

# 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 2008 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「NPI」**

**セチリジン塩酸塩錠10mg「NPI」**

**Cetirizine**

剤形	錠剤（フィルムコーティング錠）
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	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）
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
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本薬品工業株式会社 安全管理課 TEL. 03-5833-5011/FAX. 03-5833-5100 受付時間：9:00～17:00（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.npi-inc.co.jp/medical.html">http://www.npi-inc.co.jp/medical.html</a>

本 IF は 2012 年 12 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.info.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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

### 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 判、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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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、今後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。

(2008 年 9 月)

## I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯 …………… 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 …………… 1

## II. 名称に関する項目

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

## III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 …………… 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …………… 4
3. 有効成分の確認試験法 …………… 4
4. 有効成分の定量法 …………… 5

## IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 …………… 6
2. 製剤の組成 …………… 6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 …………… 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 …………… 7
5. 調整法及び溶解後の安定性 …………… 10
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化） …………… 10
7. 溶出性 …………… 11
8. 生物学的試験法 …………… 12
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 …………… 12
10. 製剤中の有効成分の定量法 …………… 12
11. 力価 …………… 12
12. 混入する可能性のある夾雑物 …………… 12
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 …………… 12
14. その他 …………… 12

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 …………… 13
2. 用法及び用量 …………… 13
3. 臨床成績 …………… 13

## VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …………… 15
2. 薬理作用 …………… 15

## VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法 …………… 16
2. 薬物速度論的パラメータ …………… 17
3. 吸収 …………… 18
4. 分布 …………… 18
5. 代謝 …………… 18
6. 排泄 …………… 18
7. 透析等による除去率 …………… 19

## 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 …………… 20
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） …………… 20
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 …………… 20
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 …………… 20
5. 慎重投与内容とその理由 …………… 20
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 …………… 21
7. 相互作用 …………… 21
8. 副作用 …………… 21
9. 高齢者への投与 …………… 22
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 …………… 23
11. 小児等への投与 …………… 23
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 …………… 23
13. 過量投与 …………… 23
14. 適用上の注意 …………… 23
15. その他の注意 …………… 23
16. その他 …………… 23

## IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 …………… 24
2. 毒性試験 …………… 24

## X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分 …………… 25
2. 有効期間又は使用期限 …………… 25
3. 貯法・保存条件 …………… 25
4. 薬剤取扱い上の注意点 …………… 25
5. 承認条件等 …………… 25
6. 包装 …………… 25
7. 容器の材質 …………… 25
8. 同一成分、同効薬 …………… 25
9. 国際誕生年月日 …………… 25
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 …………… 26
11. 薬価基準収載年月日 …………… 26
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 …………… 26
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 …………… 26
14. 再審査期間 …………… 26
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 …………… 26
16. 各種コード …………… 26
17. 保険給付上の注意 …………… 26

## X I. 文献

1. 引用文献 …………… 27
2. その他の参考文献 …………… 27

## X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 …………… 27
2. 海外における臨床支援情報 …………… 27

## X III. 備考

- その他の関連資料 …………… 27

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

セチリジン塩酸塩は、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り、セチリジン塩酸塩錠 5mg/10mg「NPI」は、日本薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、医薬発第 481 号(平成 11 年 4 月 8 日)に基づき、規格及び試験法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、平成 19 年 7 月に承認を得て、平成 19 年 11 月に発売に至った。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1)選択的なH<sub>1</sub>受容体拮抗作用によりアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症に効果を示します。
- (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ます。
- (3)重大な副作用としてショック、アナフィラキシー様症状、痙攣、肝機能障害、黄疸、血小板減少があらわれることがあります。(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」 + 「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）

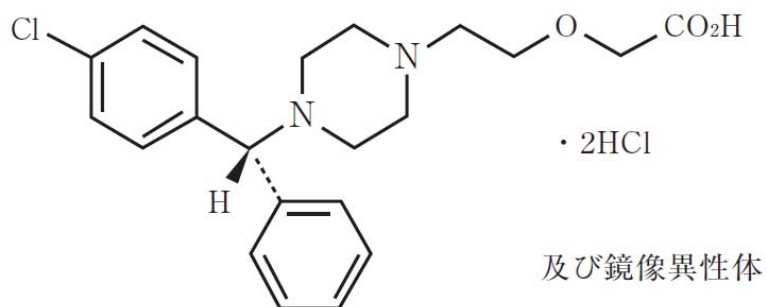
Cetirizine（INN）

#### (3)ステム

ジフェニルメチルピペラジン誘導体：-izine

### 3. 構造式又は示性式

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）

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

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

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である。

##### (2) 溶解性

日局表現	溶媒
極めて溶けやすい	水
溶げにくい	エタノール (99.5)

本品は 0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

##### 溶解度(37°C)<sup>1)</sup>

液性	
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<sup>1)</sup>

$pK_{a1}$  : 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

本品の水溶液(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<sup>1)</sup>

水	0.02%溶液は、37°C、12時間は安定である。
液性 (pH)	0.02%溶液は、pH1~12、37°C、12時間は安定である。
光	なし
その他	なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「セチリジン塩酸塩」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



#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方「セチリジン塩酸塩」定量法による  
電位差滴定法







## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、規格及び性状

セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」：白色のフィルムコーティング錠である。

セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」：白色のフィルムコーティング錠である。

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

#### (2) 製剤の物性

硬度：「IV-4.製剤の各種条件下における安定性」の項参照

#### (3) 識別コード

セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」：錠剤表面に NPI 102

セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」：錠剤表面に NPI 103

#### (4) pH、浸透圧比、粘土、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

#### (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

各種条件下における安定性<sup>2)</sup>

##### 1) 加速試験

最終包装製品(PTP)を用いた加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、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。

<セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」>

	規格	試験開始時	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	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
確認試験	(1)、(2)	適	適	適	適
含量均一性	日局一般試験法の含量均一性試験	適	適	適	適
溶出試験	局外規溶出試験	適	適	適	適
定量 (%)	表示量の95.0～105.0%を含む	100.1 99.1 99.7	100.4 100.2 100.3	100.4 99.5 100.3	100.6 100.2 99.8

(3ロット、各ロットn=3)

確認試験 (1) 沈殿反応：淡赤色の沈殿を生じる

(2) 吸収極大：波長 230～234nm に吸収の極大を示す

<セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」>

	規格	試験開始時	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	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
確認試験	(1)、(2)	適	適	適	適
含量均一性	日局一般試験法の含量均一性試験	適	適	適	適
溶出試験	局外規溶出試験	適	適	適	適
定量 (%)	表示量の95.0～105.0%を含む	99.1 99.6 100.0	98.6 100.9 100.0	100.0 99.8 99.8	101.3 99.5 99.5

(3ロット、各ロットn=3)

確認試験 (1) 沈殿反応：淡赤色の沈殿を生じる

(2) 吸収極大：波長 230～234nm に吸収の極大を示す

## 2)無包装安定性試験

セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」及びセチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」の無包装状態における安定性を 期間3ヵ月、温度：25±1℃、湿度：75±5%RH 遮光・開放の条件下で行った。すべての項目において品質の低下は認められず、安定であった。

### <セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」>

試験項目	判定基準	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
外観	白色のFC錠	白色のFC錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	—	7.3kg (100.0%)	4.6kg (63.0%)	5.6kg (76.7%)	5.5kg (75.3%)
溶出(%)	15分 85%以上	102.4% 94.5% 102.4% 93.9% 102.4% 99.0%	94.5% 101.7% 99.5% 101.2% 96.7% 101.7%	90.8% 102.8% 93.6% 101.2% 95.2% 96.3%	94.5% 98.4% 99.5% 97.8% 90.1% 101.2%
含量(%)	95.0~ 105.0%	98.1% (100.0%)	97.0% (98.9%)	96.3% (98.2%)	97.8% (99.7%)

※含量 n=3、溶出 n=6、硬度 n=10

( ) 内は開始時を 100%として換算した数値

※含量及び硬度は平均値を記載

### <セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」>

試験項目	判定基準	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
外観	白色のFC錠	白色のFC錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	—	6.6kg (100.0%)	5.8kg (87.9%)	6.4kg (97.0%)	6.4kg (97.0%)
溶出(%)	30分 80%以上	103.6% 99.1% 103.6% 99.6% 100.8% 99.6%	99.9% 102.1% 99.3% 101.0% 98.3% 99.3%	100.4% 101.0% 99.3% 104.3% 105.9% 101.5%	99.5% 97.8% 96.1% 96.1% 99.5% 98.3%
含量(%)	95.0~ 105.0%	98.5% (100.0%)	97.4% (98.9%)	97.7% (99.2%)	97.2% (98.7%)

※含量 n=3、溶出 n=6、硬度 n=10

( ) 内は開始時を 100%として換算した数値

※含量及び硬度は平均値を記載

### 3)温度安定性試験

セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」及びセチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」の温度安定性試験を、無包装状態（遮光・気密ガラス瓶）、期間3ヵ月、温度：40±2℃の条件下で行った。すべての項目において品質の低下は認められず、安定であった。

#### <セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」>

試験項目	判定基準	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
外観	白色のFC錠	白色のFC錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	—	7.3kg (100.0%)	7.3kg (100.0%)	8.0kg (109.6%)	7.8kg (106.8%)
溶出(%)	15分 85%以上	102.4% 94.5% 102.4% 93.9% 102.4% 99.0%	96.8% 105.3% 100.8% 103.0% 100.8% 100.8%	101.2% 99.5% 101.7% 98.4% 102.3% 97.4%	101.2% 97.3% 100.1% 102.3% 102.3% 97.8%
含量(%)	95.0~ 105.0%	98.1% (100.0%)	98.1% (100.0%)	96.0% (97.9%)	96.9% (98.8%)

※含量 n=3、溶出 n=6、硬度 n=10

( ) 内は開始時を 100%として換算した数値

※含量及び硬度は平均値を記載

#### <セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」>

試験項目	判定基準	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
外観	白色のFC錠	白色のFC錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	—	6.6kg (100.0%)	8.0kg (121.2%)	8.5kg (128.8%)	8.3kg (125.8%)
溶出(%)	30分間 80%以上	103.6% 99.1% 103.6% 99.6% 100.8% 99.6%	98.2% 97.7% 102.1% 99.3% 97.7% 99.9%	97.7% 98.8% 97.1% 93.8% 98.2% 101.0%	101.2% 97.3% 96.1% 98.4% 98.4% 95.6%
含量(%)	95.0~ 105.0%	98.5% (100.0%)	97.5% (99.0%)	97.5% (99.0%)	96.2% (97.7%)

※含量 n=3、溶出 n=6、硬度 n=10

( ) 内は開始時を 100%として換算した数値

※含量及び硬度は平均値を記載

#### 4) 光安定性試験

光に対する安定性を無包装 1000Lux、24hr 照射/日 保存期間 25 日（総照度 60 万 Lux・hr）  
温度・湿度なりゆき・気密ガラス瓶（無色）の条件下で行った。

##### <セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」>

60 万 Lux・hr 曝露後、外観においてわずかに着色（微褐色）が認められたが、その他の項目については安定であり、品質上特に問題ないと判断された。

試験項目	判定基準	開始時	60 万 Lux・hr
外観	白色の FC 錠	白色の FC 錠	微褐色に変化
硬度(kg)	—	7.3kg (100.0%)	7.4kg (101.4%)
溶出(%)	15 分 85%以上	102.4% 94.5% 102.4% 93.9% 102.4% 99.0%	96.0% 96.6% 99.3% 94.9% 97.7% 99.9%
含量(%)	95.0~105.0%	98.1% (100.0%)	97.8% (99.7%)

※含量 n=3、溶出 n=6、硬度 n=10

( ) 内は開始時を 100%として換算した数値

※含量及び硬度は平均値を記載

##### <セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」>

60 万 Lux・hr 曝露後、外観においてわずかに着色（微褐色）が認められたが、その他の項目については安定であり、品質上特に問題ないと判断された。

試験項目	判定基準	開始時	60 万 Lux・hr
外観	白色の FC 錠	白色の FC 錠	微褐色に変化
硬度(kg)	—	6.6kg (100.0%)	7.5kg (113.6%)
溶出(%)	30 分 80%以上	103.6% 99.1% 103.6% 99.6% 100.8% 99.6%	99.3% 97.7% 100.4% 95.5% 99.9% 94.4%
含量(%)	95.0~105.0%	98.5% (100.0%)	97.2% (98.7%)

※含量 n=3、溶出 n=6、硬度 n=10

( ) 内は開始時を 100%として換算した数値

※含量及び硬度は平均値を記載

#### 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<sup>3)</sup>

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、日本薬局方外医薬品規格第3部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。

回転数：50rpm(パドル法)

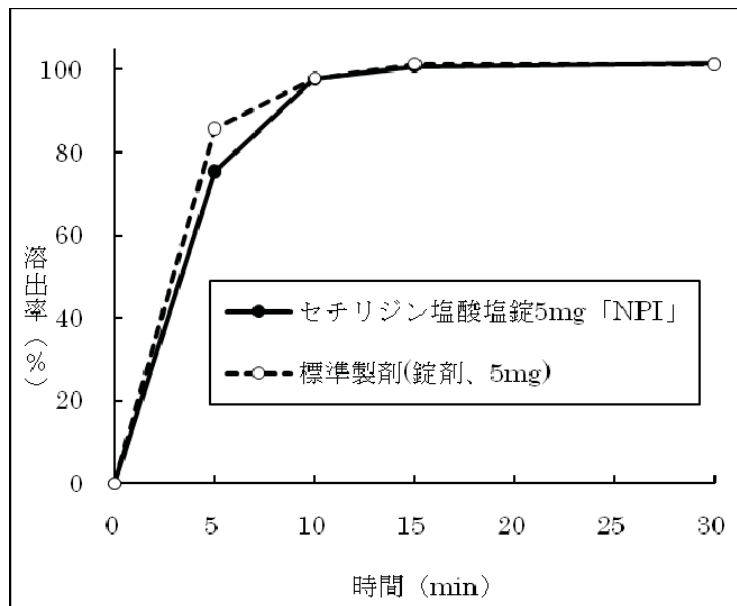
試験液：水

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

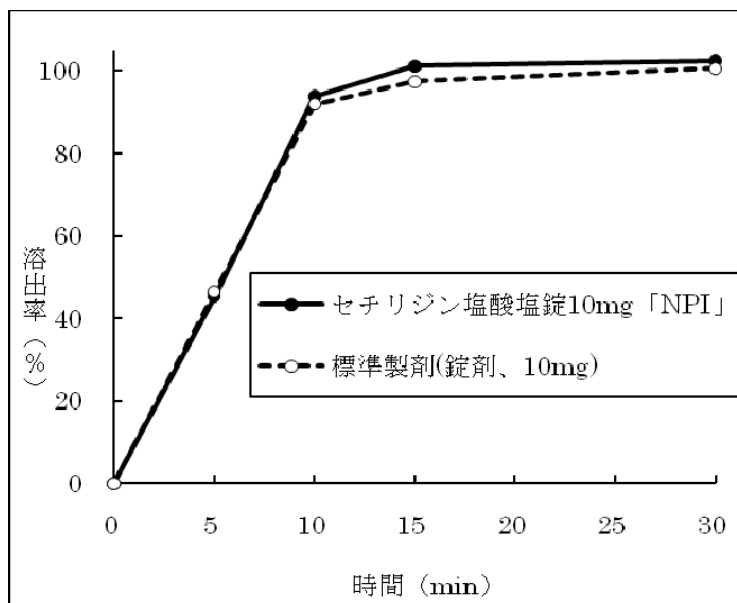
セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」の溶出曲線

標準製剤：(錠剤、5mg)



セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」の溶出曲線

標準製剤：(錠剤、10mg)



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

日本薬局方「セチリジン塩酸塩錠」確認試験による  
紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方「セチリジン塩酸塩錠」定量法による  
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. 治療上注意が必要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

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症

### 2. 用法及び用量

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>

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

### 3. 臨床成績

#### (1)臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

該当しない

#### (2)臨床効果

該当資料なし

#### (3)臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (4)探索的試験：用量反応探索試験

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・特別使用成績調査（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

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>受容体拮抗剤

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>4)</sup>

セチリジン塩酸塩はH<sub>1</sub>受容体遮断薬であり、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。また、抗コリン作用はほとんどない。

#### (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<sup>5)</sup>

健康成人男子に本剤 5mg(n=20)を絶食単回投与したときの T<sub>max</sub> は 1.25±0.41 時間であった。

健康成人男子に本剤 10mg(n=20)を絶食単回投与したときの T<sub>max</sub> は 1.18±0.37 時間であった。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

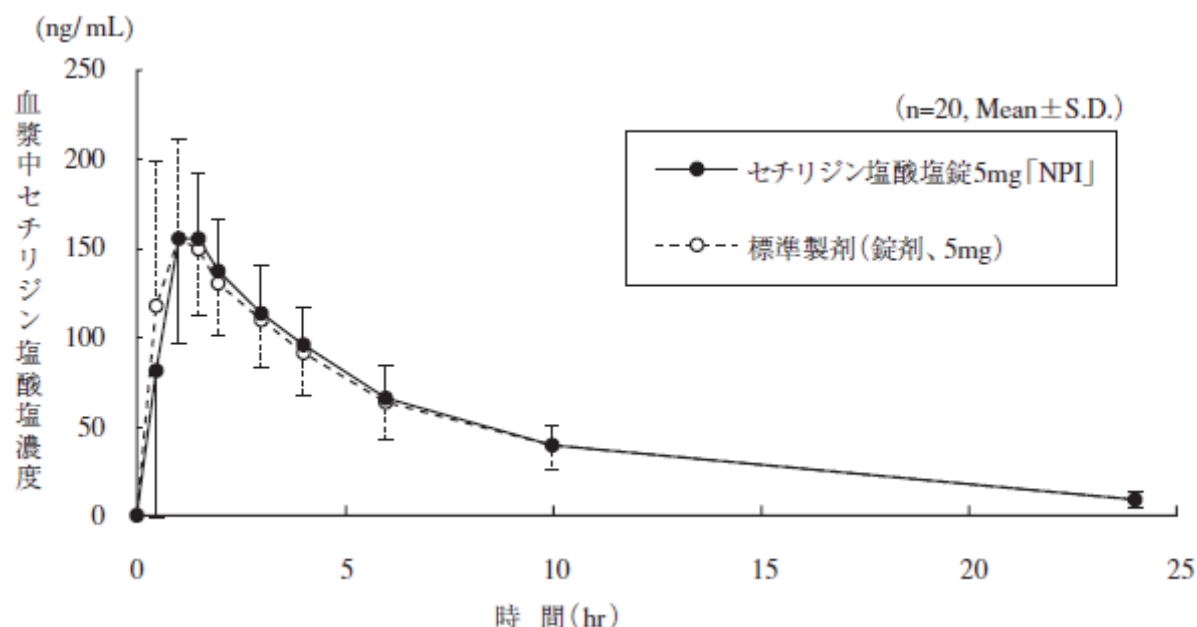
生物学的同等性試験<sup>5)</sup>

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、C<sub>max</sub>)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。

#### 1) セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」

製品名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→24</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (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

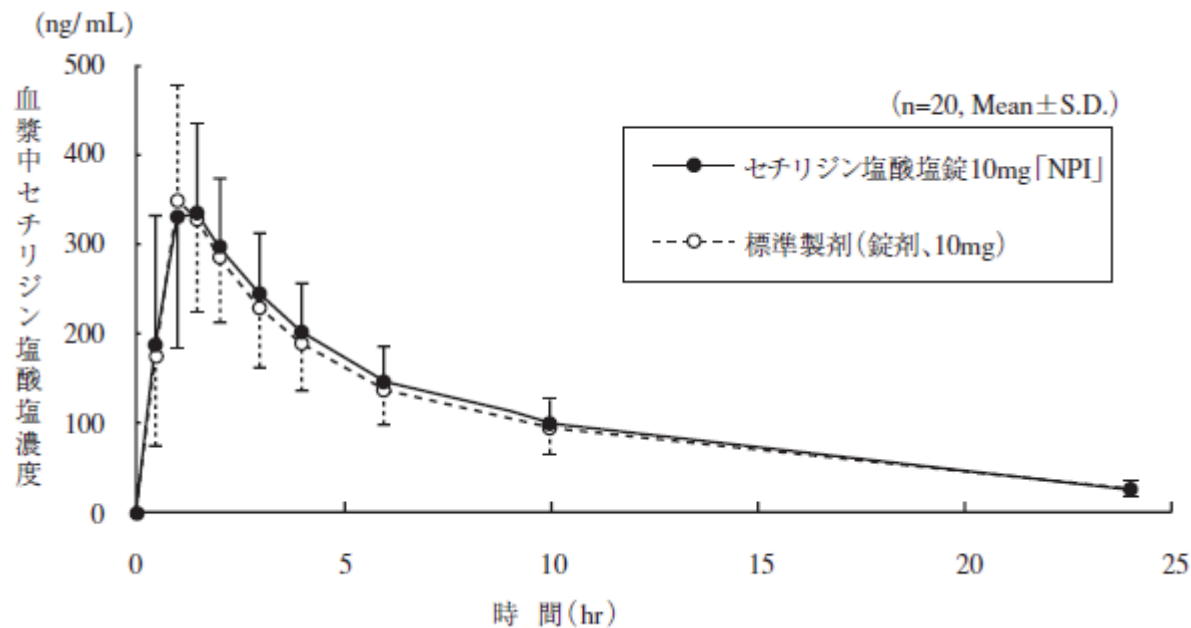
(平均値±標準偏差、n=20)



2) セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」

製品名	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「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

(平均値±標準偏差、n=20)



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

(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)コンパートメントモデル

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

「VIII-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(1)」の項参照

(3) 乳汁中への移行性

「VIII-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)」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

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

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

- (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

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

### 5. 慎重投与内容とその理由

- (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

- (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。
- (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

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

- 1) ショック、アナフィラキシー様症状 (頻度不明)  
ショック、アナフィラキシー様症状(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 (頻度不明)  
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 (頻度不明)  
AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -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（頻度不明）

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

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
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、瘙痒感、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

「VIII-2.禁忌とその理由」、「VIII-8.副作用(2)重大な副作用と初期症状」、「VIII-8.副作用(3) その他の副作用」の項参照

### 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

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(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

該当なし

#### 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 5mg 「NPI」 該当しない

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」 該当しない

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：製造後 3 年

### 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) 薬局での取り扱いについて

「VIII-14.適用上の注意」の項参照

#### (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII-6.重大な基本的注意とその理由及び処置方法」、「VIII-14.適用上の注意」の項参照

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」：100 錠（10 錠×10）

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「NPI」：100 錠（10 錠×10）、500 錠（10 錠×50）

### 7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニフィルム、アルミニウム箔

ピロー(又は内袋)：ポリエチレン・ポリプロピレン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、ジルテック錠 10、ジルテックドライシロップ 1.25%

同効薬：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>受容体拮抗剤

### 9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造承認年月日：2007年7月11日

承認番号：

セチリジン塩酸塩錠 5mg「NPI」：21900AMX01013000

セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」：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

該当しない

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」	118208801	4490020F1314	620005871
セチリジン塩酸塩錠 10mg「NPI」	118209501	4490020F2310	620005872

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発品医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) (財)日本公定書協会編：医療用医薬品品質情報集(Orange Book No.27)
- 2) 日本薬品工業株式会社：安定性に関する資料（社内資料）
- 3) 日本薬品工業株式会社：溶出に関する資料（社内資料）
- 4) 第十六改正日本薬局方解説書 C-2281、廣川書店、東京 2011
- 5) 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16改正 日本薬局方

The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names (INN) for pharmaceutical substances, 2011

## XII. 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

該当しない

## XIII. 備考

その他関連資料