

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DS0.5%「杏林」

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE DS

(レボセチリジン塩酸塩ドライシロップ)

剤形	ドライシロップ剤
製剤の規制区分	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
規格・含量	1g 中、レボセチリジン塩酸塩 5mg 含有
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：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：8時～22時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://med.kyorin-rmd.com/

本 IF は 2020 年 12 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/>にてご確認下さい。

I F 利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I F と略す）の位置付け並びに I F 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-I F）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F は、（独）医薬品医療機器総合機構のホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-I F を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・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、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された I F は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

【I F の様式】

- ①規格は A 4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤字・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② I F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

【 I F の作成】

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「 I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（ P D F ）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【 I F の発行】

- ① 「 I F 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「 I F 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「 I F 記載要領 2013」においては、 P D F ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の M R 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、 I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、 I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、 I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I F を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。 I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、 I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、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	2. 薬物速度論的パラメータ	14
1. 開発の経緯	1	3. 吸収	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	4. 分布	14
II. 名称に関する項目	2	5. 代謝	15
1. 販売名	2	6. 排泄	15
2. 一般名	2	7. トランスポーターに関する情報	15
3. 構造式又は示性式	2	8. 透析等による除去率	15
4. 分子式及び分子量	2	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16
5. 化学名(命名法)	2	1. 警告内容とその理由	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	16
7. CAS登録番号	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
III. 有効成分に関する項目	3	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
1. 物理化学的性質	3	5. 慎重投与内容とその理由	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
3. 有効成分の確認試験法	3	7. 相互作用	16
4. 有効成分の定量法	3	8. 副作用	17
IV. 製剤に関する項目	4	9. 高齢者への投与	19
1. 剤形	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
2. 製剤の組成	4	11. 小児等への投与	20
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	20
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	13. 過量投与	20
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	14. 適用上の注意	20
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	15. その他の注意	20
7. 溶出性	8	16. その他	20
8. 生物学的試験法	9	IX. 非臨床試験に関する項目	21
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	9	1. 薬理試験	21
10. 製剤中の有効成分の定量法	9	2. 毒性試験	21
11. 力価	9	X. 管理的事項に関する項目	22
12. 混入する可能性のある夾雑物	9	1. 規制区分	22
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	9	2. 有効期間又は使用期限	22
14. その他	9	3. 貯法・保存条件	22
V. 治療に関する項目	10	4. 薬剤取扱い上の注意点	22
1. 効能又は効果	10	5. 承認条件等	22
2. 用法及び用量	10	6. 包装	22
3. 臨床成績	11	7. 容器の材質	22
VI. 薬効薬理に関する項目	12	8. 同一成分・同効薬	23
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	12	9. 国際誕生年月日	23
2. 薬理作用	12	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
VII. 薬物動態に関する項目	13	11. 薬価基準収載年月日	23
1. 血中濃度の推移・測定法	13	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	23
		13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	23

14. 再審査期間	23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
16. 各種コード	23
17. 保険給付上の注意	23
XI. 文献	24
1. 引用文献	24
2. その他の参考文献	24
XII. 参考資料	25
1. 主な外国での発売状況	25
2. 海外における臨床支援情報	25
XIII. 備考	26
1. その他の関連資料	26

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、後発医薬品として薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2020 年 2 月に承認を取得、2020 年 6 月に発売に至った。

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

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

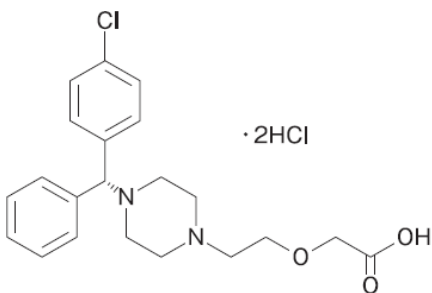
(1)抗ヒスタミン薬 (H_1 受容体遮断薬) であるが、ロイコトリエン及びプロスタグランジン D_2 の遊離抑制作用を併せ持っており、アレルギー症状を改善する。古典的な抗ヒスタミン薬と異なり、鎮静・催眠などの中枢性副作用が少ないため、アレルギー性鼻炎、皮膚炎、皮膚そう痒症及び花粉症など慢性的な症状の治療薬として汎用されている。^{1),2)}

(2)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。

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

(「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、8. 副作用(2)重大な副作用と初期症状」の項参照)

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 DS0.5% 「杏林」
(2) 洋名	LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE DS 0.5% “KYORIN”
(3) 名称の由来	一般名+剤形+規格(含量)+「杏林」
2. 一般名	
(1) 和名(命名法)	レボセチリジン塩酸塩 (JAN)
(2) 洋名(命名法)	Levocetirizine Hydrochloride (JAN)
(3) ステム	ジフェニルメチルピペラジン誘導体：-izine (-yzine)
3. 構造式又は示性式	
4. 分子式及び分子量	分子式： $C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot 2HCl$ 分子量：461.81
5. 化学名(命名法)	2-(2-(4-[(<i>R</i>)-(4-Chlorophenyl)phenylmethyl]piperazin-1-yl)ethoxy)acetic acid dihydrochloride (IUPAC)
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	特になし
7. CAS 登録番号	130018-87-0

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（塩化カリウム錠剤法） (3) 塩化物の定性反応
4. 有効成分の定量法	液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形	
(1) 剤形の区別、外観及び性状	性状：橙色の粉末を含む粒状のドライシロップ剤である。
(2) 製剤の物性	該当資料なし
(3) 識別コード	KRM303
(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	1g 中、レボセチリジン塩酸塩 5mg 含有
(2) 添加物	乳糖水和物、 β -シクロデキストリン、クエン酸ナトリウム水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、アセスルファムカリウム、スクラロース、軽質無水ケイ酸、黄色 5 号、香料
(3) その他	特になし
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	該当しない

IV. 製剤に関する項目

4. 製剤の各種条件下における安定性

【加速試験】³⁾

< 保存条件 >

40±2℃、75±5%RH

< 試験検体 >

分包包装：アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネートフィルムに入れ、加熱シール、紙箱

バラ包装：アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネート袋に入れ、加熱シール、紙箱

< 試験項目及び規格 >

試験項目	規 格
性状	本品は橙色の粉末を含む粒状のドライシロップ剤である。また、0.5gの分包品でもある。
確認試験	液体クロマトグラフィーにより試験を行うとき、試料溶液及び標準溶液の主ピークの保持時間は等しい。また、それらのピークの吸収スペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。
pH	本品2gを水20mLに溶かした液のpHは5.3~6.7である。
純度試験 (類縁物質)	相対保持時間約 0.35、約 0.55、約 0.80、約 1.35、約 1.50 の類縁物質：0.5%以下 上記以外の類縁物質：0.2%以下 類縁物質の合計：1.5%以下
製剤均一性	分包品は含量均一性試験を行うとき、適合する。 (判定値：15.0%以下)
溶出性	水/900mL/パドル法/毎分 50 回転/15 分間/85%以上
定量法	含量：95.0~105.0%

< 試験結果 >

分包包装

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
pH ^{**}	5.99	6.01	6.00	5.99
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適			適
溶出性	適	適	適	適
定量(含量) ^{**}	99.75%	100.84%	99.79%	99.96%

※1ロット n=3 の 3 ロットの平均値

IV. 製剤に関する項目

バラ包装

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
pH*	6.00	6.01	5.99	6.00
純度試験	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量(含量)*	98.54%	98.52%	97.82%	98.14%

※1ロット n=3 の 3 ロットの平均値

【長期保存試験】⁴⁾

<保存条件>

25±2℃、60±5%RH

<試験検体>

加速試験の項参照

<試験項目及び規格>

加速試験の項参照

<試験結果>

分包包装

試験項目	開始時	3 ヶ月	6 ヶ月	9 ヶ月	12 ヶ月	18 ヶ月	24 ヶ月
性状	適	適	適	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適	適	適	適
pH*	5.99	6.00	5.99	5.98	5.98	5.96	6.03
純度試験	適	適	適	適	適	適	適
製剤均一性	適	△	△	△	適	適	適
溶出性	適	適	適	適	適	適	適
定量(含量)*	99.75%	100.66%	100.32%	99.94%	100.25%	99.77%	100.18%

※1ロット n=3 の 3 ロットの平均値

バラ包装

試験項目	開始時	3 ヶ月	6 ヶ月	9 ヶ月	12 ヶ月	18 ヶ月	24 ヶ月
性状	適	適	適	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適	適	適	適
pH*	6.00	6.00	6.00	5.98	5.98	5.96	6.03
度試験	適	適	適	適	適	適	適
製剤均一性	適	△	△	△	適	適	適
溶出性	適	適	適	適	適	適	適
定量(含量)*	98.54%	98.71%	98.21%	98.17%	98.77%	99.06%	100.22%

※1ロット n=3 の 3 ロットの平均値

IV. 製剤に関する項目

【無包装状態での安定性】⁵⁾

保存条件	結 果			
	性状	純度試験	溶出性	定量法
加温条件下 [40℃、75%RH、3 ヶ月、 遮光・気密状態]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
加湿条件下 [25℃、75%RH、100 日、 遮光・開放状態]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
光照射下 [総照射量 120 万 lx・ hr、25℃、60%RH、開放 状態]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：橙色の粉末を含む粒状のドライシロップ剤、純度試験：相対保持時間約 0.35、約 0.55、約 0.80、約 1.35、約 1.50 の類縁物質：0.5%以下、その他の類縁物質：0.2%以下、類縁物質の合計：1.5%以下、溶出性：15 分間 85%以上、含量：95.0～105.0%

<参考>評価基準

分類	性状	純度試験 溶出性	定量法
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	規格値内 の場合	含量低下が 3%未満の場合
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	/	含量低下が 3% 以上で、規格値 内の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化 等を認め、規格を逸脱してい る場合		規格値外 の場合

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会：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」を参考に評価しました。本資料は本剤の安定性に関する資料であり、無包装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

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
(物理化学的変化)

該当しない

IV. 製剤に関する項目

7. 溶出性

【溶出挙動における類似性】⁶⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日付 薬食審査発 0229 第 10 号）に従い、標準製剤との溶出挙動の類似性を検証した。

<試験方法>

試験法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

試験液：以下の試験液 900mL

試験液の温度：37±0.5℃

試験液		回転数
pH1.2	溶出試験第 1 液	50 回転/分
pH6.5	薄めた McIlvaine の緩衝液	50 回転/分
pH6.8	溶出試験第 2 液	50 回転/分
水	水	50 回転/分

<判定基準>

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：

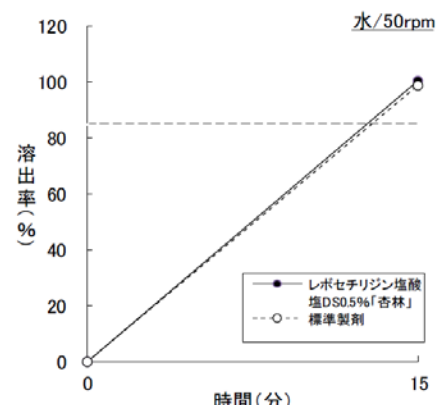
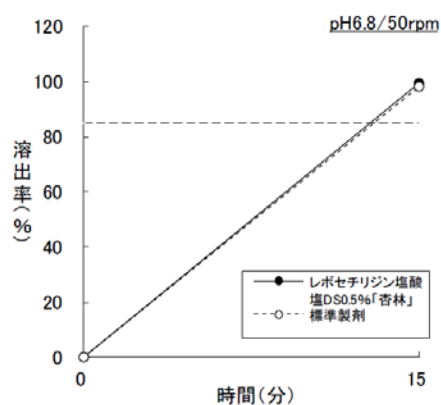
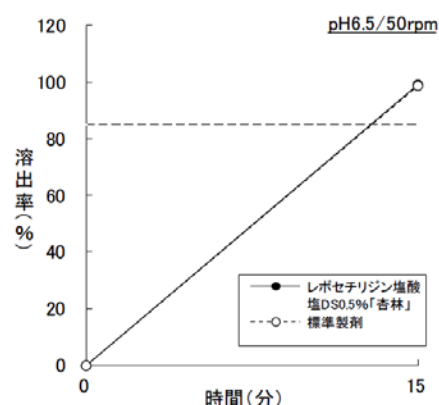
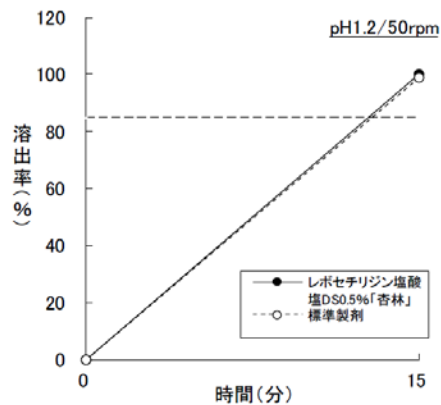
試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

<結果>

溶出条件	判定 時点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率(%)			判定
		レボセチリジン 塩酸塩 DS0.5% 「杏林」	標準製剤 (シロップ [®] 剤、5mg)	差	
pH1.2/50rpm	15	100.1	98.9	1.2	適合
pH6.5/50rpm	15	99.0	98.8	0.2	適合
pH6.8/50rpm	15	99.2	98.1	1.1	適合
水/50rpm	15	100.2	98.7	1.5	適合

すべての溶出試験条件において後発医薬品ガイドラインに示された溶出挙動の類似性の判定基準に適合することから、レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」は標準製剤と溶出挙動が類似していると判定された。

IV. 製剤に関する項目



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. カ価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

特になし

14. その他

特になし

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

[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>

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	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。

V. 治療に関する項目

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 H ₁ 受容体拮抗薬： セチリジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、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、エバスチン、ベタボスチンベシル酸塩、デスロラタジン、ビラスチン など
2. 薬理作用	
(1) 作用部位・作用機序	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っており、アレルギー症状を改善する。古典的な抗ヒスタミン薬と異なり、鎮静・催眠などの中枢性副作用が少ないため、アレルギー性鼻炎、皮膚炎、皮膚そう痒症及び花粉症など慢性的な症状の治療薬として汎用されている。 ^{1),2)}
(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

VII. 薬物動態に関する項目、1. 血中濃度の推移・測定法(3)臨床試験で確認された血中濃度の項を参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

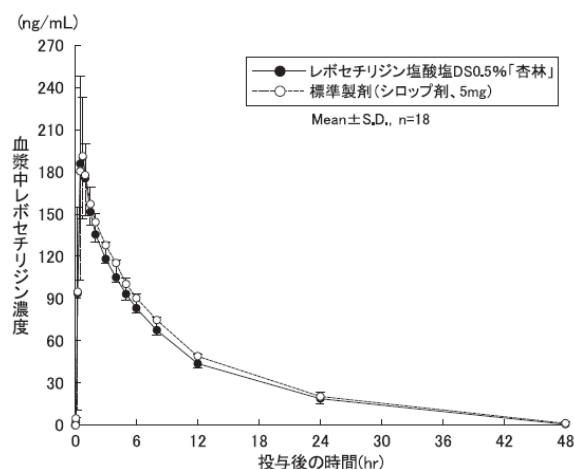
【生物学的同等性試験】⁷⁾

レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」は、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(薬食審査発 0229 第 10 号 平成 24 年 2 月 29 日)」に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」と標準製剤をクロスオーバー法により、試験製剤は 1g、標準製剤は 10mL (レボセチリジン塩酸塩として 5mg)、健康成人男子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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	評価パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→48} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」	1699.2 ±251.9	209.2 ±38.8	0.8 ±0.3	8.6 ±1.0
標準製剤 (シロップ剤、5mg)	1845.5 ±288.3	212.0 ±42.8	0.8 ±0.4	8.4 ±0.7

(Mean ± S. D., n=18)



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

VII. 薬物動態に関する項目

(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. 相互作用の項を参照
(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因	該当資料なし
2. 薬物速度論的パラメータ	
(1) 解析方法	該当資料なし
(2) 吸収速度定数	該当資料なし
(3) バイオアベイラビリティ	該当資料なし
(4) 消失速度定数	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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(1)の項を参照
(3) 乳汁への移行性	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)の項を参照

VII. 薬物動態に関する項目

(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出される
(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	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)	<p>【禁忌（次の患者には投与しないこと）】</p> <ol style="list-style-type: none"> 1. 本剤の成分又はピペラジン誘導体（セチリジン、ヒドロキシジンを含む）に対し過敏症の既往歴のある患者 2. 重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者 [高い血中濃度が持続するおそれがある。]
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	該当しない
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	V. 治療に関する項目、2. 用法及び用量<用法・用量に関連する使用上の注意>の項を参照
5. 慎重投与内容とその理由	<p>慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）</p> <ol style="list-style-type: none"> (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	<p>重要な基本的注意</p> <ol style="list-style-type: none"> (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に十分注意すること。 (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

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(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

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

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

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

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

- 2) 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。

分類	副作用（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、Al-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。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(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	<p>(1) 禁忌（次の患者には投与しないこと） 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</p> <p>(2) 重大な副作用（頻度不明） 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。</p> <p>(3) その他の副作用（頻度不明） 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。 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</p>
9. 高齢者への投与	<p>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。</p>
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	<p>(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。]</p> <p>(2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。[セチリジン^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。</p>

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

11. 小児等への投与	低出生体重児、新生児又は6ヵ月未満の乳児に対する安全性は確立していない（国内における使用経験はない）。
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	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	<p>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。</p> <p>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。</p>
14. 適用上の注意	該当しない
15. その他の注意	該当しない
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（「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	<p>製 剤：レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「杏林」 処方箋医薬品^{注)}</p> <p>有効成分：レボセチリジン塩酸塩 該当しない</p> <p>注) 注意－医師等の処方箋により使用すること</p>
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),4)}
3. 貯法・保存条件	気密容器、室温保存
4. 薬剤取扱い上の注意点	
(1) 薬局での取り扱い上の留意点について	特になし
(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）	<p>VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、14. 適用上の注意の項を参照</p> <p>患者向医薬品ガイド：有り</p> <p>くすりのしおり：有り</p>
(3) 調剤時の留意点について	特になし
5. 承認条件等	該当しない
6. 包装	<p>分包：0.5g×100包</p> <p>バラ：100g</p>
7. 容器の材質	<p>[PTP 包装品]</p> <p>分包包装：アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートフィルム</p> <p>箱：紙</p> <p>[バラ包装品]</p> <p>アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネート袋</p> <p>箱：紙</p>

X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬	<p>同一成分薬：ザイザルシロップ 0.05%、ザイザル錠 5mg</p> <p>同 効 薬：ヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬（セチリジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、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、エバスチン、ベタボスチンベシル酸塩、デスロラタジン、ビラスチン など）</p>						
9. 国際誕生年月日	2001年 1月 3日（ドイツ）						
10. 製造販売承認年月日 及び承認番号	<p>製造販売承認年月日：2020年 2月17日</p> <p>承認番号：30200AMX00143000</p>						
11. 薬価基準収載年月日	2020年 6月19日						
12. 効能又は効果追加、 用法及び用量変更追 加等の年月日及びそ の内容	該当しない						
13. 再審査結果、再評価 結果公表年月日及び その内容	該当しない						
14. 再審査期間	該当しない						
15. 投薬期間制限医薬品 に関する情報	本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。						
16. 各種コード	<table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="480 1581 799 1677">HOT(9桁)番号</th> <th data-bbox="799 1581 1118 1677">厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード</th> <th data-bbox="1118 1581 1442 1677">レセプト 電算コード</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="480 1677 799 1776">128006701</td> <td data-bbox="799 1677 1118 1776">4490028R1040</td> <td data-bbox="1118 1677 1442 1776">622800601</td> </tr> </tbody> </table>	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	128006701	4490028R1040	622800601
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					
128006701	4490028R1040	622800601					
17. 保険給付上の注意	本剤は診療報酬上の後発医薬品である。						

XI. 文献

1. 引用文献	<ol style="list-style-type: none">1) 第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店, C-2553, 20162) 田中千賀子 他編: NEW 薬理学 改訂第7版, 南江堂, 160, 20173) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「杏林」の安定性試験に関する資料 (加速試験)4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「杏林」の安定性試験に関する資料 (長期保存試験)5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「杏林」の無包装状態での安定性に関する資料6) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「杏林」の溶出性に関する資料7) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: レボセチリジン塩酸塩 DS0.5% 「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
2. その他の参考文献	該当資料なし

XII. 参考資料

- | | |
|-----------------|--------|
| 1. 主な外国での発売状況 | 該当しない |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 該当資料なし |

XII. 備考

1. その他の関連資料

該当資料なし