

# 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「サワイ」**

**セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」**

CETIRIZINE HYDROCHLORIDE

**セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」**

**セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」**

CETIRIZINE HYDROCHLORIDE OD

セチリジン塩酸塩口腔内崩壊錠

剤形	錠：フィルムコーティング錠 OD錠：素錠(口腔内崩壊錠)
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠5mg/OD錠5mg：1錠中日局セチリジン塩酸塩5mg含有 錠10mg/OD錠10mg：1錠中日局セチリジン塩酸塩10mg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 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2007年3月15日(錠5mg/錠10mg) 2010年1月15日(OD錠5mg/OD錠10mg) 薬価基準収載年月日：2007年7月6日(錠5mg/錠10mg) 2010年5月28日(OD錠5mg/OD錠10mg) 発売年月日：2007年7月6日(錠5mg/錠10mg) 2010年5月28日(OD錠5mg/OD錠10mg)
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向け総合情報サイト： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2016年10月改訂(錠5mg/錠10mg)、2018年3月改訂(OD錠5mg/OD錠10mg)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<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

# 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.info.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か審査・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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	29
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	29
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)	29
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	29
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	29
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	29
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	29
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	30
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	30
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	32
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	32
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	32
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	32
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	32
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	32
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	33
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	33
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	34
2. 製剤の組成	7	1. 薬理試験	34
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	2. 毒性試験	34
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	35
5. 調製法及び溶解後の安定性	12	1. 規制区分	35
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	12	2. 有効期間又は使用期限	35
7. 溶出性	12	3. 貯法・保存条件	35
8. 生物学的試験法	17	4. 薬剤取扱い上の注意点	35
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	17	5. 承認条件等	35
10. 製剤中の有効成分の定量法	17	6. 包装	35
11. 力価	17	7. 容器の材質	36
12. 混入する可能性のある夾雑物	18	8. 同一成分・同効薬	36
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	18	9. 国際誕生年月日	36
14. その他	18	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	36
V. 治療に関する項目	19	11. 薬価基準収載年月日	37
1. 効能又は効果	19	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	37
2. 用法及び用量	19	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	37
3. 臨床成績	20	14. 再審査期間	37
VI. 薬効薬理に関する項目	22	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	37
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	22	16. 各種コード	37
2. 薬理作用	22	17. 保険給付上の注意	37
VII. 薬物動態に関する項目	23	XI. 文献	38
1. 血中濃度の推移・測定法	23	1. 引用文献	38
2. 薬物速度論的パラメータ	26	2. その他の参考文献	38
3. 吸収	27	XII. 参考資料	39
4. 分布	27	1. 主な外国での発売状況	39
5. 代謝	27	2. 海外における臨床支援情報	39
6. 排泄	28	XIII. 備考	39
7. トランスポーターに関する情報	28	その他の関連資料	39
8. 透析等による除去率	28		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

セチリジン塩酸塩錠 5mg/錠10mg/OD錠 5mg/OD錠10mg「サワイ」は、日局セチリジン塩酸塩を含有する持続性選択H<sub>1</sub>受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

セチリジン塩酸塩は、ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗剤であり、末梢H<sub>1</sub>受容体に選択的に結合しアレルギー反応を抑制する。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

	錠 5mg/錠10mg	OD錠 5mg/OD錠10mg
承認申請に際し準拠した通知名	平成17年 3月31日 薬食発第0331015号	
承認	2007年 3月	2010年 1月
上市	2007年 7月	2010年 5月

2013年 9月に小児に対する効能・効果及び用法・用量が追加承認された。[錠 5mg/OD錠 5mg] (X. -12. 参照)

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 水なし(唾液のみ)でも服用可能な口腔内崩壊錠である。[OD錠 5mg/OD錠10mg]
- 2) 有効成分の酸刺激性、苦味をマスキングした製剤である。
- 3) 普通錠、口腔内崩壊錠があり、個々の状況に応じた剤形選択が可能である。
- 4) 抗ヒスタミン薬(H<sub>1</sub>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D<sub>2</sub>の遊離抑制作用を併せ持つ。<sup>1)</sup>
- 5) 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H<sub>2</sub>、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H<sub>1</sub>受容体への影響が少ないとされる。<sup>1)</sup>
- 6) 通年性及び季節性アレルギー性鼻炎患者を対象とした群内比較試験において、標準製剤と治療学的に同等であることが確認された[錠10mg] (V. -3. 参照)。<sup>2)</sup>
- 7) 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(頻度不明)。

## II. 名称に関する項目

### 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「サワイ」  
セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」  
セチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」  
セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」

##### 2) 洋名

CETIRIZINE HYDROCHLORIDE  
CETIRIZINE HYDROCHLORIDE OD

##### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

#### 2. 一般名 .....

##### 1) 和名(命名法)

セチリジン塩酸塩(JAN)

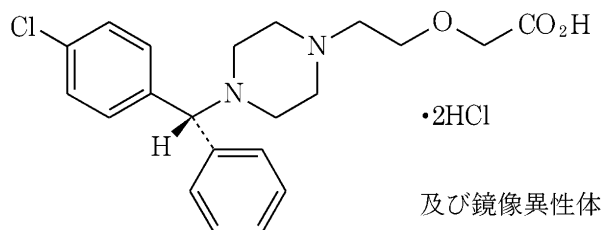
##### 2) 洋名(命名法)

Cetirizine Hydrochloride (JAN)  
Cetirizine (INN)

##### 3) ステム

-i(y)zine : diphenylmethyl piperazine誘導体 抗ヒスタミン剤

#### 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) .....  
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 .....  
別名：塩酸セチリジン

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

## 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、においはなく、味はわずかに苦い。

#### 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。

溶媒	本品 1gを溶解するための溶媒量 <sup>1)</sup>
水	1 mL未満
メタノール	約30mL
エタノール(99.5)	約950mL

溶解度(37°C)<sup>3)</sup> : pH1.2 : 1 g/mL以上、pH4.0 : 1 g/mL以上、pH6.8 : 1 g/mL以上、  
水 : 1 g/mL以上

#### 3) 吸湿性

乾燥減量 : 0.5%以下(1g、減圧、60°C、3時間)

#### 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

pKa<sub>1</sub> = 2.85(滴定法)<sup>3)</sup>

pKa<sub>2</sub> = 8.33(滴定法)<sup>3)</sup>

#### 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。

比吸光度 E<sub>1cm</sub><sup>1%</sup>(237nm) : 約370[本品の0.1mol/L塩酸試液溶液(1→50000)]<sup>1)</sup>

pH : 5%水溶液のpHは1.2~1.8である。<sup>4)</sup>

### 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°C、12時間は安定である。<sup>3)</sup>

液性(pH) : 0.02%溶液は、pH 1~12、37°C、12時間は安定である。<sup>3)</sup>



3. 有効成分の確認試験法 .....

日局「セチリジン塩酸塩」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法 .....













日局「セチリジン塩酸塩」の定量法に準ずる。(電位差滴定法)

IV. 製剤に関する項目

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
セチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 6.1	 約88	 3.0	白色
セチリジン塩酸塩錠 10mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 7.1	 約119	 3.1	白色
セチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」	素錠 (口腔内崩壊錠)	 7.1	 約120	 4.0	白色～微黄白色
セチリジン塩酸塩OD錠 10mg「サワイ」	素錠 (口腔内崩壊錠)	 9.1	 約240	 5.2	白色～微黄白色

2) 製剤の物性

●セチリジン塩酸塩錠 5mg/錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局セチリジン塩酸塩錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局セチリジン塩酸塩錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、15分：85%以上)

●セチリジン塩酸塩OD錠 5mg/OD錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

3) 識別コード

●セチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」：SW CTR 5

●セチリジン塩酸塩錠 10mg「サワイ」：SW CTR10

●セチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」：SW 251

●セチリジン塩酸塩OD錠 10mg「サワイ」：SW 252

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

## 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/OD錠 5 mg「サワイ」

1錠中に日局セチリジン塩酸塩 5 mgを含有する。

## ●セチリジン塩酸塩錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

1錠中に日局セチリジン塩酸塩10mgを含有する。

## 2) 添加物

## ●セチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」

添加物として、カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、乳糖、ヒプロメロース、マクロゴール400を含有する。

## ●セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」

添加物として、カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、乳糖、ヒプロメロース、マクロゴール400を含有する。

## ●セチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」

添加物として、アセスルファムK、アラビアゴム、クエン酸Na、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、β-シクロデキストリン、スクラロース、ステアリン酸Mg、抽出トコフェロール、デキストリン、乳糖、香料を含有する。

## ●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」

添加物として、アセスルファムK、アラビアゴム、クエン酸Na、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、β-シクロデキストリン、スクラロース、ステアリン酸Mg、デキストリン、乳糖、バニリン、プロピレングリコール、香料を含有する。

## 3) その他

## ●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」

熱量：1錠中、約0.90kcalである。(分析結果より算出)

## 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

●セチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」<sup>5)</sup>

## 1) PTP包装品の安定性(加速試験)

セチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.8	99.8

※：表示量に対する含有率(%)

2)無包装下の安定性

セチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3ヵ月)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.1	5.7	3.7	5.9	4.6
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.0	101.3	100.2	100.2

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」<sup>6)</sup>

1)PTP包装品の安定性(加速試験)

セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.7	99.7

※：表示量に対する含有率(%)

2)無包装下の安定性

セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	なりゆき (室温散光下 3ヵ月)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	4.7	5.4	3.6	5.7	4.3
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.3	100.8	98.7	99.1

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」<sup>7)</sup>

## 1) PTP包装品の安定性(長期保存試験)

セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 3年
性状	白色～微黄白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	98.6	98.6

※：表示量に対する含有率(%)

## 2) PTP包装品の安定性(加速試験)

セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色～微黄白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	98.3	97.0

※：表示量に対する含有率(%)

## 3) 無包装下の安定性(苛酷試験)

セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、全ての条件下で性状変化、湿度及び室温の条件下で不純物増加が観察された。

保存条件	イニシャル	温度(40°C)		湿度(25°C75%RH)	
		1ヵ月	3ヵ月	1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の素錠	微黄白色に変化(規格内)	微黄白色に変化(規格内)	変化なし	微黄白色に変化(規格内)
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	不純物増加	不純物増加
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.9	98.8	98.8	97.8

#### IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	室温(25°C60%RH)			光(総照射量 60万lx・hr)
		2週間	1ヵ月	3ヵ月	
性状	白色の素錠	—	変化なし	微黄白色に変 化(規格内)	淡黄白色に変 化
純度試験	問題なし	問題なし	不純物増加	不純物増加	問題なし
崩壊試験	問題なし	—	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	—	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	—	99.1	97.8	97.7

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

#### <補足>

セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」の無包装の製剤について、下記条件下で保存し、硬度を測定した。

その結果、硬度低下は観察されなかった。

保存条件	イニシャル	温度(40°C) 2週間	25°C75%RH 2週間
硬度(kg)	3.5	3.3	3.3

#### ●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」<sup>8)</sup>

##### 1) PTP包装品の安定性(長期保存試験)

セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 3年
性状	白色～微黄白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.3	99.1

※：表示量に対する含有率(%)

##### 2) PTP包装品の安定性(加速試験)

セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色～微黄白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	98.3	97.8

※：表示量に対する含有率(%)

### 3) 無包装下の安定性(苛酷試験)

セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、全ての条件下で性状変化、温度の条件下で不純物増加及び含量低下、湿度及び室温の条件下で不純物増加が観察された。

保存条件	イニシャル	温度(40°C)		湿度(25°C75%RH)	
		1ヵ月	3ヵ月	1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の素錠	微黄白色に変化(規格内)	微黄白色に変化(規格内)	変化なし	微黄白色に変化(規格内)
純度試験	問題なし	不純物増加	不純物増加	不純物増加	不純物増加
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.0	96.4	99.5	97.5

保存条件	イニシャル	室温(25°C60%RH)			光(総照射量 60万lx・hr)
		2週間	1ヵ月	3ヵ月	
性状	白色の素錠	—	変化なし	微黄白色に変化(規格内)	淡黄白色に変化
純度試験	問題なし	問題なし	不純物増加	不純物増加	問題なし
崩壊試験	問題なし	—	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	—	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	—	99.9	98.4	97.3

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

#### <補足>

セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、下記条件下で保存し、硬度を測定した。

その結果、硬度低下は観察されなかった。

保存条件	イニシャル	温度(40°C) 2週間	25°C75%RH 2週間
硬度(kg)	4.3	4.6	4.6

IV. 製剤に関する項目

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)

該当資料なし

7. 溶出性

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●セチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」<sup>9,10)</sup>

本剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH5.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

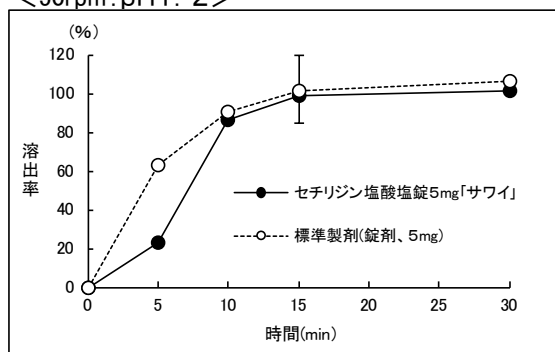
<100rpm : pH5.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

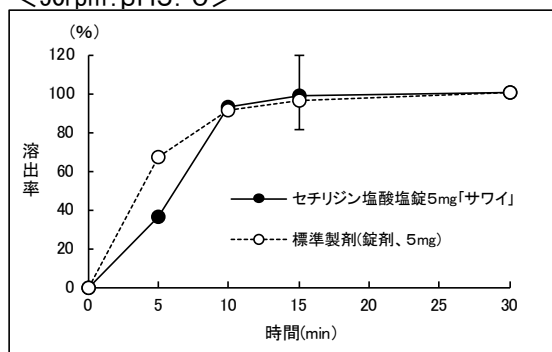
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

(溶出曲線)

<50rpm:pH1.2>

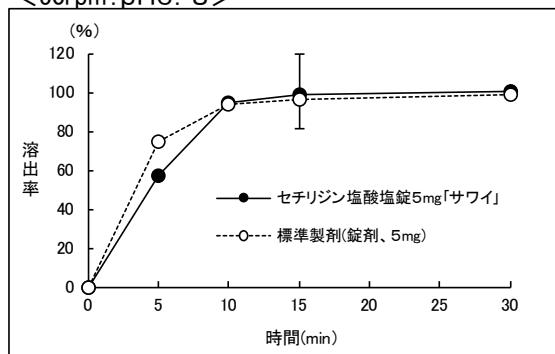


<50rpm:pH5.0>

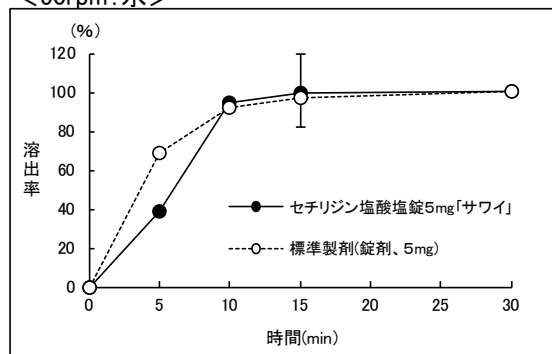




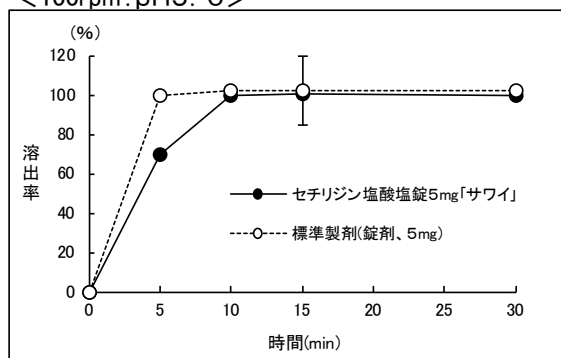
<50rpm: pH6.8>



<50rpm: 水>



<100rpm: pH5.0>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

●セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」<sup>9, 11)</sup>

本剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm (pH4.0)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH4.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<100rpm : pH4.0>

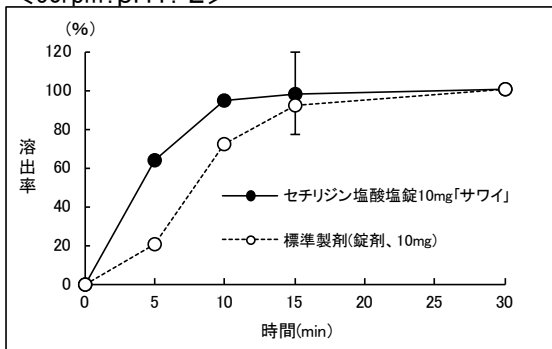
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

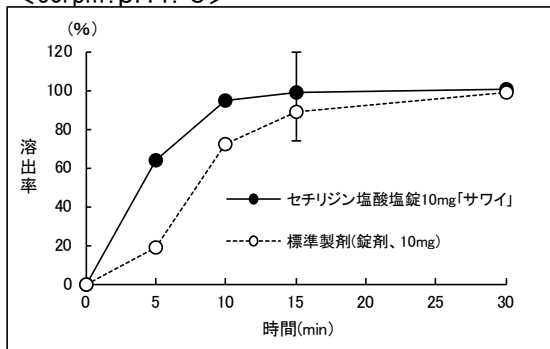
IV. 製剤に関する項目

(溶出曲線)

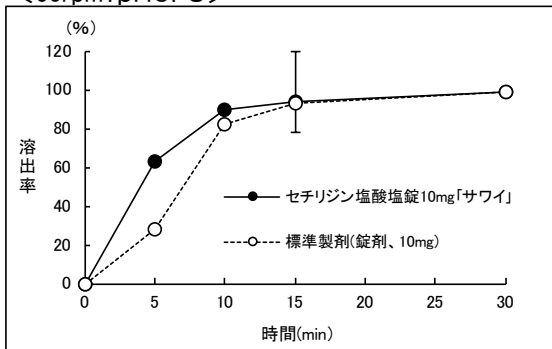
<50rpm:pH1. 2>



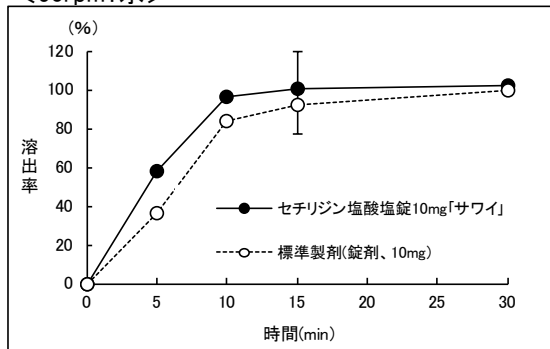
<50rpm:pH4. 0>



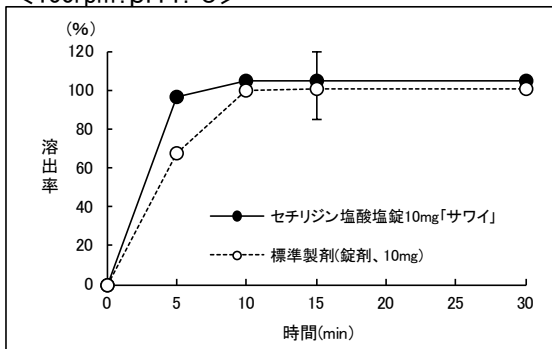
<50rpm:pH6. 8>



<50rpm:水>



<100rpm:pH4. 0>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

●セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」<sup>12)</sup>

通知等	「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、3.0、6.8、水)、100rpm(pH6.8)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」(2錠)	
標準製剤	セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH3. 0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<100rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

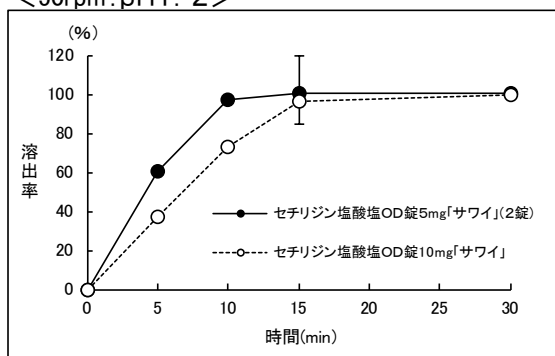
最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

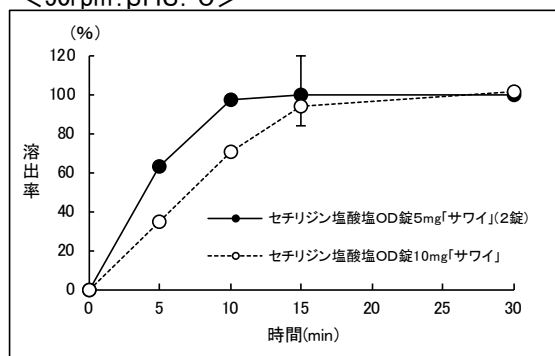
本剤の処方変更水準はB水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。

(溶出曲線)

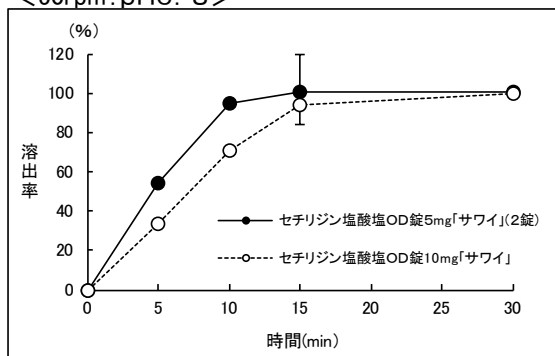
<50rpm:pH1. 2>



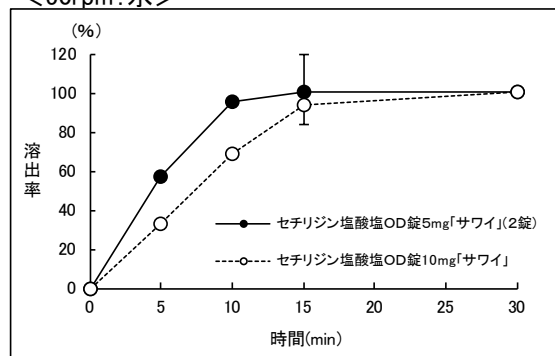
<50rpm:pH3. 0>



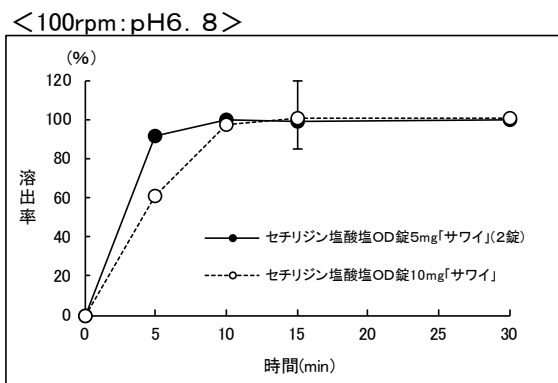
<50rpm:pH6. 8>



<50rpm:水>



IV. 製剤に関する項目



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」<sup>13, 14)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm (pH6.8)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH4.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

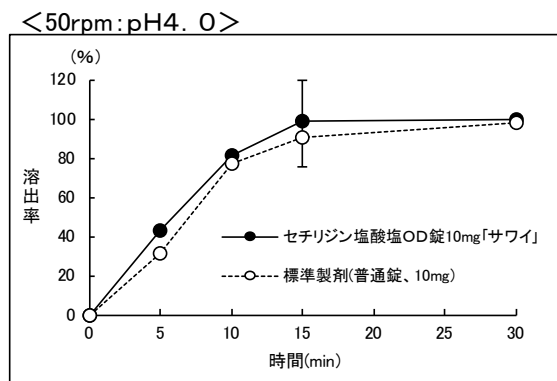
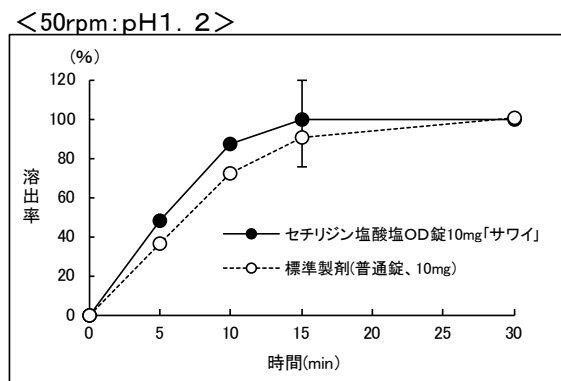
両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

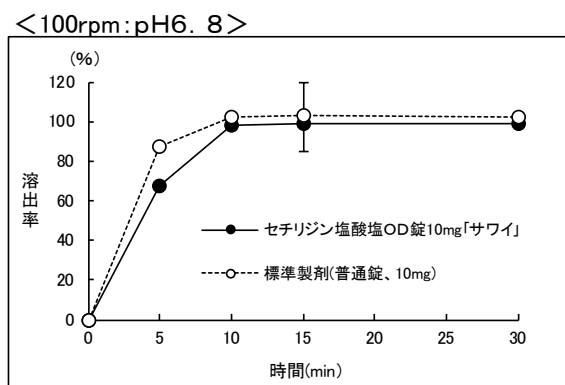
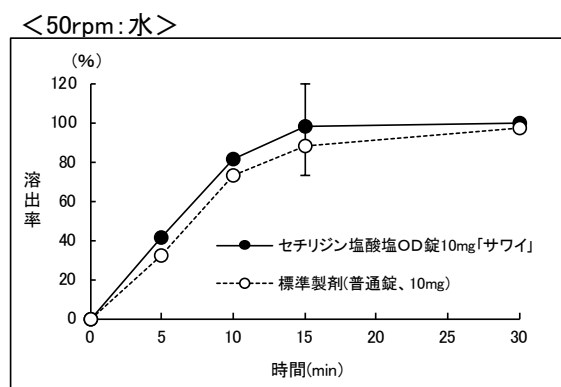
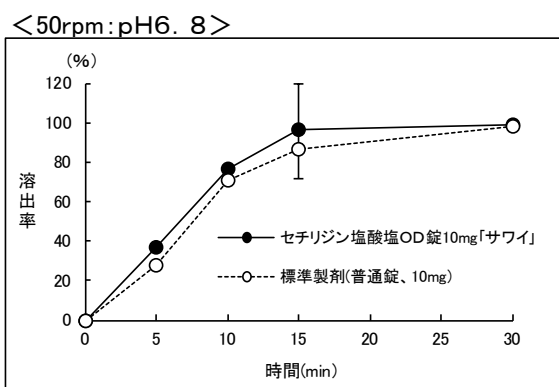
<100rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)





( [ ] : 判定基準の適合範囲)

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 .....

●セチリジン塩酸塩錠 5 mg/錠10mg「サワイ」

日局「セチリジン塩酸塩錠」の確認試験に準ずる。(紫外可視吸光度測定法)

●セチリジン塩酸塩OD錠 5 mg/OD錠10mg「サワイ」

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法 .....

●セチリジン塩酸塩錠 5 mg/錠10mg「サワイ」

日局「セチリジン塩酸塩錠」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)

●セチリジン塩酸塩OD錠 5 mg/OD錠10mg「サワイ」

液体クロマトグラフィー

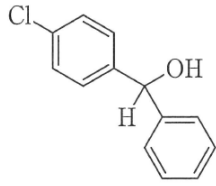
11. 力価 .....

該当しない

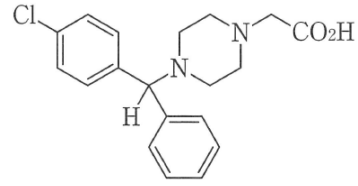
IV. 製剤に関する項目

12. 混入する可能性のある夾雑物 .....

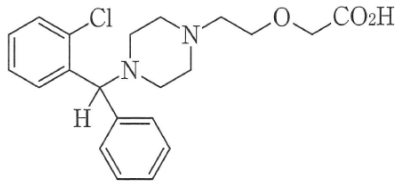
有効成分に混在が予想される類縁物質には〔1〕～〔5〕などがある。<sup>1)</sup>



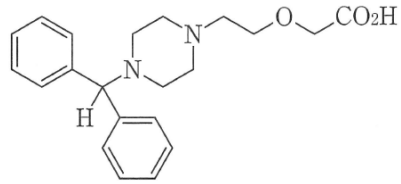
〔1〕



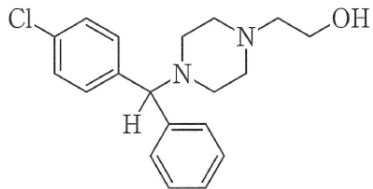
〔2〕



〔3〕



〔4〕



〔5〕

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....

該当資料なし

14. その他 .....

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

<セチリジン塩酸塩錠 5mg/OD錠 5mg「サワイ」>

[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

<セチリジン塩酸塩錠10mg/OD錠10mg「サワイ」> [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

### 2. 用法及び用量

<セチリジン塩酸塩錠 5mg/OD錠 5mg「サワイ」>

[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。

<セチリジン塩酸塩錠10mg/OD錠10mg「サワイ」> [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。

#### <用法及び用量に関連する使用上の注意>

- 1) 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・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。

[OD錠 5mg/OD錠10mgのみ]

- 2) 本剤は口腔内で崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込むこと。(「適用上の注意」の項参照)

## V. 治療に関する項目

### 3. 臨床成績

#### 1) 臨床データパッケージ

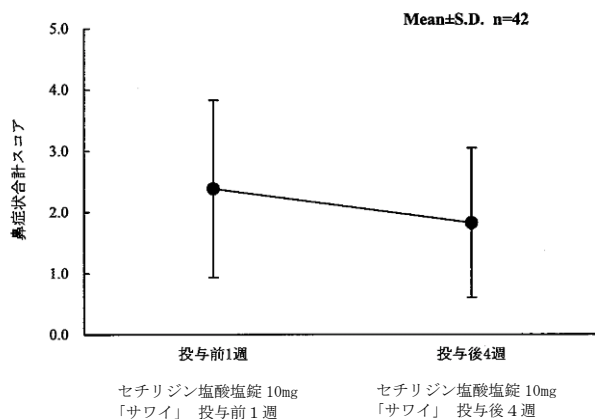
該当しない

#### 2) 臨床効果

標準製剤を4週以上使用している通年性又は季節性アレルギー性鼻炎患者42例を対象として、セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」に切り替えた際の有効性及び安全性を群内比較で検討した。その結果、

- 1) 主要評価項目である鼻症状(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉)の合計スコアについて、非劣性検定の結果、セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」は標準製剤と同等の効果が認められた。
- 2) 副次的評価項目である自覚症状(咽頭痛、涙目、頭重)スコア、鼻局所所見(下鼻甲介粘膜の腫脹、水性分泌量)スコア及び日常生活の支障度スコアにおいても、セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」は標準製剤と同等の効果が認められた。
- 3) 安全性については、副作用として軽度の「眠気」が42例中1件1例(2.4%)に発現したほか、特に問題となる事象は認められなかった。

以上の結果より、本剤は標準製剤と治療学的に同等と判断された。<sup>2)</sup>



【鼻症状(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉)の合計スコアの推移】

#### 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

V. -3. -2) 参照

(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

該当しない

---

## 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……………

H<sub>1</sub>受容体拮抗薬：ロラタジン、フェキソフェナジン塩酸塩等

2. 薬理作用……………

セチリジン塩酸塩の薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

セチリジンはヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗剤であり、末梢H<sub>1</sub>受容体に選択的に結合しアレルギー反応を抑制する。また、好酸球遊走抑制及びロイコトリエン産生抑制の作用も有する。

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

作用持続時間：12～24時間<sup>15)</sup>

## VII. 薬物動態に関する項目

セチリジン塩酸塩製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

## 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

VII. -1. -3) 参照

## 3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●セチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」<sup>9, 16)</sup>

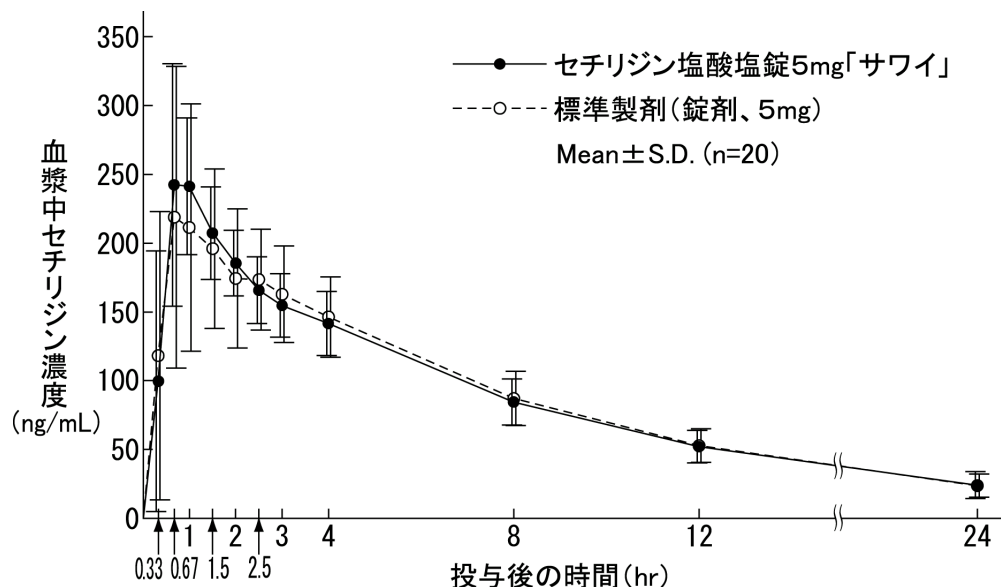
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、2.5、3、4、8、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

セチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠（セチリジン塩酸塩として5mg）空腹時単回経口投与（クロスオーバー法）し、血漿中セチリジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> (ng・hr/mL)
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「サワイ」	276±57	0.9±0.3	8.6±1.4	1862±334
標準製剤（錠剤、5mg）	278±49	0.9±0.5	8.6±1.9	1873±333

(Mean±S.D.)



VII. 薬物動態に関する項目

●セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」<sup>9, 17)</sup>

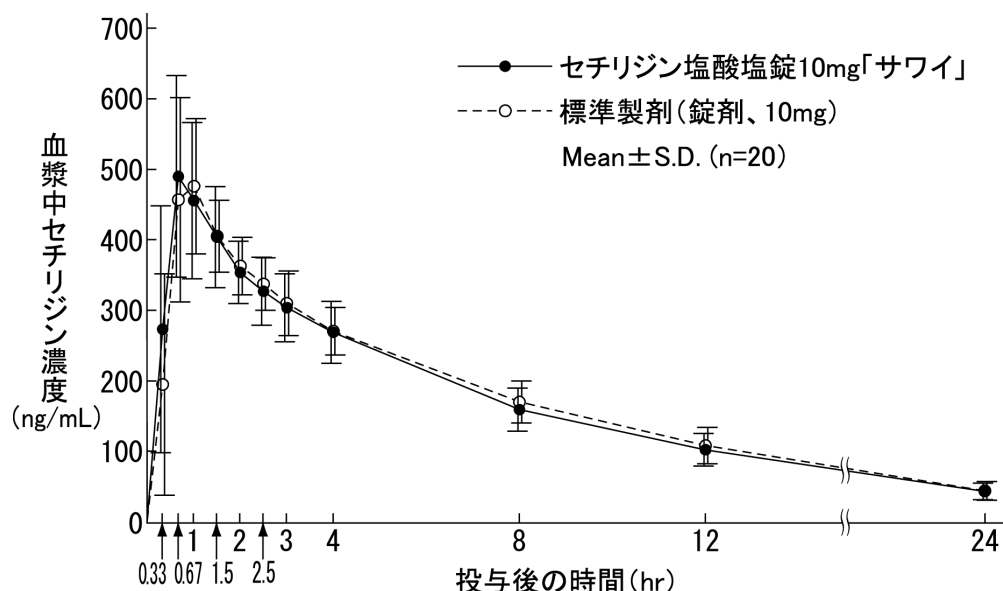
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、2.5、3、4、8、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(セチリジン塩酸塩として10mg) 空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中セチリジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> (ng・hr/mL)
セチリジン塩酸塩錠10mg 「サワイ」	530±92	0.9±0.6	8.8±1.2	3635±550
標準製剤(錠剤、10mg)	527±90	0.9±0.3	8.4±1.7	3719±572

(Mean±S.D.)



●セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」<sup>12)</sup>

セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成18年11月24日付 薬食審査発第1124004号)」に基づき、セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。(IV. -7. 参照)

●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」<sup>13, 18)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、10、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

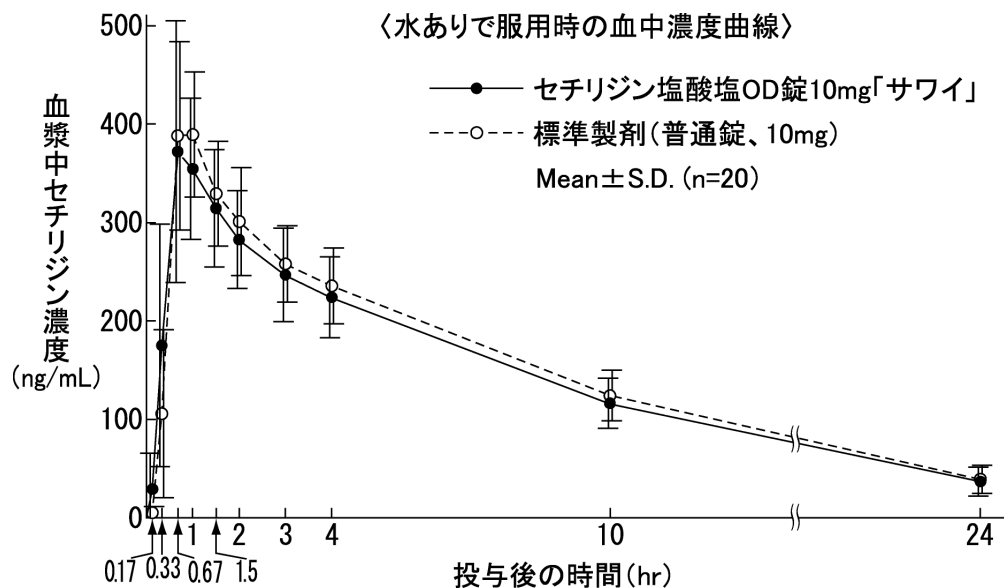
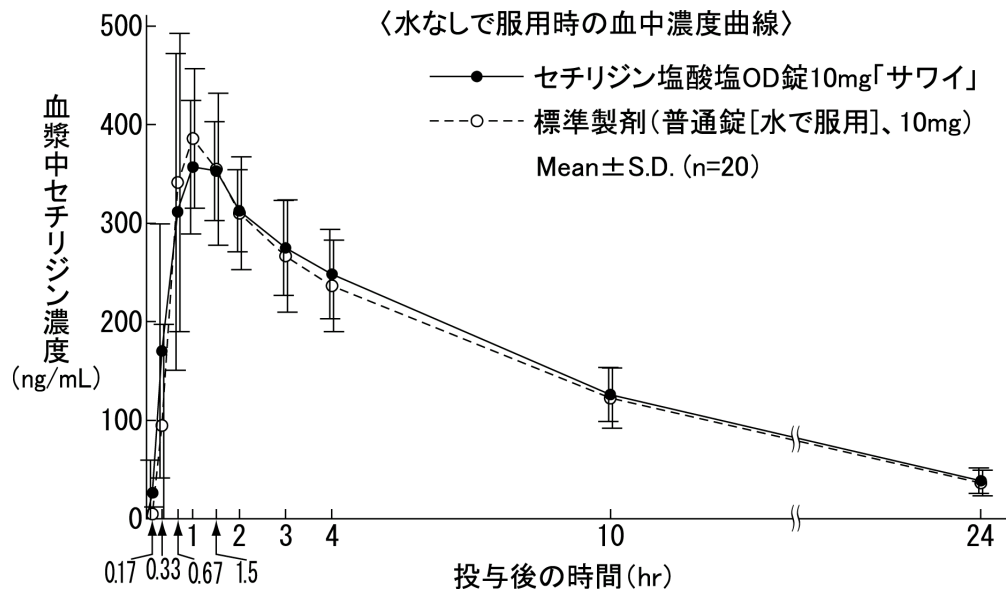
セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」(水なし又は水で服用)と標準製剤[普通錠](水で服用)を健康成人男子にそれぞれ1錠(セチリジン塩酸塩として10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中セチリジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> (ng・hr/mL)
※ 水なし	セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」	405±75	1.0±0.4	7.5±1.1	3384±639
	標準製剤(普通錠、10mg)	426±84	1.0±0.4	7.4±1.0	3280±701
水あり	セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」	412±78	0.9±0.4	7.9±1.4	3152±574
	標準製剤(普通錠、10mg)	422±61	0.9±0.3	7.8±1.3	3304±581

※標準製剤は水で服用

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびに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。

## VII. 薬物動態に関する項目

### 4) 中毒域

該当資料なし

### 5) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 参照

### 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

●セチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠 (セチリジン塩酸塩として 5mg) 空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>9,16)</sup>

$$0.082 \pm 0.013 \text{hr}^{-1}$$

●セチリジン塩酸塩錠 10mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠 (セチリジン塩酸塩として 10mg) 空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>9,17)</sup>

$$0.081 \pm 0.011 \text{hr}^{-1}$$

●セチリジン塩酸塩 OD 錠 10mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠 (セチリジン塩酸塩として 10mg) 空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>13,18)</sup>

$$[\text{水なし}] 0.095 \pm 0.015 \text{hr}^{-1}、[\text{水あり}] 0.090 \pm 0.013 \text{hr}^{-1}$$

### 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

92%<sup>1)</sup>

3. 吸収 .....
- 消化管より速やかに吸収される。<sup>4)</sup>
- セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」
- セチリジン塩酸塩の口腔粘膜からの吸収性を検討するために、口腔粘膜吸収試験を行った。その結果、セチリジン塩酸塩は口腔粘膜から吸収されないものと判定された。<sup>19)</sup>
4. 分布 .....
- 1) 血液—脳関門通過性
 

ほとんど通過しない<sup>15)</sup>
  - 2) 血液—胎盤関門通過性
 

<参考>動物実験(ラット)で胎盤を通過することが報告されている。
  - 3) 乳汁への移行性
 

ヒト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
 

ごく一部が酸化的O-脱アルキル化を受ける。<sup>20)</sup>
  - 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
 

肝初回通過効果の程度は低い。<sup>20)</sup>
  - 4) 代謝物の活性の有無及び比率
 

酸化的O-脱アルキル体のごくわずかな抗ヒスタミン作用を示す。<sup>20)</sup>
  - 5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
 

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

6. 排泄 .....

1) 排泄部位及び経路

主として腎臓から排泄される。

2) 排泄率

24時間後までに約50%が未変化体として尿中に排泄される。<sup>1)</sup>

3) 排泄速度

VII. -6. -2) 参照

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 .....

10mg投与したとき、10%以下が血液透析により除去される。<sup>20)</sup>



## 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. -2. 参照

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。(「用法及び用量に関連する使用上の注意」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。(「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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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、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	併用により、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

<p>1) 重大な副作用(頻度不明)</p> <p>(1) <b>ショック、アナフィラキシー</b>：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。</p> <p>(2) <b>痙攣</b>：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。</p> <p>(3) <b>肝機能障害、黄疸</b>：AST(GOT)、ALT(GPT)、<math>\gamma</math>-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。</p> <p>(4) <b>血小板減少</b>：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。</p>
--

## 3) その他の副作用

## 2) 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

## 1) 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) 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

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 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

- 1) 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。
- 2) 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

- 1) 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、更には穿孔をお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)  
[OD錠5mg/OD錠10mgのみ]
- 2) 服用時：
  - (1) 本剤は舌の上への唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。
  - (2) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	劇薬

## 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

## 3. 貯法・保存条件

- セチリジン塩酸塩錠 5 mg/錠10mg「サワイ」

室温保存

- セチリジン塩酸塩OD錠 5 mg/OD錠10mg「サワイ」

室温保存

開封後は湿気を避けて保存すること

## 4. 薬剤取扱い上の注意点

- 1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

- 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)

くすりのしおり：有り

VIII. -6. 及びVIII. -14. 参照

- 3) 調剤時の留意点について

該当しない

## 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「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

- セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、140錠(14錠×10)、500錠(10錠×50)

X. 管理的事項に関する項目

●セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

7. 容器の材質

●セチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔、  
[ピロー]ポリエチレンフィルム

●セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔、  
[ピロー]ポリエチレンフィルム

●セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔、  
[ピロー]アルミラミネートフィルム

●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔、  
[ピロー]アルミラミネートフィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ジルテック錠5/錠10/ドライシロップ1.25%

同効薬：ロラタジン、フェキソフェナジン塩酸塩等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

●セチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2007年3月15日、承認番号：21900AMX00471000

●セチリジン塩酸塩錠10mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2007年3月15日、承認番号：21900AMX00472000

●セチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2010年1月15日、承認番号：22200AMX00123000

●セチリジン塩酸塩OD錠10mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2010年1月15日、承認番号：22200AMX00124000



11. 薬価基準収載年月日 .....

- セチリジン塩酸塩錠 5 mg/錠10mg「サワイ」：2007年 7 月 6 日
- セチリジン塩酸塩OD錠 5 mg/OD錠10mg「サワイ」：2010年 5 月28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 .....

セチリジン塩酸塩錠 5 mg/OD錠 5 mg「サワイ」  
 承認年月日：2013年 9 月26日  
 効能・効果内容：小児に対する効能・効果を追加した。  
 用法・用量内容：効能・効果追加に伴い、関連の用法・用量を追加した。

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(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード .....

品名	HOT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 5 mg「サワイ」	117973601	4490020F1225	620005455
セチリジン塩酸塩 錠10mg「サワイ」	117990301	4490020F2221	620005483
セチリジン塩酸塩 OD錠 5 mg「サワイ」	119923901	4490020F3023	621992301
セチリジン塩酸塩 OD錠10mg「サワイ」	119924601	4490020F4020	621992401

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。

---

## XI . 文 献

---

1. 引用文献 .....
- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十七改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016, C-2553 -C-2557.
  - 2) 道下秀雄他, アレルギーの臨床, **27**(13), 1051(2007).
  - 3) 日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集, No. 27, 薬事日報社, 2007, p. 173.
  - 4) Martindale : The Complete Drug Reference 35<sup>th</sup> edition, 2007, p.515-516.
  - 5)～8) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
  - 9) 坂田之訓他, 診療と新薬, **44**(5), 510(2007).
  - 10)～12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
  - 13) 竹内譲他, 診療と新薬, **47**(3), 286(2010).
  - 14) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
  - 15) 高折修二他監訳, グッドマン・ギルマン薬理書, 第12版, 廣川書店, 2013, p. 1171-1179.
  - 16)～18) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]
  - 19) 沢井製薬(株) 社内資料[薬物動態学的試験]
  - 20) American Society of Health-System Pharmacists, AHFS Drug Information, 2011, p. 26-32.
2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....

2. 海外における臨床支援情報 .....

該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

その他の関連資料 .....

