

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

セチリジン塩酸塩錠5mg「タカタ」

セチリジン塩酸塩錠10mg「タカタ」

セチリジン塩酸塩DS1.25%「タカタ」

日本薬局方 セチリジン塩酸塩錠
シロップ用セチリジン塩酸塩
CETIRIZINE HYDROCHLORIDE

剤形	錠 5mg、錠 10mg : フィルムコーティング錠 DS1.25% : シロップ用剤		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	錠 5mg : 1錠中 セチリジン塩酸塩 5mg 錠 10mg : 1錠中 セチリジン塩酸塩 10mg DS1.25% : 1g中 セチリジン塩酸塩 12.5mg		
一般名	和名:セチリジン塩酸塩 [日局] 洋名:Cetirizine Hydrochloride		
製造販売承認年月日 薬価基準収載 発売年月日		錠 5mg、錠 10mg	DS1.25%
	製造販売承認年月日	2007年3月15日	2009年7月13日
	薬価基準収載	2007年7月6日	2009年11月13日
	発売年月日	2007年7月6日	2009年11月13日
開発・製造販売(輸入) ・提携・販売会社名	製造販売元:高田製薬株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社 学術部 TEL: 0120-989-813 FAX:048-816-4183 医療関係者向けホームページ http://www.takata-seiyaku.co.jp		

本IFは2016年10月改訂(第11版)(錠剤)、2016年10月改訂(第9版)(DS剤)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、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/>にてご確認ください。

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。
- ② IF 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	VII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	26
1. 開発の経緯.....	1	1. 警告内容とその理由.....	26
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）.....	26
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.....	26
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.....	26
2. 一般名.....	2	5. 慎重投与内容とその理由.....	26
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.....	26
4. 分子式及び分子量.....	2	7. 相互作用.....	26
5. 化学名（命名法）.....	3	8. 副作用.....	27
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	9. 高齢者への投与.....	29
7. CAS登録番号.....	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	29
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与.....	29
1. 物理化学的性質.....	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	29
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	4	13. 過量投与.....	29
3. 有効成分の確認試験法.....	4	14. 適用上の注意.....	29
4. 有効成分の定量法.....	4	15. その他の注意.....	29
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他.....	30
1. 剤形.....	5	IX. 非臨床試験に関する項目	31
2. 製剤の組成.....	6	1. 薬理試験.....	31
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意.....	6	2. 毒性試験.....	31
4. 製剤の各種条件下における安定性.....	6	X. 管理的事項に関する項目	32
5. 調製法及び溶解後の安定性.....	11	1. 規制区分.....	32
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.....	32
7. 溶出性.....	12	3. 貯法・保存条件.....	32
8. 生物学的試験法.....	15	4. 薬剤取扱い上の注意点.....	32
9. 製剤中の有効成分の確認試験法.....	15	5. 承認条件等.....	32
10. 製剤中の有効成分の定量法.....	15	6. 包装.....	32
11. 力価.....	15	7. 容器の材質.....	33
12. 混入する可能性のある夾雑物.....	15	8. 同一成分・同効薬.....	33
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報.....	15	9. 国際誕生年月日.....	33
14. その他.....	16	10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	33
V. 治療に関する項目	17	11. 薬価基準収載年月日.....	33
1. 効能又は効果.....	17	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.....	33
2. 用法及び用量.....	17	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	33
3. 臨床成績.....	18	14. 再審査期間.....	34
VI. 薬効薬理に関する項目	19	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	34
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群.....	19	16. 各種コード.....	34
2. 薬理作用.....	19	17. 保険給付上の注意.....	34
VII. 薬物動態に関する項目	20	XI. 文献	35
1. 血中濃度の推移・測定法.....	20	1. 引用文献.....	35
2. 薬物速度論的パラメータ.....	23	2. その他の参考文献.....	35
3. 吸収.....	23	XII. 参考資料	36
4. 分布.....	24	1. 主な外国での発売状況.....	36
5. 代謝.....	24	2. 海外における臨床支援情報.....	36
6. 排泄.....	24	XIII. 備考	36
7. トランスポーターに関する情報.....	24	1. その他の関連資料.....	36
8. 透析等による除去率.....	25		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

セチリジン塩酸塩は、アレルギー反応の即時相と遅発相の両相に作用し、即時相では、強く選択的な抗ヒスタミン作用と肥満細胞からのロイコトリエン遊離抑制作用によりアレルギーの諸症状を速やかに改善し、遅発相では、好酸球の遊走と活性化を抑制する選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

本邦では 1998 年 9 月に上市された。

セチリジン塩酸塩錠 5mg/10mg「タカタ」は、高田製薬(株) が後発医薬品として企画・開発し、医薬審第 481 号(1999 年 4 月 8 日)に従い、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 月に製造販売承認を得て、同年 7 月より発売している。

セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」は、高田製薬(株) が後発医薬品として企画・開発し、医薬審第 481 号(1999 年 4 月 8 日)に従い、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、2009 年 7 月に製造販売承認を得て、同年 11 月より発売している。

また、2013 年 11 月に色と味を改良した処方変更製剤の製造販売一部変更承認を取得し、発売している。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 即効性と持続性を併せ持ち強く選択的なヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用を示す。
- (2) アレルギー反応の遅発相における好酸球遊走を抑制し、好酸球における活性酸素の酸性を抑制する。
- (3) アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症に適応がある。
- (4) 1 日 1 回の投与で十分な効果を発揮する。
- (5) 主な副作用として、眠気、倦怠感、口渇、嘔気であらわれることがある。また、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、血小板減少であらわれることがある。
- (6) DS 剤は錠剤の服用が困難な場合に適する。
- (7) DS 剤は β -シクロデキストリンで苦味をマスキングし、イチゴミルク風味にしている。

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「タカタ」
セチリジン塩酸塩錠10mg「タカタ」
セチリジン塩酸塩DS1.25%「タカタ」

(2) 洋名

CETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets 5mg 「TAKATA」
CETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets 10mg 「TAKATA」
CETIRIZINE HYDROCHLORIDE DS 1.25% 「TAKATA」

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

セチリジン塩酸塩（JAN）

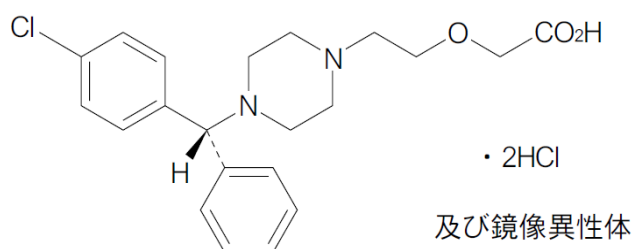
(2) 洋名（命名法）

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



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)phenylmethyl]piperazin-1-yl}ethoxy)acetic acid
dihydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

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

水に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくい。0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

水溶液(1→10)は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

日局「セチリジン塩酸塩」の確認試験による。

- (1) 紫外可視吸光光度法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法(KCl錠剤法)
- (3) 定性反応:塩化物の定性反応を呈する。

4. 有効成分の定量法







日局「セチリジン塩酸塩」の定量による。

本品を薄めたアセトン(7→10)に溶かし、0.1mol/L 水酸化ナトリウム液で滴定する。(電位差滴定法)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

品名	セチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「タカタ」	セチリジン塩酸塩 DS1.25% 「タカタ」
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	白色の微粒又は粉末で、特異 なおいがあり、味は甘い。
表面 直径 (mm)	 約 6.6	 約 7.1	
裏面 重さ (g)	 約 0.093	 約 0.119	
側面 厚さ (mm)	 約 2.9	 約 2.9	

(2) 製剤の物性

●錠 5 mg、10 mg^{1,2)}

硬度(自主規格):30N 以上

●DS1.25%³⁾

	メッシュサイズ	セチリジン塩酸塩 DS1.25% 「タカタ」
粒 度 分 布 (%)	18Mon	0.00
	30Mon	0.66
	42Mon	5.11
	50Mon	11.01
	60Mon	22.98
	83Mon	40.33
	100Mon	9.05
	140Mon	7.54
	200Mon	2.15
	200Mpass	1.15

(3) 識別コード

錠 5mg	TTS-400
錠 10mg	TTS-401

(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

錠 5mg	1錠中 セチリジン塩酸塩 5mg
錠 10mg	1錠中 セチリジン塩酸塩 10mg
DS1.25%	1g中 セチリジン塩酸塩 12.5mg

(2) 添加物

錠 5mg 錠 10mg	乳糖水和物、結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、カルナウバロウ
DS1.25%	乳糖水和物、クエン酸ナトリウム水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、β-シクロデキストリン、D-マンニトール、アセスルファムカリウム、香料

(3) その他

該当資料なし

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5mg/錠10mg「タカタ」は、最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、60%RH、36ヵ月)の結果、3年間安定であることが確認された。また、セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」は、加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、3年間安定であることが確認された。

(1) 長期保存試験 (25℃±2℃、60%RH±5%RH) ^{1,2)}

●錠 5mg

PTP包装

(3ロットの平均)

	開始時	12ヵ月後	24ヵ月後	36ヵ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠			
確認試験(UV)	適合	適合	適合	適合
溶出性(%)	98	97	96	96
定量(%)	100.2	96.8	96.4	98.5
残存率(%)	100	96.6	96.2	98.3

●錠 10mg

PTP 包装

(3 ロットの平均)

	開始時	12 ヶ月後	24 ヶ月後	36 ヶ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠			
確認試験(UV)	適合	適合	適合	適合
溶出性(%)	98	99	97	95
定量(%)	100.3	98.1	97.1	99.5
残存率(%)	100	97.8	96.8	99.2

●DS1.25%

長期保存試験は現在実施中。

(2) 加速試験 (40±1°C 75±5%RH) ^{1,2,4)}

●錠 5mg

PTP 包装

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠			
確認試験(1)	液は赤褐色を呈した			
確認試験(2)	標準溶液と同一波長のところに同様の強度の吸収を認めた			
溶出試験(%)	97.2	98.2	97.8	94.0
残存率(%)	100	100.3-101.1	100.5-100.8	100.0-101.2

●錠 10mg

PTP 包装

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠			
確認試験(1)	液は赤褐色を呈した			
確認試験(2)	標準溶液と同一波長のところに同様の強度の吸収を認めた			
溶出試験(%)	99.1	100.1	98.4	94.8
残存率(%)	100	99.4-101.7	99.5-100.9	98.8-100.4

バラ包装

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠			
確認試験(1)	液は赤褐色を呈した			
確認試験(2)	標準溶液と同一波長のところに同様の強度の吸収を認めた			
溶出試験(%)	99.1	100.1	98.3	96.4
残存率(%)	100	98.5-101.1	99.0-101.1	98.6-101.0

●DS1.25%

ポリエチレン瓶

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性 状	白色の微粒を含む粉末で、特異なおいがあり、味は甘い。			
確認試験(1)	適合	変化なし		
確認試験(2)	適合	変化なし		
pH	5.94~5.95	5.94~5.96	5.98	5.96
純度試験 類縁物質(%)	0.06	0.10~0.12	0.17~0.19	0.15~0.16
溶出率(%)	99.6~104.2	97.3~102.6	98.8~102.9	92.3~98.9
定量法(%)	98.22~100.91	98.61~100.68	98.18~100.34	98.33~100.25
残存率(%)	100	99.6~101.0	99.1~100.1	99.3~100.1
水分(%)	4.23~4.28	3.86~3.99	3.68~3.96	3.69~3.75

0.2g 分包

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性 状	白色の微粒を含む粉末で、特異なおいがあり、味は甘い。			
確認試験(1)	適合	変化なし		
確認試験(2)	適合	変化なし		
pH	5.94~5.95	5.98~5.99	5.97~5.98	5.95~5.98
純度試験 類縁物質(%)	0.06	0.11~0.12	0.22~0.26	0.21~0.23
製剤均一性(%)	1.39~3.76			1.44~6.02
溶出率(%)	99.6~104.2	99.4~102.7	99.2~102.2	94.3~99.5
定量法(%)	98.22~100.91	98.78~100.68	97.86~101.95	98.69~100.91
残存率(%)	100	99.7~101.4	98.8~101.0	99.6~100.6
水分(%)	4.23~4.28	4.13~4.21	4.04~4.10	3.78~3.85

0.4g 分包

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性 状	白色の微粒を含む粉末で、特異なおいがあり、味は甘い。			
確認試験(1)	適合	変化なし		
確認試験(2)	適合	変化なし		
pH	5.94~5.95	5.98	5.98	5.97
純度試験 類縁物質(%)	0.06	0.12~0.13	0.24~0.25	0.22~0.23
製剤均一性(%)	1.24~2.78			1.22~3.22
溶出率(%)	99.6~104.2	99.1~103.5	98.9~102.0	98.7~102.5
定量法(%)	98.22~100.91	98.75~100.53	98.53~100.54	98.72~100.78
残存率(%)	100	99.6~101.7	99.5~100.5	99.5~102.6
水分(%)	4.23~4.28	4.12~4.19	3.91~3.98	4.20~4.28

0.8g 分包

(3 ロットのまとめ)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	白色の微粒を含む粉末で、特異なおいがあり、味は甘い。			
確認試験(1)	適合	変化なし		
確認試験(2)	適合	変化なし		
pH	5.94~5.95	5.98	5.98~5.99	5.97~5.98
純度試験 類縁物質(%)	0.06	0.12~0.13	0.23~0.25	0.19
製剤均一性(%)	0.82~1.61			0.60~2.62
溶出率(%)	99.6~104.2	99.4~102.2	100.6~103.3	97.9~102.0
定量法(%)	98.22~100.91	99.03~100.90	97.35~99.78	98.41~100.65
残存率(%)	100	100.0~101.3	98.3~99.5	99.4~101.5
水分(%)	4.23~4.28	4.16~4.18	3.91~3.96	4.21~4.29

(3) 無包装状態の安定性 (参考資料) ^{5,6)}

●錠 5mg

①湿度:25°C、75%RH(シャーレ開放)

	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠			
色差(Δ)	-	0.78	1.60	2.97
溶出試験(%)	95.7	95.1	94.0	95.5
残存率(%)	100	101.2	99.8	102.0
硬度(N)	60	42	41	38

②光:2500lx、25°C、45%RH

	開始時	30 万 lx・hr	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性状	白色のフィルムコーティング錠			
色差(Δ)	-	0.75	0.83	0.43
溶出試験(%)	95.7	100.3	96.5	92.3
残存率(%)	100	99.7	100.5	100.6
硬度(N)	60	58	53	50

③温度:40°C(褐色ガラス瓶、気密)

	開始時	1 ヶ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠	
色差(Δ)	-	0.31
溶出試験(%)	95.7	97.0
残存率(%)	100	100.0
硬度(N)	60	53

●錠 10mg

①湿度:25°C、75%RH(シャール開放)

	開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠			
色差(Δ)	-	0.70	1.23	3.07
溶出試験(%)	95.7	98.1	96.1	96.2
残存率(%)	100	98.9	98.4	101.0
硬度(N)	87	56	54	50

②光:2500lx、25°C、45%RH

	開始時	30万lx・hr	60万lx・hr	120万lx・hr
性状	白色のフィルムコーティング錠			
色差(Δ)	-	1.49	1.90	0.87
溶出試験(%)	95.7	103.0	100.3	95.3
残存率(%)	100	100.1	98.6	99.9
硬度(N)	87	77	72	72

③温度:40°C(褐色ガラス瓶、気密)

	開始時	1ヵ月後
性状	白色のフィルムコーティング錠	
色差(Δ)	-	1.16
溶出試験(%)	95.7	96.2
残存率(%)	100	100.3
硬度(N)	87	72

●DS1.25%

セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」について無包装状態における、各種条件下での安定性を検討した。その結果、下記の条件(温度、湿度、光)では、いずれの項目も規格内であった。

なお、セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」を25°C±2°C、75%RH±5%RHの条件で保存した場合、1箇月目から3箇月目で同程度の固化がみられたため、測定に際しては固化物をスパーテルで軽く粉砕し粉末とした。

よって、本製剤は吸湿によって影響を受けやすい製剤であるため、湿度には十分に気を付けて保存すること。

1) 保存条件及び保存期間

対象項目	保存条件	保存期間(測定時期)
温度	40°C±2°C:気密容器・遮光	1箇月後、2箇月後、3箇月後
湿度	25°C±2°C:75%RH±5%RH :開放・遮光	1箇月後、2箇月後、3箇月後
光	白色蛍光ランプ 1000 lx :気密容器	試験開始時、 60万lx・hr、120万lx・hr

2) 保存条件及び保存期間

対象項目	試験項目	試験数
温度	性状、類縁物質、溶出性、定量、水分	定量のみn=2、その他はn=1
湿度	性状、類縁物質、溶出性、定量、水分	定量のみn=2、その他はn=1
光	性状、類縁物質、溶出性、定量、水分	定量のみn=2、その他はn=1

3) 結果

①温度(温度:40°C±2°C:気密容器・遮光) (1ロット)

		開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
性 状		白色の微粒で、特異なおいがある。	白色の微粒で、特異なおいがある。		
定 量(%)		101.02	99.35~100.50	100.06~100.84	99.68~100.07
類縁物質 (%)	個々の類縁物質	0.06	0.04	0.08	0.07
	総類縁物質	0.22	0.28	0.34	0.31
溶出性(%)		101.32	101.90	100.58	100.57
水 分(%)		3.37	3.84	4.02	3.86

②湿度(温度:25°C±2°C:75%RH±5%RH:開放・遮光) (1ロット)

		開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
性 状		白色の微粒で、特異なおいがある。	白色の固化物で、特異なおいがある。		
定 量(%)		101.02	96.79~97.17	96.91~97.03	96.69~97.16
類縁物質 (%)	個々の類縁物質	0.06	0.07	0.08	0.11
	総類縁物質	0.22	0.35	0.38	0.43
溶出性(%)		101.32	98.02	98.53	98.43
水 分(%)		3.37	5.84	5.69	5.72

③光(白色蛍光ランプ 1000 lx:気密容器) (1ロット)

		開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性 状		白色の微粒で、特異なおいがある。	白色の微粒で、特異なおいがある。	
定 量(%)		101.02	99.96~100.58	99.20~99.38
類縁物質 (%)	個々の類縁物質	0.06	0.06	0.08
	総類縁物質	0.22	0.42	0.57
溶出性(%)		101.32	101.07	98.78
水 分(%)		3.37	4.57	4.48

5. 調製法及び溶解後の安定性

●DS1.25%³⁾

本剤 0.8g(セチリジン塩酸塩として 10mg)を水 10mL に溶解し、溶解直後及び 24 時間後の性状、pH、含量を確認した。

	試験項目	試験開始時	24 時間後
セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」 (25°C・遮光)	性状	無色透明の液	無色透明の液
	pH	5.98	5.96
	含量(%)	97.51	97.23
	残存率(%)	—	99.7

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」と併用が予想される薬剤につき配合変化試験を行った。詳しくは「配合変化表」参照。

7. 溶出性

(1) 公的溶出試験^{7,8)}

錠剤は、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。

溶出試験法及び溶出規格

日本薬局方一般試験法の溶出試験法（パドル法）による

試験条件：試験液：水

試験液量：900 mL

回転数：毎分 50 回転

測定：紫外可視吸光度測定法（測定波長：230nm）

溶出規格

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

(2) 生物学的同等性試験ガイドラインにおける標準製剤との溶出挙動の評価^{7,8,9)}

●錠 5mg

[参考]後発医薬品の生物学的同等性試験のガイドラインに従い溶出の類似性を検討した。

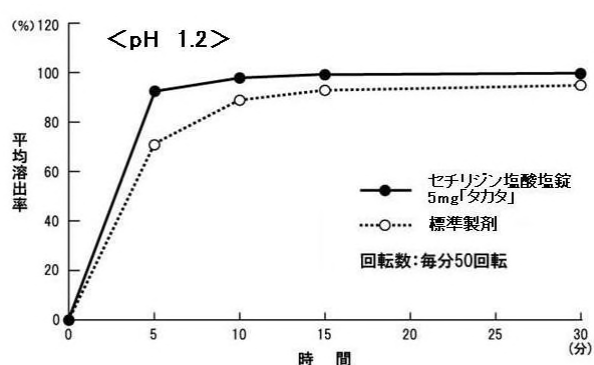
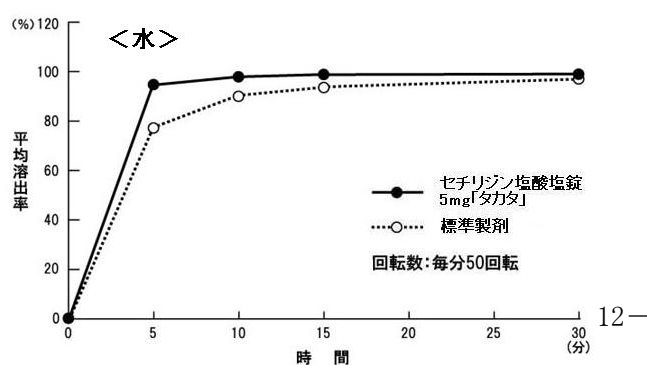
試験液：水、pH 1.2、pH 3.0、pH 6.8、pH1.2(毎分 100 回転)

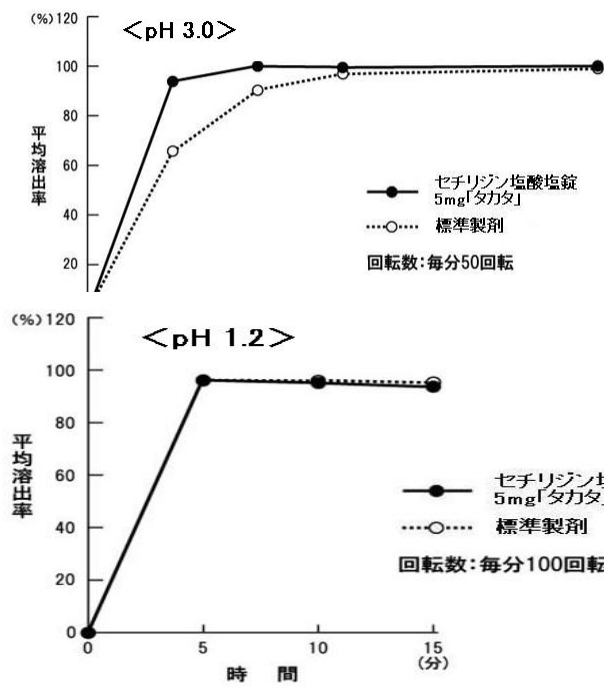
回転数：毎分 50 回転

界面活性剤：なし

溶出試験法：日局「溶出試験法パドル法」で試験

分析法：紫外吸光度測定法





●錠 10mg

[参考]後発医薬品の生物学的同等性試験のガイドラインに従い溶出の類似性を検討した。

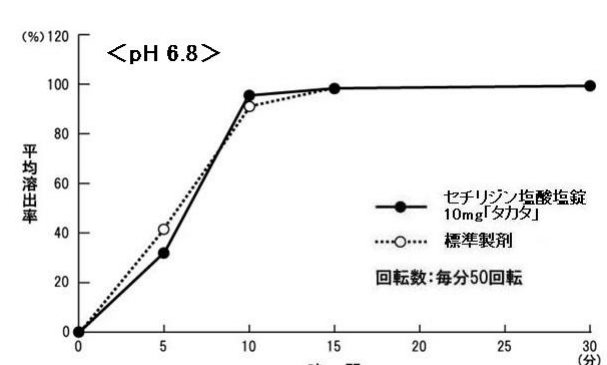
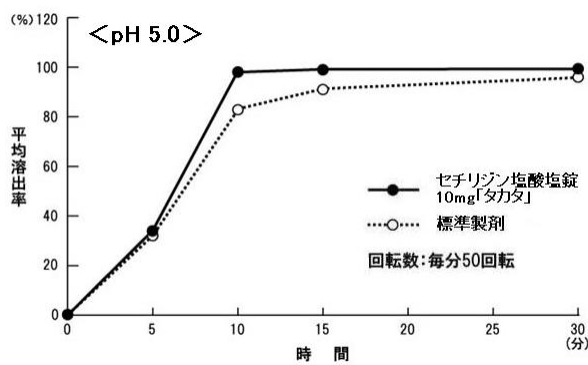
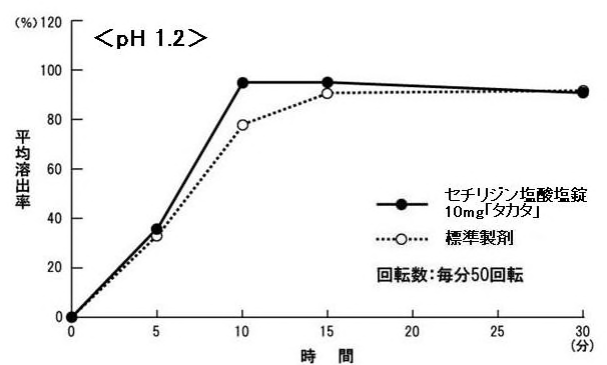
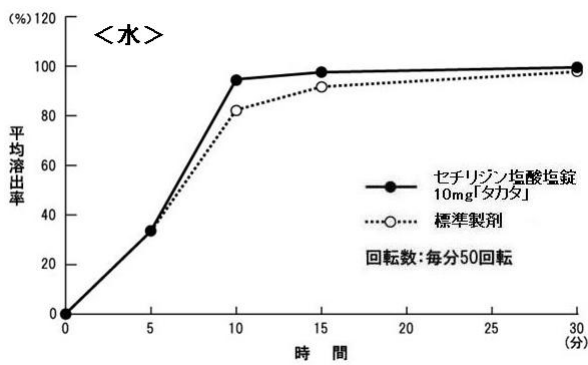
試験液: 水、pH 1.2、pH 5.0、pH 6.8、pH5.0(毎分 100 回転)

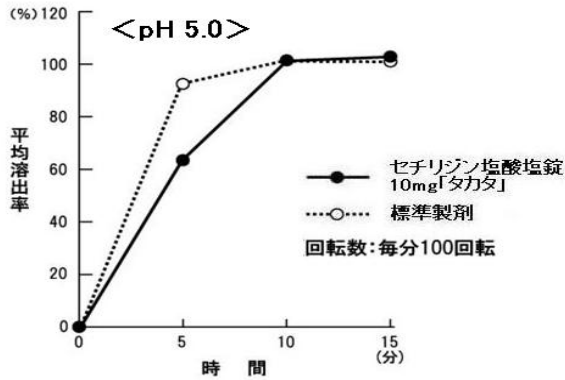
回転数: 毎分 50 回転

界面活性剤: なし

溶出試験法: 日局「溶出試験法パドル法」で試験

分析法: 紫外吸光光度測定法





● DS1.25%

[参考]後発医薬品の生物学的同等性試験のガイドラインに従い、セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」の処方変更前の本品と処方変更後の本品の溶出挙動の類似性を検討した。

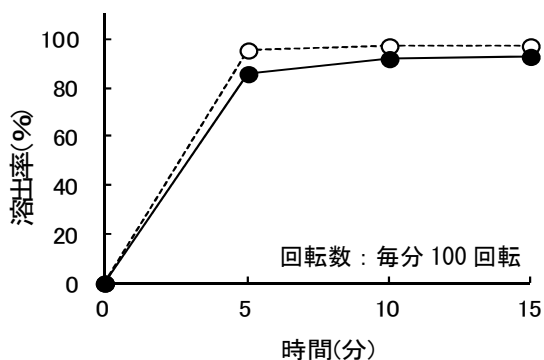
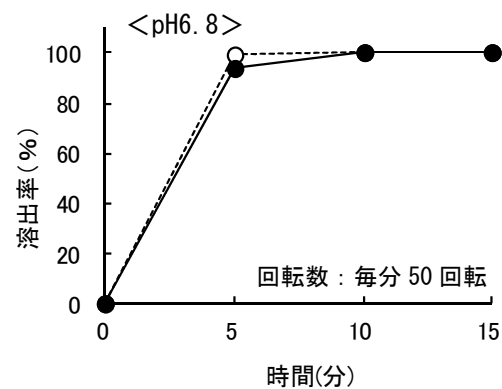
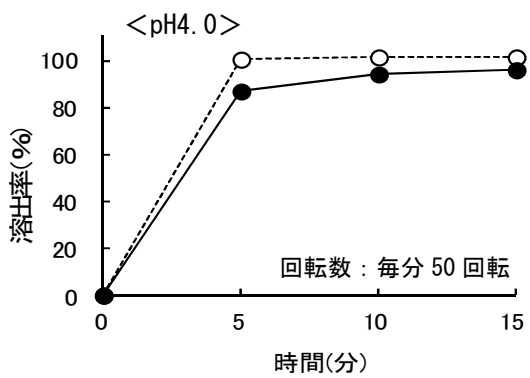
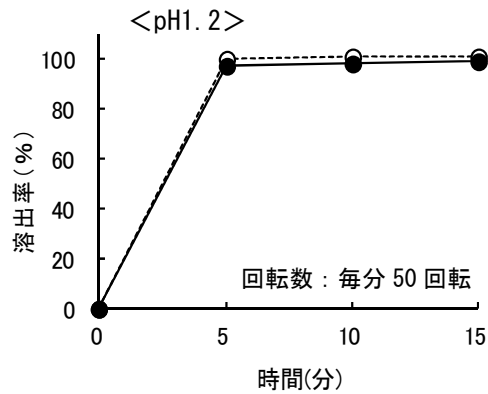
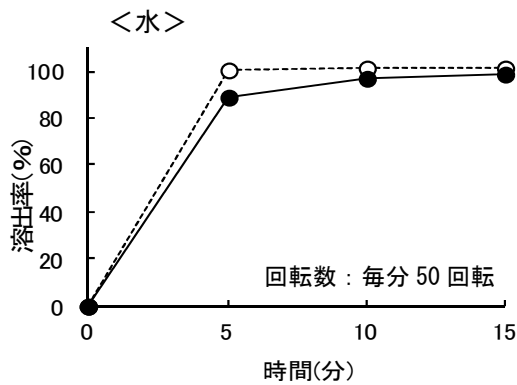
試験液：水、pH 1.2、pH4.0、pH6.8、pH4.0(毎分 100 回転)

回転数：毎分 50 回転

界面活性剤：なし

溶出試験法：日局「溶出試験法パドル法」で試験

分析法：紫外吸光光度測定法



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

●錠 5mg、錠 10mg

日局「セチリジン塩酸塩錠」の確認試験による。

UV による定性試験

●DS1.25%

(1) カルボン酸の呈色反応

(2) UV による定性試験

10. 製剤中の有効成分の定量法

●錠 5mg、錠 10mg

日局「セチリジン塩酸塩錠」の定量による。

・液体クロマトグラフィー

カラム:内径 4.6mm、長さ 25cm のステンレス管に 5 μ m の液体クロマトグラフィー用オクチルシリル化シリカゲルを充てんする。

移動相:リン酸二水素ナトリウム二水和物 3.12g を水 1000mL に溶かし、リン酸を加えて pH を 2.3 に調整する。この液 450mL にアセトニトリル 550mL を加え、ラウリル硫酸ナトリウム 1.44g を加える。

検出器:紫外吸光光度計(測定波長:230nm)

●DS1.25%

・液体クロマトグラフィー

カラム:内径 4.0mm、長さ 25cm のステンレス管に 5 μ m の液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

移動相:1-ヘプタンスルホン酸ナトリウム 0.4g を水 580mL に溶かし、0.5mol/L 硫酸試液を加えて pH を 3.0 に調整する。この液にアセトニトリル 420mL を加える。

検出器:紫外吸光光度計(測定波長:230nm)

11. 力価

本剤は力価表示に該当しない。

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

該当しない

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、皮膚掻痒症

〔小児〕 アレルギー性鼻炎

蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症)に伴う痒疹

2. 用法及び用量

●錠 10mg

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。

●錠 5mg

〔成人〕

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として1回 10mg(2錠)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。

●DS1.25%

〔成人〕

通常、成人には1回 0.8g(セチリジン塩酸塩として 10mg)を1日1回、就寝前に用時溶解して経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は1日 1.6g(セチリジン塩酸塩として 20mg)とする。

〔小児〕

通常、2歳以上7歳未満の小児には1回 0.2g(セチリジン塩酸塩として 2.5mg)を1日2回、朝食後及び就寝前に用時溶解して経口投与する。

通常、7歳以上15歳未満の小児には1回 0.4g(セチリジン塩酸塩として 5mg)を1日2回、朝食後及び就寝前に用時溶解して経口投与する。

〈用法・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・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、個別に用量を調節すること。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(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

ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロタラジン等のヒスタミン H₁ 拮抗薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

<作用部位>

- ①鼻及び皮膚のヒスタミン H₁ 受容体
- ②好酸球、肥満細胞、好中球などの細胞

<作用機序>

セチリジン塩酸塩はアレルギー反応における即時相と遅発相の両相において作用し、即時相においては抗ヒスタミン作用及び肥満細胞からのロイコトリエン遊離抑制作用を有し、アレルギー反応における諸症状を速やかに和らげる。また、遅発相においては好酸球の遊走と活性化抑制作用を有し、これらによってアレルギー反応を持続的に抑制すると考えられている。

(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^{10,11)}

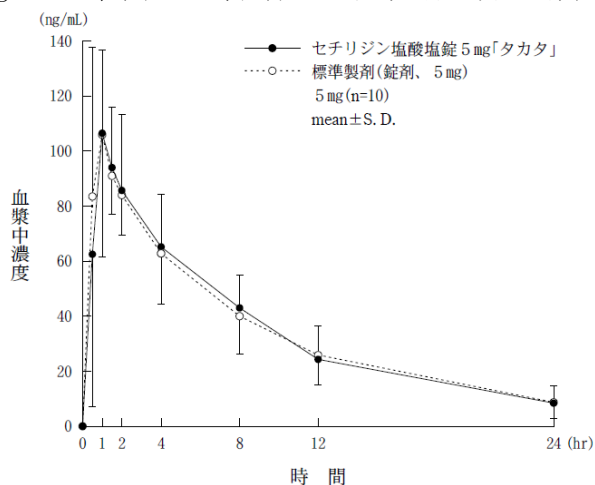
	最高血中濃度到達時間	被験者数(n)
セチリジン塩酸塩錠5mg「タカタ」	約 1.0 時間	10
セチリジン塩酸塩錠 10mg「タカタ」	約 0.9 時間	19
セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」	約 0.7 時間	17

(3) 臨床試験で確認された血中濃度^{10,11)}

<生物学的同等性試験>

●錠 5mg

本剤と標準製剤(錠剤、5mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子 10 名にそれぞれ 1 錠(セチリジン塩酸塩として 5mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.5、1、1.5、2、4、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したセチリジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの平均値の差は $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



図VII-1 セチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」の平均血漿中濃度の時間的推移

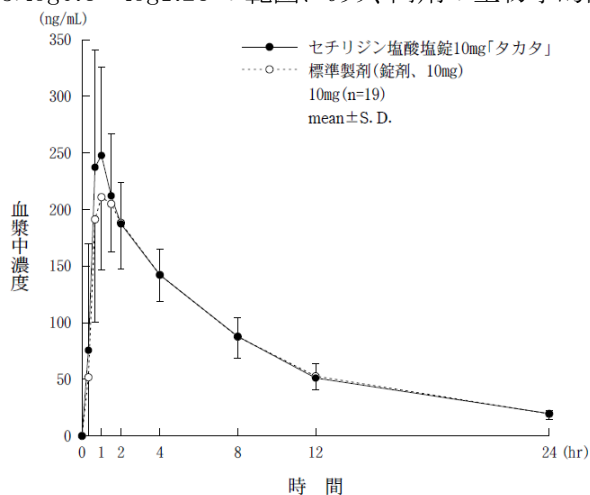
製剤	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	t _{1/2} (hr)
セチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	850.4 ± 251.3	121.7 ± 23.5	1.0 ± 0.5	6.6 ± 1.5
標準製剤 (錠剤、5mg)	853.0 ± 249.9	122.6 ± 40.8	1.0 ± 0.4	7.0 ± 2.0

(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。

●錠 10mg

本剤と標準製剤(錠剤、10mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子 19 名にそれぞれ 1 錠(セチリジン塩酸塩として 10mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.33、0.67、1、1.5、2、4、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MS により測定したセチリジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの平均値の差は $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



図VII-2 セチリジン塩酸塩錠 10mg 「タカタ」の平均血漿中濃度の時間的推移

製 剤	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	t _{1/2} (hr)
セチリジン塩酸塩錠 10mg「タカタ」	1853.8 ± 322.8	278.7 ± 84.0	0.9 ± 0.4	7.4 ± 1.1
標準製剤 (錠剤、10mg)	1823.4 ± 298.4	245.0 ± 52.3	1.0 ± 0.4	7.3 ± 0.7

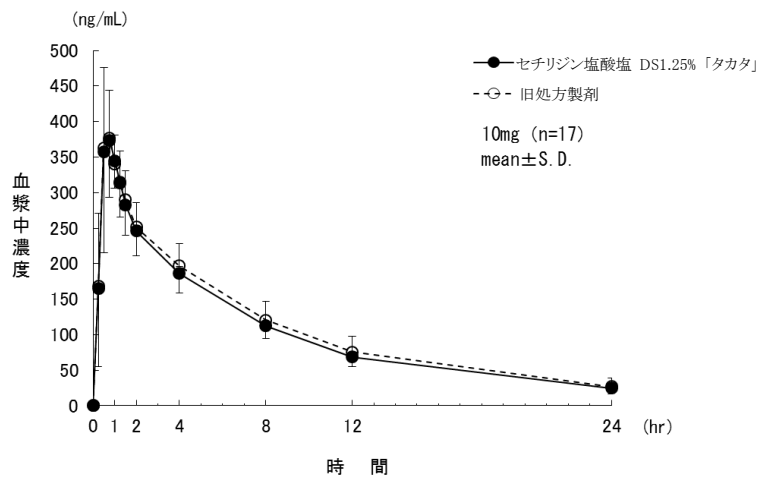
(mean ± S.D.)

※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。

●DS1.25%

[旧処方製剤との生物学的同等性試験]

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」と旧処方製剤を対象とした生物学的同等性試験により同等性が確認されている旧処方製剤をクロスオーバー法により、健康成人男子 17 名にそれぞれ 0.8g(セチリジン塩酸塩として 10mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、4、8、12 及び 24 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS により測定したセチリジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、両剤は生物学的に同等であると判断された。



図VII-3 セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」の平均血漿中濃度の時間的推移

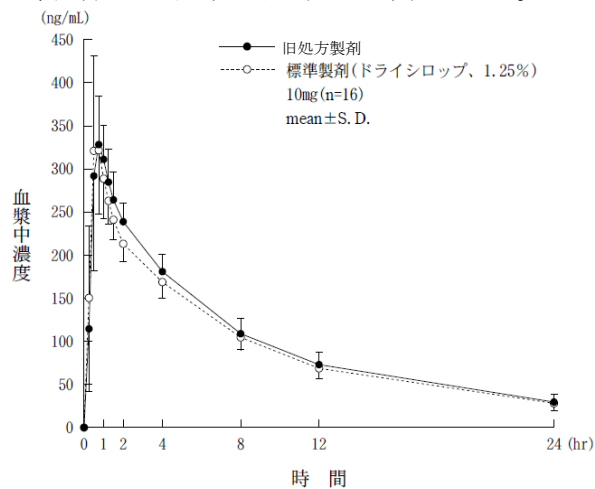
製剤	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	t _{1/2} (hr)
セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」	2507.0±376.7	419.7±60.8	0.7±0.2	7.4±1.1
旧処方製剤	2653.4±511.8	411.5±51.9	0.7±0.3	7.3±1.2

(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。

[旧処方製剤と標準製剤(ドライシロップ、1.25%)との生物学的同等性試験]

旧処方製剤と標準製剤(ドライシロップ、1.25%)をクロスオーバー法により、健康成人男子16名にそれぞれ0.8g(セチリジン塩酸塩として10mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、4、8、12及び24時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MSにより測定したセチリジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの平均値の差はlog0.8～log1.25の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



図VII-4 旧処方製剤の平均血漿中濃度の時間的推移

製 剤	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt(ng・hr/mL)	Cmax(ng/mL)	tmax(hr)	t _{1/2} (hr)
旧処方製剤	2470.2±327.8	351.2±54.0	0.8±0.2	8.6±1.4
標準製剤 (ドライシロップ、1.25%)	2336.1±294.4	353.9±66.3	0.7±0.4	8.5±1.3

(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

該当しない

(3) バイオアベイラビリティ

該当しない

(4) 消失速度定数^{10,11)}

品 名	セチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「タカタ」	セチリジン塩酸塩 DS1.25% 「タカタ」
kel(hr ⁻¹)	0.109±0.020	0.0951±0.0150	0.0952±0.0145

(mean±S.D.)

(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

該当しない

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

「Ⅷ. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」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

該当しない

(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. 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

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）

【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」を参照のこと。

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。](「Ⅴ. 2 用法及び用量」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

該当記載事項なし

(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、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（頻度不明）と初期症状

- 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

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、痒痒感、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. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」に以下の記載あり。

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分又はペパジン誘導体（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

「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用（頻度不明）と初期症状」に以下の記載あり。

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。

「Ⅷ. 8. (3) その他の副作用」に以下の記載あり。

発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、痒痒感、血管浮腫、多形紅斑の過敏症の症状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。

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。用量に留意して慎重に投与すること。

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

●錠 5 mg、10 mg

- (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。)

●DS1.25%

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

●錠 5mg、10mg

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

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

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「タカタ」:該当しない
セチリジン塩酸塩錠10mg「タカタ」:該当しない
セチリジン塩酸塩DS1.25%「タカタ」: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:錠 5mg、10mg:外箱等に表示(3年)
DS1.25%:外箱等に表示(3年)
(「IV. 4. 製剤の各種条件下における安定性」参照)

3. 貯法・保存条件

錠 5mg、10mg:室温保存
DS1.25%:気密容器に入れ、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

- (1) 薬局での取り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)
「VIII. 14. 適用上の注意」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 5mg「タカタ」		セチリジン塩酸塩錠 10mg「タカタ」		セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」	
PTP 包装	100 錠(10 錠×10)	PTP 包装	100 錠(10 錠×10) 500 錠(10 錠×50) 280 錠(14 錠×20)	分包装	0.2g×100 包 0.4g×100 包 0.8g×100 包
				バラ包装	100g

7. 容器の材質

- 錠 5mg、10mg

PTP 包装: ポリ塩化ビニル、金属 (アルミニウム)

- DS1.25%

分包包装: アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

バラ包装: ポリエチレン (瓶本体、中栓)、ポリプロピレン (蓋)

8. 同一成分・同効薬

同一成分 [先発品]: ジルテック

同 効 薬: ケトチフェンフマル酸塩

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

	セチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	セチリジン塩酸塩錠 10mg「タカタ」	セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」
製造承認年月日	2007年3月15日	2007年3月15日	2009年7月13日
承認番号	21900AMX00523	21900AMX00524	22100AMX02060

11. 薬価基準収載年月日

錠 5mg、10mg : 2007年7月6日

DS1.25% : 2009年11月13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

用法・用量追加年月日: 2013年9月2日

- 錠 5mg: 小児の用法・用量追加

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。

- DS1.25%: 小児の用法・用量追加

通常、2歳以上7歳未満の小児には1回0.2g (セチリジン塩酸塩として2.5mg) を1日2回、朝食後及び就寝前に用時懸濁して経口投与する。

通常、7歳以上15歳未満の小児には1回0.4g (セチリジン塩酸塩として5mg) を1日2回、朝食後及び就寝前に用時懸濁して経口投与する。

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

販売名	HOTコード(9桁)	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「タカタ」	117976701	4490020F1241	620005459
セチリジン塩酸塩錠 10mg「タカタ」	117993401	4490020F2248	620005487
セチリジン塩酸塩 DS1.25%「タカタ」	119446301	4490020R1035	621944601

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 高田製薬株式会社 社内資料(錠 5mg:安定性)
- 2) 高田製薬株式会社 社内資料(錠 10mg:安定性)
- 3) 高田製薬株式会社 社内資料(DS1.25%:物性)
- 4) 高田製薬株式会社 社内資料(DS1.25%:安定性)
- 5) 高田製薬株式会社 社内資料(錠 5mg:無包装状態の安定性試験)
- 6) 高田製薬株式会社 社内資料(錠 10mg:無包装状態の安定性試験)
- 7) 高田製薬株式会社 社内資料(錠 5mg:溶出性)
- 8) 高田製薬株式会社 社内資料(錠 10mg:溶出性)
- 9) 高田製薬株式会社 社内資料(DS1.25%:溶出性)
- 10) 高田製薬株式会社 社内資料(錠 5mg・10mg:生物学的同等性試験)
- 11) 高田製薬株式会社 社内資料(DS1.25%:生物学的同等性試験)

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

販売名	国名
ZIRTEC	アメリカ、イタリア、イギリス、フランス、ドイツ、カナダ
VIRLIX	イタリア
FORMISTIN	イタリア
CETEC	イギリス
GALPHARM ALLERGY	イギリス
CETIRIZINE ARROW	イギリス
CETIRIZINE PLIVA	イギリス
ALLERTEK	イギリス
GALPHARM HAYFEVER	イギリス
ALAIRGIX	フランス
CETIRIZINE WINTHR.	フランス
ZYRTECSET	フランス
CETI BLUE	ドイツ
REACTINE	ドイツ
REACTINE	カナダ

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII 備考

1. その他の関連資料

なし

MEMO

MEMO

MEMO

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1

CTR-2(13)2016年10月改訂