

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2013 に準拠して作成

持続性選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」

セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

Cetirizine Hydrochloride Tablets 5mg "IWAKI"

Cetirizine Hydrochloride Tablets 10mg "IWAKI"

(日本薬局方 セチリジン塩酸塩錠)

剤 形	錠剤 (フィルムコーティング錠)
規 格 ・ 含 量	日局 セチリジン塩酸塩含量 セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」 : 1錠中 5mg セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」 : 1錠中 10mg
一 般 名	和名: セチリジン塩酸塩 (塩酸セチリジン) 洋名: Cetirizine Hydrochloride
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 発売年月日	セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」 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 セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」 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: 岩城製薬株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	
問い合わせ窓口	学術部 TEL 03-3668-1574 FAX 03-3668-5282 受付時間: 土、日、祝日を除く 9:00~17:00 医療関係者向けホームページ http://www.iwakiseiyaku.co.jp/product/index_m.html

本 I F は 2014 年 4 月 作成 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 総合 情報 提供 HP にて ご 確認 ください。
<http://www.info.pmda.go.jp>

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の作成の経緯

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提供や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 記載用量 2008 が策定された。

IF 記載用量 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事(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 が提供される事となった。

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。

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て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「添付文書などの情報を補完し、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」と位置づけられる。

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、1 色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場には、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。「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、再審査結果または再評価結果(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自らが整備するとともに、IF の利用にあたっては、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から記載されている「臨床成績」や「おもな外国での発売状況」に関する事項は承認条項にもかかわることがあり、その取り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いただきたい。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保管する情報資材であり、今後インターネットでの公開などもふまえて、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
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名(命名法)	2
6. 慣用名,別名,略号,記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	4
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
4. 製剤の各種条件下における安定性	6
5. 調剤及び溶解後の安定性	8
6. 他剤との配合変化	8
7. 溶出性	8
8. 生物学的試験法	12
9. 製剤中の有効成分の確認試験方法	12
10. 製剤中の有効成分の定量法	12
11. 力価	12
12. 混入する可能性のある夾雑物	12
13. 治療上注意が必要な容器・外観に関する情報	12
14. その他	12
V. 治療に関する項目	13
1. 効能又は効果	13
2. 用法及び用量	13
3. 臨床成績	14
VI. 薬効薬理に関する項目	14
1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群	14
2. 薬理作用	14
VII. 薬物動態に関する項目	15
1. 血中濃度の推移・測定法	18
2. 薬物速度論的パラメータ	18
3. 吸収	18
4. 分布	18
5. 代謝	19
6. 排泄	19
7. トランスポーターに関する情報	19

8. 透析等による除去率	19
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	20
1. 警告内容とその理由	20
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	20
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20
4. 用法及び用量に関する使用上の注意とその理由	20
5. 慎重投与内容とその理由	20
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21
7. 相互作用	21
8. 副作用	22
9. 高齢者への投与	23
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	23
11. 小児等への投与	23
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	23
13. 過量投与	23
14. 適用上の注意	23
15. その他の注意	23
16. その他	23
IX. 非臨床試験に関する項目	24
1. 薬理試験	24
2. 毒性試験	24
X. 管理的事項に関する項目	25
1. 規制区分	25
2. 有効期間又は使用期限	25
3. 貯法・保存条件	25
4. 薬剤取り扱い上の注意点	25
5. 承認条件等	25
6. 包装	25
7. 容器の材質	25
8. 同一成分・同効薬	26
9. 国際誕生年月日	27
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	27
11. 薬価基準収載年月日	27
12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	27
13. 再審査結果,再評価結果公表年月日及びその内容	27
14. 再審査期間	27
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	27
16. 各種コード	27
17. 保険給付上の注意	27
X I. 文献	28
1. 引用文献	28
2. その他の参考文献	28
X II. 参考資料	28
1. 主な外国での発売状況	28
2. 海外における臨床支援情報	28
X III. 備考	28
その他の関連資料	28

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

セチリジン塩酸塩は、ベルギーにおいて開発された抗アレルギー製剤(第二世代の抗ヒスタミン薬)である。アレルギー性鼻炎や蕁麻疹の治療薬として、ヨーロッパ、アメリカを初めとし、世界で広く使用されている。

当社では、後発医薬品として開発を企画し、2007年3月に承認を取得、同年7月セチリジン塩酸塩錠5mg及び10mg「イワキ」として発売を開始した。

本製品は診療報酬上の後発医薬品に該当する。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) H_1 受容体拮抗作用機序のアレルギー性疾患治療剤である。成人においてはアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症に、小児においてはアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒に適応症を持つ。

通常、成人では1日1回、小児では1日2回(1回5mg)の経口投与となっている。

[V. 治療に関する項目]

(2) 本剤の成分及び、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、重度の腎障害(クレアチニンクリアランス10mL/min未満)の患者に使用しないこと【禁忌】VII. 安全性(使用上の注意等)に関する報告]

(3) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー様症状、痙攣、肝機能障害、黄疸、血小板減少が報告されている。

[VII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目]

(4) 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。[VII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目]

II. 名称に関する項目

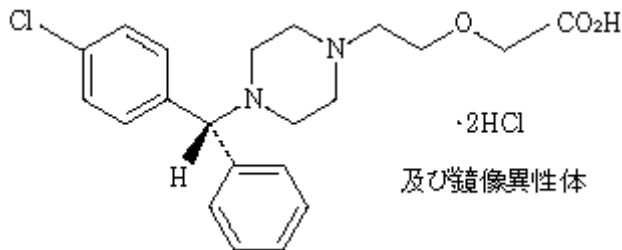
1. 販売名

- (1)和名：セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」・セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」
- (2)洋名：Cetirizine Hydrochloride Tablets 5mg/10mg “IWAKI”
- (3)名称の由来：一般名+規格+製造販売会社略称

2. 一般名

- (1)和名 (命名法)：セチリジン塩酸塩 (塩酸セチリジン) (JAN)
- (2)洋名 (命名法)：Cetirizine Hydrochloride (JAN)
- (3)ステム : diphenylmethyl piperazine derivatives : -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

6. 慣用名,別名,略号,記号番号

該当資料なし

7. CAS 登録番号

83881-52-1 (セチリジン塩酸塩)
83881-51-0 (セチリジン)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状¹⁾

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性¹⁾

水に極めて溶けやすく、エタノール (99.5) に溶けにくい。

0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

(参考)¹⁾

1g は、水 1mL 未満、エタノール(99.5)約 950mL に溶ける。メタノールにはやや溶けやすく約 30mL 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¹⁾

融点：約 207°C (分解)

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(参考：実測値)

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

吸光度 $E_{1\%}^{1cm}$ (231nm) : 370¹⁾

pH : 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 1.0~1.8

旋光性：水溶液 (1→10) は旋光性を示さない。¹⁾

無臭で味はわずかに苦い¹⁾

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) 過塩素酸ヒドロキシルアミン・N,N'-ジヒクロヘキシルカルボジイミド試液による呈色反応 (カルボン酸の確認)

(2) 紫外線可視吸収度測定法

(3) 赤外線吸収スペクトル測定法

(4) 塩化物の定性反応 (1)および(2)

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

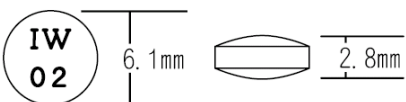
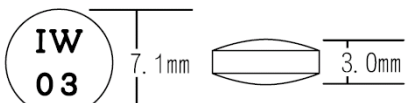
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別 外観及び性状

1) 剤形の区別：錠剤

2) 性状：

製剤	性状	備考
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	<p>白色のフィルムコーティング錠</p>  <p>直径 6.1mm 厚さ 2.8mm</p>	<p>識別コード</p> <ul style="list-style-type: none"> ・錠剤刻印 IW、02、割線なし ・PTP 表：CT5 裏：セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」	<p>白色のフィルムコーティング錠</p>  <p>直径 7.1mm 厚さ 3.0mm</p>	<p>識別コード</p> <ul style="list-style-type: none"> ・錠剤刻印 IW、03、割線なし ・PTP 表：CT10 裏：セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

(2) 製剤の物性

[セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

日局 製剤均一試験法「含量均一性試験」により試験するとき適合する。

局外規第三部「セチリジン塩酸塩錠溶出試験」により試験するとき適合する。

[セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」]

日局 製剤均一試験法「含量均一性試験」により試験するとき適合する。

局外規第三部「セチリジン塩酸塩錠溶出試験」により試験するとき適合する。

(3) 識別コード

[セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

コード種別	コード
錠剤	刻印：IW 02 (割線無し)
PTP	表面：CT5 裏面：セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」

[セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」]

コード種別	コード
錠剤	刻印：IW 03 (割線無し)
PTP	表面：CT10 裏面：セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 領域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

製剤	規格
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	1錠中 日本薬局方 セチリジン塩酸塩(塩酸セチリジン)5mg含有
セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」	1錠中 日本薬局方 セチリジン塩酸塩(塩酸セチリジン)10mg含有

(2) 添加物

製剤	添加物
セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」	乳糖水和物、セルロース、 ヒドロキシプロピルセルロース、二酸化ケイ素、 ステアリン酸 Mg、ヒプロメロース、マクロゴール、 酸化チタン、カルナウバロウ
セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」	セルロース、乳糖水和物、 ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸 Mg、 ヒプロメロース、プロピレングリコール、酸化チタン、 青色 2 号

(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

(1) 加速試験²⁾

セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」の PTP における加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月)、及びセチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」の PTP-アルミピロー(アルミニウムと塩化ビニルフィルム)包装を用いた加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であった。セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」及びセチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」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。

加速試験結果

[セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」] (n=9)

容器	項目	試験開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP	外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	含量均一性	適合	適合	適合	適合
	確認試験	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	溶出試験	適合	適合	適合	適合
	含量 (%) 残存率 (%)	99.7 (100.0)	100.3 (100.7)	100.0 (100.4)	100.2 (100.6)
ポリエチレン容器 参考)	外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	含量均一性	適合	適合	適合	適合
	確認試験	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	溶出試験	適合	適合	適合	適合
	含量 (%) 残存率 (%)	99.9 (100.0)	99.9 (100.0)	100.1 (100.2)	100.0 (100.1)

※試験方法は、本製剤の規格試験、及び局方一般試験法に準ずる。

[セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」] 結果 (n=9)

容器	項目	試験開始時	2 ヶ月	4 ヶ月	6 ヶ月
PTP(アルミピロー)	外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	質量偏差試験	適合	適合	適合	適合
	確認試験	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	崩壊試験	適合	適合	適合	適合
	溶出試験	適合	適合	適合	適合
	含量 (%) 残存率 (%)	98.2 (100.0)	98.6 (100.9)	98.1 (99.9)	98.2 (99.9)

※ 試験方法は、本製剤の規格試験、及び局方一般試験法に準ずる。

(2) 各種条件下における安定性（参考試験）³⁾

1) 試験条件：40°C75%RH で保存

剤形	包装	試験期間	概要
錠	PTP	6ヶ月	<ul style="list-style-type: none"> 5mg 錠は、試験期間内において、品質上の大きな問題は認められなかった。 10mg 錠は溶出挙動に遅延が見られた。最終包装製品を用いた加速試験ではアルミピロー包装で異常が見られなかったことから吸湿の影響を受けていると考えられる。防湿対策が最良の管理方法であるが、25°Cの試験では溶出挙動には問題がないことから室温で保存であれば問題がないと考えられる。
	褐色ガラス瓶	6ヶ月	
	無包装	8週間	
	薬包紙	8週間	
	調剤用フィルム袋	8週間	
粉砕品	無包装	8週間	<ul style="list-style-type: none"> 5mg 錠は無包装で含量のわずかな低下、性状の変化が見られ、調剤用フィルム包装の場合、含量のわずかな低下が見られた。 10mg 錠では全ての条件で含量のわずかな低下、性状の変化が見られた。
	薬包紙	8週間	
	調剤用フィルム袋	8週間	

2) 試験条件：25°C75%RH で保存

剤形	包装	試験期間	概要
錠剤	PTP	6ヶ月	試験期間内において、品質上の大きな問題認められなかった。
	褐色ガラス瓶	6ヶ月	
	無包装	2ヶ月	
	薬包紙	2ヶ月	
	調剤用フィルム袋	2ヶ月	
粉砕品	無包装	2ヶ月	
	薬包紙	2ヶ月	
	調剤用フィルム袋	2ヶ月	

3) 試験条件：光照射、60万(1x・hr)又は120万(1x・hr)

剤形	包装	概要
錠剤	PTP	<ul style="list-style-type: none"> 5mg 錠はわずかな含量低下が見られたが品質上の大きな問題は認められなかった。 10mg 錠は品質上の大きな問題は認められなかった。
	褐色ガラス瓶	
	無包装	
	薬包紙	
	調剤用フィルム袋	
粉品	無包装	<ul style="list-style-type: none"> 全ての包装条件について着色が見られた。
	薬包紙	
	調剤用フィルム袋	

4) まとめ

- 錠剤は、いずれの包装形態においても湿度や温度による影響は少ないと考えられる。高温にならず、強度の光に長時間曝されるようなことのない、例えば薬局等での適切な管理下といった環境であれば、どの包装形態であっても試験した期間内での品質は問題ないものと判断した。
- 粉砕品の保管は光に対する注意が必要であり、長期にわたって保管すべきではないことが示唆された。

5. 調剤及び溶解後の安定性

該当しない。

(参考) 簡易懸濁法についてXⅢ. 備考 その他の関連資料に記す。

6. 他剤との配合変化

該当しない

7. 溶出性

(1) 公的溶出試験 (局外規第三部「セチリジン塩酸塩錠の溶出規格」における溶出試験)⁴⁾

[セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」、セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」]

試験方法：日局溶出試験法第2法 (パドル法)

条 件：回転数 50 rpm

試 験 液：水

溶出規格

製剤	規定時間	溶出率
セチリジン塩酸塩錠 5mg	15 分	85%以上
セチリジン塩酸塩錠 10mg	30 分	85%以上

結 果：セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」、セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」は、日本薬局方外医薬品規格第三部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た。

(2) 生物学的同等性試験における溶出曲線⁴⁾

セチリジン塩酸塩錠 5mg および 10mg 「イワキ」と標準製剤について pH1.2、3.0、6.8 及び水の 4 条件について後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインにおける溶出試験 (v. 溶出試験、3. 試験条件、2) 「中性又は塩基性薬物を含む製剤、コーティング製剤」の項目) を行い、その溶出パターンを比較したところ、溶出挙動の同等性が確認された。

1) 試験条件等

試験条件	パドル法 (日局(JP13)溶出試験法第2法) 攪拌速度：50rpm pH1.2 について 100rpm 試験液量：900mL 試験液の温度：37℃ 試験数：一条件につき 12 ベッセル	
溶出液	pH1.2 (日局(JP13)崩壊試験液の第一液)	pH6.8 (日局(JP13)崩壊試験液の第二液)
	pH3.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液)	水 (日局精製水)
定量法	液体クロマトグラフィー	

2) 結果

①セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」

試験液 pH1.2、pH4.0、pH6.8 及び水において標準製剤およびセチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」ともに 15 分以内に 85%以上が溶出した。

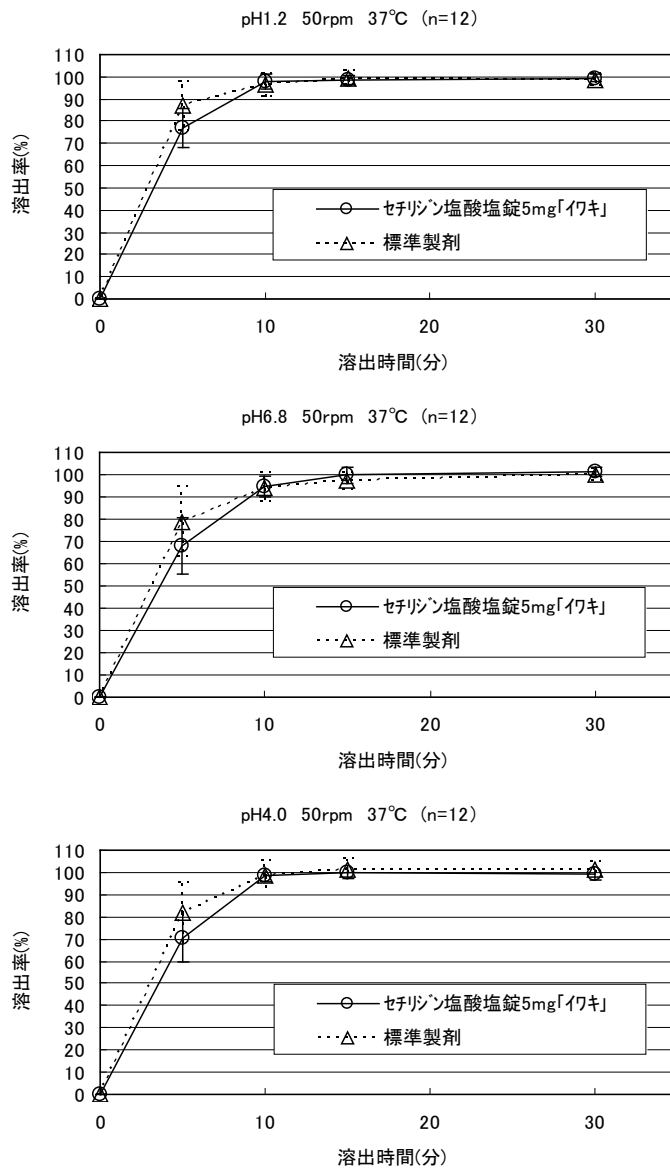
以上の結果から後発医薬品のガイドライン「溶出挙動の類似性の判定」において判定し、本試験におけるセチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」の溶出挙動は標準製剤と同等であると判断した。

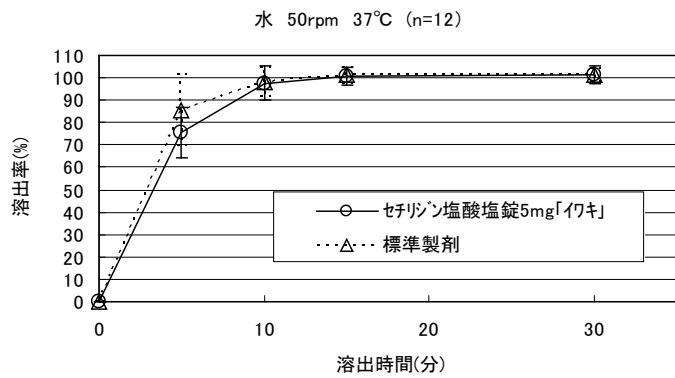
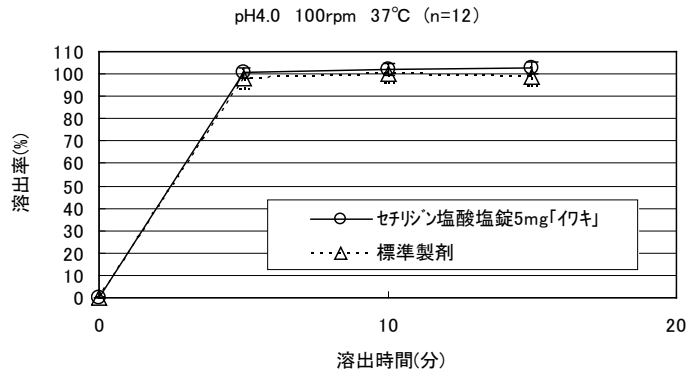
②セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」

試験液 pH1.2、pH4.0、pH6.8 及び水においてセチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」は 15 分以内に 85%以上が溶出した。標準製剤は試験液 pH1.2、pH4.0、pH6.8 において 15 分以内に 85%以上が溶出したが、水においては 15 分～30 分以内に 85%が溶出した。後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに従い求めた f2 関数の値は 53.4(水)であり、45 以上であった。以上の結果から後発医薬品のガイドライン「溶出挙動の類似性の判定」において判定し、本試験におけるセチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」の溶出挙動は標準製剤と同等であると判断した。

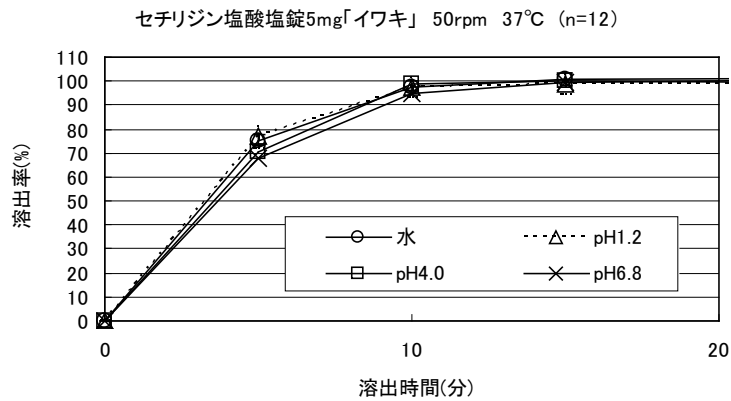
3) 溶出結果グラフ

①セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」

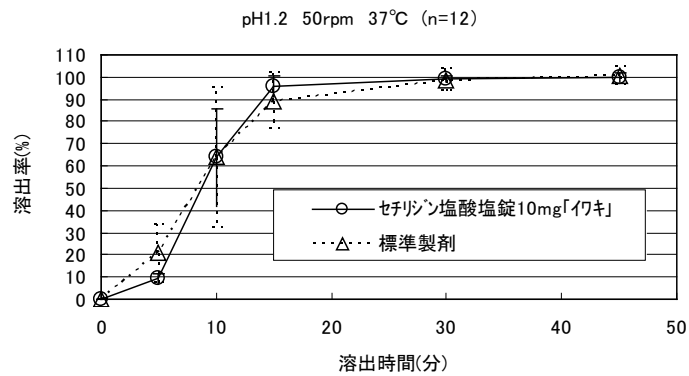


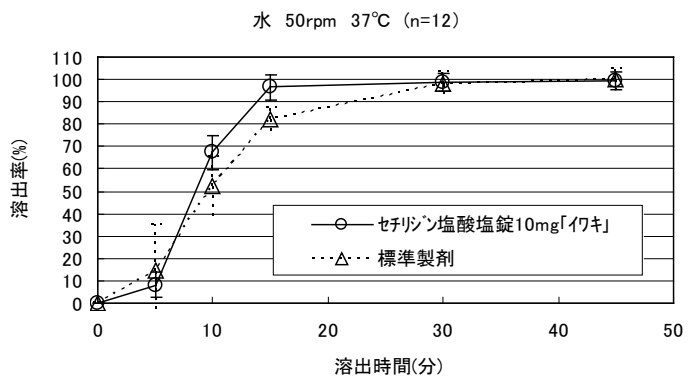
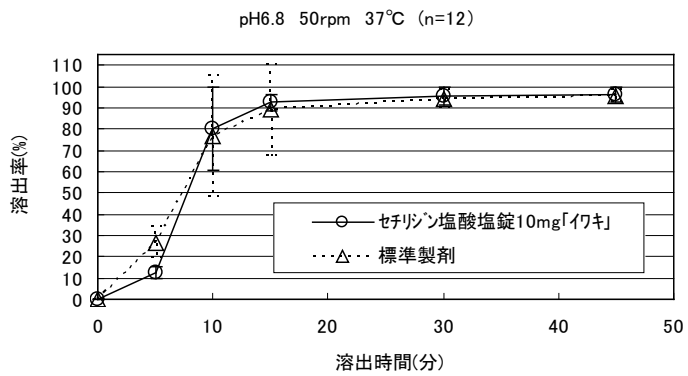
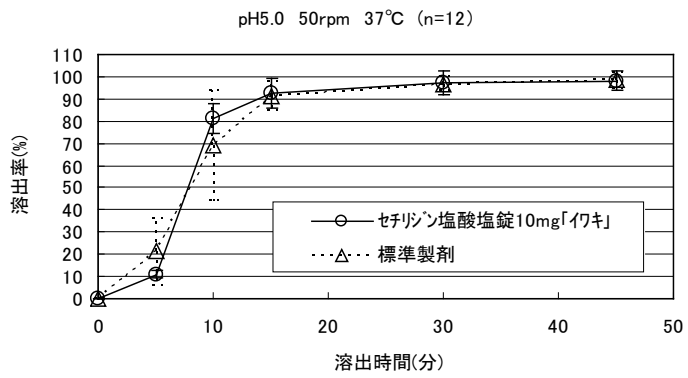
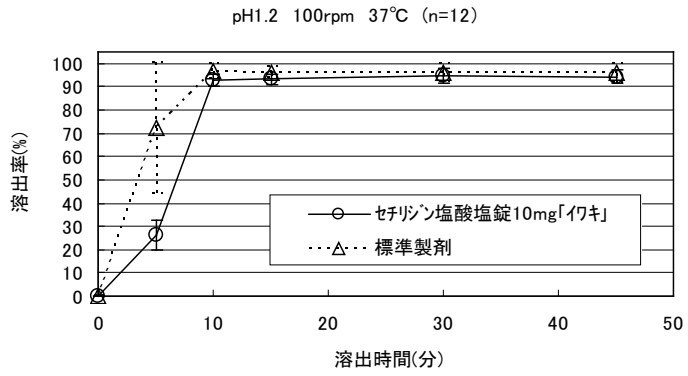


(参考) 各溶出液における挙動

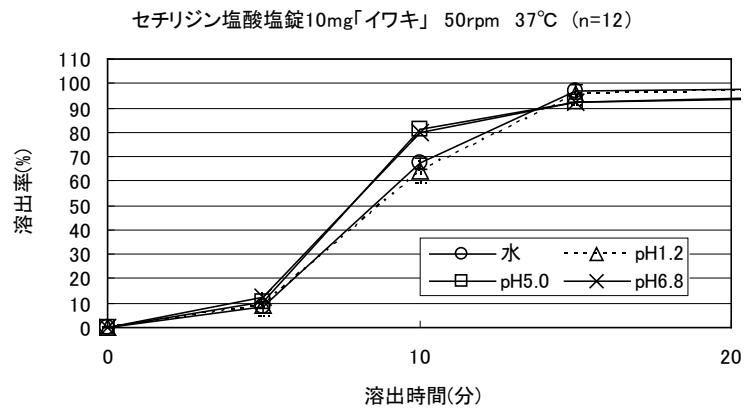


②セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」





(参考) 各溶出液における挙動



8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験方法

[セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

- (1) 過塩素酸ヒドロキシルアミン・N,N'-ジヒクロヘキシルカルボジイミド試液による呈色反応 (カルボン酸の確認)
- (2) ライネッケ塩試液による第3級アミンの沈殿反応
- (3) 紫外線可視吸光度測定法

[セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」]

- (1) 過塩素酸ヒドロキシルアミン・N,N'-ジヒクロヘキシルカルボジイミド試液による呈色反応 (カルボン酸の確認)
- (2) 紫外線可視吸光度測定法

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

日本薬局方セチリジン塩酸塩の規格に適合する。

13. 治療上注意が必要な容器・外観に関する情報

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

[セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」]

[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

[セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

[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

[セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」]

通常、成人にはセチリジン塩酸塩（塩酸セチリジン）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。

[セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

[成人] 通常、成人にはセチリジン塩酸塩（塩酸セチリジン）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（塩酸セチリジン）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。

[セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」・セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

〈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
該当資料なし
- (2) 臨床効果
該当資料なし
- (3) 臨床薬理試験：忍容性試験（単回、反復）、薬力学的試験及びQT/QTc 評価試験
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) 無作為化平行用量反応試験
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・製造販売後臨床試験
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. 薬理学的に関連のある化合物又は化合物群

抗アレルギー用薬。特に、ヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤

2. 薬理作用

- (1) 作用部位・作用機序
 - 1) 作用部位
鼻や皮膚のヒスタミン H₁ 受容体、
肥満細胞をはじめとするアレルギー反応性細胞
 - 2) 作用機序
抗ヒスタミン作用（H₁ 受容体遮断作用）、及び肥満細胞からのロイコトリエン遊離抑制、プロスタグランジン D₂ 遊離抑制作用を併せ持つ。抗コリン作用はほとんどなく、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。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

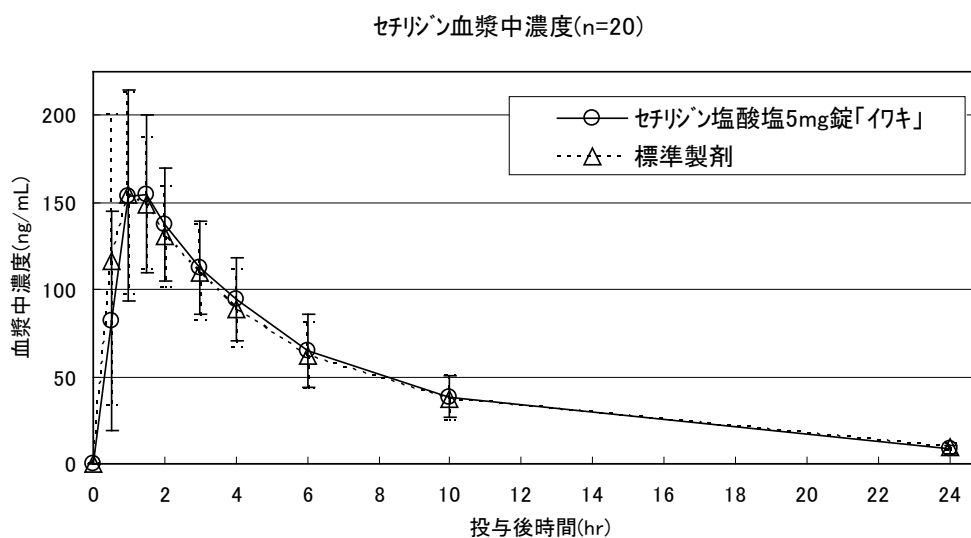
[血清中濃度：生物学的同等性試験]⁴⁾

1) 試験結果概要

[セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（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。なお、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

図 1 セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=20)

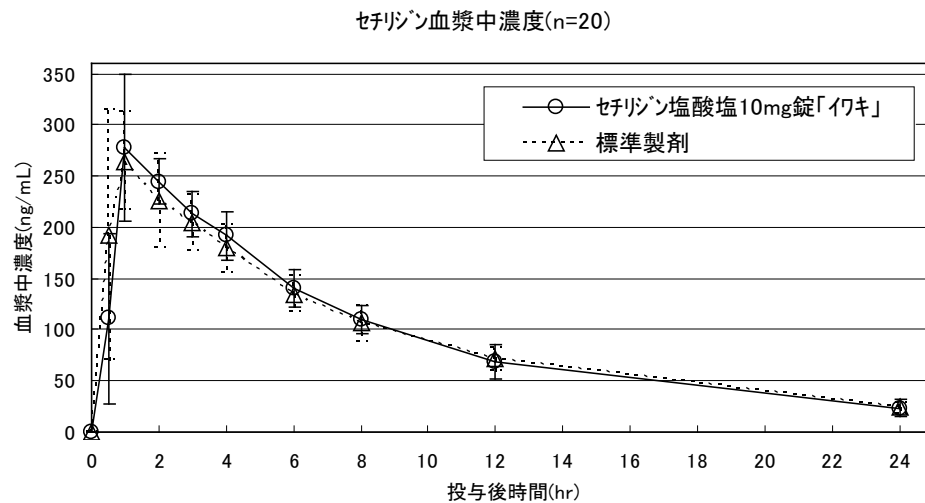
パラメータ	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL)
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	1.3±0.4	167.1±47.1	6.4±0.9	1152.5±321.4
標準製剤 (錠剤、5mg)	1.2±0.6	172.8±56.3	6.9±0.8	1140.5±303.8

血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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 「イワキ」]

セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（セチリジン塩酸塩として 10mg）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。なお、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～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2 セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=20)

製剤	パラメータ	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL)
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」		1.2±0.4	296.9±39.3	6.5±0.9	2306.7±288.1
標準製剤 (錠剤、10mg)		1.0±0.6	296.9±39.2	6.7±0.7	2293.7±305.6

血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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) 生物学的同等性試験の詳細情報（治験デザイン等）

試験概要	ガイドライン等	<ul style="list-style-type: none"> 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日医薬審第487号）（改正平成13年5月31日医薬審第786号）に基づいて実施した。 本治験はGCPを遵守して実施した。 						
	試験方法	<ul style="list-style-type: none"> 2剤2期のクロスオーバー試験 血漿中の塩酸セチリジン濃度の薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。 						
試験方法	被験者	<ul style="list-style-type: none"> 健康成人男子 5mg錠：BMI18.4～23.9 10mg錠：BMI18.9～25.3 						
	投与量及び投与方法	<ul style="list-style-type: none"> 単回投与 （第Ⅰ期と第Ⅱ期の間の休薬期間 5mg錠で6日間、6mg錠で5日間） 試験製剤及び標準製剤を1錠、空腹時に水150mLとともに単回経口投与した。 <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="width: 50%;">試験製剤</th> <th style="width: 50%;">標準製剤</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」</td> <td>標準製剤（セチリジン塩酸塩として5mg）</td> </tr> <tr> <td>セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」</td> <td>標準製剤（セチリジン塩酸塩として10mg）</td> </tr> </tbody> </table>	試験製剤	標準製剤	セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	標準製剤（セチリジン塩酸塩として5mg）	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」	標準製剤（セチリジン塩酸塩として10mg）
	試験製剤	標準製剤						
	セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	標準製剤（セチリジン塩酸塩として5mg）						
	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」	標準製剤（セチリジン塩酸塩として10mg）						
被験者数	5mg錠：20例 10mg錠：20例							
体液の採取方法及び測定方法	<ul style="list-style-type: none"> 体液の採取時間 投与前、投与後30分、1時間、2時間、3時間、4時間、6時間、8時間、10時間（5mg錠）または12時間（10mg錠）、24時間の10ポイント 採取体液等：静脈血 測定方法 5mg錠：GC-MS 10mg錠：HPLC 							
同等性	試験結果	<ul style="list-style-type: none"> 本試験における各パラメータの平均値 標準偏差を「1）試験結果の概要」に記載 						
	同等性の要約	<p>[セチリジン塩酸塩 5mg錠「イワキ」]</p> <ul style="list-style-type: none"> 本試験の結果、セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」と標準製剤との平均値の差の90%信頼区間はAUC_tでは$\log(0.91) \sim \log(1.11)$、$C_{max}$では$\log(0.88) \sim \log(1.08)$であった。従って『後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン』で示されている同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ に適合したことから、セチリジン塩酸塩錠 5mg「イワキ」は標準製剤と生物学的に同等であると判断した。 <p>[セチリジン塩酸塩 10mg錠「イワキ」]</p> <ul style="list-style-type: none"> 本試験の結果、セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」と標準製剤との平均値の差の90%信頼区間はAUC_tでは$\log(0.97) \sim \log(1.05)$、$C_{max}$では$\log(0.96) \sim \log(1.05)$であった。従って『後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン』で示されている同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ に適合したことから、セチリジン塩酸塩錠 10mg「イワキ」は標準製剤と生物学的に同等であると判断した。 						

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 | [血清中濃度：生物学的同等性試験] ³⁾ |
| (3) 臨床試験で確認された血中濃度 | [血清中濃度：生物学的同等性試験] ³⁾ |
| (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 |

(参考)

[血清中濃度：生物学的同等性試験]³⁾は服用前 12 時間、服用後 4 時間の絶食試験である。

- | | |
|--------------------------------------|--------|
| (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 |
|--------------------------------------|--------|
- (参考)¹⁾

健常人では 10mg を単回経口投与したとき、速やかに吸収され、約 1.5 時間後に最高血漿中濃度に達し、消失半減期は約 6.7 時間、AUC は約 2.0mg・hr・L である。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。ヒト血漿蛋白結合率は 92% である。

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 | [血清中濃度：生物学的同等性試験] ³⁾ |
| (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 |
| (参考) アトピー性皮膚炎診療ガイドラインにおいて、10mg で非鎮静性、20mg で軽度沈静性の薬剤とされる。 ^{3) 参考} | |
| (2) 血液—胎盤関門通過性 | 該当資料なし |
| (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。[Ⅷ. 妊婦、散布、授乳婦等への投与 参照] | |
| (3) 乳汁中への移行性 | 該当資料なし |
| (参考) ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。[Ⅷ. 妊婦、散布、授乳婦等への投与 参照] | |
| (4) 髄液への移行性 | 該当資料なし |
| (5) その他の組織への移行性 | 該当資料なし |

5. 代謝

- | | |
|-------------------------------|--------|
| (1) 代謝部位及び代謝経路 | 該当資料なし |
| (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種 | 該当資料なし |
| (3) 初回通過効果の有無及びその割合 | 該当資料なし |
| (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 | 腎臓 (尿中) |
| (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

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. 用法及び用量に関する使用上の注意とその理由

[セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」・セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」]

〈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

- (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	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。

重大な副作用と初期症状

1) ショック、アナフィラキシー様症状（頻度不明）

ショック、アナフィラキシー様症状（呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

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（頻度不明）

AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTP、LDH、Al-P の上昇等の肝機能障害（初期症状：全身けん怠感、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

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。

種類 \ 頻度	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
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

その他の副作用、過敏症に示されるような症状があらわれた場合には、投与を中止する。

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

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。

（参考）

一般的に、抗ヒスタミン薬の中毒症状として、中枢神経系の興奮、興奮後の抑制あるいは初めからの抑制作用がある。幼小児では興奮が先行し、次に抑制状態、成人では中枢神経抑制が見られることが多い。具体的症状は、『8. 副作用』の項目を参考とする。対応は、薬品を体外に排出する措置（胃洗浄、吸着剤、下剤、透析など）、対症療法および支持療法となる。^{1) 参考}

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。）

15. その他の注意

特になし

16. その他

特になし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

- | | |
|--------------|--------|
| (1) 薬効薬理試験 | 該当資料なし |
| (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

該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(外箱に記載)

(参考) 安定性試験

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、外観及び含量等は規格の範囲内であり、セチリジン塩酸塩錠5mg「イワキ」及びセチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」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。

3. 貯法・保存条件

気密容器・室温保存

4. 薬剤取り扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

廃棄方法について特に指定はなく、医療用医薬品として取り扱う。

(2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)

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。)

(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「イワキ」	PTP100錠 PTP500錠
セチリジン塩酸塩錠10mg「イワキ」	PTP100錠 PTP500錠

7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル アルミニウム

アルミピロー：ポリ塩化ビニル アルミニウム

8. 同一成分・同効薬

(1) 同一有効成分

ジルテック錠(5mg、10mg)・ジルテックドライシロップ(1.25%)

(2) 同効薬

抗アレルギー製剤分類一覧表²⁾参考 (※印：適応名を一部省略して記載)

薬効別分類及び 一般名(銘柄名など)	気管支喘息	蕁麻疹	湿疹・皮膚炎	皮膚掻痒症	痒疹	アトピー性皮膚炎	※1:食物アレルギー性皮膚炎	痒疹を伴う尋常性乾癬	皮膚疾患に伴う痒疹						※2:アレルギー性皮膚疾患	花粉症(枯草熱)	アレルギー性鼻炎	血管運動性鼻炎	血管運動性浮腫	ケロイド・肥厚性瘢痕
									湿疹・皮膚炎	皮膚掻痒症	アトピー性皮膚炎	痒疹	薬疹	尋常性乾癬						
1ター遊離抑制薬 ケミカルメデイエ	クロモグリク酸ナトリウム(インタル細粒10%)						○													
	トラニラスト(リザヘン)	○					○									○				○
	アレキサクス(ソルファ)	○														○				
	ヘミロラスト(アレキサル・ヘミラスト)	○														○				
(第1世代) 抗ヒスタミン薬	d-メレトリンカロルフェラジン(ボラジン)		○						○	○					○	○	○	○	○	
	フェマル酸メチルピリフェン(カバジール)														○	○	○			
	塩酸シロバタジン(ヘリアクシ)		○						○	○					○	○	○	○	○	
抗ヒスタミン薬(第2世代)	フェマル酸チフェン(ザジテン)	○	○	○	○											○				
	塩酸アゼラスチン(アゼラチン)	○	○	○	○	○	○									○				
	セキサトミン(セルテクト)		○	○	○	○										○				
	(セルテクトドライシロップ)	○	○			○	○													
	メキタジン(セレスワン・ネボラジン)	○	○						○	○							○			
	フェマル酸エメタスチン(カレン・レミカト)		○	○	○	○										○				
	塩酸エビナスタチン(アレジオン)	○	○	○	○	○		○								○				
	エバスタチン(エバステル)		○	○	○	○										○				
	塩酸セチリジン(ジルテック)		○	○	○	○										○				
	塩酸フェキソフェナジン(アレグラー)		○						○	○	○					○				
	塩酸ロバタジン(アレロック)		○						○	○		○	○			○				
	ロラタジン(クラリチン)		○						○	○						○				
ベシメチル酸ヘボタスチン(オロン)		○						○	○		○				○					
トロンボキササンA ₂ 合成阻害・受容体拮抗薬 ラモロハソン(ハビタス)															○					
ロイコトリエン拮抗薬 プラニロラスト(オロン)	○															○				
(オロンドライシロップ)	○																			
Th ₂ サイトカイン阻害剤 トルラスチン(アビータイ)	○					○									○					
(アビータイドライシロップ)	○																			

省略適応名 ※1：食物アレルギーに基づくアトピー性皮膚炎

※2：アレルギー性皮膚疾患(蕁麻疹、皮膚炎、痒疹症)

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

製剤	製造販売承認年月日	承認番号
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	2007年3月15日	21900AMX00553000
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」	2007年3月15日	21900AMX00546000

11. 薬価基準収載年月日

2007年7月6日

12. 効能・効果追加、用法・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 「イワキ」]

一部変更承認年月日：2014年4月1日

・効能・効果追加

[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

・用法・用量追加

[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（塩酸セチリジン）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。

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

該当しない

16. 各種コード

販売名	セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」
厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	4490020F1187	4490020F2183
HOT 番号(13桁)	1179675010101	1179675010102
レセプト電算コード	620005446	620005474

17. 保険給付上の注意

該当しない

なお、本剤は診療報酬上の後発医薬品に該当する。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 第 16 改正 日本薬局方解説書
- 2) 岩城製薬 社内資料 (加速試験)
- 3) 岩城製薬 社内資料 (各種条件下での安定性)
- 4) 岩城製薬 社内資料 (生物学的同等性)

2. その他の参考文献

- 1) 参考急性中毒情報ファイル 第 4 版 廣川書店
- 2) 参考医薬品要覧 第 6 版 大阪府病院薬剤師会編 株式会社じほう
- 3) 参考アトピー性皮膚炎診療ガイドライン
日本皮膚科学会誌 119(8) 1515-1534, 2009 年

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

Zirtek (アメリカ、EU)

2. 海外における臨床支援情報

妊婦への投与に関する情報

海外の基準	基準
FDA 基準	B
オーストラリアの分類	B2

FDA Use-in-Pregnancy Ratings Category : B

No evidence of risk in humans—Adequate, well controlled studies in pregnant women have not shown increased risk of fetal abnormalities despite adverse findings in animals,

Prescribing medicines in pregnancy 4th

(An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

Category B2

Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed. Studies in animals are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

X III. 備考

その他の関連資料

(参考試験)簡易懸濁法 次ページ

(参考試験) セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」 簡易懸濁法試験

[試験方法]

シリンジのピストン部を抜き取り、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℃の精製水 20mL を吸い取り、筒先に蓋をして 5 分間自然放置した。5 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。5 分後に崩壊しない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊懸濁しない場合は、この方法を中止する。中止した製品は、錠剤 1 個を薬包紙に包み、上から乳棒で数回叩いて破壊後、上述と同様の操作を行う。得られた懸濁液を経管栄養用カテーテル (8Fr. チューブ) の注入端より、約 2~3mL/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 30cm 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。

[判定]

(1) 錠剤を約 55℃の精製水に入れ、5 分または 10 分放置後に攪拌した時の崩壊状況

製品	放置時間	判定
セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」	5 分	△
	10 分	○

※判定基準

- ：完全崩壊またはディスペンサーに吸い取り可能
- ×：投与困難
- △：時間をかければ完全崩壊しそうな状況、またはフィルム残存等によりチューブを閉塞する危険性がある
- ：簡易懸濁法対象外

(2) 簡易懸濁法を適用可否の総合判定

製品	判定
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」	適 1

※判定基準

- 適 1：10 分以内に崩壊・懸濁し、8 Fr. チューブを通過する
- 適 2：錠剤のコーティングを破壊すれば、10 分以内に崩壊・懸濁し、8 Fr. チューブを通過
- 不適：簡易懸濁法では経管投与に適さない

[考察]

セチリジン塩酸塩錠 5mg 「イワキ」について簡易懸濁法の適否を検討した結果、錠剤のままで 10 分以内に 8Fr. チューブを通過し、通過性に問題はないと判断された。

[注意]

簡易懸濁法とは、錠剤やカプセルを開封せずにそのまま約 55℃の温湯に入れて最長 10 分間自然放冷し、崩壊懸濁させて経管投与する方法です。(じほう 内服薬 経管投与ハンドブック 2001 年) 本試験は、約 55℃の温湯に入れて放冷した場合の崩壊の観察と、経管投与のシュミレーションから製剤が物理的に簡易懸濁法に適しているかどうかを判断したものであり、本使用法の有効性・安全性・品質の保証、および使用を推奨するものではありません。

以上

(参考試験) セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」 簡易懸濁法試験

[試験方法]

シリンジのピストン部を抜き取り2、シリンジ内に錠剤を1個入れてピストンを戻し、これに55℃とした精製水 20mL を吸い取り、筒先に蓋をして5分間自然放置した。5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。5分後に崩壊しない場合は、更に5分間放置後、同様の操作を行う。

得られた懸濁液を経管栄養用カテーテル（8Fr. チューブ）の注入端より約2~3mL/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30cm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に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

[判定]

(1) 錠剤を約55℃の精製水に入れ、5分または10分放置後に攪拌した時の崩壊状況

製品	放置時間	回数		
		1	2	3
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」	5分	△	△	△
	10分	○	○	○
標準製品	5分	△	△	△
	10分	○	○	○

※判定基準

- ：完全崩壊またはディスペンサーに吸い取り可能
- ×：投与困難
- △：時間をかければ完全崩壊しそうな状況、またはフィルム残存等によりチューブを閉塞する危険性がある
- ：簡易懸濁法対象外

(2) 簡易懸濁法を適用可否の総合判定

製品	回数		
	1	2	3
セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」	適1	適1	適1
標準製品	適1	適1	適1

※判定基準

- 適1：10分以内に崩壊・懸濁し、8Fr. チューブを通過する
- 適2：錠剤のコーティングを破壊すれば、10分以内に崩壊・懸濁し、8Fr. チューブを通過
- 不適：簡易懸濁法では経管投与に適さない

[考察]

崩壊状況の観察において、5分後ではシリンジ壁面にわずかにフィルムが残っていたが、10分後にはいずれも完全に崩壊した。チューブの通過状況においてもチューブ内に残存物は見られず、総合して通過性に問題ないと判定した。

なお、セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」と標準製品は、同様に判定された。

以上より、セチリジン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」は、55℃の精製水 10分放置の条件で崩壊し、経管栄養用カテーテル（8Fr. チューブ）を通過することから、55℃10分での崩壊を条件とした簡易懸濁法の適用は可能と考えられる。

[注意]

簡易懸濁法とは、錠剤やカプセルを開封せずにそのまま約55℃の温湯に入れて最長10分間自然放冷し、崩壊懸濁させて経管投与する方法です。（じほう 内服薬 経管投与ハンドブック 2001年）本試験は、約55℃の温湯に入れて放冷した場合の崩壊の観察と、経管投与のシュミレーションから製剤が物理的に簡易懸濁法に適しているかどうかを判断したものであり、本使用法の有効性・安全性・品質の保証、および使用を推奨するものではありません。

以上