

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

レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「タカタ」

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「タカタ」

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「タカタ」

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「タカタ」

レボセチリジン塩酸塩DS0.5%「タカタ」

レボセチリジン塩酸塩製剤

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE

剤形	錠 2.5mg・5mg：フィルムコーティング錠 OD錠 2.5mg・5mg：裸錠 DS0.5%：ドライシロップ
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 錠 5mg・OD錠 5mg：1錠中 レボセチリジン塩酸塩 5mg DS0.5%：1g中 レボセチリジン塩酸塩 5mg
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：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：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 TEL:0120-989-813 FAX:048-816-4183 医療関係者向けホームページ https://www.takata-seiyaku.co.jp

本IFは2020年8月作成(第2版)(錠、OD錠)、2020年2月作成(第1版)(DS)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。
- 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	46
1. 開発の経緯.....	1	1. 警告内容とその理由.....	46
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）.....	46
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.....	46
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.....	46
2. 一般名.....	2	5. 慎重投与内容とその理由.....	46
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.....	46
4. 分子式及び分子量.....	3	7. 相互作用.....	47
5. 化学名（命名法）.....	3	8. 副作用.....	47
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	9. 高齢者への投与.....	49
7. CAS 登録番号.....	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	49
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与.....	49
1. 物理化学的性質.....	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	49
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	4	13. 過量投与.....	49
3. 有効成分の確認試験法.....	4	14. 適用上の注意.....	50
4. 有効成分の定量法.....	4	15. その他の注意.....	50
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他.....	50
1. 剤形.....	5	IX. 非臨床試験に関する項目	51
2. 製剤の組成.....	6	1. 薬理試験.....	51
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意.....	6	2. 毒性試験.....	51
4. 製剤の各種条件下における安定性.....	7	X. 管理的事項に関する項目	52
5. 調整法及び溶解後の安定性.....	26	1. 規制区分.....	52
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	27	2. 有効期間又は使用期限.....	52
7. 溶出性.....	27	3. 貯法・保存条件.....	52
8. 生物学的試験法.....	34	4. 薬剤取扱い上の注意点.....	52
9. 製剤中の有効成分の確認試験法.....	34	5. 承認条件等.....	52
10. 製剤中の有効成分の定量法.....	34	6. 包装.....	52
11. 力価.....	34	7. 容器の材質.....	53
12. 混入する可能性のある夾雑物.....	34	8. 同一成分・同効薬.....	53
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報.....	34	9. 国際誕生年月日.....	53
14. その他.....	34	10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	53
V. 治療に関する項目	35	11. 薬価基準収載年月日.....	54
1. 効能又は効果.....	35	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.....	54
2. 用法及び用量.....	35	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	54
3. 臨床成績.....	36	14. 再審査期間.....	54
VI. 薬効薬理に関する項目	38	15. 投与期間制限医薬品に関する情報.....	54
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群.....	38	16. 各種コード.....	54
2. 薬理作用.....	38	17. 保険給付上の注意.....	54
VII. 薬物動態に関する項目	39	XI. 文献	55
1. 血中濃度の推移・測定法.....	39	1. 引用文献.....	55
2. 薬物速度論的パラメータ.....	43	2. その他の参考文献.....	55
3. 吸収.....	43	XII. 参考資料	56
4. 分布.....	43	1. 主な外国での発売状況.....	56
5. 代謝.....	44	2. 海外における臨床支援情報.....	56
6. 排泄.....	44	XIII. 備考	57
7. トランスポーターに関する情報.....	44	1. その他の関連資料.....	57
8. 透析等による除去率.....	44		

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は、第二世代ヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬である。

高田製薬株式会社では、レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg/OD 錠 2.5mg・5mg/DS0.5%「タカタ」を後発医薬品として規格及び試験方法、安定性試験、生物学的同等性試験に関する資料を添付して申請し、2020年2月に承認を得た。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) レボセチリジンは、セチリジンの活性鏡像体であり、第二世代 H₁ 受容体拮抗薬である。第二世代 H₁ 受容体拮抗薬は、抗コリン作用による副作用がなく、また主に血液-脳関門を通過しないことにより非鎮静性であるといわれる。¹⁾
- (2) オレンジ風味の製剤である。(OD 錠)
- (3) いちごミルク風味の製剤である。(DS)
- (4) 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、血小板減少があらわれることがある。（「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」参照）

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「タカタ」
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「タカタ」
レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「タカタ」
レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「タカタ」
レボセチリジン塩酸塩DS0.5%「タカタ」

(2) 洋名

Levocetirizine hydrochloride Tablets 2.5mg “TAKATA”
Levocetirizine hydrochloride Tablets 5mg “TAKATA”
Levocetirizine hydrochloride OD Tablets 2.5mg “TAKATA”
Levocetirizine hydrochloride OD Tablets 5mg “TAKATA”
Levocetirizine hydrochloride DS 0.5% “TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

レボセチリジン塩酸塩（JAN）

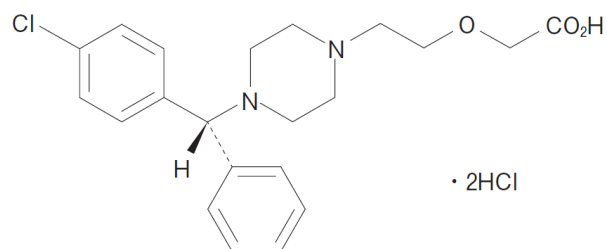
(2) 洋名（命名法）

Levocetirizine hydrochloride（JAN）
levocetirizine（INN）

(3) ステム

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：C₂₁H₂₅ClN₂O₃・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

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：レボセチリジン塩酸塩

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

該当資料なし

(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

(3) 塩化物の定性反応

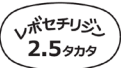

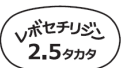



4. 有効成分の定量法





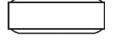

電位差滴定法

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		レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」	レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」
性状		淡黄白色楕円形の フィルムコーティング錠	白色楕円形の割線入りの フィルムコーティング錠
外形	表面	 長径 約 8.1mm 短径 約 4.6mm	 長径 約 8.1mm 短径 約 4.6mm
	裏面 重さ	 約 0.1g	 約 0.1g
	側面 厚さ	 約 3.3mm	 約 3.3mm

品名		レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「タカタ」	レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」
性状		淡黄白色円形の裸錠	淡黄白色円形の割線入りの裸錠
外形	表面 直径	 約 7mm	 約 9mm
	裏面 重さ	 約 0.13g	 約 0.25g
	側面 厚さ	 約 2.6mm	 約 3.2mm

品名	レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」
性状	白色の微粒又は粉末

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

なし

(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

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg/OD 錠 2.5mg「タカタ」：1 錠中 レボセチリジン塩酸塩 2.5mg

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg/OD 錠 5mg「タカタ」：1 錠中 レボセチリジン塩酸塩 5mg

レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」：1g 中 レボセチリジン塩酸塩 5mg

(2) 添加物

普通錠	2.5mg	乳糖水和物、結晶セルロース、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、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、酸化チタン、タルク、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ
	5mg	乳糖水和物、結晶セルロース、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、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、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ
OD 錠 2.5mg・5mg		乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、β-シクロデキストリン、アセスルファムカリウム、スクラロース、ステアリン酸マグネシウム、黄色三二酸化鉄、香料
DS0.5%		粉末還元麦芽糖水アメ、β-シクロデキストリン、クエン酸ナトリウム水和物、水酸化ナトリウム、アセスルファムカリウム、香料

(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

該当資料なし

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 長期保存試験、加速試験

下記の保存条件において全て規格内であった。

● レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」²⁾ (3ロット)

試験名	保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
				試験開始時	試験終了時
長期保存試験	25℃ 60%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー*/紙 箱)	24 箇月	性状	淡黄白色楕円形の フィルムコーティン グ錠	淡黄白色楕円形の フィルムコーティン グ錠
			確認試験	適	適
			製剤均一性	適	適
			溶出性(%)	99.0-102.8	98.8-101.7
			定量法(%)	100.06-100.63	99.66-100.01
			純度試験	適	適
加速試験	40℃ 75%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー*/紙 箱)	6 箇月	性状	淡黄白色楕円形の フィルムコーティン グ錠	淡黄白色楕円形の フィルムコーティン グ錠
			確認試験	適	適
			製剤均一性	適	適
			溶出性(%)	99.0-102.8	97.8-101.8
			定量法(%)	100.06-100.63	99.95-100.20
			純度試験	適	適

*乾燥剤入り

● レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」³⁾ (3ロット)

試験名	保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
				試験開始時	試験終了時
加速試験	40℃ 75%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー*/紙 箱)	6 箇月	性状	白色楕円形の割線 入りのフィルム コーティング錠	白色楕円形の割線 入りのフィルム コーティング錠
			確認試験	適	適
			製剤均一性	適	適
			溶出性(%)	99.5-106.7	96.6-102.2
			定量法(%)	100.04-100.30	99.67-99.90
			純度試験	適	適

*乾燥剤入り

●レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「タカタ」⁴⁾

(3ロット)

試験名	保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
				試験開始時	試験終了時
長期保存試験	25℃ 60%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー*/紙 箱)	24 箇月	性状	淡黄白色円形の裸錠	淡黄白色円形の裸錠
			確認試験	適	適
			製剤均一性	適	適
			崩壊性(秒)	18-22	23-30
			溶出性(%)	93.9-100.1	96.6-101.3
			定量法(%)	99.28-99.50	99.31-99.55
			純度試験	適	適
加速試験	40℃ 75%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー*/紙 箱)	6 箇月	性状	淡黄白色円形の裸錠	淡黄白色円形の裸錠
			確認試験	適	適
			製剤均一性	適	適
			崩壊性(秒)	18-22	26-29
			溶出性(%)	93.9-100.1	93.9-100.3
			定量法(%)	99.28-99.50	99.21-99.45
			純度試験	適	適

*乾燥剤入り

●レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg 「タカタ」⁵⁾

(3ロット)

試験名	保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
				試験開始時	試験終了時
長期保存試験	25℃ 60%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー*/紙 箱)	24 箇月	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠
			確認試験	適	適
			製剤均一性	適	適
			崩壊性(秒)	28-35	31-38
			溶出性(%)	92.6-98.4	93.2-99.3
			定量法(%)	98.76-99.59	99.39-99.51
			純度試験	適	適
加速試験	40℃ 75%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー*/紙 箱)	6 箇月	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠
			確認試験	適	適
			製剤均一性	適	適
			崩壊性(秒)	28-35	30-34
			溶出性(%)	92.6-98.4	93.2-98.9
			定量法(%)	98.76-99.59	99.43-99.74
			純度試験	適	適

*乾燥剤入り

試験名	保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
				試験開始時	試験終了時
長期保存 試験	25℃ 60%RH / 分包 0.25g (アルミ分包/ 紙箱)	24 箇月	性状	白色の微粒を 含む粉末	白色の微粒を 含む粉末
			確認試験	適	適
			pH	7.47-7.63	7.58-7.59
			製剤均一性	適	適
			定量法 (%)	98.62-99.59	98.38-98.52
			純度試験	適	適
	25℃ 60%RH / 分包 0.5g (アルミ分包/ 紙箱)	24 箇月	性状	白色の微粒を 含む粉末	白色の微粒を 含む粉末
			確認試験	適	適
			pH	7.47-7.63	7.56
			製剤均一性	適	適
			定量法 (%)	98.62-99.59	98.56-98.84
			純度試験	適	適
	25℃ 60%RH / バラ包装 100g (ポリエチレ ン瓶*/紙箱)	24 箇月	性状	白色の微粒を 含む粉末	白色の微粒を 含む粉末
			確認試験	適	適
			pH	7.47-7.63	7.55-7.58
定量法 (%)			98.62-99.59	99.41-99.72	
純度試験			適	適	
加速試験	40℃ 75%RH / 分包 0.25g (アルミ分包/ 紙箱)	6 箇月	性状	白色の微粒を 含む粉末	白色の微粒を 含む粉末
			確認試験	適	適
			pH	7.47-7.63	7.56-7.57
			製剤均一性	適	適
			定量法 (%)	98.62-99.59	98.93-99.21
			純度試験	適	適
	40℃ 75%RH / 分包 0.5g (アルミ分包/ 紙箱)	6 箇月	性状	白色の微粒を 含む粉末	白色の微粒を 含む粉末
			確認試験	適	適
			pH	7.47-7.63	7.55-7.57
			製剤均一性	適	適
			定量法 (%)	98.62-99.59	98.80-99.95
			純度試験	適	適
	40℃ 75%RH / バラ包装 100g (ポリエチレ ン瓶*/紙箱)	6 箇月	性状	白色の微粒を 含む粉末	白色の微粒を 含む粉末
			確認試験	適	適
			pH	7.47-7.63	7.55-7.56
定量法 (%)			98.62-99.59	99.87-100.21	
純度試験			適	適	

*乾燥剤入り

(2) 分割後の安定性試験

下記の保存条件において全て規格内であった。

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」³⁾

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験開始時	2週間	1箇月
25℃ 85%RH 遮光 / 無包装	性状	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色)	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色)	
	確認試験	適	適	
	溶出性 (%)	90.5-102.4	91.3-100.0	89.2-98.4
	定量法 (%)	99.02	99.63	99.69
	純度試験	適	適	
25℃ 85%RH 遮光 / ポリセロ 包装	性状	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色)	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色)	
	確認試験	適	適	
	溶出性 (%)	90.5-102.4	93.1-104.3	92.3-102.0
	定量法 (%)	99.02	99.44	99.30
	純度試験	適	適	

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験開始時	60万 lx・hr	120万 lx・hr
3000 lx / 無包装	性状	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色)	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色*)	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色*)
	確認試験	適	適	
	溶出性 (%)	90.5-102.4	93.4-103.2	90.6-101.2
	定量法 (%)	99.02	99.28	98.43
	純度試験	適	適	
3000 lx / ポリセロ 包装	性状	白色のフィルムコーティング錠 (断面は白色)	白色のフィルムコーティング錠 (断面は微黄白色)	白色のフィルムコーティング錠 (断面は微黄白色)
	確認試験	適	適	
	溶出性 (%)	90.5-102.4	91.3-104.8	91.5-102.4
	定量法 (%)	99.02	99.16	99.33
	純度試験	適	適	

※試験開始時と比較してわずかな変色が見られたが、白色の範囲内と判断した。

●レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg 「タカタ」⁵⁾

表 1

(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験開始時	2 週間	1 箇月
25℃ 85%RH 遮光 / 無包装	性状	淡黄白色の裸錠	淡黄白色の裸錠	
	確認試験	適	適	
	崩壊性(秒)	16-17	8-10	7-8
	溶出性(%)	93.4-102.4	89.6-106.2	93.5-104.2
	定量法(%)	99.36	99.66	99.59
	純度試験	適	適	
25℃ 85%RH 遮光 / ポリセロ 包装	性状	淡黄白色の裸錠	淡黄白色の裸錠	
	確認試験	適	適	
	崩壊性(秒)	16-17	14	11-12
	溶出性(%)	93.4-102.4	89.8-102.8	92.0-102.1
	定量法(%)	99.36	99.40	99.14
	純度試験	適	適	

表 2

(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	試験項目	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / 無包装	性状	淡黄白色の裸錠	淡黄白色の裸錠	
	確認試験	適	適	
	崩壊性(秒)	16-17	15-16	15-16
	溶出性(%)	93.4-102.4	94.1-101.2	94.5-102.9
	定量法(%)	99.36	98.94	99.10
	純度試験	適	適	
3000 lx / ポリセロ 包装	性状	淡黄白色の裸錠	淡黄白色の裸錠	
	確認試験	適	適	
	崩壊性(秒)	16-17	15-16	16-17
	溶出性(%)	93.4-102.4	93.5-100.8	93.5-101.6
	定量法(%)	99.36	98.67	99.02
	純度試験	適	適	

(3) 苛酷試験（製造販売後の試験結果）

評価基準

【外観】

分類	評価基準	判定
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	◎
変化あり（規格内）	わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合	○
変化あり（規格外）	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合	△

【溶出性】又は【崩壊性】

分類	評価基準	判定
変化なし	規格値内の場合	◎
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

【含量】

分類	評価基準	判定
変化なし	含量低下が3%未満の場合	◎
変化あり（規格内）	含量低下が3%以上で、規格値内の場合	○
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

【硬度】

分類	評価基準	判定
変化なし	硬度変化が30%未満の場合	◎
変化あり（規格内）	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kg重以上の場合	○
変化あり（規格外）	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kg重未満の場合	△

【その他の試験項目】

分類	評価基準	判定
変化なし	規格値内の場合	◎
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

平成11年8月20日付「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）」（日本病院薬剤師会）一部改変

(3) - 1: 無包装状態の安定性試験

●レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」²⁾

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	性状	淡黄白色楕円形のフィルムコーティング錠	淡黄白色楕円形のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性 (%)	98.0-100.5	88.3-100.7	97.4-101.6	99.0-100.5
	判定	—	◎	◎	◎
	含量 (%)	99.80	98.44	98.90	99.51
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度 (kg 重)	8.2	8.3	8.2	8.0
判定	—	◎	◎	◎	

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	性状	淡黄白色楕円形 のフィルムコー ティング錠	淡黄白色楕円形のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性(%)	98.0-100.5	96.7-99.6	96.5-98.9	95.7-97.7
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	99.80	99.25	98.60	98.83
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	8.2	5.6	5.6	4.6
判定	—	◎	◎	◎	

表 3

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / 気密	性状	淡黄白色楕円形 のフィルムコー ティング錠	淡黄白色楕円形の フィルムコーティング錠	
	判定	—	◎	
	溶出性(%)	98.0-100.5	98.2-100.0	98.7-100.9
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	99.80	99.22	98.64
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度(kg 重)	8.2	6.8	6.3
判定	—	◎	◎	

「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)に準じて判定した。

—：実施せず

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」³⁾

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	性状	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性(%)	98.4-100.6	99.2-101.8	99.1-101.1	99.6-101.4
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	99.87	100.50	99.72	99.73
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	8.9	8.5	8.5	8.4
判定	—	◎	◎	◎	
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	性状	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性(%)	98.4-100.6	96.6-99.2	94.1-100.9	97.4-99.4
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	99.87	100.22	100.50	99.52
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	8.9	5.7	5.3	4.8
判定	—	○	○	○	

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / 気密	性状	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	
	判定	—	◎	
	溶出性 (%)	98.4-100.6	97.9-100.3	99.6-101.1
	判定	—	◎	◎
	含量 (%)	99.87	100.09	99.75
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度 (kg 重)	8.9	7.0	6.4
	判定	—	◎	◎

「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)に準じて判定した。

●レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「タカタ」⁴⁾

本剤は、「40℃、遮光、気密」で 3 箇月間、「3000 lx、気密」で 120 万 lx・hr の保存条件では規格内であった。しかし、「25℃、75%RH、遮光、開放」で 3 箇月間の保存条件では硬度が規格外であったため、湿度に注意が必要である。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	性状	淡黄白色円形の裸錠	淡黄白色円形の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性 (%)	97.5-99.9	97.3-101.4	95.4-99.0	98.2-99.1
	判定	—	◎	◎	◎
	含量 (%)	98.48	99.47	99.98	99.87
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度 (kg 重)	4.1	4.2	4.1	4.4
判定	—	◎	◎	◎	

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	性状	淡黄白色円形の 裸錠	淡黄白色円形の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性(%)	97.5-99.9	97.9-100.1	96.7-100.8	97.4-100.3
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	98.48	99.22	99.38	99.94
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	4.1	2.0	2.1	1.9
	判定	—	○	○	△

表 3

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / 気密	性状	淡黄白色円形の 裸錠	淡黄白色円形の裸錠	
	判定	—	◎	
	崩壊性 (判定)	—	◎	
	溶出性(%)	97.5-99.9	96.4-99.9	96.0-100.0
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	98.48	98.92	99.32
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度(kg 重)	4.1	3.9	3.6
	判定	—	◎	◎

「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)に準じて判定した。

—：実施せず

●レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg 「タカタ」⁵⁾

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の割線入りの裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性(%)	97.3-101.4	97.5-101.3	97.0-99.6	95.7-99.2
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	101.52	100.40	101.28	100.63
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	5.4	5.6	5.6	5.5
	判定	—	◎	◎	◎
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の割線入りの裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性(%)	97.3-101.4	99.6-101.1	97.0-101.4	97.9-99.7
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	101.52	100.12	100.60	100.20
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	5.4	2.6	2.5	2.4
	判定	—	○	○	○

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / 気密	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の割線入りの裸錠	
	判定	—	◎	
	崩壊性 (判定)	—	◎	
	溶出性(%)	97.3-101.4	96.1-102.0	96.8-99.7
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	101.52	99.69	99.79
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度(kg 重)	5.4	4.8	4.5
判定	—	◎	◎	

「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)に準じて判定した。

— : 実施せず

●レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「タカタ」⁶⁾

本剤は、「40℃、遮光、気密」及び「25℃、75%RH、遮光、開放」で3箇月間の保存条件では規格内であった。しかし、「3000 lx、気密」で120万 lx・hrの保存条件では純度試験が規格外であったため、光に注意が必要である。

表1 (1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	性状	白色の粉末	白色の粉末		
	判定	—	◎		
	pH (判定)	—	◎		
	含量(%)	99.22	99.40	98.36	98.67
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	性状	白色の粉末	白色の粉末		
	判定	—	○*		
	pH (判定)	—	◎		
	含量(%)	99.22	98.14	97.62	97.57
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		

※吸湿により固化を生じた。固化部分は容易に崩れた。

《参考》申請時の苛酷試験では、「25℃、85%RH、遮光、開放」で2週間の保存条件では性状が「白色の固化物であった。」とされ規格外であったため、バラ包装を一包化する際は湿度に注意が必要である。

表2 (1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60万 lx・hr	120万 lx・hr
3000 lx / 気密	性状	白色の粉末	白色の粉末	
	判定	—	◎	
	pH (判定)	—	◎	
	含量(%)	99.22	98.71	97.90
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	△

「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)に準じて判定した。

—：実施せず

(3) - 2 : PTP 状態の安定性試験

●レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」²⁾

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / PTP	性状	淡黄白色楕円形 のフィルムコー ティング錠	淡黄白色楕円形のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性 (%)	98.0-100.5	98.7-100.9	97.6-99.2	98.6-100.5
	判定	—	◎	◎	◎
	含量 (%)	99.80	99.83	99.16	99.70
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度 (kg 重)	8.2	8.2	8.3	8.3
	判定	—	◎	◎	◎

表 2

(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
25℃ 75%RH 遮光 / PTP	性状	淡黄白色楕円形 のフィルムコー ティング錠	淡黄白色楕円形のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性 (%)	98.0-100.5	98.3-100.5	95.9-98.2	95.8-97.1
	判定	—	◎	◎	◎
	含量 (%)	99.80	98.86	98.84	99.28
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度 (kg 重)	8.2	6.1	5.2	4.7
	判定	—	◎	○	○

表 3

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / PTP	性状	淡黄白色楕円形 のフィルムコー ティング錠	淡黄白色楕円形の フィルムコーティング錠	
	判定	—	◎	
	溶出性(%)	98.0-100.5	98.3-100.8	98.6-100.6
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	99.80	99.60	99.32
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度(kg 重)	8.2	6.9	6.0
	判定	—	◎	◎

「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)に準じて判定した。

—：実施せず

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」³⁾

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / PTP	性状	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性(%)	98.4-100.6	94.6-100.7	98.0-100.7	97.6-101.3
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	99.87	100.02	100.33	99.92
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	8.9	8.8	8.7	9.0
判定	—	◎	◎	◎	
25℃ 75%RH 遮光 / PTP	性状	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性(%)	98.4-100.6	83.9-100.9*	96.6-99.6	94.4-100.6
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	99.87	100.26	99.90	99.50
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	8.9	6.7	5.0	4.7
判定	—	◎	○	○	

* : 6 ベッセルの試験で 1 錠 85%未満の錠剤を認めたため、追加 6 ベッセルの試験を実施し、12 ベッセルの結果で評価した。

表 2

(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / PTP	性状	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	白色楕円形の割線入りのフィルムコーティング錠	
	判定	—	◎	
	溶出性 (%)	98.4-100.6	98.8-101.8	97.9-101.3
	判定	—	◎	◎
	含量 (%)	99.87	99.75	100.58
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度 (kg 重)	8.9	6.9	6.1
	判定	—	◎	○

「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)に準じて判定した。

— : 実施せず

●レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「タカタ」⁴⁾

本剤は、「40℃、遮光、PTP」で 3 箇月間、「3000 lx、PTP」で 120 万 lx・hr の保存条件では規格内であった。しかし、「25℃、75%RH、遮光、PTP」で 3 箇月間の保存条件では硬度が規格外であったため、湿度に注意が必要である。

表 1

(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / PTP	性状	淡黄白色円形の裸錠	淡黄白色円形の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性 (%)	97.5-99.9	97.7-101.0	96.4-98.8	96.5-99.7
	判定	—	◎	◎	◎
	含量 (%)	98.48	99.45	98.99	99.23
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度 (kg 重)	4.1	4.0	4.0	4.1
判定	—	◎	◎	◎	

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
25℃ 75%RH 遮光 / PTP	性状	淡黄白色円形の 裸錠	淡黄白色円形の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性(%)	97.5-99.9	96.2-99.7	96.2-99.4	96.5-98.7
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	98.48	99.08	99.34	99.02
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	4.1	2.4	2.1	1.8
判定	—	○	○	△	

表 3

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
3000 lx / PTP	性状	淡黄白色円形の 裸錠	淡黄白色円形の裸錠	
	判定	—	◎	
	崩壊性 (判定)	—	◎	
	溶出性(%)	97.5-99.9	95.9-97.6	95.2-98.8
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	98.48	98.70	98.40
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度(kg 重)	4.1	3.3	3.5
判定	—	◎	◎	

「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)に準じて判定した。

—：実施せず

●レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg 「タカタ」⁵⁾

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / PTP	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の割線入りの裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性(%)	97.3-101.4	98.6-100.9	98.3-100.4	97.2-101.4
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	101.52	100.90	101.78	100.84
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	5.4	5.3	5.4	5.6
	判定	—	◎	◎	◎
25℃ 75%RH 遮光 / PTP	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の割線入りの裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性 (判定)	—	◎		
	溶出性(%)	97.3-101.4	98.6-102.1	97.2-100.7	97.7-100.0
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	101.52	100.43	100.83	100.57
	判定	—	◎	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎		
	硬度(kg 重)	5.4	2.7	2.4	2.4
	判定	—	○	○	○

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60万 lx・hr	120万 lx・hr
3000 lx / PTP	性状	淡黄白色円形の 割線入りの裸錠	淡黄白色円形の割線入りの裸錠	
	判定	—	◎	
	崩壊性 (判定)	—	◎	
	溶出性(%)	97.3-101.4	98.1-100.4	96.7-98.8
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	101.52	100.77	99.95
	判定	—	◎	◎
	純度試験 (判定)	—	◎	
	硬度(kg重)	5.4	5.1	4.1
判定	—	◎	◎	

「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)に準じて判定した。

—：実施せず

5. 調整法及び溶解後の安定性⁷⁾

検体の調製方法：レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」1g (レボセチリジン塩酸塩として5mg) を精密に量り、水10mLに溶かす。※先発医薬品であるザイザルシロップ0.05%に相当する濃度となるように調整した。

表 1

(1ロット)

保存条件	試験項目	結果			
		試験開始時	12時間	1日	3日
室温、遮光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液		
	確認試験	適	適		
	pH	7.56	7.56	7.54	7.51
	定量法(%)	99.54	98.80	98.77	98.71
	純度試験	適	適		

表 2

(1ロット)

保存条件	試験項目	結果			
		試験開始時	1日	3日	7日
5℃、遮光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液		無色澄明の液*
	確認試験	適	適		
	pH	7.56	7.56	7.57	7.53
	定量法(%)	99.54	97.94	99.17	99.06
	純度試験	適	適		

*わずかに沈殿を認めた。検体を室温(23℃)に戻すと沈殿は溶けて無くなった。

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

●レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」⁸⁾

本剤は、「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 「タカタ」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。

1. 薬剤

試験製剤：レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」

標準製剤：レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」

2. 試験方法

日本薬局方 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

3. 試験条件

・試験液量：900mL

・試験液温：37±0.5℃

・試験液：水

pH1.2＝溶出試験第 1 液

pH3.0＝pH3.0 の薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8＝溶出試験第 2 液

・回転数：50rpm

(50rpm ですべての試験において、15 分以内に試験製剤、標準製剤ともに平均 85%以上溶出したため 100rpm での試験は実施しなかった。)

・試験回数：各 12 ベッセル

4. 試験時間

・5、10 及び 15 分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー

6. 判定基準

ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。

I. 平均溶出率

①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±10%の範囲にある。

【本試験では水、pH1.2、pH3.0、pH6.8 が該当】

II. 個々の溶出率

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、以下の基準に適合する。

a. 標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、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。

【本試験では水、pH1.2、pH3.0、pH6.8 が該当】

7. 結果

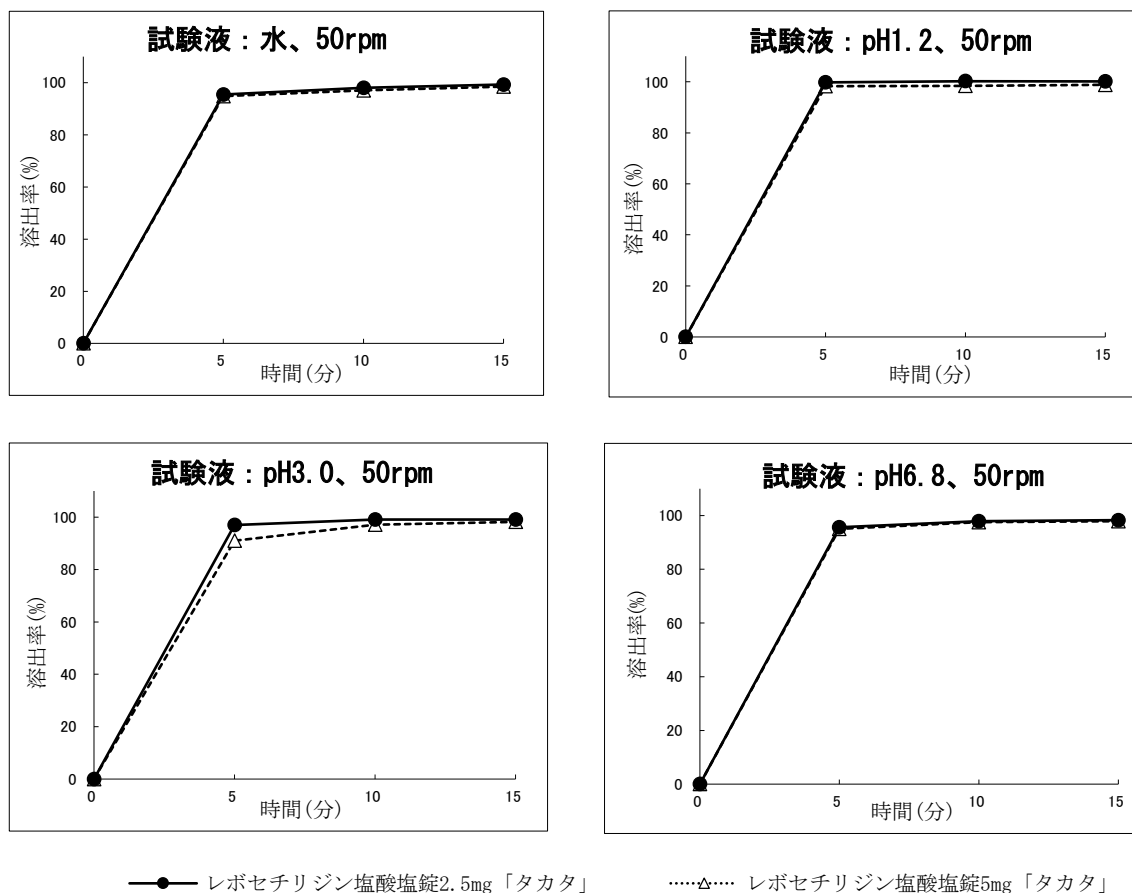


図 レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」とレボセチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」の平均溶出曲線

表 溶出挙動の同等性の判定結果

試験条件			平均溶出率 (%)		判定	
回転数	試験液	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤	平均溶出率	個々の溶出率
50rpm	水	15	98.5	99.3	適	適
	pH1.2	15	98.8	100.1	適	適
	pH3.0	15	98.2	99.1	適	適
	pH6.8	15	97.9	98.3	適	適

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」⁹⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」(平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号)に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

1. 薬剤

試験製剤：レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」

標準製剤：錠剤、5mg

2. 試験方法

日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 (パドル法)

3. 試験条件

・試験液量：900mL

・試験液温：37±0.5℃

- ・試験液 : 水
pH1.2=溶出試験第1液
pH5.0=pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液
pH6.8=溶出試験第2液
- ・回転数 : 50rpm
(パドル法、100rpmで実施すべき試験液性において、パドル法、毎分50rpmの溶出試験で、30分以内に標準製剤、試験製剤ともに平均85%以上溶出したため、パドル法、100rpmの溶出試験を省略した。)
- ・試験回数 : 各12ベッセル

4. 試験時間

- ・5、10及び15分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー法

6. 判定基準

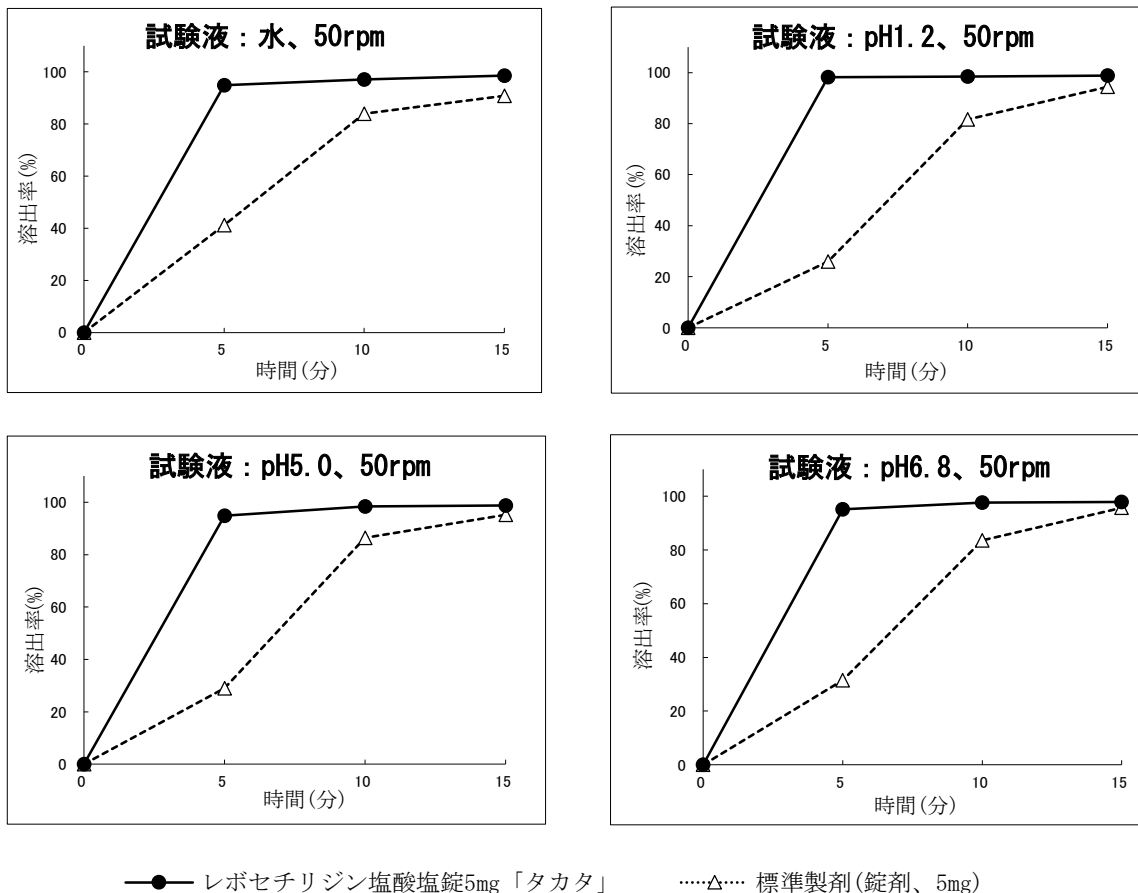
ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。

- ①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。

【本試験では、水、pH1.2、pH5.0、pH6.8が該当】

7. 結果



—●— レボセチリジン塩酸塩錠5mg「タカタ」 △..... 標準製剤 (錠剤、5mg)

図 レボセチリジン塩酸塩錠5mg「タカタ」と標準製剤の平均溶出曲線

表 溶出挙動の類似性の判定結果

試験条件		判定基準		平均溶出率(%)		判定
回転数	試験液	溶出率	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤	
50rpm	水	15分以内に平均85%以上	15	90.8	98.5	適
	pH1.2	15分以内に平均85%以上	15	94.4	98.8	適
	pH5.0	15分以内に平均85%以上	15	95.2	98.8	適
	pH6.8	15分以内に平均85%以上	15	95.7	97.9	適

●レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「タカタ」¹⁰⁾

本剤は、「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 「タカタ」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。

1. 薬剤

試験製剤：レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「タカタ」

標準製剤：レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg 「タカタ」

2. 試験方法

日本薬局方 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

3. 試験条件

・試験液量：900mL

・試験液温：37±0.5℃

・試験液：水

pH1.2＝溶出試験第1液

pH5.0＝pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH6.8＝溶出試験第2液

・回転数：50rpm

（50rpmですべての試験において、15分以内に試験製剤、標準製剤ともに平均85%以上溶出したため100rpmでの試験は実施しなかった。）

・試験回数：各12ベッセル

4. 試験時間

・5、10及び15分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー

6. 判定基準

ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。

I. 平均溶出率

①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±10%の範囲にある。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0、pH6.8が該当】

II. 個々の溶出率

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、以下の基準に適合する。

a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、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。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0、pH6.8が該当】

7. 結果

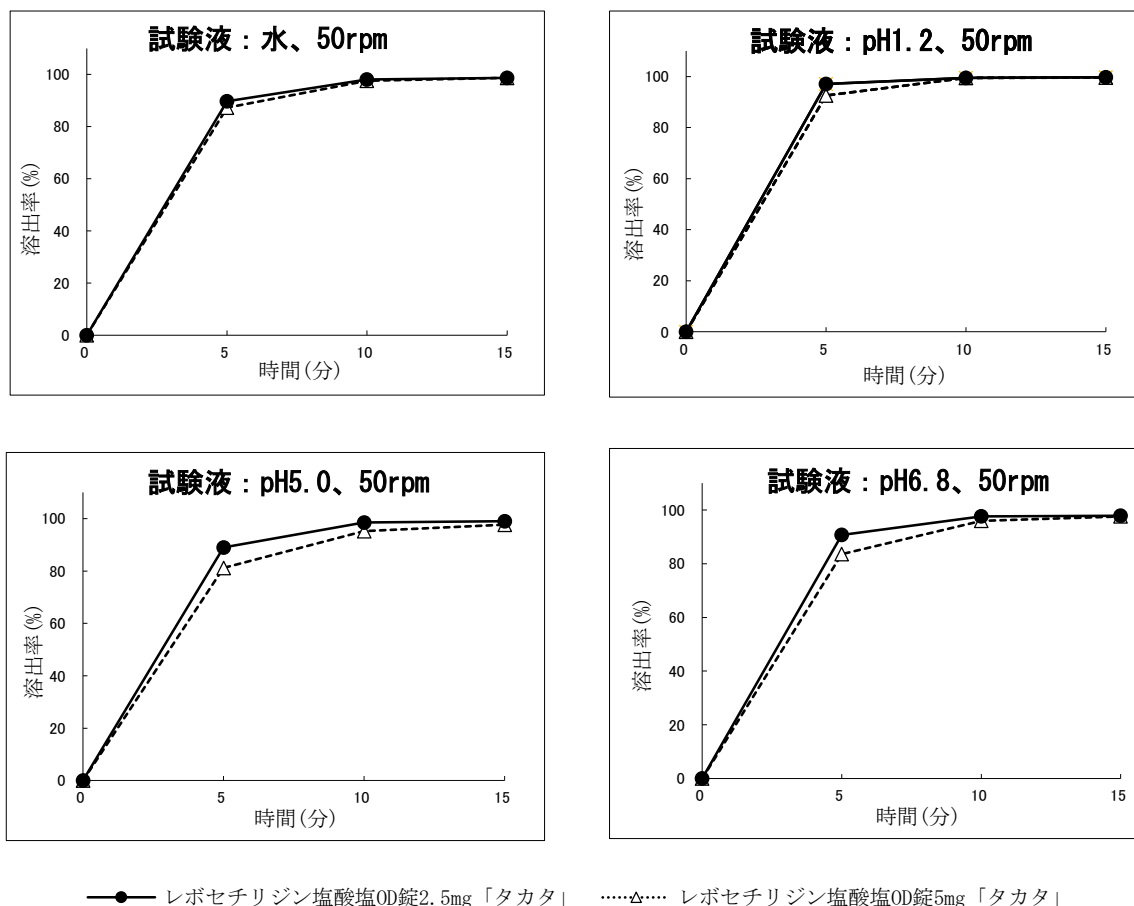


図 レボセチリジン塩酸塩 0D 錠 2.5mg「タカタ」とレボセチリジン塩酸塩 0D 錠 5mg「タカタ」の平均溶出曲線

表 溶出挙動の同等性の判定結果

試験条件			平均溶出率(%)		判定	
回転数	試験液	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤	平均溶出率	個々の溶出率
50rpm	水	15	98.7	98.7	適	適
	pH1.2	15	99.6	99.7	適	適
	pH5.0	15	97.7	99.0	適	適
	pH6.8	15	97.6	97.9	適	適

●レボセチリジン塩酸塩 0D 錠 5mg「タカタ」¹¹⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」（平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発 0229 第 10 号）に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

1. 薬剤

試験製剤：レボセチリジン塩酸塩 0D 錠 5mg「タカタ」

標準製剤：錠剤、5mg

2. 試験方法

日本薬局方 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

3. 試験条件

・試験液量：900mL

・試験液温：37±0.5℃

- ・試験液 : 水
pH1.2=溶出試験第1液
pH5.0=pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液
pH6.8=溶出試験第2液
- ・回転数 : 50rpm
(パドル法、100rpmで実施すべき試験液性において、パドル法、毎分50rpmの溶出試験で、30分以内に標準製剤、試験製剤ともに平均85%以上溶出したため、パドル法、100rpmの溶出試験を省略した。)
- ・試験回数 : 各12ベッセル

4. 試験時間

- ・5、10及び15分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー法

6. 判定基準

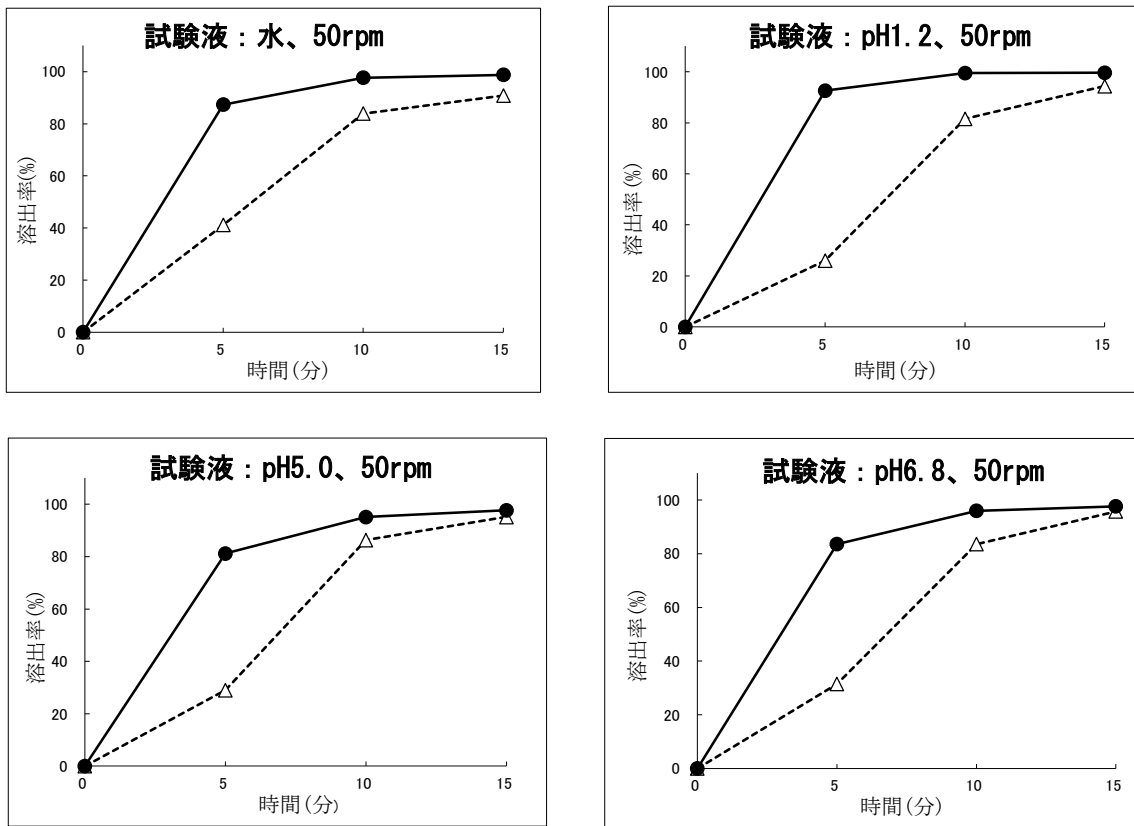
ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。

- ①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。

【本試験では、水、pH1.2、pH5.0、pH6.8が該当】

7. 結果



—●— レボセチリジン塩酸塩0D錠5mg「タカタ」 △..... 標準製剤(錠剤、5mg)

図 レボセチリジン塩酸塩 0D 錠 5mg「タカタ」と標準製剤の平均溶出曲線

表 溶出挙動の類似性の判定結果

試験条件		判定基準		平均溶出率 (%)		判定
回転数	試験液	溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤	
50rpm	水	15分以内に 平均85%以上	15	90.8	98.7	適
	pH1.2	15分以内に 平均85%以上	15	94.4	99.6	適
	pH5.0	15分以内に 平均85%以上	15	95.2	97.7	適
	pH6.8	15分以内に 平均85%以上	15	95.7	97.6	適

●レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」¹²⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」（平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号）に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

1. 薬剤

試験製剤：レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」

標準製剤：シロップ剤、0.05%

2. 試験方法

日本薬局方 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

3. 試験条件

・試験液量：900ml（試験製剤）、890ml（標準製剤）

・試験液温：37±0.5℃

・試験液：水

pH1.2＝溶出試験第1液

pH3.0＝pH3.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH4.0＝pH4.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH5.0＝pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH6.8＝溶出試験第2液

・回転数：50rpm

・試験回数：各1ベッセル

4. 試験時間

試験方法	回転数	試験液	試験時間 (分)
パドル法	50rpm	水	1
		pH1.2	1
		pH3.0	1
		pH4.0	1
		pH5.0	1
		pH6.8	1

5. 分析法

目視

6. 判定基準

ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。

各試験液で溶解していることが確認できれば、その試験液では標準製剤及び試験製剤が15分以内に85%以上溶出した医薬品とみなされる。

①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 分以内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。

【本試験では、水、pH1.2、pH3.0、pH4.0、pH5.0、pH6.8 が該当】

7. 結果

表 溶出挙動の類似性の判定結果

試験条件		判定基準	比較時点 (分)	結果		判定
回転数	試験液			標準液	試験液	
50rpm	水	標準製剤及び試験製剤のいずれも、試験液は澄明な液である	1	試験液は澄明な液であった	試験液は澄明な液であった	適
	pH1.2	標準製剤及び試験製剤のいずれも、試験液は澄明な液である	1	試験液は澄明な液であった	試験液は澄明な液であった	適
	pH3.0	標準製剤及び試験製剤のいずれも、試験液は澄明な液である	1	試験液は澄明な液であった	試験液は澄明な液であった	適
	pH4.0	標準製剤及び試験製剤のいずれも、試験液は澄明な液である	1	試験液は澄明な液であった	試験液は澄明な液であった	適
	pH5.0	標準製剤及び試験製剤のいずれも、試験液は澄明な液である	1	試験液は澄明な液であった	試験液は澄明な液であった	適
	pH6.8	標準製剤及び試験製剤のいずれも、試験液は澄明な液である	1	試験液は澄明な液であった	試験液は澄明な液であった	適

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

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

該当資料なし

14. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

〈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

レボセチリン塩酸塩錠 2.5mg・5mg/OD 錠 2.5mg・5mg 「タカタ」：

〈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。

レボセチリン塩酸塩 DS0.5% 「タカタ」：

〈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・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、血中濃度が增大するため、クレアチニンクリアランスに応じて、下記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。

(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。（「Ⅷ. 14. 適用上の注意」の項参照）

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

ヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

レボセチリジンは、セチリジンの活性鏡像体であり、第二世代 H₁ 受容体拮抗薬である。第二世代 H₁ 受容体拮抗薬は、抗コリン作用による副作用がなく、また主に血液-脳関門を通過しないことにより非鎮静性であるといわれる。¹⁾

(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^{13, 14, 15)}

	最高血中濃度到達時間(hr)
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」	1.06 ± 0.86 (n=15)
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「タカタ」 (水で服用)	0.90 ± 0.78 (n=19)
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「タカタ」 (水なしで服用)	1.24 ± 0.55 (n=19)
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「タカタ」	0.85 ± 0.85 (n=16)

(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2.5mg 「タカタ」⁸⁾

レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg 「タカタ」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 「タカタ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。(「IV. 7. 溶出性」参照)

●レボセチリジン塩酸塩錠5mg 「タカタ」¹³⁾

レボセチリジン塩酸塩錠5mg 「タカタ」と標準製剤(錠剤、5mg)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)、健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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)の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

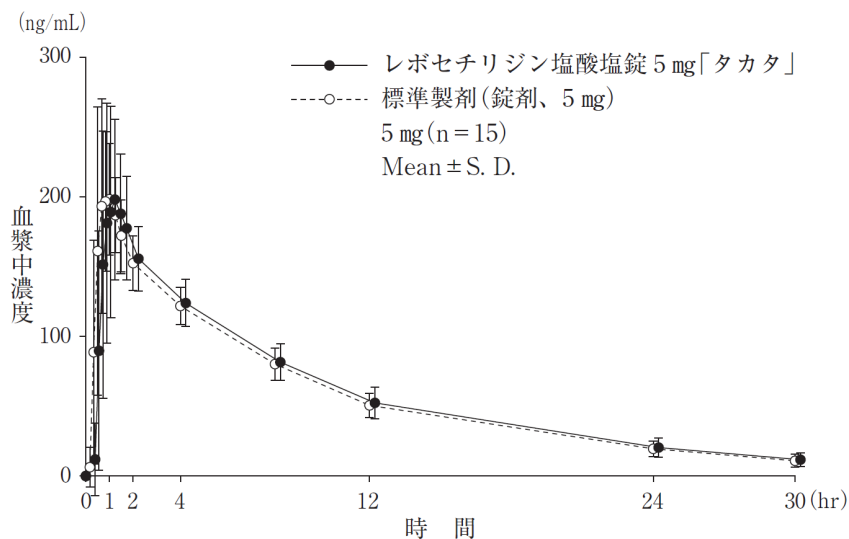


図 レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」と標準製剤の平均血漿中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

製剤	評価パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「タカタ」	1789.2±318.9	233.9±38.0	1.06±0.86	8.05±1.25
標準製剤 (錠剤、5mg)	1750.4±242.1	238.1±39.5	0.85±0.34	8.07±1.29

(Mean±S.D., n=15)

※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「タカタ」¹⁰⁾

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「タカタ」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「タカタ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。（「IV.7. 溶出性」参照）

●レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「タカタ」¹⁴⁾

(1) 水で服用

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「タカタ」と標準製剤（錠剤、5mg）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）、健康成人男性に絶食時に水で単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、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）の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

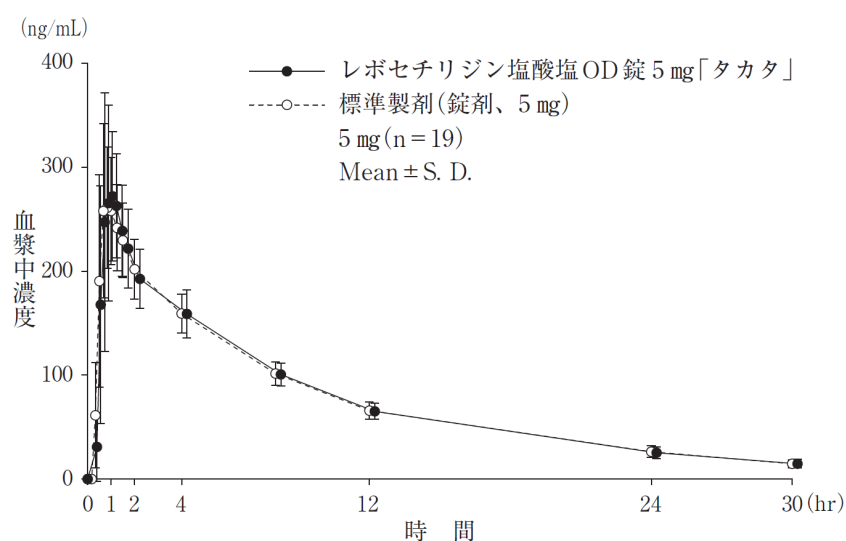


図 レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」と標準製剤の平均血漿中濃度推移（水で服用）

表 薬物動態パラメータ

製剤	評価パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「タカタ」	2273.0±259.1	309.7±64.7	0.90±0.78	8.30±1.13
標準製剤 (錠剤、5mg)	2271.9±238.6	290.8±54.9	0.97±0.44	8.28±0.88

(Mean±S.D., n=19)

※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。

(3) 水なしで服用

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「タカタ」と標準製剤（錠剤、5mg）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）、健康成人男性に絶食時に本剤は水なしで、標準製剤は水で単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、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)の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

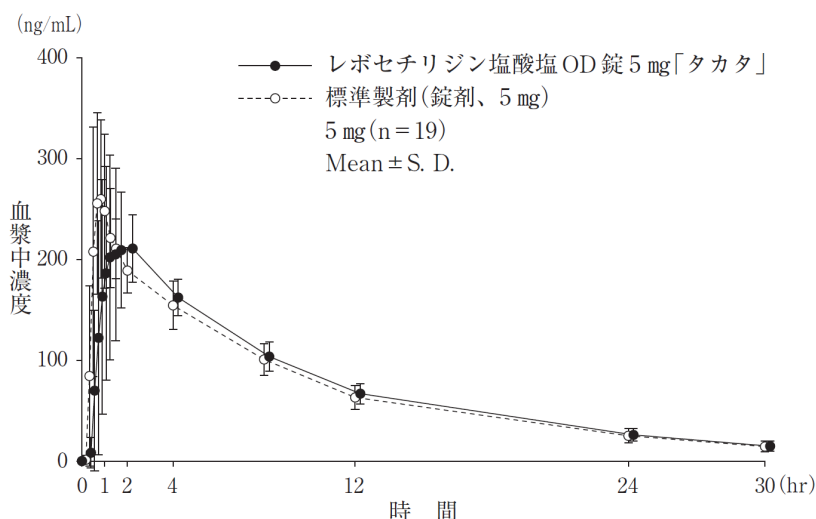


図 レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「タカタ」と標準製剤の平均血漿中濃度推移（水なしで服用）

表 薬物動態パラメータ

製剤	評価パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」	2242.7±327.6	274.6±49.6	1.24±0.55	8.29±1.09
標準製剤 (錠剤、5mg)	2197.5±303.1	307.5±56.1	0.84±0.42	8.31±1.10

(Mean±S. D., n=19)

※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DS0.5%「タカタ」¹⁵⁾

レボセチリジン塩酸塩DS0.5%「タカタ」と標準製剤(シロップ剤、0.05%)を、クロスオーバー法によりそれぞれ1g及び10mL(レボセチリジン塩酸塩として5mg)、健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、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。

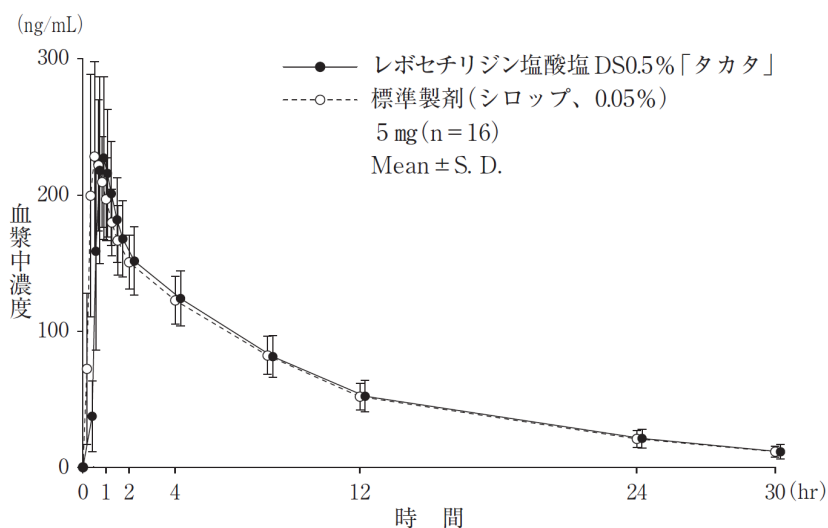


図 レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」と標準製剤の平均血漿中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

製剤	評価パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」	1821.8±335.5	240.6±48.5	0.85±0.85	7.95±0.99
標準製剤 (シロップ剤、0.05%)	1825.8±273.4	244.4±52.6	0.62±0.40	7.91±1.00

(Mean±S. D., n=16)

※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

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁中への移行性

セチリジン^{注1)} 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。

(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

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

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

添付文書に記載なし

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

「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照すること。

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」を参照すること。

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」〈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。]（「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

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 ^{注1)} 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 ^{注1)} 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 ^{注1)} 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 ^{注1)} 塩酸塩との併用により、セチリジン ^{注1)} 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 ^{注1)} 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 ^{注1)} 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

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（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）、 γ -GTP、LDH、A1-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、傾眠、疲労、無力症、睡眠障害、錯感覚、幻覚、自殺念慮、失神、健忘 ^{注2)} 、不随意運動 ^{注2)} 、意識消失 ^{注2)} 、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 ^{注2)} 、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍 ^{注2)} 、心房細動）
血液	好酸球増多 ^{注2)} 、好中球減少、リンパ球増多 ^{注2)} 、白血球増多、白血球減少、単球増多 ^{注2)} 、血小板増加 ^{注2)} 、血小板減少 ^{注2)}
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、A1-P 上昇
腎臓・泌尿器	尿蛋白 ^{注2)} 、BUN 上昇、尿糖 ^{注2)} 、ウロビリノーゲンの異常 ^{注2)} 、頻尿、血尿 ^{注2)} 、排尿困難、尿閉、遺尿 ^{注2)}
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

「Ⅷ. 2. 禁忌内容とその理由」に以下の記載あり。

【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

「Ⅷ. 8. (3) その他の副作用」に以下の記載あり。

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女性には、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) 授乳中の女性には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔セチリジン^{注1)} 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

錠・OD 錠：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）。

DS：低出生体重児、新生児又は 6 ヶ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、アレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン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

錠・OD錠：

(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。]

(2) 服用時

- 1) OD錠は舌の上への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

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 : レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」 処方箋医薬品^{注)}
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」 処方箋医薬品^{注)}
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「タカタ」 処方箋医薬品^{注)}
レボセチリジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「タカタ」 処方箋医薬品^{注)}
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「タカタ」 処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分 : レボセチリジン塩酸塩(該当しない)

2. 有効期間又は使用期限

使用期限 : 外箱等に表示

錠 2.5mg・5mg/OD 錠 2.5mg・5mg/DS0.5% : 3年(安定性試験結果に基づく)

(「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

<錠剤、OD 錠>気密容器・室温保存

<DS 剤>遮光した気密容器・室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

1. OD 錠は製剤の特性上、吸湿により錠剤表面がざらつくことがある。
2. OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg は、それぞれ錠剤表面に使用色素による黄色の斑点がみられることがある。

(2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)

(「VIII. 14. 適用上の注意」参照)

くすりのしおり : 有り

患者向け医薬品ガイド : 有り

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

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 「タカタ」	PTP 包装 : 100 錠 (10 錠×10)
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」	PTP 包装 : 100 錠 (10 錠×10)

レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「タカタ」	PTP包装：100錠（10錠×10）
レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」	PTP包装：100錠（10錠×10）
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」	分包：0.25g×400包、0.5g×400包 バラ包装：100g（プラスチック瓶）

7. 容器の材質

表 レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg/OD錠 2.5mg・5mg「タカタ」

PTP包装	ポリプロピレンフィルム アルミニウム箔
ピロー包装	アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム（シリカゲル乾燥剤入り）
箱	紙箱

表 レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」

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	瓶：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン（シリカゲル乾燥剤入り）
箱	紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ザイザル錠 5mg/シロップ 0.05%

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、メキタジン等

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

	製造販売承認年月日	承認番号
レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」	2020年2月17日	30200AMX00129
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	2020年2月17日	30200AMX00130
レボセチリジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「タカタ」	2020年2月17日	30200AMX00141
レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」	2020年2月17日	30200AMX00142
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「タカタ」	2020年2月17日	30200AMX00212

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. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は投与期間制限医薬品に該当しない。

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
レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」	127049501	4490028F2066	622704901
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	127050101	4490028F1132	622705001
レボセチリジン塩酸塩 OD錠2.5mg「タカタ」	127051801	4490028F3046	622705101
レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「タカタ」	127052501	4490028F4050	622705201
レボセチリジン塩酸塩 DSO.5%「タカタ」	127053201	4490028R1058	622705301

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) 高折修二他監訳：グッドマン・ギルマン薬理書（第12版），p. 1179（2013）
- 2) 高田製薬株式会社内資料（錠 2.5mg：安定性試験）
- 3) 高田製薬株式会社内資料（錠 5mg：安定性試験）
- 4) 高田製薬株式会社内資料（OD錠 2.5mg：安定性試験）
- 5) 高田製薬株式会社内資料（OD錠 5mg：安定性試験）
- 6) 高田製薬株式会社内資料（DS0.5%：安定性試験）
- 7) 高田製薬株式会社内資料（DS0.5%：溶解後の安定性試験）
- 8) 高田製薬株式会社内資料（錠 2.5mg：生物学的同等性及び溶出挙動試験）
- 9) 高田製薬株式会社内資料（錠 5mg：溶出挙動試験）
- 10) 高田製薬株式会社内資料（OD錠 2.5mg：生物学的同等性及び溶出挙動試験）
- 11) 高田製薬株式会社内資料（OD錠 5mg：溶出挙動試験）
- 12) 高田製薬株式会社内資料（DS0.5%：溶出挙動試験）
- 13) 高田製薬株式会社内資料（錠 5mg：生物学的同等性試験）
- 14) 高田製薬株式会社内資料（OD錠 5mg：生物学的同等性試験）
- 15) 高田製薬株式会社内資料（DS0.5%：生物学的同等性試験）

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

該当資料なし

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

該当資料なし

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