

# 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 2.5mg「YD」  
 レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」  
 レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「YD」  
 レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」  
 レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5% 「YD」  
 LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE TABLETS  
 LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS  
 LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE DRY SYRUP

剤形	錠 2.5mg、錠 5mg：フィルムコーティング錠 OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg：素錠 ドライシロップ：ドライシロップ剤	
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 2.5mg、OD 錠 2.5mg	1 錠中、レボセチリジン塩酸塩 2.5mg を含有する。
	錠 5mg、OD 錠 5mg	1 錠中、レボセチリジン塩酸塩 5mg を含有する。
	ドライシロップ 0.5%	1 g 中、レボセチリジン塩酸塩 5mg を含有する。
一般名	和名：レボセチリジン塩酸塩（JAN） 洋名：Levocetirizine hydrochloride（JAN）	
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	令和2年2月17日
	薬価基準収載年月日	令和2年6月19日
	発売年月日	令和2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：株式会社陽進堂	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	株式会社陽進堂 お客様相談室 ☎ 0120-647-734 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.yoshindo.co.jp">https://www.yoshindo.co.jp</a>	

本IFは2020年10月改訂（第2版）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

<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

# I F 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、I F と略す）の位置付け並びに I F 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 I F 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 I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F 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-I F）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場合の e-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F 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 (<https://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-I F 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-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F 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。

平成 20 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、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. I F とは

I F 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 I F 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 I F 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。

### 〔I F の様式〕

- ① 規格は A 4 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。
- ② I F 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「I F 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。

#### [ I F の作成 ]

- ① I F 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。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F 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、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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。

#### [ I F の発行 ]

- ① 「I F 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、「I F 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 I F が改訂される。

### 3. I F の利用にあたって

「I F 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 I F 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、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、I F 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、I F 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、I F 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

I F 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。I F 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、I F 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。

(2013 年 4 月改訂)

# 目 次

I.	概要に関する項目	5
1.	開発の経緯	
2.	製品の治療学的・製剤学的特性	
II.	名称に関する項目	6
1.	販売名	
2.	一般名	
3.	構造式又は示性式	
4.	分子式及び分子量	
5.	化学名（命名法）	
6.	慣用名、別名、略号、記号番号	
7.	C A S登録番号	
III.	有効成分に関する項目	8
1.	物理化学的性質	
2.	有効成分の各種条件下における安定性	
3.	有効成分の確認試験法	
4.	有効成分の定量法	
I V.	製剤に関する項目	9
1.	剤 形	
2.	製剤の組成	
3.	懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	
4.	製剤の各種条件下における安定性	
5.	調製法及び溶解後の安定性	
6.	他剤との配合変化（物理化学的変化）	
7.	溶出性	
8.	生物学的試験法	
9.	製剤中の有効成分の確認試験法	
10.	製剤中の有効成分の定量法	
11.	力価	
12.	混入する可能性のある夾雑物	
13.	注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	
14.	その他	
V.	治療に関する項目	20
1.	効能又は効果	
2.	用法及び用量	
3.	臨床成績	
V I.	薬効薬理に関する項目	22
1.	薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	
2.	薬理作用	
V II.	薬物動態に関する項目	23
1.	血中濃度の推移・測定法	
2.	薬物速度論的パラメータ	
3.	吸 収	
4.	分 布	
5.	代 謝	
6.	排 泄	
7.	トランスポーターに関する情報	

8.	透析等による除去率	
<b>V III.</b>	<b>安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	<b>33</b>
1.	警告内容とその理由	
2.	禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	
3.	効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	
4.	用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	
5.	慎重投与内容とその理由	
6.	重要な基本的注意とその理由及び処置方法	
7.	相互作用	
8.	副作用	
9.	高齢者への投与	
10.	妊婦、産婦、授乳婦等への投与	
11.	小児等への投与	
12.	臨床検査結果に及ぼす影響	
13.	過量投与	
14.	適用上の注意	
15.	その他の注意	
16.	その他	
<b>I X.</b>	<b>非臨床試験に関する項目</b>	<b>38</b>
1.	薬理試験	
2.	毒性試験	
<b>X.</b>	<b>管理的事項に関する項目</b>	<b>39</b>
1.	規制区分	
2.	有効期間又は使用期限	
3.	貯法・保存条件	
4.	薬剤取扱い上の注意点	
5.	承認条件等	
6.	包装	
7.	容器の材質	
8.	同一成分・同効薬	
9.	国際誕生年月日	
10.	製造販売承認年月日及び承認番号	
11.	薬価基準収載年月日	
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	
13.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	
14.	再審査期間	
15.	投薬期間制限医薬品に関する情報	
16.	各種コード	
17.	保険給付上の注意	
<b>X I.</b>	<b>文献</b>	<b>42</b>
1.	引用文献	
2.	その他の参考文献	
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b>	<b>42</b>
1.	主な外国での発売状況	
2.	海外における臨床支援情報	
<b>X III.</b>	<b>備考</b>	<b>42</b>
	その他の関連資料	

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

レボセチリジンは第二世代ピペラジン類の  $H_1$  受容体拮抗薬である。セチリジンの活性鏡像体であり、レボセチリジン 2.5mg はセチリジン 5mg に相当する抗ヒスタミン活性を有する。

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」は株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、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、令和 2 年 2 月に承認を得て、令和 2 年 6 月発売に至った。

なお本剤は、後発医薬品として、株式会社陽進堂、キョーリンリメディオ株式会社との合計 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「YD」は株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、長期保存試験を実施し、「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 12 年 2 月 14 日付医薬審第 64 号、平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発 0229 第 10 号一部改正）に基づき、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」を標準製剤として生物学的に同等とみなされ、令和 2 年 2 月に承認を得て、令和 2 年 6 月発売に至った。

なお本剤は、後発医薬品として、株式会社陽進堂、キョーリンリメディオ株式会社との合計 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」は株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、長期保存試験、生物学的同等性試験を実施し、令和 2 年 2 月に承認を得て、令和 2 年 6 月発売に至った。

なお本剤は、後発医薬品として、株式会社陽進堂、日新製薬株式会社との合計 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「YD」は株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、長期保存試験を実施し、「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 12 年 2 月 14 日付医薬審第 64 号、平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発 0229 第 10 号一部改正）に基づき、レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」を標準製剤として生物学的に同等とみなされ、令和 2 年 2 月に承認を得て、令和 2 年 6 月発売に至った。

なお本剤は、後発医薬品として、株式会社陽進堂、日新製薬株式会社との合計 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「YD」は株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、長期保存試験、生物学的同等性試験を実施し、令和 2 年 2 月に承認を得て、令和 2 年 6 月発売に至った。

なお本剤は、後発医薬品として、株式会社陽進堂、キョーリンリメディオ株式会社、日本臓器製薬株式会社との合計 3 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

普通錠、水なしでも服用できる口腔内崩壊錠及びドライシロップ剤の 3 剤形から選択できる。

（6 ヶ月以上 1 歳未満の小児及び 1 歳以上 7 歳未満の小児の用法・用量はドライシロップ剤のみ。）

## 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 2.5mg「YD」  
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」  
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「YD」  
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」  
レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5% 「YD」

#### (2) 洋名

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE TABLETS 2.5mg  
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE TABLETS 5mg  
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS 2.5mg  
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS 5mg  
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE DRY SYRUP 0.5%

#### (3) 名称の由来

成分名

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

レボセチリジン塩酸塩（JAN）

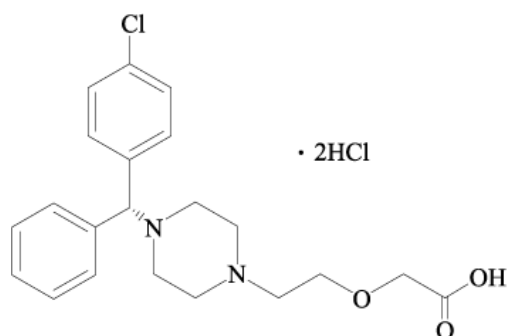
#### (2) 洋名（命名法）

Levocetirizine hydrochloride（JAN）

#### (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： $\text{C}_{21}\text{H}_{25}\text{Cl}_3\text{N}_2\text{O}_3 \cdot 2\text{HCl}$

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

該当資料なし

7. CAS登録番号

130018-87-0



## 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。

#### (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

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(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

液体クロマトグラフィー

# I V. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

### (1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名		レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「YD」	レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」
剤形		フィルムコーティング錠	
色調		白色	
重量		90mg	
形状	表面		
	裏面		
	側面		
		直径 約 6.1mm	長径 約 8.1mm 短径 約 4.6mm
		厚さ 約 2.8mm	厚さ 約 3.2mm

販売名		レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「YD」	レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」
剤形		素錠	
色調		白色	
重量		90mg	
形状	表面		
	裏面		
	側面		
		直径 約 6.5mm	直径 約 8.0mm
		厚さ 約 2.4mm	厚さ 約 3.6mm

#### レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「YD」

白色の円形のフィルムコーティング錠である。

#### レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」

白色の楕円形のフィルムコーティング錠である。

#### レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「YD」

白色の素錠である。

#### レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」

片面割線入りの白色の素錠である。

#### レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「YD」

橙色の粉末を含む粒状のドライシロップ剤である。

### (2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」: YD540 (PTP)  
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」: YD541 (PTP)  
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」: YD511 (本体、PTP)  
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」: YD512 (本体、PTP)  
レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」: YD699 (分包)

(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ドライシロップ 0.5%「Y D」  
本品 2 g を水 20mL に溶かした液の pH は 5.3~6.7 である。

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 2.5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」  
1 錠中、レボセチリジン塩酸塩 2.5mg を含有する。  
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」  
1 錠中、レボセチリジン塩酸塩 5mg を含有する。  
レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」  
1 g 中、レボセチリジン塩酸塩 5mg を含有する。

(2) 添加物

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」

添加物として、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、無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg、酸化チタン、タルク、カルナウバロウを含有する。

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」

添加物として、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、無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg、酸化チタン、タルク、カルナウバロウを含有する。

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」

添加物として、セルロース、クエン酸ナトリウム水和物、ケイ酸 A 1、ヒドロキシプロピルスターチ、香料、1-メントール、シクロデキストリン、アセスルファミカリウム、ステアリン酸 Mg を含有する。

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」

添加物として、セルロース、クエン酸ナトリウム水和物、ケイ酸 A 1、ヒドロキシプロピルスターチ、香料、1-メントール、シクロデキストリン、アセスルファミカリウム、ステアリン酸 Mg を含有する。

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」

添加物として、乳糖水和物、シクロデキストリン、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、アセスルファミカリウム、スクラロース、無水ケイ酸、黄色 5 号、香料を含有する。

(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<sup>1)</sup>

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」

### <長期保存試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、24 ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「YD」は市場流通下において 2 年間安定であることが確認された。<sup>\*1</sup>

保存形態：P T P 包装

試験項目	試験開始時	24ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験 (%) (95.0~105.0)	98.6	98.4

### <加速試験>

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「YD」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。<sup>\*1</sup>

保存形態：P T P 包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験 (%) (95.0~105.0)	98.6	98.3

※1 「安定性データの評価に関するガイドラインについて」（平成 15 年 6 月 3 日 医薬審発第 0603004 号）」に基づき、長期保存試験結果、加速試験結果、及び先発医薬品の使用期限より、有効期間を 3 年として設定する。

### レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」

#### <加速試験>

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」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。

保存形態：P T P 包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験 (%) (95.0~105.0)	99.0	99.2

## レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「Y D」

### <長期保存試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、18 ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「Y D」は市場流通下において1年6 ヶ月間安定であることが確認された。

※2

保存形態：P T P包装

試験項目	試験開始時	18ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	
崩壊試験	適合	
溶出試験	適合	適合
定量試験 (%) (95.0~105.0)	99.8	101.0

### <加速試験>

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「Y D」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。※2

保存形態：P T P包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
崩壊試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験 (%) (95.0~105.0)	99.8	100.5

※2 「安定性データの評価に関するガイドラインについて」（平成 15 年 6 月 3 日 医薬審発第 0603004 号）に基づき、長期保存試験結果、加速試験結果、及び先発医薬品の使用期限より、有効期間を2年6 ヶ月として設定する。

## レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg「Y D」

### <長期保存試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、18 ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg「Y D」は市場流通下において1年6 ヶ月間安定であることが確認された。

※3

保存形態：P T P包装

試験項目	試験開始時	18ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	
崩壊試験	適合	
溶出試験	適合	適合
定量試験 (%) (95.0~105.0)	99.7	100.8

### <加速試験>

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg「YD」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。<sup>※3</sup>

保存形態：PTP包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
崩壊試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.7	100.4

※3 「安定性データの評価に関するガイドラインについて」（平成15年6月3日 医薬審発第0603004号）」に基づき、長期保存試験結果、加速試験結果、及び先発医薬品の使用期限より、有効期間を2年6ヶ月として設定する。

### レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」

#### <長期保存試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、24ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「YD」は市場流通下において2年間安定であることが確認された。<sup>※4</sup>

保存形態：分包品

試験項目	試験開始時	24ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
pH	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.8	100.2

保存形態：バラ包装

試験項目	試験開始時	24ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
pH	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	98.5	100.2

### <加速試験>

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6ヶ月）の結果、レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「YD」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。<sup>※4</sup>

保存形態：分包品

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
pH	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.8	100.0

保存形態：バラ包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
pH	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	98.5	98.1

※4 「安定性データの評価に関するガイドラインについて」(平成15年6月3日 医薬審発第0603004号)に基づき、長期保存試験結果、加速試験結果、及び先発医薬品の使用期限より、有効期間を3年として設定する。

#### 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

#### 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>2)</sup>

溶出挙動における類似性

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移、測定法」を参照

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」

「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13年5月31日付 医薬審発第783号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

試験方法

装置 : パドル法

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5℃

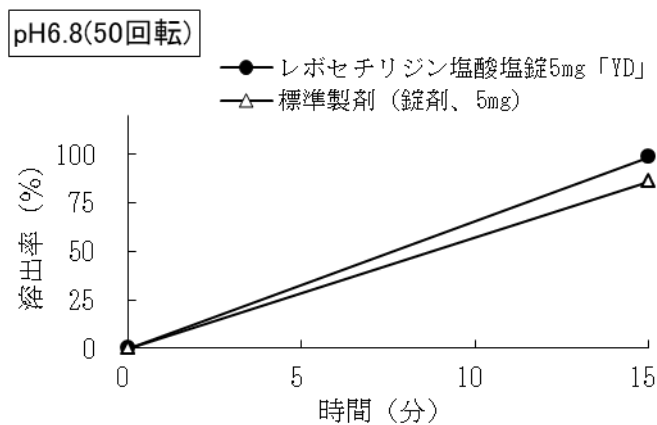
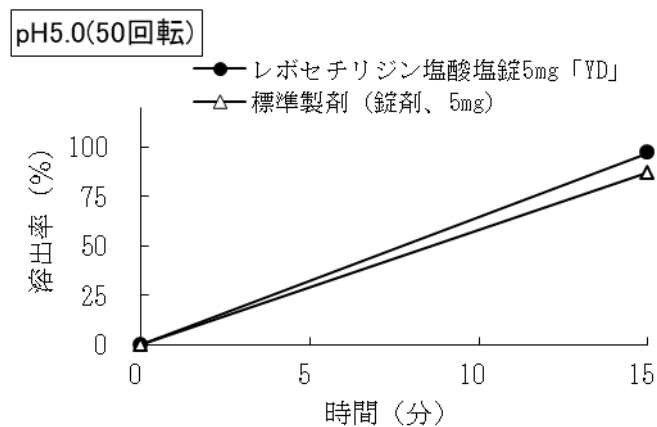
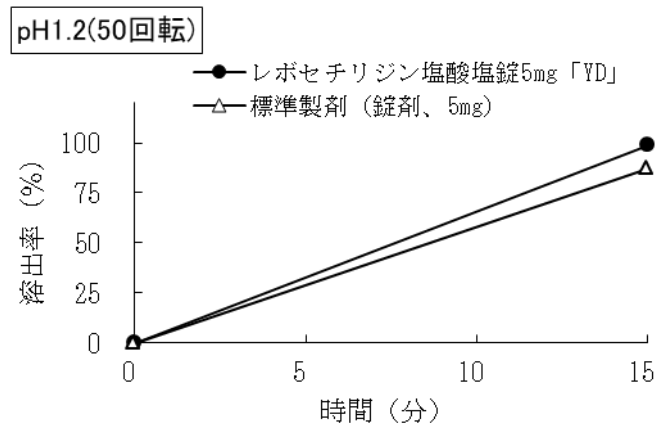
回転数 : 50回転

試験液 : pH1.2=日本薬局方溶出試験第1液  
 pH5.0=薄めた McIlvaine の緩衝液  
 pH6.8=日本薬局方溶出試験第2液  
 水 =日本薬局方精製水

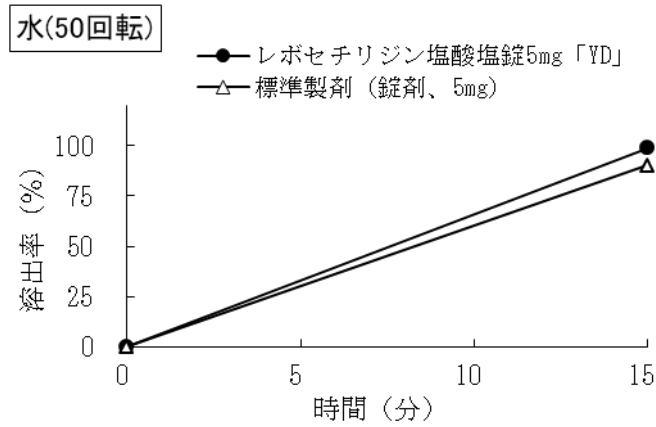
判定基準:【pH1.2、pH5.0、pH6.8、水】

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合、試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

試験結果:







レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「YD」

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移、測定法」を参照

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

試験方法

装置 : パドル法

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5℃

回転数 : 50回転

試験液 : pH1.2=日本薬局方溶出試験第1液

pH3.0=薄めたMcIlvaineの緩衝液

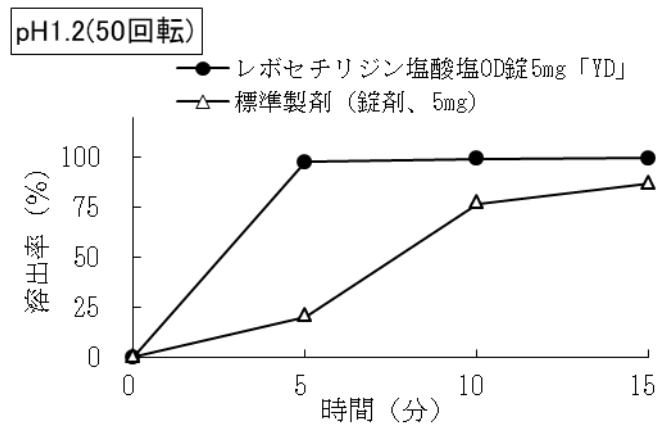
pH6.8=日本薬局方溶出試験第2液

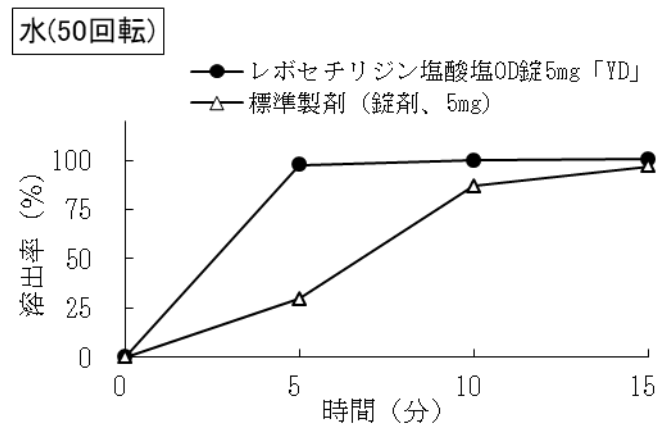
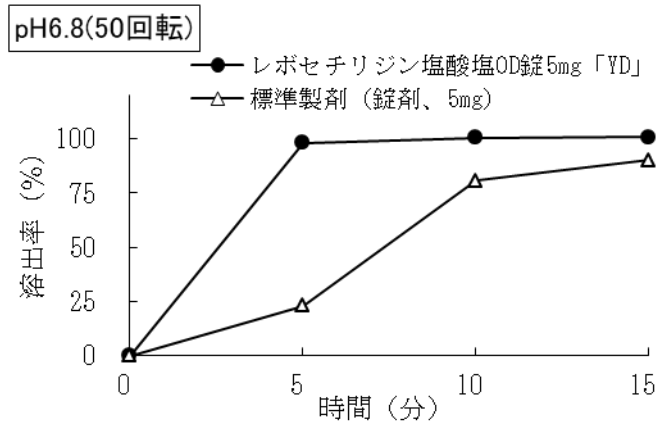
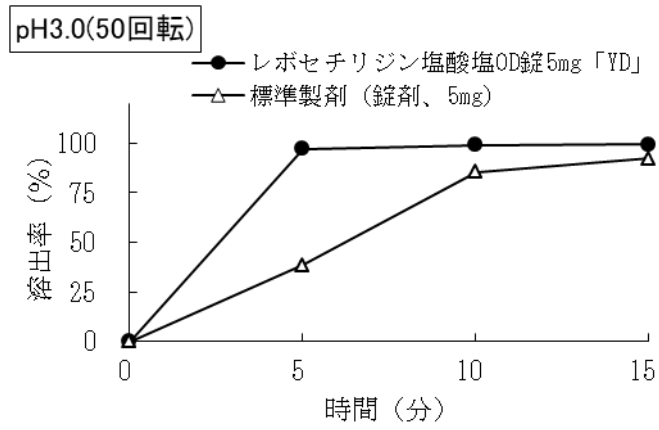
水 = 日本薬局方精製水

判定基準 : 【pH1.2、pH3.0、pH6.8、水】

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合、試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

試験結果 :





**レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」**

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

**試験方法**

装置 : パドル法

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5°C

回転数 : 50回転

試験液 : pH1.2=日本薬局方溶出試験第1液

pH6.5=薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH6.8=日本薬局方溶出試験第2液

水 = 日本薬局方精製水

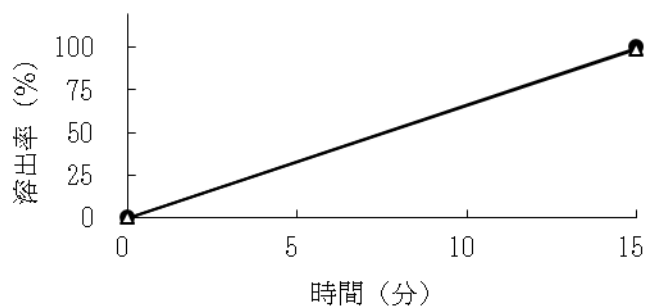
判定基準：【pH1.2、pH6.5、pH6.8、水】

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合、試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

試験結果：

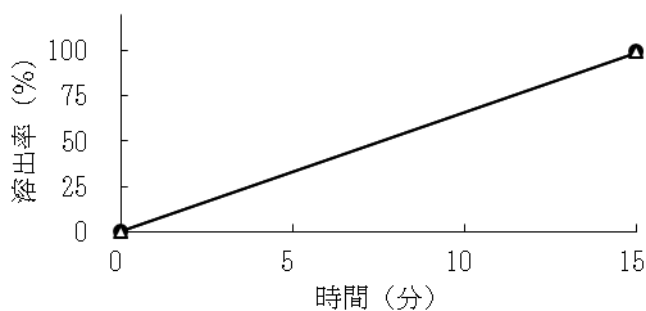
pH1.2(50回転)

● レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」  
▲ 標準製剤（シロップ剤、5mg）



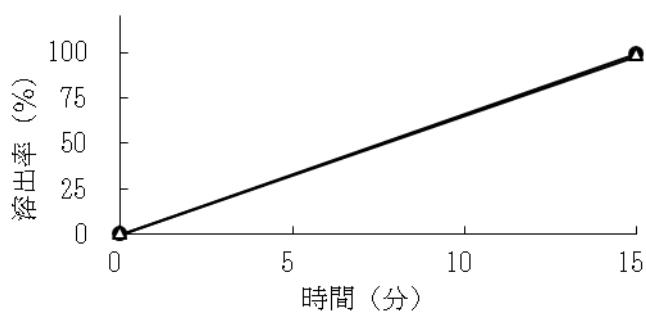
pH6.5(50回転)

● レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」  
▲ 標準製剤（シロップ剤、5mg）

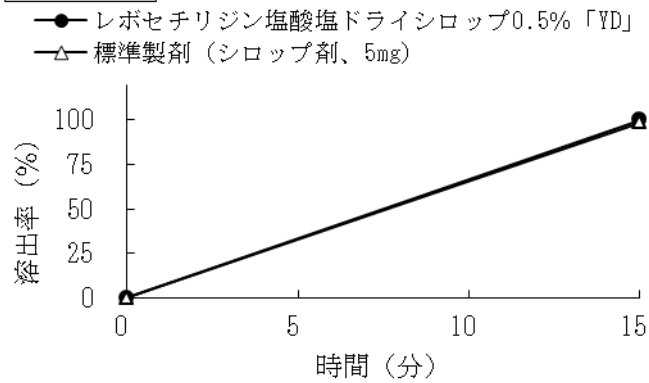


pH6.8(50回転)

● レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」  
▲ 標準製剤（シロップ剤、5mg）



水(50回転)



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

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. 治療上注意が必要な容器・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

### ※効能又は効果に関連する使用上の注意

該当記載なし

### 2. 用法及び用量

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩 0D 錠 2.5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩 0D 錠 5mg「Y D」

〔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。

#### レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」

〔成人〕

通常、成人には1回1g（レボセチリジン塩酸塩として5mg）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2g（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0.25g（レボセチリジン塩酸塩として1.25mg）を1日1回用時溶解して経口投与する。

通常、1歳以上7歳未満の小児には1回0.25g（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0.5g（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用時溶解して経口投与する。

### ※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：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

# V I . 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

セチリジン塩酸塩、ロラタジン、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、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン、デスロラタジン、ビラスチン

## 2. 薬理作用

### (1) 作用部位・作用機序<sup>3), 4)</sup>

レボセチリジンは第二世代ヒペラジン類のH<sub>1</sub>受容体拮抗薬である。セチリジンの活性鏡像体であり、レボセチリジン2.5mg はセチリジン5mg に相当する抗ヒスタミン活性を有する。

### (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

該当資料なし

## V II. 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>2)</sup>

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」

約 0.9 時間

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」

水で服用した場合：約 0.76 時間

水なしで服用した場合：約 1.10 時間

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」

約 0.8 時間

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>2)</sup>

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」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 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号)」に基づき、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」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。

#### 試験方法

装置 : パドル法

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5°C

回転数 : 50 回転

試験液 : p H1.2 = 日本薬局方溶出試験第 1 液

p H5.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液

p H6.8 = 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 = 日本薬局方精製水

判定基準 : 【pH1.2、pH5.0、pH6.8、水】

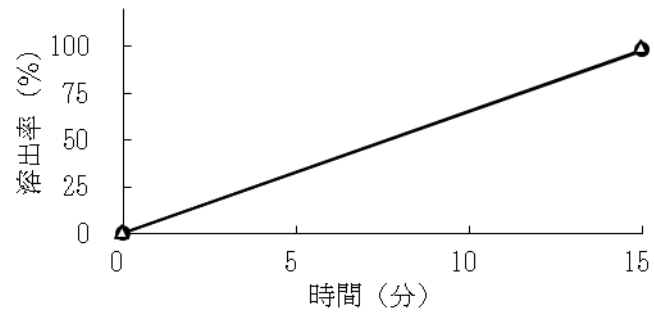
標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合、試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。また、最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。



試験結果：

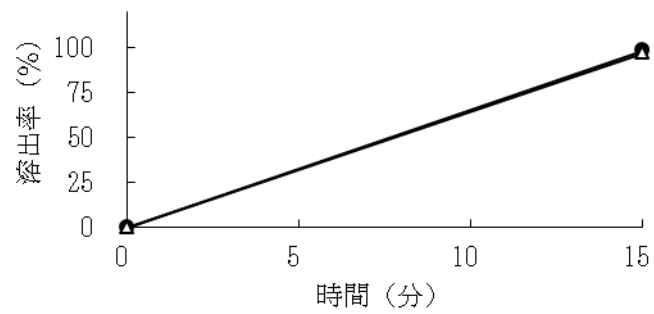
**pH1.2(50回転)**

- レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「YD」
- △ 標準製剤（錠剤、5mg）



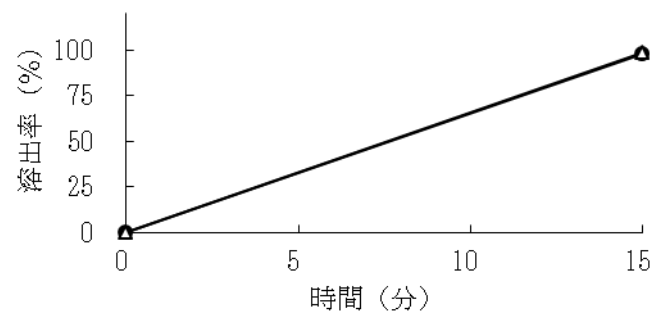
**pH5.0(50回転)**

- レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「YD」
- △ 標準製剤（錠剤、5mg）



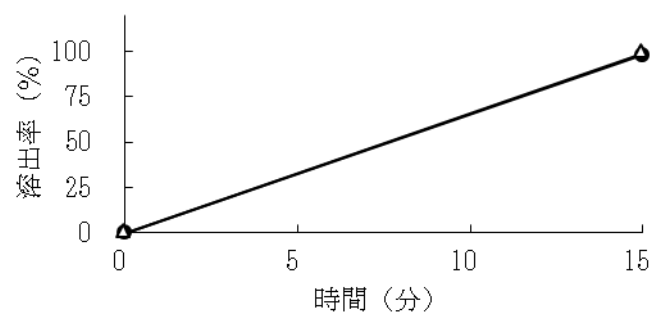
**pH6.8(50回転)**

- レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「YD」
- △ 標準製剤（錠剤、5mg）



**水(50回転)**

- レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「YD」
- △ 標準製剤（錠剤、5mg）



判定時点での試験製剤の溶出率

試験液	pH1.2	pH5.0	pH6.8	水	
判定時点	15分	15分	15分	15分	
平均溶出率%	98.1	98.8	97.9	97.9	
試験製剤	1	95.2	99.6	98.3	98.2
	2	98.5	98.6	99.0	99.4
	3	99.5	99.5	96.7	98.8
	4	99.5	97.7	98.1	99.7
	5	98.6	98.2	99.0	96.3
	6	98.8	97.9	97.6	96.2
	7	97.3	98.2	97.4	97.1
	8	99.1	99.1	96.7	99.4
	9	98.2	100.3	98.2	96.7
	10	98.0	97.6	97.1	98.7
	11	97.7	98.7	97.1	98.0
	12	97.2	99.6	99.5	96.4

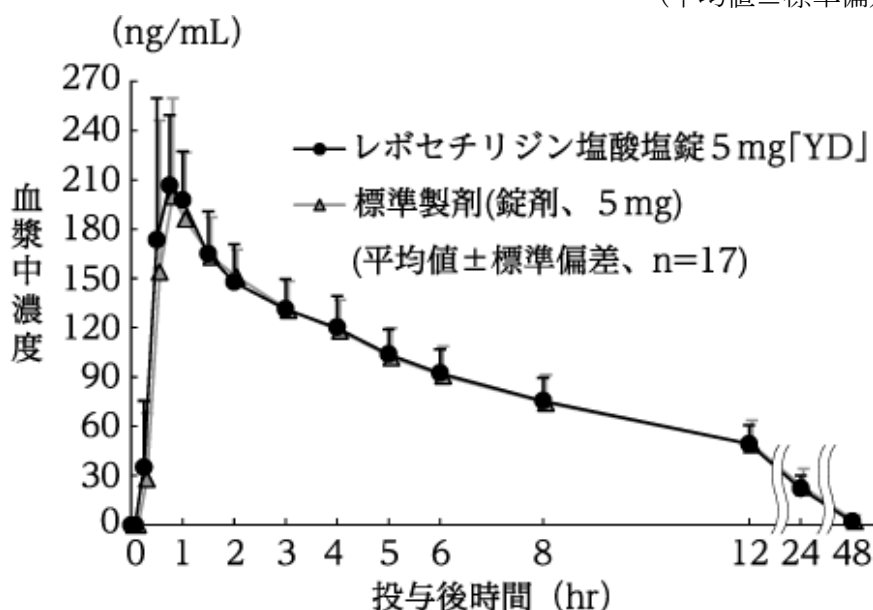
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠(レボセチリジン塩酸塩として5mg)、健康成人男子17名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」	1904.3±395.8	225.6±41.0	0.9±0.8	8.9±1.4
標準製剤 (錠剤、5mg)	1895.6±516.1	218.8±44.6	0.9±0.4	8.9±1.5

(平均値±標準偏差、n=17)



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。

### レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「YD」

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「YD」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24年2月29日薬食審査発0229第10号)」に基づき、レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「YD」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。

#### 試験方法

装置 : パドル法

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5℃

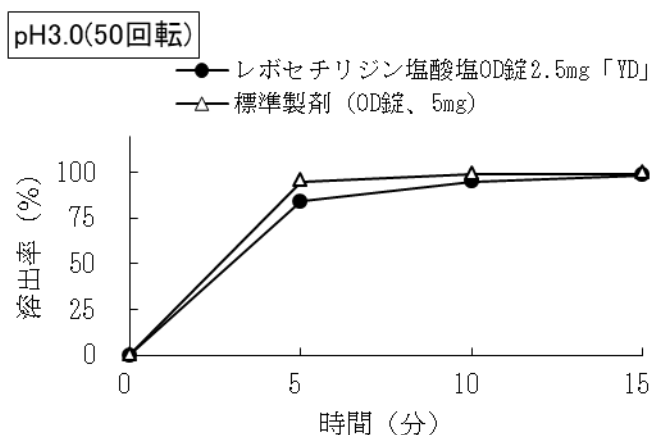
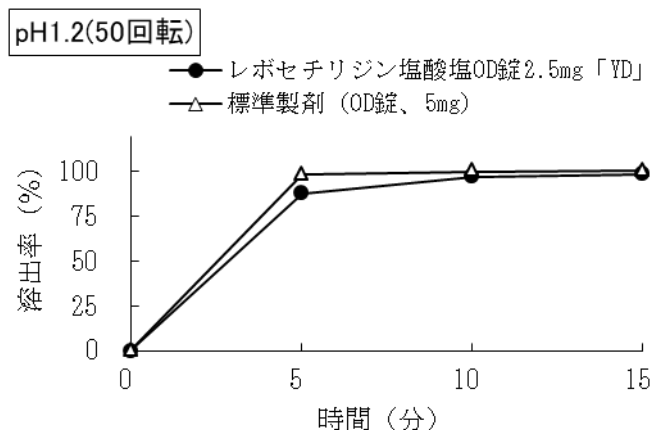
回転数 : 50回転

試験液 : pH1.2=日本薬局方溶出試験第1液  
pH3.0=薄めたMcIlvaineの緩衝液  
pH6.8=日本薬局方溶出試験第2液  
水 = 日本薬局方精製水

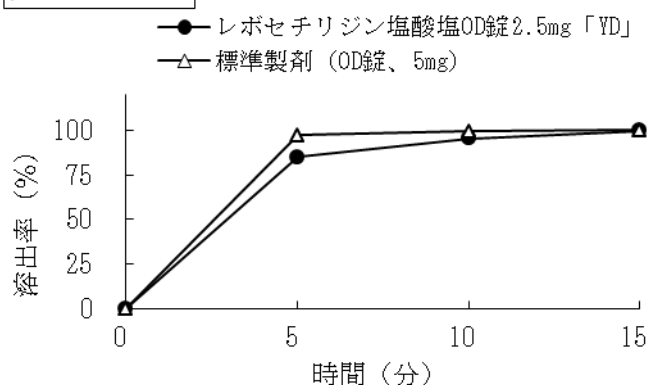
判定基準 : 【pH1.2、pH3.0、pH6.8、水】

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合、試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。また、最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、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い。

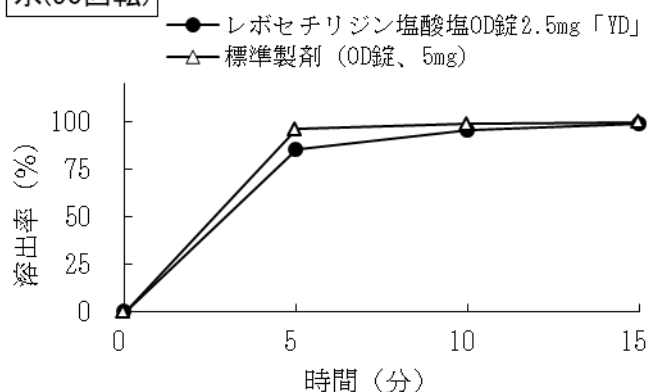
試験結果 :



pH6.8(50回転)



水(50回転)



判定時点での試験製剤の溶出率

試験液	pH1.2	pH3.0	pH6.8	水	
判定時点	15分	15分	15分	15分	
平均溶出率%	98.8	98.5	99.8	98.9	
試験製剤	1	99.6	95.2	98.5	99.6
	2	95.7	98.1	101.3	97.3
	3	99.4	96.3	99.6	101.3
	4	98.7	97.6	103.3	103.0
	5	99.4	100.1	99.9	98.9
	6	99.3	101.7	100.4	96.1
	7	96.6	102.1	99.0	97.8
	8	98.9	99.8	97.2	97.0
	9	100.6	96.2	93.6	102.1
	10	97.4	99.7	100.0	100.0
	11	99.8	98.0	101.9	96.6
	12	100.7	97.1	103.1	97.0

### レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」

「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13年5月31日付医薬審発第783号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

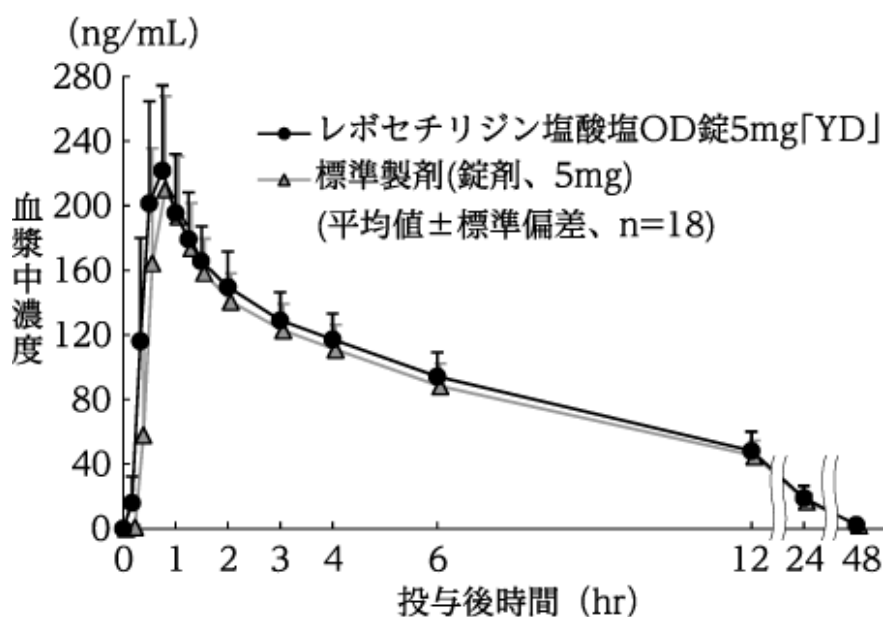
#### (1) 水で服用した場合

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠(レボセチリジン塩酸塩として5mg)、健康成人男子18名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体

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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg 「YD」	1873.13±375.25	236.10±50.22	0.76±0.25	7.98±1.42
標準製剤 (錠剤、5mg)	1724.32±283.99	227.54±49.76	0.81±0.30	7.80±1.35

(平均値±標準偏差、n=18)



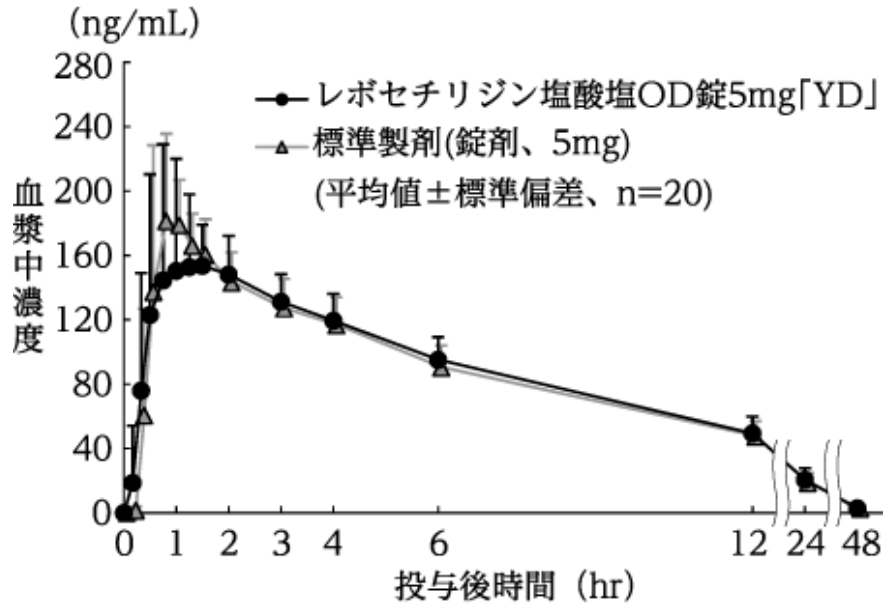
血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## (2) 水なしで服用した場合 (標準製剤は水で服用)

レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg「YD」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 1錠 (レボセチリジン塩酸塩として 5mg)、健康成人男子 20 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg 「YD」	1862.93±318.78	202.18±31.99	1.10±0.68	8.46±1.21
標準製剤 (錠剤、5mg)	1813.88±250.74	207.66±38.63	1.01±0.61	8.35±1.24

(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。

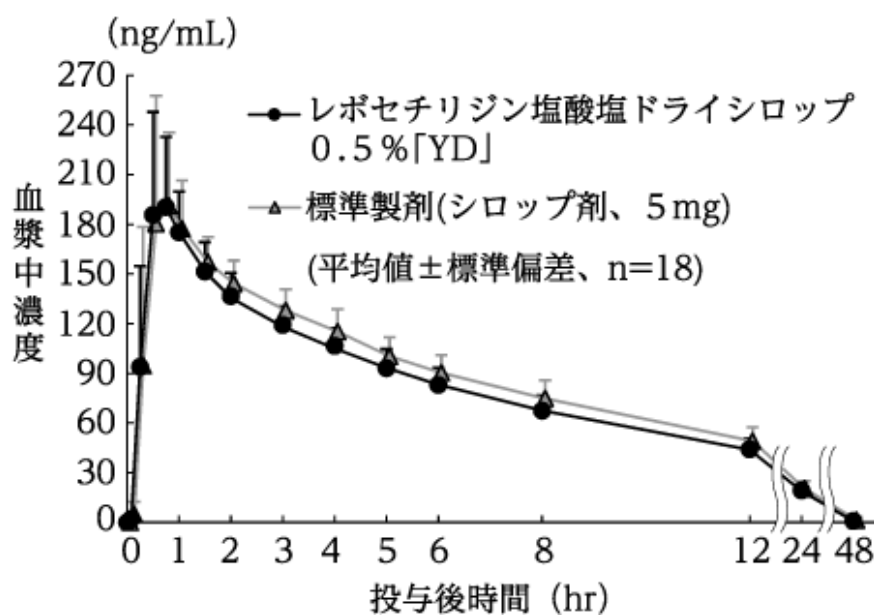
#### レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」と標準製剤をクロスオーバー法により、試験製剤は1g、標準製剤は10mL(レボセチリジン塩酸塩として5mg)、健康成人男子18名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」	1699.2±251.9	209.2±38.8	0.8±0.3	8.6±1.0
標準製剤 (シロップ剤、5mg)	1845.5±288.3	212.0±42.8	0.8±0.4	8.4±0.7

(平均値±標準偏差、n=18)



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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 7. 相互作用」を参照

(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<sup>2)</sup>

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「YD」

0.0798 (hr<sup>-1</sup>)

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「YD」

水で服用した場合：0.0894 (hr<sup>-1</sup>)

水なしで服用した場合：0.0836 (hr<sup>-1</sup>)

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「YD」

0.0815 (hr<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

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(参考：動物データ)

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」を参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」を参照

(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. 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

## V Ⅲ. 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

該当記載なし

### 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

該当記載なし

### 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 2. 用法及び用量」を参照

### 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・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

該当記載なし

(2) 併用注意とその理由

相互作用		
(1) 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1)</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1)</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1)</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1)</sup> 塩酸塩との併用により、セチリジン <sup>注1)</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1)</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1)</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1) 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

レボセチリジンは、ラセミ体であるセチリジンの R-エナンチオマーである。  
本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

**重大な副作用**

1) **ショック、アナフィラキシー**(いずれも頻度不明)  
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**(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**(いずれも頻度不明)  
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

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。	
	<b>頻度不明</b>
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2)</sup> 、不随意運動 <sup>注2)</sup> 、意識消失 <sup>注2)</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2)</sup> 、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍 <sup>注2)</sup> 、心房細動)
血液	好酸球増多 <sup>注2)</sup> 、好中球減少、リンパ球増多 <sup>注2)</sup> 、白血球増多、白血球減少、単球増多 <sup>注2)</sup> 、血小板増加 <sup>注2)</sup> 、血小板減少 <sup>注2)</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2)</sup> 、BUN 上昇、尿糖 <sup>注2)</sup> 、ウロビリノーゲンの異常 <sup>注2)</sup> 、頻尿、血尿 <sup>注2)</sup> 、排尿困難、尿閉、遺尿 <sup>注2)</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2)セチリジン塩酸塩でのみ認められている副作用。

(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

重大な副作用

1) ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

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。

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。

その他の副作用	
	<b>頻度不明</b>
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

### 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

### 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1)</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1)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

レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「YD」、レボセチリジン塩酸塩錠5mg「YD」、レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「YD」、レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「YD」

### 小児等への投与

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)。

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.5%「YD」

### 小児等への投与

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

### 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

### 過量投与

#### 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。

#### 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

レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「YD」、レボセチリジン塩酸塩錠5mg「YD」

### 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)

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」

適用上の注意

(1) 薬剤交付時

P T P包装の薬剤はP T Pシートから取り出して服用するよう指導すること。(P T P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) 本剤は舌の上に乗せて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

(3) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用しないこと。

15. その他の注意

該当記載なし

16. その他

該当記載なし

## I X. 非臨床試験に関する項目

---

### 1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験(「V I. 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：処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」

使用期限：30ヶ月間（安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存、気密容器

### 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

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」、レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」

アルミピロー包装の開封後は湿気を避けて保存すること。

#### (2) 薬剤交付時の取り扱いについて（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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」を参照

#### (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

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」

PTP：100錠、500錠

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」

PTP：100錠、500錠

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」

PTP：100錠、500錠

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」

PTP：100錠、500錠

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」

分包品：0.5g×100包、0.5g×600包

バラ：100g

### 7. 容器の材質

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」



PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネートフィルム

**レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」**

PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネートフィルム

**レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」**

PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

**レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」**

PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

**レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」**

分包品：アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネートフィルム

バラ：アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネート袋

**8. 同一成分・同効薬**

同一成分：ザイザル錠 5mg、ザイザルシロップ 0.05% (GSK)

同効薬：セチリジン塩酸塩、ロラタジン、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、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン、デスロラタジン、ビラスチン

**9. 国際誕生年月日**

該当資料なし

**10. 製造販売承認年月日及び承認番号**

承認年月日

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」：令和2年2月17日

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」：令和2年2月17日

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」：令和2年2月17日

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」：令和2年2月17日

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」：令和2年2月17日

承認番号

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」：30200AMX00151000

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」：30200AMX00152000

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」：30200AMX00126000

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」：30200AMX00127000

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」：30200AMX00137000

**11. 薬価基準収載年月日**

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「Y D」：令和2年6月19日

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「Y D」：令和2年6月19日

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「Y D」：令和2年6月19日

レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「Y D」：令和2年6月19日

レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.5%「Y D」：令和2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（9）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 2.5mg「YD」	127871201	4490028F2040	622787101
レボセチリジン塩酸 塩錠 5mg「YD」	127872901	4490028F1086	622787201
レボセチリジン塩酸 塩 0D 錠 2.5mg「YD」	127873601	4490028F3038	622787301
レボセチリジン塩酸 塩 0D 錠 5mg「YD」	127874301	4490028F4034	622787401
レボセチリジン塩酸 塩ドライシロップ 0.5%「YD」	127875001	4490028R1031	622787501

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## X I . 文 献

---

### 1. 引用文献

- 1) ㈱陽進堂 社内資料：安定性試験
- 2) ㈱陽進堂 社内資料：生物学的同等性試験
- 3) 高折修二監修：グッドマン・ギルマン薬理書第12版, p. 1179、廣川書店
- 4) Devalia JL, et al. : Allergy, 56, 50-57 (2001)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II . 参 考 資 料

---

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## X III . 備 考

---

### その他の関連資料

該当資料なし



株式会社 陽進堂

富山県富山市婦中町萩島3697番地8号