容器（室温保存）

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱いについて

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII-6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法の(1)」、「VIII-14.適用上の注意」の項参照。

患者向医薬品ガイド：無し

くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

セチリジン塩酸塩錠 5 mg 「NPI」 : 100錠（10錠×10）

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」 : 100錠（10錠×10）

7. 容器の材質

PTP 包装品

PTP : ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、アルミ箔

ピロー包装 : ポリエチレン、ポリプロピレン

8. 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：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、デスロラタジン、ピラスチン等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤

9. 国際誕生年月日

1986年11月6日（セチリジン塩酸塩製剤）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

| 販売名 | 製造販売承認年月日 | 承認番号 |
|----------------------|------------|------------------|
| セチリジン塩酸塩錠 5 mg 「NPI」 | 2007年7月11日 | 21900AMX01013000 |
| セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」 | 2007年7月11日 | 21900AMX01014000 |

11. 薬価基準収載年月日

2007年11月2日

12. 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

・セチリジン塩酸塩 5mg 「NPI」

2013年10月1日

7歳以上15歳未満の小児に対する効能又は効果、用法及び用量の追加

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

| 販売名 | HOT (9桁) 番号 | 厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード | レセプト電算コード |
|------------------------|-------------|-----------------------|-----------|
| セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」 | 118208802 | 4490020F1314 | 620005871 |
| セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」 | 118209502 | 4490020F2310 | 620005872 |

17. 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) 日本薬品工業株式会社：安定性に関する資料(社内資料)
- 2) 日本薬品工業株式会社：無包装状態における安定性に関する資料（社内資料）
- 3) 日本薬品工業株式会社：粉碎後の安定性に関する資料（社内資料）
- 4) 日本薬品工業株式会社：溶出に関する資料(社内資料)
- 5) 第十七改正日本薬局方解説書 C-2556, 廣川書店, 東京, 2016
- 6) 日本薬品工業株式会社：生物学的同等性に関する資料（社内資料）

2. その他の参考文献

第十七改正 日本薬局方 解説書
医療用医薬品品質情報集 No.27

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリアの分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリア分類とは異なる。

【使用上の注意】「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。

[動物実験（ラット、イヌ）で乳汁中へ移行することが報告されている。]

| | 分類 |
|---|---------------|
| FDA : Pregnancy Category | B (2004年3月) |
| オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy) | B2 (2016年12月) |

参考：分類の概要

FDA : Pregnancy Category

B : Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus and there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women OR Animal studies have shown an adverse effect, but adequate and well-controlled studies in pregnant women have failed to demonstrate a risk to the fetus in any trimester.

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

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

その他の関連資料

