

# 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

## レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」 レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」 レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets, OD Tablets [SAWAI]  
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Syrup [SAWAI]

### レボセチリジン塩酸塩製剤

剤形	錠5mg : 割線入りフィルムコーティング錠 OD錠5mg : 割線入り素錠(口腔内崩壊錠) シロップ0.05% : シロップ剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品※ ※注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠5mg : 1錠中レボセチリジン塩酸塩5mg含有 OD錠5mg : 1錠中レボセチリジン塩酸塩5mg含有 シロップ0.05% : 1mL中レボセチリジン塩酸塩0.5mg含有
一般名	和名 : レボセチリジン塩酸塩 洋名 : Levocetirizine 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 : 2020年2月17日 薬価基準収載年月日 : 2020年6月19日 発売年月日 : 2020年6月19日
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2020年3月作成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	25
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	25
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)	25
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	25
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	25
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	25
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	25
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	26
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	28
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	28
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	28
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	28
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	28
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	29
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	30
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	30
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	30
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	31
5. 調製法及び溶解後の安定性	12	1. 規制区分	31
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	31
7. 溶出性	12	3. 貯法・保存条件	31
8. 生物学的試験法	14	4. 薬剤取扱い上の注意点	31
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	14	5. 承認条件等	31
10. 製剤中の有効成分の定量法	14	6. 包装	32
11. 力価	14	7. 容器の材質	32
12. 混入する可能性のある夾雑物	14	8. 同一成分・同効薬	32
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	14	9. 国際誕生年月日	32
14. その他	14	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	32
V. 治療に関する項目	15	11. 薬価基準収載年月日	33
1. 効能又は効果	15	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	15	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	16	14. 再審査期間	33
VI. 薬効薬理に関する項目	18	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	33
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18	16. 各種コード	33
2. 薬理作用	18	17. 保険給付上の注意	33
VII. 薬物動態に関する項目	19	XI. 文献	34
1. 血中濃度の推移・測定法	19	1. 引用文献	34
2. 薬物速度論的パラメータ	22	2. その他の参考文献	34
3. 吸収	23	XII. 参考資料	35
4. 分布	23	1. 主な外国での発売状況	35
5. 代謝	23	2. 海外における臨床支援情報	35
6. 排泄	24	XIII. 備考	35
7. トランスポーターに関する情報	24	その他の関連資料	35
8. 透析等による除去率	24		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg/OD錠 5 mg/シロップ 0.05%「サワイ」は、レボセチリジン塩酸塩を含有するアレルギー性疾患治療剤である。

本剤は非鎮静性H<sub>1</sub>受容体拮抗薬で、ヒスタミンと受容体を競合しその作用を遮断することでアレルギー反応を抑制する。<sup>1)</sup>

レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」は、後発医薬品として、沢井製薬株式会社、共創未来ファーマ株式会社の計 2 社が共同開発を実施した。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のうえ、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」は、後発医薬品として、下記通知に基づき、沢井製薬株式会社が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。

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「サワイ」は、後発医薬品として、沢井製薬株式会社、共和薬品工業株式会社、東亜薬品株式会社、東和薬品株式会社の計 4 社で共同開発を実施した。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のうえ、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2020年2月
上市	2020年6月

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 識別性を考慮し、錠剤本体に成分名及び含量を両面印字している。[錠 5 mg/OD錠 5 mg]
- 2) PTPシートに「抗ヒスタミン薬」の文字を記載している。[錠 5 mg/OD錠 5 mg]
- 3) 添加物由来の甘みを有する。[OD錠 5 mg]
- 4) 添加物由来の甘み及び香料由来の特有の香りを有する。[シロップ]
- 5) 製品名や変動情報付GS 1 コード等を記載した両面カードが 2 枚(Wカード)付いた個装箱であり、切り取ったカードは使用期限の管理及び調剤棚ラベルとして利用可能である。[錠 5 mg/OD錠 5 mg]
- 6) レボセチリジン塩酸塩「サワイ」製剤には、普通錠、口腔内崩壊錠、シロップがあり、個々の状況に応じた剤形選択が可能である。
- 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

レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」  
レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」  
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

##### 2) 洋名

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets, OD Tablets [SAWAI]  
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Syrup [SAWAI]

##### 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)

レボセチリジン塩酸塩(JAN)

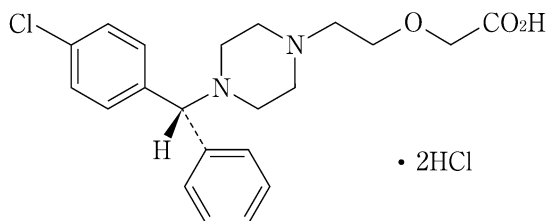
##### 2) 洋名(命名法)

Levocetirizine Hydrochloride (JAN)  
levocetirizine (INN)

##### 3) ステム

-izine : ジフェニルメチルピペラジン誘導体

#### 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-[(*R*)-(4-Chlorophenyl)phenylmethyl]piperazin-1-yl}ethoxy)acetic acid  
dihydrochloride (IUPAC)
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....  
特になし
7. CAS登録番号 .....  
130018-87-0 [Levocetirizine hydrochloride]  
130018-77-8 [Levocetirizine]

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

---



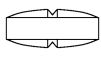


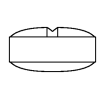

1. 物理化学的性質 .....
  - 1) 外観・性状  
白色の結晶性の粉末である。
  - 2) 溶解性  
水に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくい。0.1mol/L塩酸試液に溶ける。
  - 3) 吸湿性  
乾燥減量：0.5%以下(1g、減圧、60℃、3時間)
  - 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点  
該当資料なし
  - 5) 酸塩基解離定数  
該当資料なし
  - 6) 分配係数  
 $\text{LogP}=1.32(1\text{-オクタノール/水系、pH}7.4)^{2)}$
  - 7) その他の主な示性値  
該当資料なし
2. 有効成分の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 .....
  - 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 .....  
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	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
レボセチリジン 塩酸塩錠 5mg 「サワイ」	割線入りフィルム コーティング錠	 8.1×4.6	 約103	 3.3	白色
レボセチリジン 塩酸塩OD錠 5mg 「サワイ」	割線入り素錠 (口腔内崩壊錠)	 7.5	 約160	 3.8	白色～微黄色
レボセチリジン 塩酸塩シロップ 0.05%「サワイ」	シロップ剤				無色澄明の液

## 2) 製剤の物性

## ●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「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。

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。

## ●レボセチリジン塩酸塩OD錠 5mg「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。

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。

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。

## 3) 識別コード

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」：レボセチリジン 5 サワイ

●レボセチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」：レボセチリジン OD 5 サワイ

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」：該当しない

## 4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

## ●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

pH：4.7～5.3

比重(20度、20度)：約1.157

IV. 製剤に関する項目

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」：1錠中にレボセチリジン塩酸塩 5 mgを含有する。
- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」：1錠中にレボセチリジン塩酸塩 5 mgを含有する。
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」：1 mL中にレボセチリジン塩酸塩0.5mgを含有する。

2) 添加物

- レボ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、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロースを含有する。
- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」  
添加物として、クロスポビドン、結晶セルロース、β-シクロデキストリン、スクラロース、炭酸Mg、フマル酸ステアリルNa、D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸Mgを含有する。
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」  
添加物として、還元麦芽糖水アメ、グリセリン、酢酸、酢酸Na、サッカリンNa、トコフェロール、バニリン、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸メチル、香料を含有する。

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

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」

1) 加速試験<sup>3)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、加速試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

PTP： [PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミニウム箔  
[ピロー]アルミニウム袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の楕円形の割線入りフィルムコーティング錠	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
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験*	100.0	100.4

※：表示量に対する含有率(%), 平均値

2) 無包装下の安定性試験<sup>4)</sup>

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。  
その結果、湿度及び室温の条件で硬度低下が観察された。

	イニシャル	温度(40℃ ・遮光3ヵ月)	湿度(25℃75%RH・遮光)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の楕円形の 割線入りフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg) <sup>※1</sup>	12.5/11.0	11.6/10.7	7.4/6.0	7.1/6.1
純度試験	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 <sup>※2</sup>	100.0	100.4	98.1	100.2

	イニシャル	光* (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25℃60%RH・遮光)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の楕円形の 割線入りフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg) <sup>※1</sup>	12.5/11.0	9.7/8.3	9.5/8.0	9.2/7.7
純度試験	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 <sup>※2</sup>	100.0	99.2	98.1	100.3

※1：長径方向/短径方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*：25℃60%RH、D65蛍光ランプ(2000lx)、開放シャーレ

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>5)</sup>

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、以下のとおりであった。

	イニシャル	室温 (25℃60%RH・遮光6ヵ月)
性状	白色の楕円形の割線入りフィルム コーティング錠	変化なし
硬度(kg) <sup>※1</sup>	12.5/11.0	11.4/9.8
純度試験	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験 <sup>※2</sup>	100.0	100.7

※1：長径方向/短径方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

#### IV. 製剤に関する項目

##### 4) 分割後の安定性試験<sup>6)</sup>

本製剤を割線に沿って二分割後、下記条件で保存し、安定性試験(3ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、光の条件で性状変化が観察された。

1ロット目の試験結果を次表に示した。

		イニシャル	光*		室温 (25°C60%RH・ 遮光3ヵ月)
			総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	表面	白色	変化なし	変化なし	変化なし
	分割面	白色	帯黄白色	帯黄白色	変化なし
純度試験		問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※		100.0	97.1	97.6	99.7
含量均一性試験 (参考)		問題なし			

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(2000lx)、開放シャーレ  
分割操作は「錠剤ハサミ お薬チョッキン」を使用

#### ●レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

##### 1) 長期保存試験<sup>7)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、長期保存試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。  
その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミニウム箔  
[ピロー]アルミニウム袋、乾燥剤

	イニシャル	25°C60%RH・遮光 30ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	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※	100.0	98.2

※：表示量に対する含有率(%), 平均値

##### 2) 無包装下の安定性試験<sup>8)</sup>

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回(定量試験のみ3回))を行った。

その結果、温度及び光の条件で性状変化、湿度及び光の条件で硬度低下、室温の条件で不純物増加が観察された。

	イニシャル	温度(40°C・遮光)		湿度(25°C75%RH・遮光)	
		1ヵ月	3ヵ月	1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	白色の割線入り口腔内崩壊錠 <sup>†</sup> (規格内)	白色の割線入り口腔内崩壊錠 <sup>†</sup> (規格内)	変化なし	変化なし
硬度(kg) <sup>※1</sup>	4.7	5.3	4.8	2.4	2.3
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
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 <sup>※2</sup>	100.0	98.1	97.5	99.0	98.7

	イニシャル	光*		室温 (25°C60%RH・遮光)	
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	帯黄白色の割線入り口腔内崩壊錠 (規格内)	帯黄白色の割線入り口腔内崩壊錠 (規格内)	変化なし	変化なし
硬度(kg) <sup>※1</sup>	4.7	3.1	3.0	3.4	3.4
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	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 <sup>※2</sup>	100.0	98.3	97.9	98.6	98.0

†：褐色～灰色の斑点が1錠あたり1, 2個程度、2錠に1錠の頻度でみられた

※1：割線に対して垂直方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%), 平均値

\*：25°C60%RH、白色蛍光灯(4000lx)＋近紫外蛍光灯(10W/m<sup>2</sup>)、開放シャーレ

総近紫外放射エネルギー100W・hr/m<sup>2</sup>(60万lx・hr)

総近紫外放射エネルギー200W・hr/m<sup>2</sup>(120万lx・hr)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

### 3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>9)</sup>

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回(定量試験のみ3回))を行った。

その結果、以下のとおりであった。

	イニシャル	光* (総照射量120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH・遮光6ヵ月)
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし
硬度(kg) <sup>※1</sup>	4.7	未実施	3.9
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	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
定量試験 <sup>※2</sup>	100.0	99.5	98.5

※1：割線に対して垂直方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%), 平均値

\*：25°C60%RH、D65 蛍光灯(10000lx)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

#### IV. 製剤に関する項目

##### 4) 分割後の安定性試験<sup>10)</sup>

本製剤を割線に沿って二分割後、下記条件で保存し、安定性試験(3ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、光の条件で性状変化及び不純物増加、室温の条件で不純物増加が観察された。定量試験の変化率が最も大きかったロットの結果を次表に示した。

		イニシャル	光*		室温 (25°C60%RH・遮光)	
			総照射量 30万lx・hr	総照射量 60万lx・hr	1ヵ月	3ヵ月
性状	表面	白色	変化なし	帯黄白色 (規格内)	変化なし	変化なし
	分割面	白色	変化なし	帯黄白色	変化なし	変化なし
純度試験		問題なし	問題なし	不純物増加	問題なし	不純物増加
定量試験※		100.0	99.4	98.2	99.9	101.5
含量均一性試験 (参考)		問題なし				

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(2000lx)、開放シャーレ  
分割操作は「菓の錠剤カッター」を使用

#### ●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

##### 1) 加速試験<sup>11)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、加速試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。

その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

容器：[本体]褐色ガラス瓶

[キャップ]ポリプロピレン(ポリエチレン製中栓付き)

		イニシャル	40°C75%RH ・遮光6ヵ月
性状		無色澄明の液	同左
確認試験		規格に適合	同左
pH		5.1	5.1
微生物限度試験		規格に適合	同左
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	97.7	96.4
	パラオキシ 安息香酸プロピル	98.3	97.1
定量試験※		98.1	98.2

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

##### 2) 小分け後の安定性試験<sup>11)</sup>

本製剤(無希釈)の小分け後の安定性試験(1ロット、繰り返し3回)を実施した。

その結果、規格に適合した。

小分け容器：[本体]無色透明ポリプロピレン

[キャップ]ポリエチレン

## IV. 製剤に関する項目

		イニシャル	25°C60%RH ・遮光14日間
性状		無色澄明の液	同左
確認試験		規格に適合	同左
pH		5.1	5.1
微生物限度試験		規格に適合	同左
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	97.2	96.7
	パラオキシ 安息香酸プロピル	96.8	96.7
定量試験※		98.5	98.7

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

3) 横倒し状態での安定性試験<sup>11)</sup>

本製剤を横倒しにした状態にて安定性試験(1ロット、繰り返し3回)を実施した。

その結果、規格に適合した。

容器： [本体]褐色ガラス瓶

[キャップ]ポリプロピレン(ポリエチレン製中栓付き)

		イニシャル	40°C75%RH ・遮光6ヵ月
性状		無色澄明の液	同左
確認試験		規格に適合	同左
pH		5.1	5.1
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	98.7	97.5
	パラオキシ 安息香酸プロピル	100.6	99.2
定量試験※		98.9	99.2

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

4) 苛酷試験(褐色ガラス容器の安定性)<sup>12)</sup>

本製剤を下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し3回)を行った。

その結果、以下のとおりであった。

容器： [本体]褐色ガラス瓶

[キャップ]ポリプロピレン(ポリエチレン製中栓付き)

		イニシャル	温度		光* (総照射量 120万lx・hr)
			(50°C・ 遮光60日)	(5°C・ 遮光6ヵ月)	
性状		無色澄明の液	同左	同左	同左
確認試験		規格に適合	—	—	規格に適合
pH		5.1	5.1	5.1	5.1
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	98.7	98.0	98.7	98.8
	パラオキシ 安息香酸プロピル	100.6	99.3	99.7	99.2
定量試験※		98.9	99.4	99.4	99.3

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

\*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(3000lx)

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)

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

XIII. 備考「配合変化試験成績」参照<sup>13)</sup>

7. 溶出性

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」<sup>14)</sup>

試験方法	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に従い、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	50rpm : pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
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>

f2関数の値が42以上であった。

<50rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

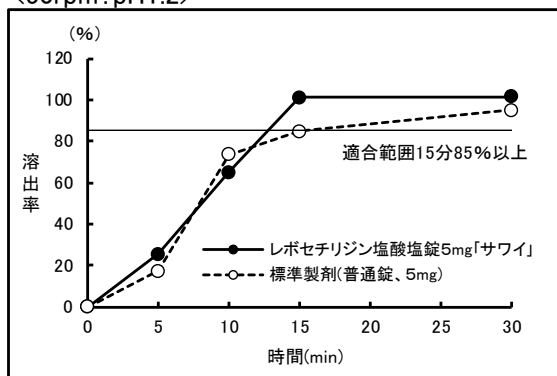
<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

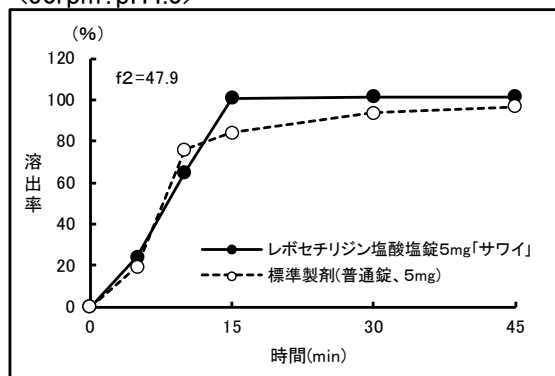
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

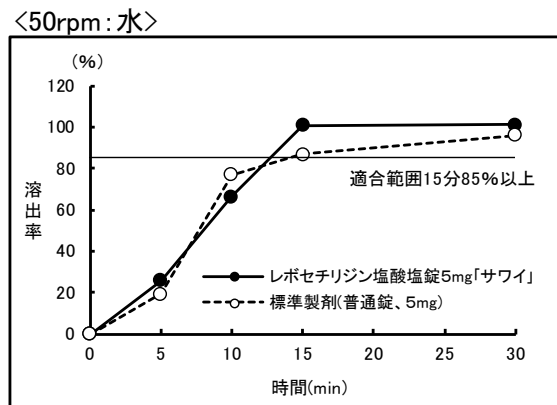
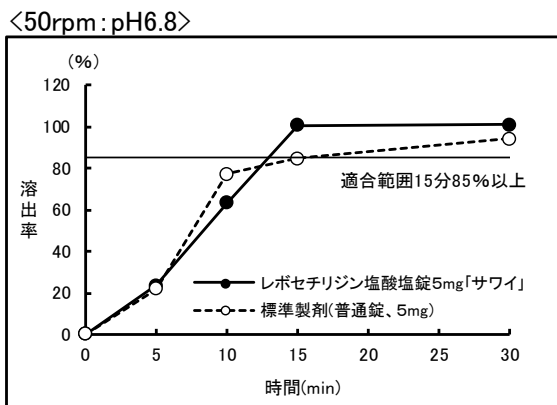
<50rpm : pH1.2>



<50rpm : pH4.0>







●レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」<sup>15)</sup>

試験方法	「剤形が異なる製剤の追加のための生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発 0229 第10号)に従い、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	50rpm : pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
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>

標準製剤の平均溶出率が60% (15分\*)及び85% (15分) 付近において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

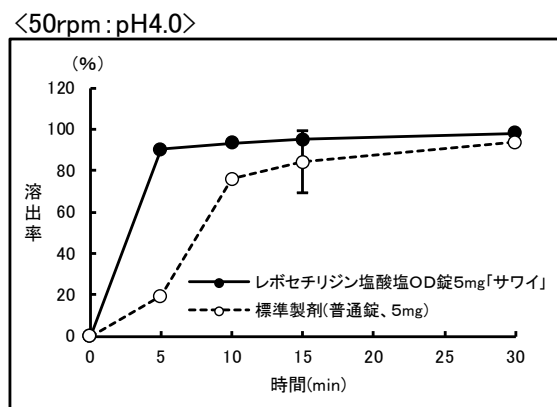
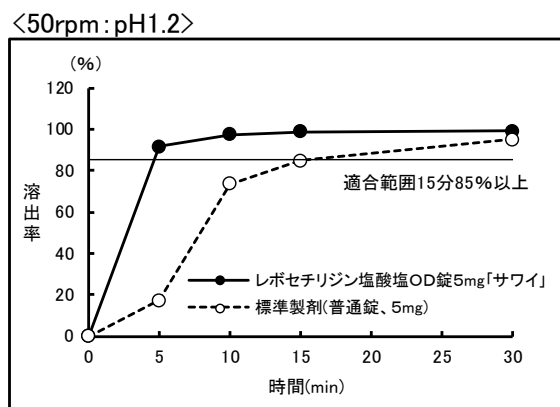
<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

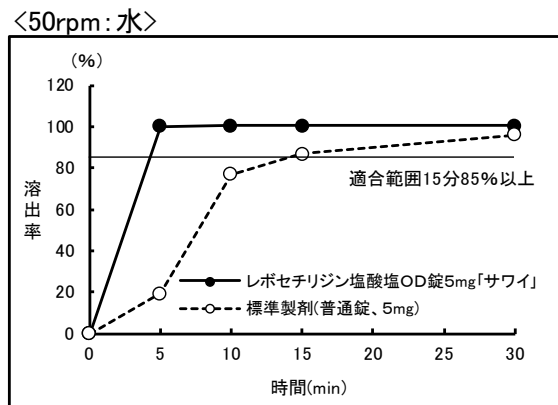
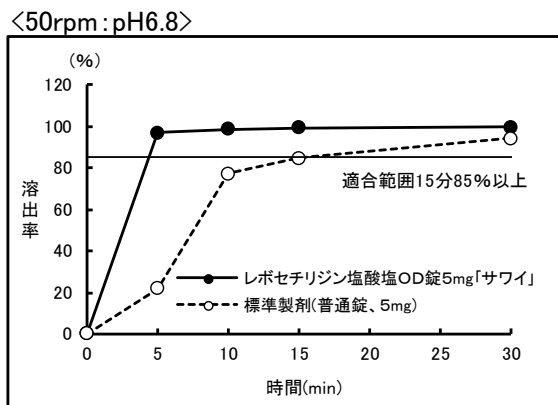
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

※：比較時点が15分未満となったため、比較時点を15分として溶出挙動の評価を行った。

(溶出曲線)



IV. 製剤に関する項目



( [ ] : 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 .....

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg / OD錠 5mg「サワイ」

紫外可視吸光度測定法

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

液体クロマトグラフィー

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 .....

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」のキャップは乳幼児の誤飲防止機能(チャイルドレジスタンス機能: プッシュアンドターンタイプ)付きである。

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

〔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

#### ●レボセチリジン塩酸塩錠5mg/OD錠5mg「サワイ」

〔成人〕

通常、成人にはレボセチリジン塩酸塩として1回5mg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10mgとする。

〔小児〕

通常、7歳以上15歳未満の小児にはレボセチリジン塩酸塩として1回2.5mg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>

- 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	5mgを 1日に1回	2.5mgを 1日に1回	2.5mgを 2日に1回	2.5mgを週に2回 (3~4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。

〔レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」のみ〕

- 2) OD錠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)

#### ●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

〔成人〕

通常、成人には1回10mL(レボセチリジン塩酸塩として5mg)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20mL(レボセチリジン塩酸塩として10mg)とする。

〔小児〕

通常、6ヵ月以上1歳未満の小児には1回2.5mL(レボセチリジン塩酸塩として1.25mg)を1日1回経口投与する。

通常、1歳以上7歳未満の小児には1回2.5mL(レボセチリジン塩酸塩として1.25mg)を1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。

## V. 治療に関する項目

通常、7歳以上15歳未満の小児には1回5mL(レボ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・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	5mgを 1日に1回	2.5mgを 1日に1回	2.5mgを 2日に1回	2.5mgを週に2回 (3~4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

非鎮静性H<sub>1</sub>受容体拮抗薬：ロラタジン、メキタジン、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、レボカバスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩<sup>1)</sup>

2. 薬理作用

レボ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

レボセチリジンは血液脳関門を通過しにくい非鎮静性H<sub>1</sub>受容体拮抗薬である。ヒスタミンと受容体を競合しその作用を遮断することでアレルギー反応を抑制する。<sup>1)</sup>

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

レボ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>

●レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」<sup>16,17)</sup>

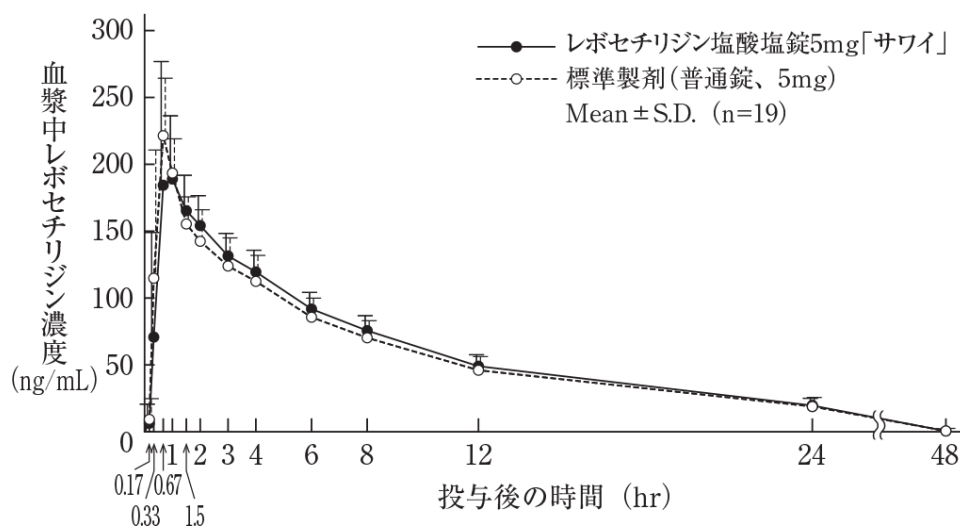
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(レボセチリジン塩酸塩として5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中レボセチリジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6、8、12、24、48hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

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>0-48hr</sub> (ng・hr/mL)
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」	227±48	1.0±0.5	8.4±1.3	1830±270
標準製剤 (普通錠、5mg)	240±38	0.7±0.2	8.5±1.5	1759±339

(Mean±S.D., n=19)



Ⅶ. 薬物動態に関する項目

	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-48hr</sub>	log(1.05)	log(1.00)～log(1.10)
Cmax	log(0.94)	log(0.86)～log(1.02)

●レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」<sup>18,19)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「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(レボ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、血漿中レボ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。

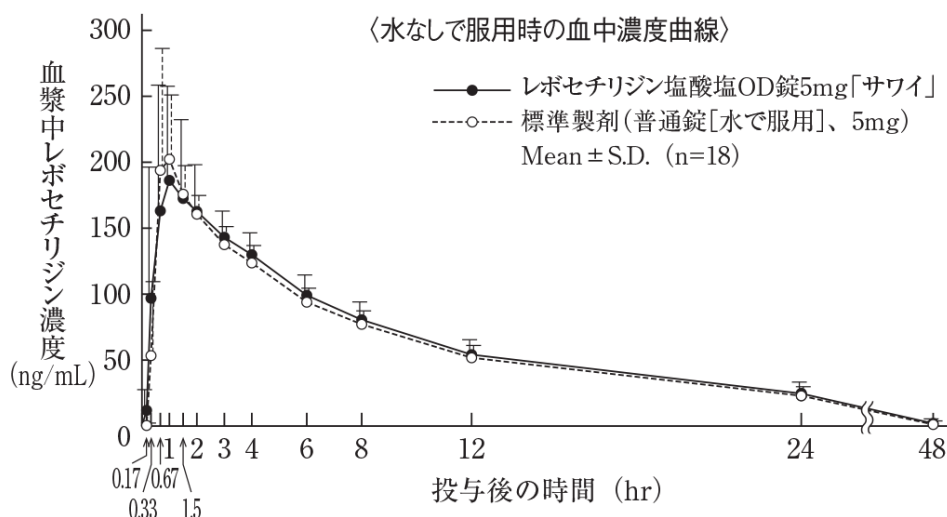
採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6、8、12、24、48hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

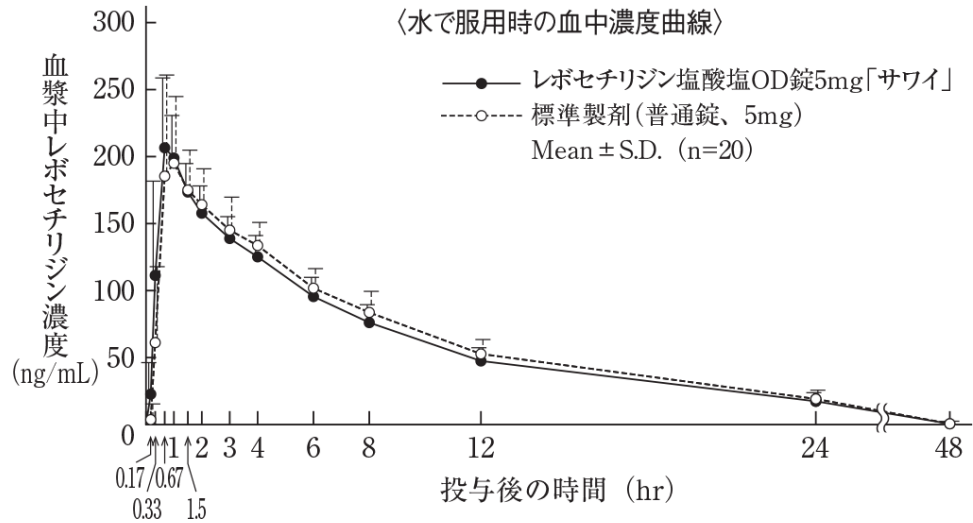
		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-48hr</sub> (ng·hr/mL)
※ 水なし (n=18)	レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「サワイ」	232±36	1.1±0.6	9.3±1.5	2045±400
	標準製剤 (普通錠、5mg)	234±45	1.0±0.6	9.2±1.4	1954±303
水あり (n=20)	レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「サワイ」	225±29	0.9±0.6	7.5±1.1	1834±311
	標準製剤 (普通錠、5mg)	220±46	1.1±0.8	7.5±1.0	1943±355

※標準製剤は水で服用

(Mean±S.D.)







		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC <sub>0-48hr</sub>	log(1.05)	log(1.01)～log(1.08)
	Cmax	log(1.01)	log(0.92)～log(1.11)
水あり	AUC <sub>0-48hr</sub>	log(0.95)	log(0.91)～log(0.98)
	Cmax	log(1.04)	log(0.96)～log(1.12)

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」<sup>20)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ10mL(レボ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、血漿中レボ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。

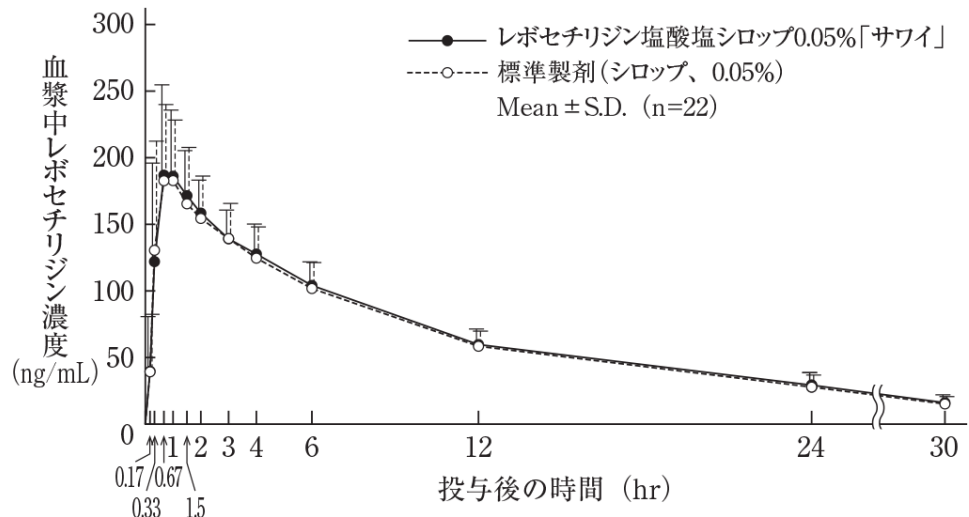
採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6、12、24、30hr
休薬期間	3日間以上
測定方法	高速液体クロマトグラフィー/タンデム質量分析(LC-MS/MS)法

各製剤10mL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>0-30hr</sub> (ng・hr/mL)
レボセチリジン塩酸塩 シロップ0.05%「サワイ」	206.8±43.71	1.0±0.5	8.9±1.4	1978±367.3
標準製剤 (シロップ、0.05%)	212.9±49.41	1.0±0.6	8.8±1.1	1930±371.5

(Mean±S.D., n=22)

VII. 薬物動態に関する項目



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-30hr</sub>	log (1. 0244)	log (0. 9835) ~log (1. 0670)
Cmax	log (0. 9741)	log (0. 9134) ~log (1. 0387)

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。

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

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(レボセチリジン塩酸塩として5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>16, 17)</sup>

$$0.085 \pm 0.014 \text{hr}^{-1}$$

- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(レボセチリジン塩酸塩として5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>18,19)</sup>  
[水なし]0.077±0.013hr<sup>-1</sup>、[水あり]0.094±0.013hr<sup>-1</sup>
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」を健康成人男子に10mL(レボセチリジン塩酸塩として5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>20)</sup>  
0.079±0.013hr<sup>-1</sup>

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

ジアゼパムサイト92%<sup>2)</sup>

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

1) 血液-脳関門通過性

通過しにくい。<sup>1)</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

セチリジン<sup>注)</sup>塩酸塩において、ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。

注)ラセミ体であるセチリジンのR-エナンチオマーがレボセチリジンである。

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

ほとんど代謝されず、代謝の寄与は3.5%であった。酸化、グルクロン酸抱合、タウリン抱合、グルタチオン抱合を受けて代謝される。<sup>2)</sup>

VII. 薬物動態に関する項目

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

主として腎臓から排泄される。

2) 排泄率

尿中未変化体排泄率は77% (48hrまで) で、尿中回収率は85% (168hrまで) である。<sup>2)</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 .....

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(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	セチリジン <sup>注)</sup> 塩酸塩との併用により、テオフィリンの薬物動態に変化はないが、セチリジン <sup>注)</sup> 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 <sup>注)</sup> 塩酸塩のクリアランスが16%減少する。
リトナビル	セチリジン <sup>注)</sup> 塩酸塩との併用により、セチリジン <sup>注)</sup> 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 <sup>注)</sup> 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	セチリジン <sup>注)</sup> 塩酸塩との併用により、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。

注)ラセミ体であるセチリジンのR-エナンチオマーがレボセチリジンである。

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) 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)、 $\gamma$ -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**：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

## 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、傾眠、疲労、無力症、睡眠障害、錯感覚、幻覚、自殺念慮、失神、健忘 <sup>注)</sup> 、不随意運動 <sup>注)</sup> 、意識消失 <sup>注)</sup> 、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 <sup>注)</sup> 、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍 <sup>注)</sup> 、心房細動
血液	好酸球増多 <sup>注)</sup> 、好中球減少、リンパ球増多 <sup>注)</sup> 、白血球増多、白血球減少、単球増多 <sup>注)</sup> 、血小板増加 <sup>注)</sup> 、血小板減少 <sup>注)</sup>
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、薬疹
眼	結膜充血、霧視、視覚障害、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 <sup>注)</sup> 、BUN上昇、尿糖 <sup>注)</sup> 、ウロビリノーゲンの異常 <sup>注)</sup> 、頻尿、血尿 <sup>注)</sup> 、排尿困難、尿閉、遺尿 <sup>注)</sup>
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、呼吸困難

注)セチリジン塩酸塩でのみ認められている副作用(ラセミ体であるセチリジンのR-エナンチオマーがレボセチリジンである。)

## 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(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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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、薬疹

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2.5mg)から投与を開始するなど慎重に投与すること。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。〔セチリジン<sup>注)</sup>塩酸塩において、ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。〕
- 注) ラセミ体であるセチリジンのR-エナンチオマーがレボセチリジンである。

11. 小児等への投与

[錠 5 mg / OD錠 5 mg]  
 低出生体重児、新生児、乳児又は7歳未満の小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はない)。  
 [シロップ0.05%]  
 低出生体重児、新生児又は6ヵ月未満の乳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はない)。

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傾眠傾向があらわれることがある。特に小児では激越、落ち着きのなさ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 .....

[錠 5mg/OD錠 5mg]

- 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)
- 2) 服用時(OD錠のみ)：
  - (1)OD錠は舌の上のにせ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)OD錠は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

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

---

レボセチリジン塩酸塩の非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

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) 急性毒性試験  
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  
VIII. -10. 参照
  
  - 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	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	該当しない

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間又は使用期限

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg / シロップ 0.05% 「サワイ」

使用期限：3年

- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg 「サワイ」

使用期限：30ヵ月

### 3. 貯法・保存条件

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg / OD錠 5 mg 「サワイ」

室温保存

- レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05% 「サワイ」

遮光室温保存

X. -4. 参照

### 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

- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg 「サワイ」

・取扱い上の注意

OD錠 5 mg：アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

#### 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)

患者向医薬品ガイド：有り、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

X. 管理的事項に関する項目

6. 包装

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」  
PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)
- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」  
PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」  
200mL

7. 容器の材質

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」  
PTP：[PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミニウム箔  
[ピロー]アルミニウム袋
- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」  
PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミニウム箔  
[ピロー]アルミニウム袋
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」  
瓶：褐色ガラス  
中栓：ポリエチレン  
キャップ：ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ザイザル錠 5 mg/OD錠 2.5 mg/OD錠 5 mg/シロップ 0.05%

同効薬：非鎮静性H<sub>1</sub>受容体拮抗薬

ロラタジン、メキタジン、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、レボカバスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩<sup>1)</sup>

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

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」  
製造販売承認年月日：2020年2月17日、承認番号：30200AMX00108000
- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」  
製造販売承認年月日：2020年2月17日、承認番号：30200AMX00159000
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」  
製造販売承認年月日：2020年2月17日、承認番号：30200AMX00232000

11. 薬価基準収載年月日 .....  
2020年6月19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(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
レボセチリジン塩酸塩 錠5mg「サワイ」	128136101	4490028F1116	622813601
レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「サワイ」	128137801	4490028F4042	622813701
レボセチリジン塩酸塩 シロップ0.05%「サワイ」	128138501	4490028Q1052	622813801

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) 田中千賀子他編, NEW薬理学, 改訂第7版, 南江堂, 2017, p. 157-160.
- 2) 平田純生他編, 透析患者への投薬ガイドブック 慢性腎臓病(CKD)の薬物治療, 改訂3版, じほう, 2017, p. 390-391.
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験]レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験]レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験]レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験]レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験]レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験]レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験]レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験]レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[苛酷試験(褐色ガラス容器の安定性)]レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
- 13) 沢井製薬(株) 社内資料[配合変化試験成績]レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」
- 15) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 16) 田中孝典他, 診療と新薬, 57(5), 417(2020).
- 17) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」
- 18) 中川美聡他, 診療と新薬, 57(5), 424(2020).
- 19) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」
- 20) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

### 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 .....

**配合変化試験成績**

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」<sup>13)</sup>

＜配合変化試験の配合方法＞

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」(以下、当社製剤)と、他剤または食品・飲料を直接配合した後、性状(外観、再分散性(他剤と配合した場合のみ))を観察し、pHおよび含量を測定(繰り返し回数：1回)した。

性状観察およびpH測定は表中記載の配合量で試験を実施し、含量測定は表中記載の配合量下段の( )内の配合量で試験を実施した。

含量は、配合直後のレボセチリジン塩酸塩量を100としたときの残存率を%で示し、( )には表示量に対する含有率を%で示した。

(保存条件)温度：25±2℃ 湿度：60±5%RH

    期間：7日間(薬剤との配合)、6時間(食品・飲料との配合)

    貯法：ガラス製試験管・密栓、遮光(性状観察およびpH測定用)

        褐色メスフラスコ・密栓、遮光(含量測定用)

再分散性：試験液を入れた試験管を5秒間倒立させ、次いで5秒間正立させる。この操作を1回として、懸濁液が均質に分散するまでの回数をカウントする。

※2020年6月作成の配合変化試験成績を掲載した。

# レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」 配合変化試験成績

## 【他剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量 <sup>†</sup>	試験項目	配合結果		
	品名	成分名	配合量 <sup>†</sup>			配合直後	3日後	7日後
解熱鎮痛消炎剤	アセトアミノフェン細粒20% (TYK)	アセトアミノフェン	50g (1g)	250mL (5mL)	外観	淡橙色の懸濁液	淡橙色の懸濁液	淡橙色の懸濁液
					再分散性	—	9回	10回
					pH	5.21	5.24	5.29
					含量	実測値 (mg/mL)	0.490	0.475
	残存率 (%)	100.0(98.0)	96.9	98.2				
	カロナールシロップ2%	アセトアミノフェン	250mL (10mL)	125mL (5mL)	外観	無色透明の液	無色透明の液	無色透明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	5.23	5.23	5.26
含量					実測値 (mg/mL)	0.494	0.489	0.492
	残存率 (%)	100.0(98.8)	99.0	99.6				
精神神経用剤	アタラックス-Pシロップ 0.5%	ヒドロキシジ ンパモ酸塩	30mL (10mL)	15mL (5mL)	外観	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液
					再分散性	—	26回	22回
					pH	4.78	4.79	4.80
					含量	実測値 (mg/mL)	0.490	0.485
残存率 (%)	100.0(98.0)	99.0	98.6					
鎮咳剤	クロフェドリンS配合シロップ	ジヒドロコ デインリン 酸塩・dl-メ チルエフェ ドリン塩 酸塩・クロ ルフェニラ ミンマレ イン酸塩	100mL (2mL)	250mL (5mL)	外観	暗褐色透明の液	暗褐色透明の液	暗褐色透明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	5.94	5.94	5.98
					含量	実測値 (mg/mL)	0.493	0.495
残存率 (%)	100.0(98.6)	100.4	99.6					
去たん剤	ムコダインシロップ5%	L-カルボ ンステイン	240mL (12mL)	100mL (5mL)	外観	淡褐色透明の液	淡褐色透明の液	淡褐色透明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	5.59	5.64	5.65
					含量	実測値 (mg/mL)	0.492	0.493
	残存率 (%)	100.0(98.4)	100.2	100.2				
	小児用ムコソルバン シロップ0.3%	アンブロキ ソール塩 酸塩	180mL (6mL)	150mL (5mL)	外観	無色透明の液	無色透明の液	無色透明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	4.08	4.08	4.12
含量					実測値 (mg/mL)	0.497	0.491	0.492
	残存率 (%)	100.0(99.4)	98.8	99.0				
鎮咳去たん剤	アスピリンシロップ0.5%	チベジン ヒベンズ 酸塩	100mL (2mL)	250mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液
					再分散性	—	4回	4回
					pH	5.02	5.02	5.07
					含量	実測値 (mg/mL)	0.486	0.480
残存率 (%)	100.0(97.2)	98.8	99.2					
気管支拡張剤	ベネトリンシロップ0.04%	サルブタ モール硫 酸塩	180mL (6mL)	150mL (5mL)	外観	無色透明の粘性のある液	無色透明の粘性のある液	無色透明の粘性のある液
					再分散性*	—	—	—
					pH	4.27	4.30	4.33
					含量	実測値 (mg/mL)	0.494	0.492
残存率 (%)	100.0(98.8)	99.6	99.8					
ビタミンB剤	フラビタンシロップ0.3%	フラビン アデニン ジヌクレ オチドナ トリウム	100mL (2mL)	250mL (5mL)	外観	黄色透明の液	黄色透明の液	黄色透明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	5.11	5.11	5.12
					含量	実測値 (mg/mL)	0.497	0.496
残存率 (%)	100.0(99.4)	99.8	99.0					

†含量は下段に記載の( )の配合量で測定

\*試験液が澄明な液であったため再分散性は確認しなかった。



【他剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量 <sup>†</sup>	試験項目	配合結果		
	品名	成分名	配合量 <sup>†</sup>			配合直後	3日後	7日後
副腎ホルモ ン剤	リンデロンシロップ0.01%	ベタメタゾン	75mL (1.5mL)	250mL (5mL)	外観	淡橙色澄明の液	淡橙色澄明の液	淡橙色澄明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	4.73	4.73	4.74
					含量	実測値 (mg/mL)	0.498	0.504
	残存率 (%)	100.0(99.6)	101.2	99.6				
	セlestamin配合シロップ	ベタメタゾン・ d-クロルフェ ニラミンマレ イン酸塩	175mL (5mL)	175mL (5mL)	外観	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	4.34	4.35	4.44
含量					実測値 (mg/mL)	0.498	0.495	0.498
	残存率 (%)	100.0(99.6)	99.4	100.0				
代謝性医薬 品	ハイチオール散32%	L-システイン	14.4g (1.6g)	45mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液
					再分散性	—	6回	1回
					pH	4.82	4.25	4.25
					含量	実測値 (mg/mL)	0.498	0.476
残存率 (%)	100.0(99.6)	95.6	92.2					
抗ヒスタ ミン剤	ポララミンシロップ0.04%	d-クロルフェ ニラミンマレ イン酸塩	175mL (5mL)	175mL (5mL)	外観	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液
					再分散性*	—	—	—
					pH	5.27	5.26	5.29
					含量	実測値 (mg/mL)	0.491	0.491
残存率 (%)	100.0(98.2)	100.0	100.2					
アレルギー 用剤	アレロック顆粒0.5%	オロパタジン 塩酸塩	50g (1g)	250mL (5mL)	外観	淡赤色の顆粒を含む 懸濁液	淡赤色の顆粒を含む 懸濁液	淡赤色の顆粒を含む 懸濁液
					再分散性	—	1回	2回
					pH	5.03	5.02	5.04
					含量	実測値 (mg/mL)	0.492	0.491
残存率 (%)	100.0(98.4)	99.8	100.0					
抗生物質製 剤	フロモックス小児用細粒 100mg	セフカベン ピボキシル 塩酸塩水和 物	16.2g (1.8g)	45mL (5mL)	外観	赤白色の細粒を含む 懸濁液	赤白色の細粒を含む 懸濁液	赤白色の細粒を含む 懸濁液
					再分散性	—	2回	2回
					pH	4.74	4.02	3.68
					含量	実測値 (mg/mL)	0.441	0.323
	残存率 (%)	100.0(88.2)	73.2	60.8				
	エリスロシンドライシロップ 10%	エリスロマイ シンエチルコ ハク酸エステ ル	150g (5g)	150mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液
					再分散性	—	1回	1回
					pH	6.45	6.47	6.47
					含量	実測値 (mg/mL)	0.474	0.473
	残存率 (%)	100.0(94.8)	99.8	100.2				
	クラリスドライシロップ10% 小児用	クラリスロマ イシン	18g (2g)	45mL (5mL)	外観	赤白色の懸濁液	赤白色の懸濁液	赤白色の懸濁液
					再分散性	—	7回	8回
pH					9.97	10.16	10.02	
含量					実測値 (mg/mL)	0.311	0.313	0.301
	残存率 (%)	100.0(62.2)	100.6	96.8				

†含量は下段に記載の( )の配合量で測定

\*試験液が澄明な液であったため再分散性は確認しなかった。

# レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」 配合変化試験成績

## 【食品・飲料との配合】

分類	配合品		当社製剤 配合量 <sup>†</sup>	試験項目	配合結果		
	品名	配合量 <sup>†</sup>			配合直後	6時間後	
食 品 ・ 飲 料	なっちゃんオレンジジュース	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	淡黄色の懸濁液	淡黄色の懸濁液	
				pH	3.77	3.78	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.496	0.495
					残存率 (%)	100.0(99.2)	99.8
	びゅあ(粉ミルク)	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	
				pH	6.65	6.78	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.485	0.489
					残存率 (%)	100.0(97.0)	100.8
	Bigプッチンプリン	150g (25g)	30mL (5mL)	外観	淡橙黄色の懸濁液	淡橙黄色の懸濁液	
				pH	6.34	6.35	
含量				実測値 (mg/mL)	0.483	0.488	
				残存率 (%)	100.0(96.6)	101.0	
ブルガリアヨーグルトL81プレーン	150g (25g)	30mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液		
			pH	4.19	4.17		
			含量	実測値 (mg/mL)	0.485	0.494	
				残存率 (%)	100.0(97.0)	101.9	
エッセルスーパーカップ超バニラ	150g (25g)	30mL (5mL)	外観	微黄白色の懸濁液	微黄白色の懸濁液		
			pH	6.46	6.40		
			含量	実測値 (mg/mL)	0.498	0.493	
				残存率 (%)	100.0(99.6)	99.0	
健康ミネラルむぎ茶	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液		
			pH	6.50	6.64		
			含量	実測値 (mg/mL)	0.482	0.482	
				残存率 (%)	100.0(96.4)	100.0	
ポカリスエット	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	白色のわずかに懸濁した液	白色のわずかに懸濁した液		
			pH	3.89	3.92		
			含量	実測値 (mg/mL)	0.482	0.479	
				残存率 (%)	100.0(96.4)	99.4	
奥大山の天然水	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	無色澄明の液	無色澄明の液		
			pH	5.23	5.23		
			含量	実測値 (mg/mL)	0.476	0.479	
				残存率 (%)	100.0(95.2)	100.6	
日局 単シロップ	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	無色澄明の液	無色澄明の液		
			pH	5.12	5.12		
			含量	実測値 (mg/mL)	0.482	0.482	
				残存率 (%)	100.0(96.4)	100.0	

<sup>†</sup>含量は下段に記載の( )の配合量で測定



