

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受容体拮抗剤
アレルギー性疾患治療剤

日本薬局方セチリジン塩酸塩錠

セチリジン 塩酸塩錠 5mg「アメル」
セチリジン 塩酸塩錠 10mg「アメル」

CETIRIZINE HCl Tab.5mg「AMEL」・Tab.10mg「AMEL」

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	セチリジン塩酸塩錠 5mg「アメル」： 1錠中、日局セチリジン塩酸塩 5mg を含有する。 セチリジン塩酸塩錠 10mg「アメル」： 1錠中、日局セチリジン塩酸塩 10mg を含有する。
一般名	和名：セチリジン塩酸塩 洋名：Cetirizine 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：2007年3月15日 薬価基準収載年月日：2007年7月6日 発売年月日：2007年7月6日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：共和薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口 TEL.0120-041189(フリーダイヤル) FAX.06-6121-2858 医療関係者向けホームページ https://www.kyowayakuhin.co.jp/amel-di/

本IFは2018年10月改訂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。この変更に合わせて、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		V. 治療に関する項目	
1. 開発の経緯	1	1. 効能又は効果	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 用法及び用量	13
		3. 臨床成績	14
II. 名称に関する項目		VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	2	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	15
2. 一般名	2	2. 薬理作用	15
3. 構造式又は示性式	2	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	2	1. 血中濃度の推移・測定法	16
5. 化学名（命名法）	3	2. 薬物速度論的パラメータ	19
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3	3. 吸収	19
7. CAS 登録番号	3	4. 分布	19
		5. 代謝	20
III. 有効成分に関する項目		6. 排泄	20
1. 物理化学的性質	4	7. トランスポーターに関する情報	20
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	8. 透析等による除去率	20
3. 有効成分の確認試験法	4	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
4. 有効成分の定量法	5	1. 警告内容とその理由	21
		2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	21
IV. 製剤に関する項目		3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	21
1. 剤形	6	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	21
2. 製剤の組成	6	5. 慎重投与内容とその理由	21
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	7	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	22
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	7. 相互作用	22
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	8. 副作用	23
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7	9. 高齢者への投与	24
7. 溶出性	8	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	24
8. 生物学的試験法	12	11. 小児等への投与	24
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
10. 製剤中の有効成分の定量法	12	13. 過量投与	25
11. 力価	12	14. 適用上の注意	25
12. 混入する可能性のある夾雑物	12		
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12		
14. その他	12		

15. その他の注意	25
16. その他	25

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	26
2. 毒性試験	26

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	27
2. 有効期間又は使用期限	27
3. 貯法・保存条件	27
4. 薬剤取扱い上の注意点	27
5. 承認条件等	27
6. 包装	27
7. 容器の材質	27
8. 同一成分・同効薬	28
9. 国際誕生年月日	28
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	28
11. 薬価基準収載年月日	28
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	28
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	28
14. 再審査期間	28
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	28
16. 各種コード	29
17. 保険給付上の注意	29

X I. 文献

1. 引用文献	30
2. その他の参考文献	30

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	31
2. 海外における臨床支援情報	31

X III. 備考

その他の関連資料	32
----------	----

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

セチリジン塩酸塩錠 5mg「アメル」、錠 10mg「アメル」は、共和薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について(平成 17 年 3 月 31 日 薬食発第 0331015 号)」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、平成 19 年 3 月に成人に対する適用で承認を取得して同年 7 月に上市した。

また、セチリジン塩酸塩錠 5mg「アメル」、錠 10mg「アメル」は、日本薬局方 第 15 改正 第一追補により、日本薬局方セチリジン塩酸塩錠に変更された。

なお、セチリジン塩酸塩錠 5mg「アメル」は、平成 25 年 9 月に小児に対する効能効果、用法用量を追加取得した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 抗ヒスタミン薬(H_1 受容体遮断薬)であるが、ロイコトリエン及びプロスタグランジン D_2 の遊離抑制作用を併せ持つ。古典的な抗ヒスタミン薬と異なり、抗コリン作用はほとんどない。また、ヒスタミン H_2 、ドパミン、セロトニンの各受容体に対する親和性は低く、中枢神経系におけるヒスタミン H_1 受容体への影響が少ないとされる。¹⁾

(2) 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。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名：

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」

(2) 洋名：

CETIRIZINE HCl Tab.5mg 「AMEL」
CETIRIZINE HCl Tab.10mg 「AMEL」

(3) 名称の由来：

本剤の一般名「セチリジン塩酸塩」、共和薬品工業(株)の屋号「アメル」(AMEL)に由来する。

2. 一般名

(1) 和名(命名法)：

セチリジン塩酸塩(JAN)

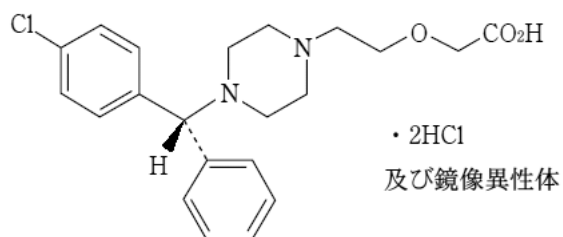
(2) 洋名(命名法)：

Cetirizine Hydrochloride(JAN)

(3) ステム：

ジフェニルメチルピペラジン誘導体：-izine (-yzine)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot 2HCl$

分子量：461.81

5. 化学名(命名法)

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

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

塩酸セチリジン

7. CAS 登録番号

83881-52-1(Cetirizine Hydrochloride)

83881-51-0(cetirizine)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状：

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性：

溶 媒	日局表現
水	極めて溶けやすい
エタノール(99.5)	溶けにくい

0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性：

該当資料なし

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点：

融点：210℃(分解)

(5) 酸塩基解離定数：

pK_{a1} ：2.85 (滴定法)

pK_{a2} ：8.33 (滴定法)

(6) 分配係数：

該当資料なし

(7) その他の主な示性値：

本品の水溶液(1→10)は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

水：0.02%溶液は、37℃、12時間は安定である。

液性(pH)：0.02%溶液は、pH1～12、37℃、12時間は安定である。

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「セチリジン塩酸塩」による

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法(塩化カリウム錠剤法)

(3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法

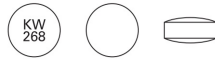

日本薬局方「セチリジン塩酸塩」による

電位差滴定法(0.1 mol/L 水酸化ナトリウム液 1 mL = 15.39 mg $C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot 2HCl$)

IV. 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	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」	フィルムコーティング錠		KW268
	白色	直径：約 6.1mm 厚さ：約 2.8mm 質量：約 89.0mg	
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」	フィルムコーティング錠		KW269
	白色	直径：約 7.1mm 厚さ：約 2.8mm 質量：約 115.0mg	

(2) 製剤の物性 :

該当資料なし

(3) 識別コード :

IV-1-(1) 参照

錠剤本体、PTP 包装資材に表示。

(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 :

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」

1 錠中、日局セチリジン塩酸塩 5mg を含有する。

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」

1 錠中、日局セチリジン塩酸塩 10mg を含有する。

(2) 添加物 :

乳糖水和物、結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 6000、カルナウバロウ

(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

(1) 加速試験での安定性²⁾ :

セチリジン塩酸塩錠「アメル」(5mg、10mg)

保存条件	保存形態*	試験期間	試験項目	試験結果
40±1℃、 75±5%RH	PTP 包装	6 ヶ月	性状、確認試験、製剤均一性、溶出性、定量法	規格内

※ PTP 包装 : ポリプロピレンフィルム+アルミニウム箔

(2) 無包装下での安定性³⁾ :

セチリジン塩酸塩錠「アメル」(5mg、10mg)

保存条件	保存形態	試験期間	試験項目	試験結果
25±1℃、 75±5%RH (湿度)	遮光・ グラシン紙分包	90 日間	性状、溶出性、定量法、硬度	規格内
40±1℃、 75±5%RH (温度)	遮光・ 気密容器	90 日間	性状、溶出性、定量法、硬度	規格内
60 万 lx・hr (光)	気密容器	1000 lx、 25 日間	性状、溶出性、定量法、硬度	規格内
	グラシン紙分包		性状、溶出性、定量法、硬度	規格内

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

7. 溶出性⁴⁾

(1) 溶出挙動における同等性

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」

「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13年5月31日付 医薬審発第786号)」に基づき、セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」及び標準製剤の溶出挙動の同等性を評価した。

試験方法	日本薬局方(JP13) 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
試験条件	試験液量：900 mL、温度：37±0.5℃	
回転数	50回転、100回転	
試験液	pH1.2	日本薬局方(JP13) 崩壊試験第1液
	pH3.0	薄めた McIlvaine 緩衝液
	pH6.8	日本薬局方(JP13) 崩壊試験第2液
	水	日本薬局方 精製水

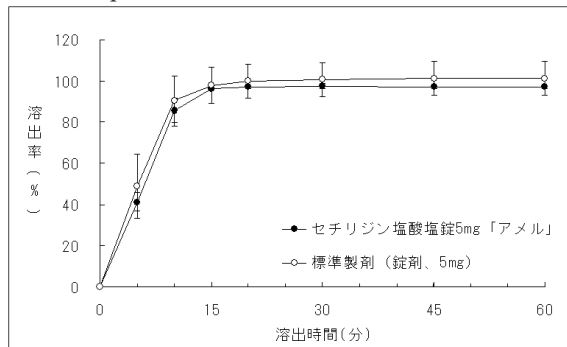
判定基準：

回転数	試験液	判定
50	pH1.2 pH3.0 pH6.8 水	試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。
100	pH1.2	

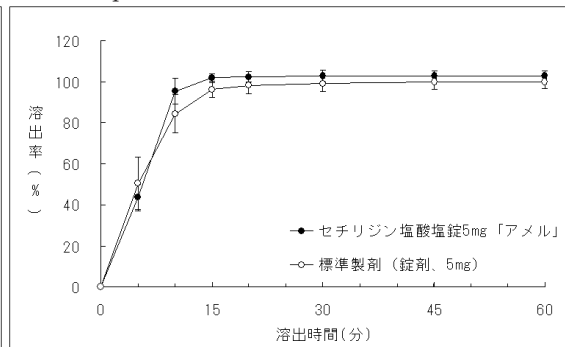
下記の溶出曲線及び試験結果より、両剤の溶出挙動は同等であると判定された。
各試験液における溶出挙動は下図の通りである。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean ± S.D.)

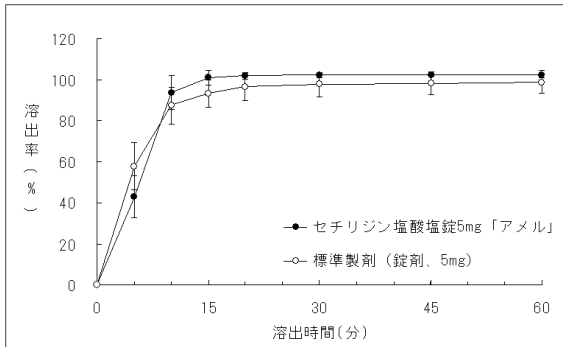
50回転[pH1.2]



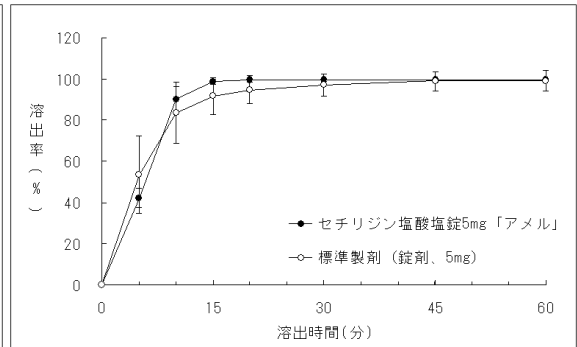
50回転[pH3.0]



50 回転[pH6.8]



50 回転[水]



100 回転[pH1.2]

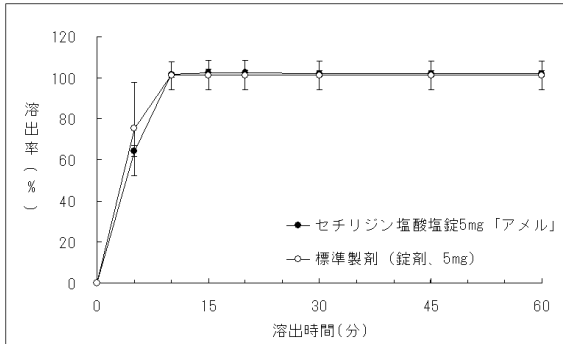


表. 溶出挙動における同等性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件		判定基準			平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率	判定時間	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	85%以上	15分	97.8	96.2	適合
		pH3.0	85%以上	15分	96.2	101.7	適合
		pH6.8	85%以上	15分	93.4	100.9	適合
		水	85%以上	15分	91.5	98.8	適合
	100	pH1.2	85%以上	15分	101.3	102.4	適合

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」

「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13年5月31日付 医薬審発第786号)」に基づき、セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」及び標準製剤の溶出挙動の同等性を評価した。

試験方法	日本薬局方(JP13) 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
試験条件	試験液量：900 mL、温度：37±0.5℃	
回転数	50回転、100回転	
試験液	pH1.2	日本薬局方(JP13) 崩壊試験第1液
	pH4.0	薄めた McIlvaine 緩衝液
	pH6.8	日本薬局方(JP13) 崩壊試験第2液
	水	日本薬局方 精製水

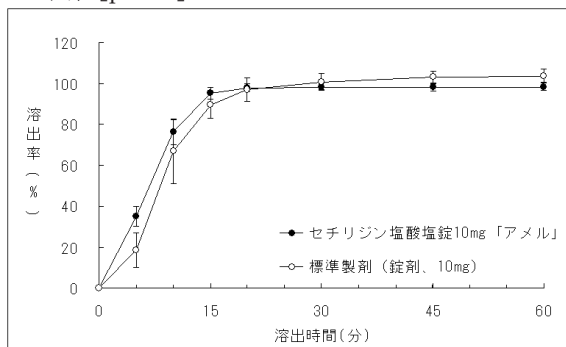
判定基準：

回転数	試験液	判定
50	pH1.2 pH4.0 pH6.8 水	試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。
100	pH4.0	

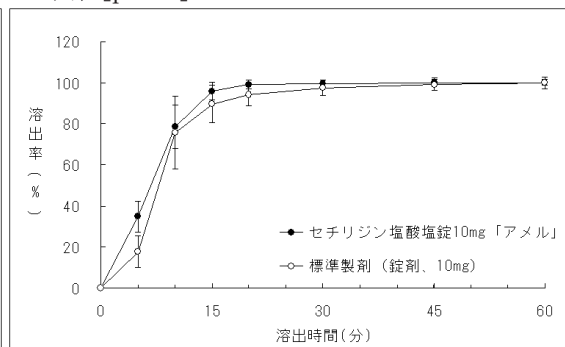
下記の溶出曲線及び試験結果より、両剤の溶出挙動は同等であると判定された。
各試験液における溶出挙動は下図の通りである。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean ± S.D.)

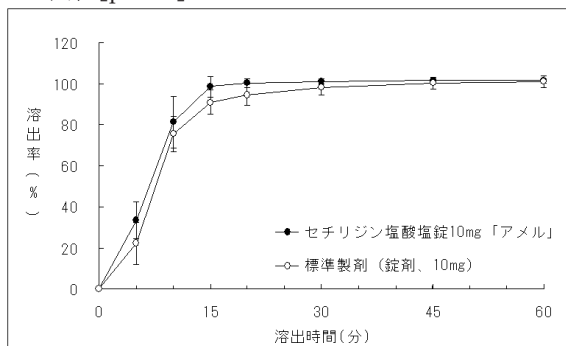
50回転[pH1.2]



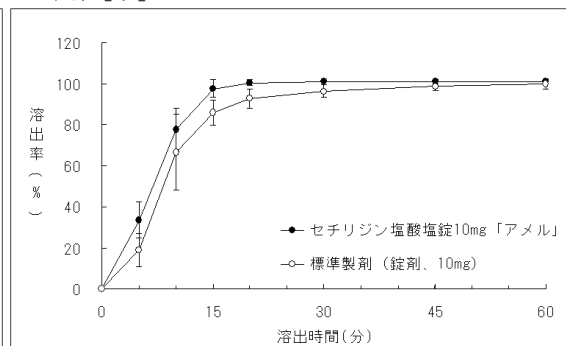
50回転[pH4.0]



50 回転[pH6.8]



50 回転[水]



100 回転[pH4.0]

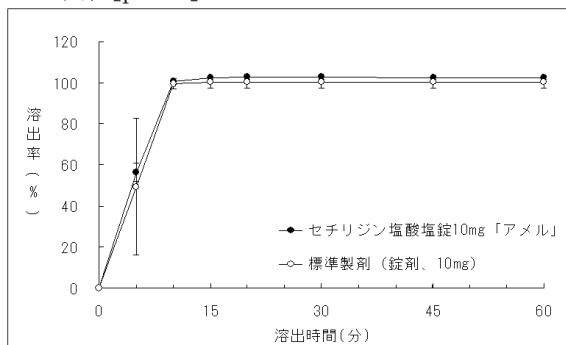


表. 溶出挙動における同等性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件		判定基準		平均溶出率(%)		判定結果	
試験方法	回転数(rpm)	試験液	溶出率	判定時間	標準製剤		試験製剤
パドル法	50	pH1.2	85%以上	15分	89.5	95.3	適合
		pH4.0	85%以上	15分	89.7	95.9	適合
		pH6.8	85%以上	15分	90.9	98.4	適合
		水	85%以上	15分	85.8	97.5	適合
	100	pH4.0	85%以上	15分	100.3	102.4	適合

(2) 溶出規格

セチリジン塩酸塩錠 5mg「アメル」、セチリジン塩酸塩錠 10mg「アメル」

日本薬局方医薬品各条に定められたセチリジン塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

表示量	回転数	試験液	規定時間	溶出率
5 mg	50 rpm	水	15分	85%以上
10 mg	50 rpm	水	30分	80%以上

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方「セチリジン塩酸塩錠」による
紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

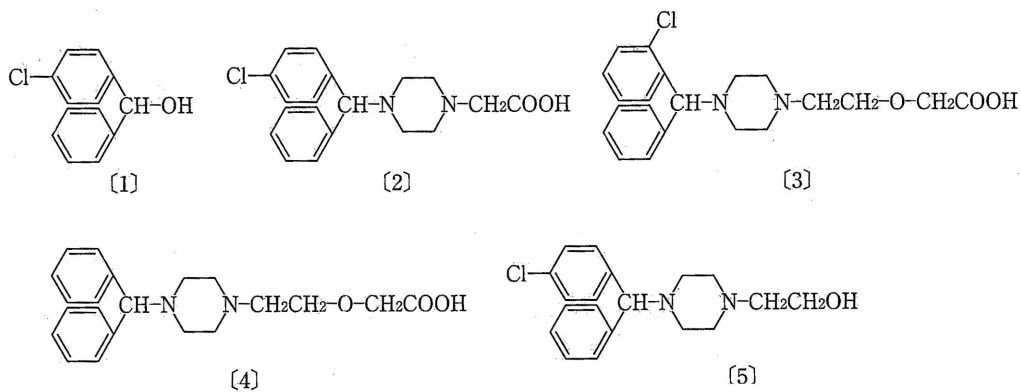
日本薬局方「セチリジン塩酸塩錠」による
液体クロマトグラフィー

11. カ 価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物¹⁾

混在が予想される類縁物質には[1]～[5]などがあるが、実質的には本品は極めて高純度であり、個々の類縁物質の許容限度は0.2%以下、類縁物質総量の許容限度は0.5%以下に規定されている。



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

〈錠 5mg〉

〔成人〕

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として1回10mgを1日1回、就寝前に経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は1日20mgとする。

〔小児〕

通常、7歳以上15歳未満の小児にはセチリジン塩酸塩として1回5mgを1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。

〈錠 10mg〉

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として1回10mgを1日1回、就寝前に経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は1日20mgとする。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

腎障害患者では、血中濃度半減期の延長が認められ、血中濃度が増大するため、クレアチニンクリアランスに応じて、下表のとおり投与量の調節が必要である。

なお、クレアチニンクリアランスが10mL/min未満の患者への投与は禁忌である。

成人患者の腎機能に対応する用法・用量の目安

(外国人データ)

	クレアチニンクリアランス(mL/min)			
	≥80	50～79	30～49	10～29
推奨用量	10mgを 1日1回	10mgを 1日1回	5mgを 1日1回	5mgを 2日に1回

腎障害を有する小児患者では、各患者の腎クリアランスと体重を考慮して、個別に用量を調整すること。

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)：

該当しない

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 受容体拮抗剤：ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、ベポタスチンベシル酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン 等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序：

抗ヒスタミン薬(H₁ 受容体遮断薬)であるが、ロイコトリエン及びプロスタグランジン D₂ の遊離抑制作用を併せ持つ。古典的な抗ヒスタミン薬と異なり、抗コリン作用はほとんどない。また、ヒスタミン H₂、ドパミン、セロトニンの各受容体に対する親和性は低く、中枢神経系におけるヒスタミン H₁ 受容体への影響が少ないとされる。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⁵⁾：

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」

0.95±0.60 時間(健康成人男子にセチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」を1錠投与した場合)

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」

1.15±0.47 時間(健康成人男子にセチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」を1錠投与した場合)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁵⁾：

セチリジン塩酸塩製剤であるセチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」、錠 10mg 「アメル」の医薬品製造販売承認申請を行うに当たり、セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」、錠 10mg 「アメル」又は標準製剤を健康成人男子 10 例(1 群 5 例)に単回経口投与し、血漿中の未変化体濃度を測定して、薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。

治験デザイン	「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 13 年 5 月 31 日 医薬審第 786 号)」に準じ、非盲検下における 2 剤 2 期のクロスオーバー法を用いた。初めの 2 泊 3 日の入院期間を第 I 期とし、2 回目の入院期間を第 II 期とした。なお、第 I 期と第 II 期間の休業期間は 7 日間とした。
投与条件	<u>セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」</u> 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にセチリジン塩酸塩として 5mg 含有するセチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」1 錠又は標準製剤 1 錠を 150mL の水とともに単回経口投与した。また、投与後 4 時間までは絶食とした。 <u>セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」</u> 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にセチリジン塩酸塩として 10mg 含有するセチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」1 錠又は標準製剤 1 錠を 150mL の水とともに単回経口投与した。また、投与後 4 時間までは絶食とした。
採血時点	第 I 期及び第 II 期ともに採血は、治験薬の投与前、投与後 0.5、1、1.5、2、3、4、6、8、10、12 及び 24 時間後の 12 時点とした。 採血量は 1 回につき 7mL とした。
分析法	LC/MS/MS 法

セチリジン塩酸塩錠 5mg「アメル」

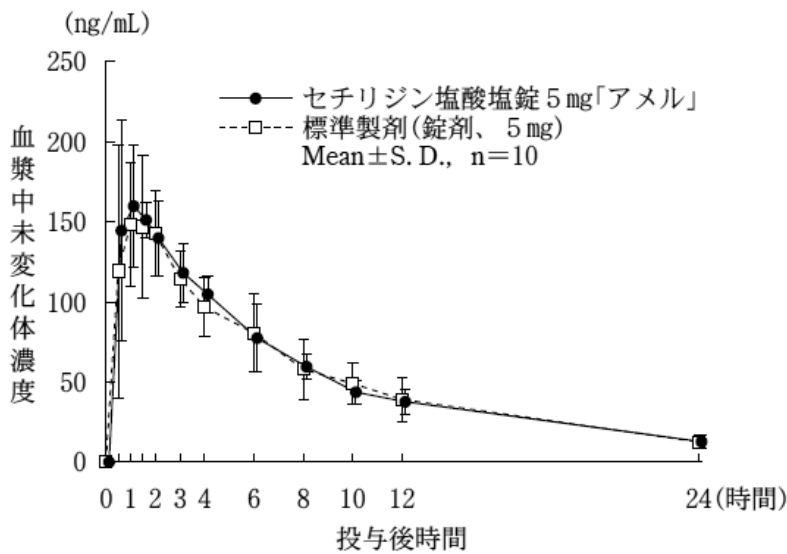
<薬物動態パラメータ>

	AUC _(0→24) (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
セチリジン塩酸塩錠 5mg「アメル」	1308.10±145.78	186.35±25.73	0.95±0.60	7.87±2.19
標準製剤 (錠剤、5mg)	1298.00±307.75	175.45±38.06	1.15±0.47	7.41±1.45

(Mean±S.D.,n=10)

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。

	AUC _(0→24)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.0254)	log(1.0773)
90%信頼区間	log(0.9443)～log(1.1135)	log(0.9695)～log(1.1971)



なお、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。

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」

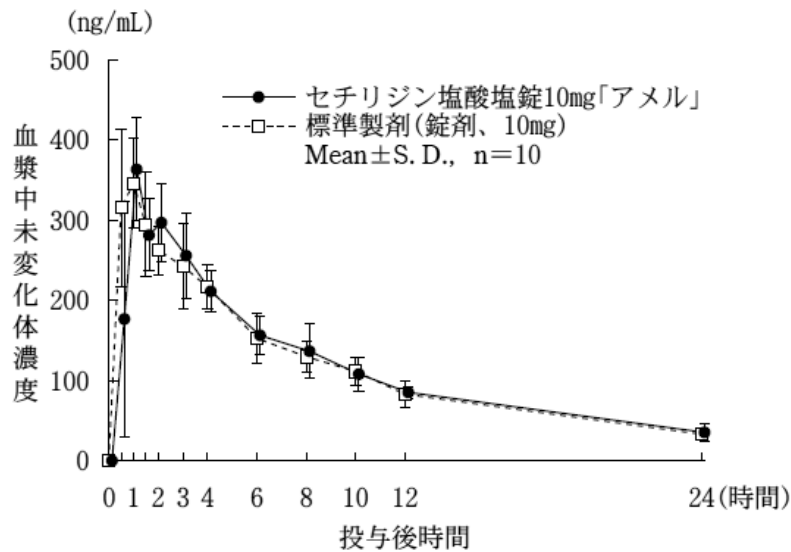
<薬物動態パラメータ>

	AUC _(0→24) (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」	2817.31±391.26	385.67±77.44	1.15±0.47	8.62±1.30
標準製剤 (錠剤、10mg)	2809.33±315.95	385.53±67.07	0.90±0.32	8.21±1.50

(Mean±S.D.,n=10)

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。

	AUC _(0→24)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(0.9994)	log(0.9943)
90%信頼区間	log(0.9502)～log(1.0511)	log(0.9219)～log(1.0725)



なお、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」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：
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¹⁾：
92%

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：
〈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：
ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。
- (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：

主として腎臓から排泄される。

(2) 排泄率¹⁾：

24 時間後までに約 50%が未変化体として尿中に排泄される。

(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

本剤は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(レボセチリジン、ヒドロキシジンを含む)に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 重度の腎障害(クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満)のある患者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

腎障害患者では、血中濃度半減期の延長が認められ、血中濃度が増大するため、クレアチニンクリアランスに応じて、下表のとおり投与量の調節が必要である。
なお、クレアチニンクリアランスが 10mL/min 未満の患者への投与は禁忌である。

成人患者の腎機能に対応する用法・用量の目安 (外国人データ)

	クレアチニンクリアランス (mL/min)			
	≥80	50～79	30～49	10～29
推奨用量	10mg を 1日1回	10mg を 1日1回	5mg を 1日1回	5mg を 2日に1回

腎障害を有する小児患者では、各患者の腎クリアランスと体重を考慮して、個別に用量を調整すること。

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。(「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、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
- (3) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由：

該当しない

(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	併用により、テオフィリンの薬物動態に変化はないが、本剤の曝露量の増加が報告されている。	機序は明らかではないが、本剤のクリアランスが16%減少する。
リトナビル	併用により、本剤の曝露量の増加(40%)及びリトナビルの曝露量のわずかな変化(-11%)が報告されている。	リトナビルにより本剤の腎排泄が阻害される可能性が考えられる。
中枢神経抑制剤 アルコール	中枢神経系に影響を与える可能性があるため、中枢神経抑制剤あるいはアルコールと併用する際は注意すること。	中枢神経抑制作用が増強される可能性がある。
ピルシカイニド塩酸塩水和物	併用により両剤の血中濃度が上昇し、ピルシカイニド塩酸塩水和物の副作用が発現したとの報告がある。	機序は明らかではない。

8. 副作用

(1) 副作用の概要：

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状：

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、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：

その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、頭重感、ふらふら感、しびれ感、めまい、浮遊感、不眠、振戦、抑うつ、激越、攻撃性、無力症、錯感覚、幻覚、不随意運動、意識消失、健忘、自殺念慮、悪夢
消化器	口渇、嘔気、食欲不振、胃不快感、下痢、消化不良、腹痛、腹部不快感、胃痛、口唇炎、便秘、口唇乾燥感、嘔吐、味覚異常、口内炎、腹部膨満感、食欲亢進
循環器	動悸、血圧上昇、不整脈(房室ブロック、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍、心房細動)
血液	好酸球増多、好中球減少、リンパ球増多、白血球増多、白血球減少、単球増多、血小板増加、血小板減少
過敏症	発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、そう痒感、血管浮腫、多形紅斑
眼	結膜充血、霧視、眼球回転発作
肝臓	ALT (GPT) 上昇、AST (GOT) 上昇、総ビリルビン上昇、Al-P 上昇
腎臓・泌尿器	尿蛋白、BUN 上昇、尿糖、ウロビリノーゲンの異常、頻尿、血尿、排尿困難、遺尿、尿閉

その他	耳鳴、月経異常、胸痛、ほてり、息苦しさ、関節痛、手足のこわばり、嗅覚異常、鼻出血、脱毛、咳嗽、体重増加、筋肉痛
-----	---

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧：

該当資料なし

(5) 基礎疾患, 合併症, 重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度：

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法：

- 1) 本剤の成分又はピペラジン誘導体(レボセチリジン、ヒドロキシジンを含む)に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 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。
- 3) 過敏症症状(発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、そう痒感、血管浮腫、多形紅斑)が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

9. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、低用量(例えば 5mg)から投与を開始するなど慎重に投与し、異常が認められた場合は減量又は休薬するなど適切な処置を行うこと。

10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔動物実験(ラット)で胎盤を通過することが報告されている。〕
- (2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。〕

11. 小児等への投与

- (1) 2歳以上7歳未満の小児に対してはセチリジン塩酸塩ドライシロップ 1.25%を投与すること。
- (2) 低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の幼児に対する安全性は確立していない(国内における使用経験が少ない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルギー皮内反応を抑制するため、アレルギー皮内反応検査を実施する 3～5 日前より本剤の投与を中止することが望ましい。

13. 過量投与

徴候、症状：

本剤の過量投与により錯乱、散瞳、落ち着きのなさ、鎮静、傾眠、昏迷、尿閉があらわれることがある。

処置：

必要に応じ対症療法を行うこと。本剤の特異的な解毒剤はなく、また本剤は透析で除去されない。

14. 適用上の注意

薬剤交付時：

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。(PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。)

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験(「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照) :

(2) 副次的薬理試験 :

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験 :

該当資料なし

(4) その他の薬理試験 :

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験 :

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験 :

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験 :

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性 :

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：セチリジン塩酸塩 劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について：

〈安定性試験〉²⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、セチリジン塩酸塩錠5mg「アメル」、錠10mg「アメル」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) 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)：

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」参照

(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

セチリジン塩酸塩錠5mg「アメル」：PTP100錠(10錠×10)

セチリジン塩酸塩錠10mg「アメル」：PTP100錠(10錠×10)

7. 容器の材質

PTP包装：ポリプロピレンフィルム+アルミニウム箔、ポリプロピレン袋

PTPサイズ：31×83 (mm)

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ジルテック錠 5、ジルテック錠 10（ユーシービージャパン(株)＝第一三共(株)）

同効薬：ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、ベポタスチンベシル酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン 等

9. 国際誕生年月日

1986年11月6日

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

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」：2007年3月15日

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」：2007年3月15日

承認番号

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」：21900AMX00412

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」：21900AMX00413

11. 薬価基準収載年月日

2007年7月6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

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」

2013年9月2日：小児に対する効能効果、用法用量の追加

13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」	117864701	4490020F1012	620005445
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」	117865401	4490020F2175	620005473

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。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方 解説書,セチリジン塩酸塩,廣川書店(2016)
- 2) 共和薬品工業株式会社 社内資料:安定性試験
- 3) 共和薬品工業株式会社 社内資料:安定性試験(無包装)
- 4) 共和薬品工業株式会社 社内資料:溶出試験
- 5) 共和薬品工業株式会社 社内資料:生物学的同等性試験

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

その他の関連資料

調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉砕

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」

粉砕状態における安定性は、25℃75%RHの湿度条件下において、90日目までいずれの試験項目においても規格値の範囲内であった。

湿度(25±1℃、75±5%RH、遮光・グラシン紙分包)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	30日目	60日目	90日目
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量法 ^{※1}	95.0～105.0%	101.3	99.1	96.5	95.8

※1.3回の平均値(%)

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」

粉砕状態における安定性は、25℃75%RHの湿度条件下において、90日目までいずれの試験項目においても規格値の範囲内であった。

湿度(25±1℃、75±5%RH、遮光・グラシン紙分包)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	30日目	60日目	90日目
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量法 ^{※1}	95.0～105.0%	102.0	99.6	98.7	99.6

※1.3回の平均値(%)

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

試験方法等は「経管投与ハンドブック第2版」(執筆 倉田なおみ(昭和大学薬学部教育推進センター准教授)、(株)じほう、2006)を参考にした。

使用器具：

ニプロシリンジ GA (20 mL) (ニプロ製)

ニューエンテラルフィーディングチューブ(8 Fr.、120 cm) (日本シャーウッド製)

試験方法：

シリンジ内に錠剤をそのまま1個入れてピストンを戻し、シリンジに55℃の湯20 mLを吸い取り放置し、5分及び10分後にシリンジを手で90度15往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察する。

得られた懸濁液を経管栄養用カテーテルの注入端より、約2～3 mL/secの速度で注入し、通過性を観察する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30 cmの高さにセットする。注入後に適量の水を注入してチューブ内を洗うとき、チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

結果：

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「アメル」：水(約55℃)、10分、8 Fr.チューブを通過した。

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「アメル」：水(約55℃)、10分、8 Fr.チューブを通過した。