2023年9月改訂（第3版）

日本標準商品分類番号：87449

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2018(2019年更新版)に準拠して作成

持続性選択H_1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ドライシロップ

レボセチリジン塩酸塩DS0.5%「杏林」

LEVOCETIRIZINE hydrochloride DS

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
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・販売開始年月日	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 販売開始年月日：2020年 6月19日
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://www.med.kyorin-rmd.com/

本IFは2023年9月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 －日本病院薬剤師会－

（2020 年 4 月改訂）

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、ＭＲ）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、ＩＦと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第２小委員会がＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第３小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、ＩＦ記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索の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ＩＦを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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ＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、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。ＩＦは日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、ＩＦを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目　次

Ⅰ. 概要に関する項目 …… 1
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的特性 …… 1
3. 製品の製剤学的特性 …… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
6. RMP の概要 …… 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）又は本質 …… 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 …… 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、定量法 …… 3

Ⅳ. 製剤に関する項目 …… 4
1. 剤形 …… 4
2. 製剤の組成 …… 4
3. 添付溶解液の組成及び容量 …… 4
4. 力価 …… 4
5. 混入する可能性のある夾雑物 …… 4
6. 製剤の各種条件下における安定性 …… 5
7. 調製法及び溶解後の安定性 …… 7
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 7
9. 溶出性 …… 7
10. 容器・包装 …… 8
11. 別途提供される資材類 …… 8
12. その他 …… 8

Ⅴ. 治療に関する項目 …… 9
1. 効能又は効果 …… 9
2. 効能又は効果に関連する注意 …… 9
3. 用法及び用量 …… 9
4. 用法及び用量に関連する注意 …… 9
5. 臨床成績 …… 10

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 …… 15
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 15
2. 薬理作用 …… 15

Ⅶ. 薬物動態に関する項目 …… 16
1. 血中濃度の推移 …… 16
2. 薬物速度論的パラメータ …… 17
3. 母集団（ポピュレーション）解析 …… 18
4. 吸収 …… 18
5. 分布 …… 18
6. 代謝 …… 19
7. 排泄 …… 19
8. トランスポーターに関する情報 …… 19
9. 透析等による除去率 …… 19
10. 特定の背景を有する患者 …… 20
11. その他 …… 21

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 …… 22
1. 警告内容とその理由 …… 22
2. 禁忌内容とその理由 …… 22
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 22
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 22
5. 重要な基本的注意とその理由 …… 22
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 …… 22
7. 相互作用 …… 23
8. 副作用 …… 24
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 …… 25
10. 過量投与 …… 25
11. 適用上の注意 …… 25
12. その他の注意 …… 25

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 …… 26
1. 薬理試験 …… 26
2. 毒性試験 …… 26

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 …… 27
1. 規制区分 …… 27
2. 有効期間 …… 27
3. 包装状態での貯法 …… 27
4. 取扱い上の注意 …… 27
5. 患者向け資材 …… 27
6. 同一成分・同効薬 …… 27
7. 国際誕生年月日 …… 27
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 …… 27
9. 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 …… 27
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 …… 28
11. 再審査期間 …… 28
12. 投薬期間制限に関する情報 …… 28
13. 各種コード …… 28
14. 保険給付上の注意 …… 28

Ⅺ. 文献 …… 29
1. 引用文献 …… 29
2. その他の参考文献 …… 30

Ⅻ. 参考資料 …… 31
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

ⅩⅢ. 備考 …… 32
1. 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 …… 32
2. その他の関連資料 …… 32

略 語 表

略語	略語内容
Al-P	アルカリホスファターゼ
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
BUN	血中尿素窒素
C_{max}	最高血中濃度
C_{min}	最小血中濃度
CL/f	見かけの全身クリアランス
CLcr	クレアチニンクリアランス
CLr	腎クリアランス
CYP	チトクロム P450
γ-GTP	γ-グルタミルトランスフェラーゼ
LDH	乳酸脱水素酵素
S.D.	標準偏差
$t_{1/2}$	消失半減期
T_{max}	最高血中濃度到達時間

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DS0.5%「杏林」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月に薬価収載した。

なお本剤は、後発医薬品として、キョーリン リメディオ株式会社、日本臓器製薬株式会社、株式会社陽進堂との合計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. 製品の治療学的特性

- 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り、セチリジンと同様に、持続性選択ヒスタミンH_1受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬である。[1)]

(「Ⅵ. 2. (1)作用部位・作用機序」の項参照)

- 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、血小板減少がある。

(「Ⅷ. 8. (1)重大な副作用と初期症状」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

- 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。
- オレンジ風味の香料を使用し、甘味料としてアセスルファムカリウム、スクラロースを使用している。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

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 Dry Syrup 0.5% “KYORIN”

(3) 名称の由来

「一般的名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づく〕

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）

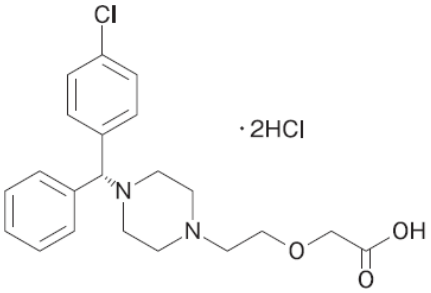
Levocetirizine Hydrochloride（JAN）

(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

化学構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{21}H_{25}ClN_2O_3$・2HCl

分子量：461.81

5. 化学名（命名法）又は本質

化学名：2-(2-{4-[(*R*)-(4-Chlorophenyl)phenylmethyl]piperazin-1-yl}ethoxy)acetic acid dihydrochloride（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

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、定量法

- 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

- 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

ドライシロップ剤

(2) 製剤の外観及び性状

性状：橙色の粉末を含む粒状のドライシロップ剤である。

(3) 識別コード

識別コード	KRM303
記載場所	分包フィルム

(4) 製剤の物性

該当しない

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

有効成分 （1g 中）	レボセチリジン塩酸塩　5mg
添加剤	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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

1）**加速試験** [2)]

［保存条件］

40℃±2℃、75%RH±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	橙色の粉末を含む粒状のドライシロップ剤
確認試験	液体クロマトグラフィー：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 上記以外の個々の類縁物質：0.2%以下 類縁物質の合計：1.5%以下
製剤均一性 （分包包装のみ）	含量均一性試験：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%

［結果］

分包包装

試験項目	開始時	1 ヵ月	3 ヵ月	6 ヵ月
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
定量法(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

バラ包装

試験項目	開始時	1 ヵ月	3 ヵ月	6 ヵ月
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
定量法(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

2）**長期保存試験** [3)]

［保存条件］

25℃±2℃、60%RH±5%RH

［試験検体］［試験項目及び規格］

加速試験 参照

［結果］

分包包装

試験項目	開始時	3ヵ月	6ヵ月	9ヵ月	12ヵ月	18ヵ月	24ヵ月
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
定量法(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ヵ月	6ヵ月	9ヵ月	12ヵ月	18ヵ月	24ヵ月
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
定量法(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

3）**無包装状態での安定性** [4)]

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ヵ月、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 ［曝光量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	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。本剤の安定性に関する結果であり、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。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

9. 溶出性

溶出挙動における類似性 [5)]

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 薬食審査発 0229 第 10 号)に準じて試験を実施した。

<table>
<tr><td>標準製剤</td><td colspan="4">ザイザルシロップ 0.05%</td></tr>
<tr><td>試験方法</td><td colspan="4">日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)</td></tr>
<tr><td rowspan="5">試験条件</td><td colspan="4">試験液量：900mL　試験液の温度：37℃±0.5℃</td></tr>
<tr><td rowspan="4">回転数/試験液</td><td rowspan="4">50rpm</td><td>pH1.2</td><td>溶出試験第 1 液</td></tr>
<tr><td>pH6.5</td><td>薄めた McIlvaine の緩衝液</td></tr>
<tr><td>pH6.8</td><td>溶出試験第 2 液</td></tr>
<tr><td>水</td><td>水</td></tr>
</table>

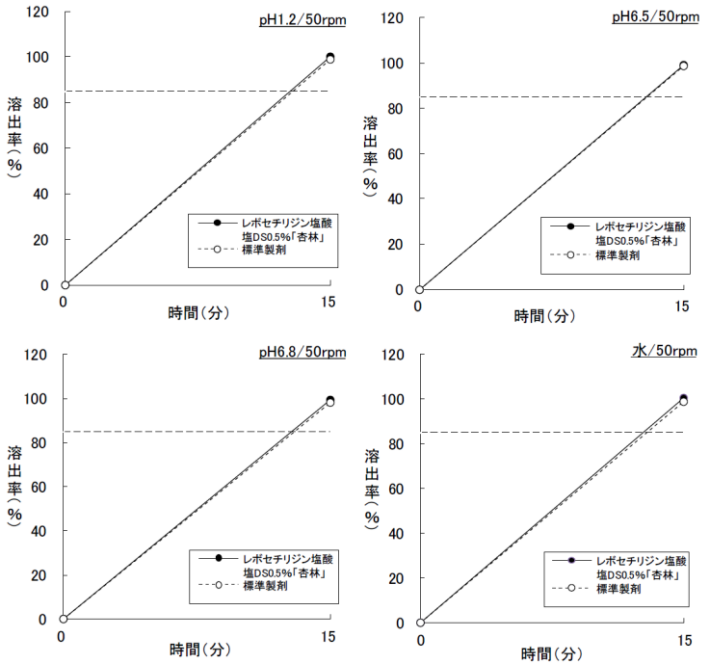
[判定基準]

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]

<table>
<tr><td rowspan="2">回転数</td><td rowspan="2">試験液</td><td rowspan="2">判定時点
(分)</td><td colspan="3">12 ベッセルの平均溶出率(%)</td><td rowspan="2">判定</td></tr>
<tr><td>レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」</td><td>標準製剤</td><td>差</td></tr>
<tr><td rowspan="4">50rpm</td><td>pH1.2</td><td>15</td><td>100.1</td><td>98.9</td><td>1.2</td><td>適合</td></tr>
<tr><td>pH6.5</td><td>15</td><td>99.0</td><td>98.8</td><td>0.2</td><td>適合</td></tr>
<tr><td>pH6.8</td><td>15</td><td>99.2</td><td>98.1</td><td>1.1</td><td>適合</td></tr>
<tr><td>水</td><td>15</td><td>100.2</td><td>98.7</td><td>1.5</td><td>適合</td></tr>
</table>

以上の結果より、すべての試験条件において溶出挙動の類似性の判定基準に適合したため、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。



10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

100 包［1 包 0.5g（分包）×100］
100g［アルミ袋］

(3) 予備容量

該当資料なし

(4) 容器の材質

〔分包包装〕
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
箱：紙
〔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
箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. 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

4.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. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6.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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7.用法及び用量に関連する注意

7.1 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。[2.2、9.2.1、9.2.2、16.6.1参照]

成人患者の腎機能に対応する用法及び用量の目安

	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。

7.2 高齢者では、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。[9.8参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.臨床成績

17.1.1 セチリジン塩酸塩の臨床試験

〈アレルギー性鼻炎〉

(1) 国内後期第Ⅱ相試験（二重盲検比較試験、成人）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回 2 週間投与した時、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は 53.8%（21/39 例）であった[6)]。

副作用発現頻度は 13.0%（6/46 例）であり、主な副作用は眠気 4.3%（2/46 例）であった。

(2) 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回 4 週間投与した時、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は 47.9%（45/94 例）であった[7)]。

副作用発現頻度は 5.5%（6/110 例）であり、主な副作用は眠気 3.6%（4/110 例）であった。

(3) 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、小児）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩ドライシロップ［2 歳以上 7 歳未満：1 回 0.2g（セチリジン塩酸塩として 2.5mg）を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 5mg）を 1 日 2 回］あるいはプラセボを 2 週間投与した。総合鼻症状スコア（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感）の変化量（解析対象 122 例）を表 17-1 に示した。その結果から、プラセボに対するセチリジン塩酸塩の優越性が検証された[8)]。

表 17-1 全治療評価期間における総合鼻症状スコア[注1)]の変化量

群	例数	ベースライン評価期間	全治療評価期間	変化量[注2)]	
		平均値（標準偏差）	平均値（標準偏差）	平均値（標準偏差）	調整済み平均値[注3)]（標準誤差）
セチリジン塩酸塩	122	6.66（1.26）	4.79（1.96）	1.87（1.79）	1.85（0.18）
プラセボ	117	6.84（1.52）	5.51（2.04）	1.33（1.79）	1.25（0.18）

セチリジン塩酸塩 vs プラセボ	点推定値[注3)]	95%信頼区間[注3)]	p 値
	0.60	［0.15～1.05］	p=0.0087

注 1）総合鼻症状スコアが 10 を超える患児は組入れから除外

注 2）変化量＝｛ベースライン評価期間（治験薬投与開始日の前 3 日間）－全治療評価期間｝

注 3）ベースライン評価期間スコア及び年齢層を共変量とした共分散分析により算出

副作用発現頻度は 9.8%（12/122 例）であり、主な副作用は ALT 増加 5.7%（7/122 例）、AST 増加 1.6%（2/122 例）であった。

(4) 国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験、小児）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩ドライシロップ［2 歳以上 7 歳未満：1 回 0.2g（セチリジン塩酸塩として 2.5mg）を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 5mg）

を1日2回］を12週間投与した。総合鼻症状スコアのベースライン評価期間からの変化量の推移（平均値±標準偏差、解析対象36例）は、投与4週時：2.81±2.62、投与8週時：3.66±2.75、投与12週時：3.40±3.01であり、効果は投与終了時まで減弱することなく、安定していた[9]。
副作用発現頻度は2.8%（1/36例）であり、主な副作用は白血球数増加1例であった。

〈蕁麻疹〉

（5）国内後期第Ⅱ相試験（二重盲検比較試験、成人）

セチリジン塩酸塩錠10mgを1日1回投与した時、投与3日後、投与1週後及び投与2週後における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、47.9%（34/71例）、64.9%（48/74例）及び71.6%（48/67例）であった[10]。
副作用発現頻度は10.8%（9/83例）であり、主な副作用は眠気4.8%（4/83例）であった。

（6）国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

セチリジン塩酸塩錠10mgを1日1回投与した時、投与3日後、投与1週後及び投与2週後における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、56.4%（53/94例）、71.3%（77/108例）及び82.2%（88/107例）であった[11]。
副作用発現頻度は15.9%（21/132例）であり、主な副作用は眠気10.6%（14/132例）であった。

（7）国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験、成人）

セチリジン塩酸塩錠10mgを1日1回投与した時、投与3日後、投与1週後及び投与2週後における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、46.7%（14/30例）、53.2%（33/62例）及び72.9%（43/59例）であった[12]。
副作用発現頻度は4.4%（3/68例）であり、主な副作用は眠気2.9%（2/68例）であった。

〈湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症〉

（8）国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験、成人）

セチリジン塩酸塩錠10mgを1日1回2週間投与した時、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は、湿疹・皮膚炎群で65.9%（81/123例）、痒疹群で57.7%（30/52例）、皮膚そう痒症で74.5%（41/55例）であった[13]。
副作用発現頻度は全体で5.5%（13/236例）であり、主な副作用は眠気3.4%（8/236例）であった。

〈蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒〉

（9）国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、小児）

アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験において、セチリジン塩酸塩ドライシロップ［3歳以上7歳未満：1回0.2g（セチリジン塩酸塩として2.5mg）を1日2回、7歳以上15歳未満：1回0.4g（セチリジン塩酸塩として5mg）を1日2回］あるいはケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ［3歳以上7歳未満：1回0.6g（ケトチフェンとして0.6mg）を1日2回、7歳以上15歳未満：1回1g（ケトチフェンとして1mg）を1日2回］を2週間投与した。そう痒の重症度の変化量（解析対象134例）を表17-2に示した。その結果から、ケトチフェンフマル酸塩に対するセチリジン塩酸塩の非劣性が検証された[14]。

表17-2 全治療評価期間におけるそう痒の重症度の変化量

群	例数[注1]	ベースライン評価期間	全治療評価期間	変化量[注2]	
		平均値（標準偏差）	平均値（標準偏差）	平均値（標準偏差）	調整済み平均値[注3]（標準誤差）
セチリジン塩酸塩	134	2.41（0.52）	1.96（0.64）	0.45（0.67）	0.43（0.05）
ケトチフェンフマル酸塩	126	2.40（0.52）	1.88（0.63）	0.52（0.62）	0.51（0.05）

セチリジン塩酸塩 vs ケトチフェンフマル酸塩	点推定値[注3]	95%信頼区間[注3]
	-0.08	［-0.22～0.06］

注1）変化量が算出可能な被験者数

注 2）変化量＝｛ベースライン評価期間（治験薬投与開始日の前 3 日間）－全治療評価期間｝
注 3）ベースライン評価期間のそう痒の重症度及び年齢層を共変量とした共分散分析により算出
副作用発現頻度は 2.7%（4/148 例）であり、主な副作用は傾眠 1.4%（2/148 例）であった。

（10）国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験、小児）

蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症を対象とした試験において、セチリジン塩酸塩ドライシロップ［2 歳以上 7 歳未満：1 回 0.2g（セチリジン塩酸塩として 2.5mg）を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 5mg）を 1 日 2 回］を 12 週間投与した。そう痒の重症度の治療期開始日からの変化量の推移（平均値±標準偏差）は、投与 4 週時：0.83±0.79、投与 8 週時：0.97±0.90、投与 12 週時：1.03±0.90 であり、効果は投与終了時まで減弱することなく、安定していた[15]。
副作用発現頻度は 1.4%（1/73 例）であり、傾眠 1 例であった。

17.1.2 レボセチリジン塩酸塩の臨床試験

〈アレルギー性鼻炎、皮膚疾患に伴うそう痒〉

（1）国内第Ⅲ相試験（非対照非盲検試験、小児）

生後 6 ヵ月以上 2 歳未満のアレルギー性鼻炎もしくは皮膚疾患に伴うそう痒を有する小児を対象として、レボセチリジン塩酸塩シロップ 1.25mg を 6 ヵ月以上 1 歳未満の小児では 1 日 1 回、1 歳以上 2 歳未満の小児では 1 日 2 回、2 週間投与した。
アレルギー性鼻炎の症状について医師が評価した全般改善度において、改善を示した被験者の割合（「中等度改善」以上の症例/総症例）は、75%（15/20 例）であった。
皮膚疾患に伴うそう痒の症状について医師が評価した全般改善度において、改善を示した被験者の割合（「中等度改善」以上の症例/総症例）は、73%（29/40 例）であった。また、そう痒の重症度の治療期開始日からの変化量（平均値±標準偏差）は、投与 1 週時：0.7±0.85、投与 2 週時：1.0±1.01 であった[16]。
副作用の発現は認められなかった（解析対象 60 例）。

〈アレルギー性鼻炎〉

（2）海外第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

季節性アレルギー性鼻炎患者を対象として、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群とセチリジン塩酸塩錠 10mg 群の臨床的同等性を検討した。主要評価項目である 4 症状（くしゃみ発作、鼻汁、鼻のそう痒及び眼のそう痒）の合計スコアの調整済み平均値の差は-0.12 であり、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群とセチリジン塩酸塩錠 10mg 群は臨床的に同等であることが示された。また、両剤はプラセボ群に比較して有意に 4 症状の合計スコアを改善した[17]。

表 17-3 4 症状の合計スコアによる同等性分析（Per Protocol 解析集団）

期間	投与群	症例数	平均値	調整済み平均値	調整済み平均値の差[注)]（90%CI）
投与前	レボセチリジン 5mg	281	7.91	－	－
	セチリジン 10mg	278	7.81		
全治療期間	レボセチリジン 5mg	280	4.03	4.00	-0.12
	セチリジン 10mg	278	3.87	3.89	(-0.41, 0.17)

4 症状の合計スコアの調整済み平均値の差の 90%CI がセチリジン 10mg の 4 症状の合計スコアの平均値から算出した 20%の範囲（-0.78, 0.78）に含まれた。
注）セチリジン 10mg の調整済み平均値からレボセチリジン 5mg の調整済み平均値を減じた。
主な副作用は、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群（解析対象 319 例）で傾眠 26 件、頭痛 9 件、口内乾燥 8 件であり、セチリジン塩酸塩錠 10mg 群（解析対象 318 例）で傾眠 20 件、頭痛 11 件、口内乾燥 6 件であった。

（3）海外第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

季節性アレルギー性鼻炎患者を対象として、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg を 1 日 1 回、2 週間投与した時、季節性アレルギー性鼻炎患者に対し、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群はプラセボ群に比し主要評価項目とした 4 症状（くしゃみ発作、鼻汁、鼻のそう痒及び眼のそう痒）の合計スコアを有意に改善した[18]。

表 17-4 4 症状の合計スコアの平均値

投与群	症例数	投与前	全治療期間 調整済み平均値	p 値[注)]
プラセボ	117	8.50	6.09	0.003
レボセチリジン 5mg	118	8.40	5.20	

注）共分散分析（共変量：投与群、投与前値、施設）

主な副作用は、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群（解析対象 119 例）で傾眠 6 件、頭痛 5 件であった。

（4）海外第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg を 1 日 1 回、6 週間投与した時、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群はプラセボ群に比し主要評価項目とした 4 症状（くしゃみ発作、鼻汁、鼻のそう痒及び眼のそう痒）の合計スコアを有意に改善した[19)、20)]。

表 17-5 4 症状の合計スコアの平均値

投与群	症例数	投与前	全治療期間 調整済み平均値	p 値[注)]
プラセボ	142	7.44	5.10	<0.001
レボセチリジン 5mg	150	7.69	3.93	

注）共分散分析（共変量：投与群、投与前値、施設）

主な副作用は、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群（解析対象 150 例）で傾眠 8 件、頭痛 6 件、口内乾燥 6 件であった。

〈蕁麻疹〉

（5）海外第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

慢性特発性蕁麻疹患者を対象として、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg を 1 日 1 回、4 週間投与した時、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群はプラセボ群に比し主要評価項目としたそう痒重症度スコアを有意に改善した[21)、22)]。

表 17-6 そう痒重症度スコアの平均値

投与群	症例数	投与前	全治療期間 調整済み平均値	p 値[注)]
プラセボ	82	2.06	1.56	<0.001
レボセチリジン 5mg	80	2.07	0.94	

注）共分散分析（共変量：投与群、投与前値、施設）

副作用発現頻度はレボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群で 18.5%（15/81 例）であり、主な副作用は疲労 9.9%（8/81 例）、頭痛 6.2%（5/81 例）であった。

2）安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

17.3. その他

17.3.1 眠気に対する影響（小児）

国内4つの小児臨床試験の併合解析の結果、セチリジン塩酸塩の眠気の発現率は1.0%（5/480例）と低かった[19、14)、15)、23)]。小児通年性アレルギー性鼻炎に対するプラセボを対照とした二重盲検比較試験の結果、セチリジン塩酸塩の眠気の発現率は1.0%未満（1/122例）であり、プラセボ（0/117例）と同程度であった[8)]。

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

第 2 世代 H_1 受容体拮抗薬：
アゼラスチン塩酸塩、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、オロパタジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、デスロラタジン、ビラスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、メキタジン、ルパタジンフマル酸塩、ロラタジン
注意：関連のある化合物の効能・効果等は，最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

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り、セチリジンと同様に、持続性選択ヒスタミン H_1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬である[1)]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用

ヒスタミン H_1 受容体に選択的に結合することにより、ヒスタミンの作用を阻害する。ヒスタミン H_1 受容体に対する親和性はセチリジンよりも約 2 倍高い。ヒスタミン H_2、ヒスタミン H_3、アドレナリン、ドパミン、アセチルコリン、セロトニンの各受容体に対する親和性は低い（ヒト、ラット、モルモット）[24)、25)]。摘出臓器（モルモット気管）のヒスタミン反応を濃度依存的に抑制した[26)]。また、ヒスタミン誘発皮膚反応における膨疹及び発赤抑制作用は投与後 1 時間から認められ、投与後 32 時間まで持続した（ヒト）[27)]。

18.3 好酸球に対する作用

In vitro において、エオタキシン刺激による好酸球の血管内皮細胞間隙遊走を抑制した（ヒト）[28)]。

18.4 細胞接着分子産生抑制作用

花粉抗原刺激による皮膚血管内皮細胞からの VCAM-1 産生を抑制した（ヒト）[29)]。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男性 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg（シロップ）を空腹時単回経口投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は投与後 0.75 時間には最高血漿中濃度 203.3ng/mL に到達した。血漿中濃度の消失半減期は約 7.9 時間であった。セチリジン塩酸塩 10mg（ドライシロップ）を空腹時単回経口投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は投与後 1 時間には最高血漿中濃度 196.5ng/mL に到達し、血漿中濃度の消失半減期は約 7.9 時間であった [30]。レボセチリジン塩酸塩（シロップ）はセチリジン塩酸塩（ドライシロップ）の半量で同様の血漿中レボセチリジン濃度が得られ、血漿中レボセチリジンの Cmax 及び AUC_{0-48} は同等であった。

表 16-1 レボセチリジンの薬物動態パラメータ

投与薬剤	投与量	tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)
レボセチリジン（シロップ）	5mg	0.75 (0.50-1.50)	203.3±42.49	7.91±1.00	1844.7±317.56
セチリジン（ドライシロップ）	10mg	1.00 (0.50-1.50)	196.5±31.31	7.85±1.00	1737.1±278.99

20 例、平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

健康成人男性 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg（錠剤）を空腹時単回経口投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は投与後 1 時間には最高血漿中濃度 232.6ng/mL に到達した。血漿中濃度の消失半減期は約 7.3 時間であった。また、10mg を単回経口投与した時、投与量増量に伴う Cmax の上昇及び AUC の増加が認められた。セチリジン塩酸塩 10mg（錠剤）を空腹時単回経口投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は投与後 1 時間には最高血漿中濃度 228.3ng/mL に到達し、血漿中濃度の消失半減期は約 7.3 時間であった [31)、32)]。

レボセチリジン塩酸塩（錠剤）はセチリジン塩酸塩（錠剤）の半量で同様の血漿中レボセチリジン濃度が得られ、血漿中レボセチリジンの Cmax 及び AUC_{0-48} は同等であった。

表 16-2 レボセチリジンの薬物動態パラメータ

投与薬剤	投与量	tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)
レボセチリジン（錠剤）	5mg	1.00 (0.25-4.00)	232.60±64.49	7.33±0.98	1814.06±392.49
	10mg	0.75 (0.50-2.00)	480.00±104.01	7.57±0.89	3546.51±712.14
セチリジン（錠剤）	10mg	1.00 (0.50-2.00)	228.30±40.67	7.32±0.78	1875.37±377.94

20 例、平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

16.1.2 反復投与

健康成人 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を 1 日 1 回 8 日間空腹時反復経口投与した時、血漿中レボセチリジン塩酸塩濃度は投与開始後 2 日までに定常状態に到達し、AUC_{0-24} について算出した累積係数は 1.08 であった（外国人データ）[33)]。

生物学的同等性試験 [34)]

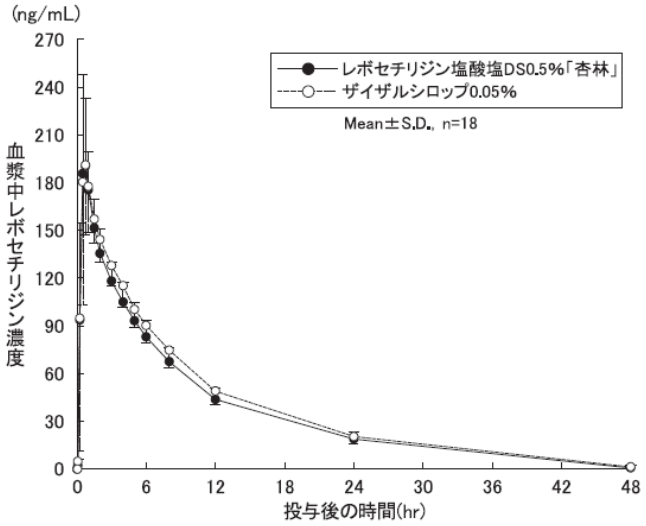
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」とザイザルシロップ 0.05%をクロスオーバー法により、レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」は 1g、ザイザルシロップ 0.05%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)～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。

薬物動態パラメータ

	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
ザイザルシロップ 0.05%	1845.5±288.3	212.1±42.8	0.8±0.4	8.4±0.7

平均値±標準偏差、n＝18



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

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) **食事の影響**

「Ⅶ. 4. 吸収」の項参照

2) **併用薬の影響**

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

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) 消失速度定数
該当資料なし

(4) クリアランス
該当資料なし

(5) 分布容積

16.3.1 分布容積
健康成人男性 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を空腹時単回経口投与した時、レボセチリジンの見かけの分布容積は 25.14L であった[32)、35)]。

(6) その他
該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法
該当資料なし

(2) パラメータ変動要因
該当資料なし

4. 吸収

16.2 吸収
16.2.1 食事の影響
健康成人 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を食後（高脂肪食）又は空腹時に単回経口投与した時、空腹時投与と比べ、食後投与の血漿中レボセチリジン塩酸塩の tmax は約 1.3 時間遅延し、Cmax が約 35%低下したが、AUC に顕著な差はみられなかった（外国人データ）[33)]。

5. 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. 6. (5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性
「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照

(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

(6) 血漿蛋白結合率

16.3.2 血漿蛋白結合率
In vitro での［^{14}C］-レボセチリジン（0.2～5μg/mL）のヒト血漿蛋白結合率は約 92%であった[36)]。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

16.4.1 代謝酵素

レボセチリジンの代謝経路はフェニル基の水酸化、*N*-及び *O*-脱アルキル化並びにタウリン抱合体の生成である。*In vitro* において、レボセチリジンは主に CYP3A4 で脱アルキル体に、複数の CYP 分子種（未同定）でフェニル基の水酸化体に代謝された[37)、38)]。

16.4.2 代謝酵素阻害・誘導

In vitro において、レボセチリジンは臨床用量の Cmax 付近の濃度で CYP1A2、2C9、2C19、2D6、2E1 及び 3A4 を阻害せず、UGT1A 並びに CYP1A2、2C9 及び 3A4 を誘導しなかった[39)]。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

「Ⅶ. 6. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照

(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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

16.5.1 健康成人男性 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg 及び 10mg を空腹時単回経口投与した時の見かけの全身クリアランスは、それぞれ 2.435±0.567L/hr 及び 2.482±0.582L/hr であった[32)、35)]。

16.5.2 健康成人 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を空腹時単回経口投与した時の投与後 48 時間までのレボセチリジン塩酸塩の累積尿中排泄率は約 73%であった（外国人データ）[33)]。

16.5.3 健康成人男性 4 例に［^{14}C］-レボセチリジン塩酸塩溶液 5mg を空腹時単回経口投与した時の投与後 168 時間までの尿及び糞中の放射能回収率はそれぞれ 85.4%及び 12.9%であった[40)]。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

「Ⅷ. 10. 過量投与」の項参照

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能低下者

クレアチニンクリアランスが 45～90mL/min（軽度）、10～45mL/min（中等度）の腎機能低下者、及び血液透析を必要とする重度の腎機能低下者にレボセチリジン塩酸塩 5mg を単回経口投与した時、腎機能正常者に比べ、腎機能低下者では、レボセチリジン塩酸塩の $AUC_{0-\infty}$は約 1.8～5.7 倍増加し、$t_{1/2}$は約 1.4～3.9 倍に延長した（外国人データ）[41]。[2.2、7.1、9.2.1、9.2.2 参照]

表 16-4 腎機能低下者におけるレボセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

腎機能	正常 (6 例)	軽度低下 (6 例)	中等度低下 (6 例)	重度低下 (5 例)
CLcr (mL/min/1.73m^2)	98.7±7.2	62.4±9.8	26.4±10.3	0
Cmax (ng/mL)	220.5±68.78	295.2±60.76	320.0±67.06	358.0±90.64
$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)	2212.5±282.60	3884.4±769.85	8290.9±3653.54	12579±3518.4
$t_{1/2}$(hr)	10.4±2.76	14.9±3.12	25.2±9.73	41.0±15.54
CLr (mL/min/1.73m^2)	25.6±4.64	14.3±5.13	4.2±2.33	－
CL/f(L/hr)	2.29±0.27	1.33±0.25	0.68±0.22	0.43±0.15

平均値±標準偏差

CLcr：クレアチニンクリアランス

CLr：腎クリアランス

CL/f：全身クリアランス

16.6.2 肝障害のある患者

肝機能低下者におけるレボセチリジン塩酸塩の薬物動態の検討は行われていない。

なお、原発性胆汁性肝硬変患者にセチリジン塩酸塩 10mg を単回経口投与した場合、肝機能正常者に比べ、血清中濃度消失半減期の延長、Cmax の上昇、AUC の増大が認められた（外国人データ）[42)～44)]。[9.3.1 参照]

表 16-5 肝障害のある患者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

被験者	tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	AUC (mg.hr/L)
健康成人（14 例）	1.0±0.5	384±103	7.4±1.6	3.3±0.9
原発性胆汁性肝硬変患者（6 例）	1.0±0.4	498±118	13.8±1.8	6.4±1.6

平均値±標準偏差

16.6.3 高齢者

高齢者（65～74 歳）9 例にレボセチリジン塩酸塩 30mg [注)] を 1 日 1 回 6 日間反復経口投与した時のレボセチリジン塩酸塩の全身クリアランスは、健康成人（21～60 歳）と比較して約 25%低かった（外国人データ）[45)]。[9.8 参照]

注）本剤の承認用量は、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、最高投与量は 1 日 10mg である。

表 16-6 高齢者におけるレボセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

被験者	tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)
健康成人（27 例）	0.58(0.58-2.08)	1635±268	6.92±1.10	13855±2340
高齢者（9 例）	1.08(0.58-2.08)	1596±287	8.92±1.71	20382±6025

平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

16.6.4 小児等

アレルギー性鼻炎もしくは皮膚疾患に伴うそう痒を有する小児（生後6ヵ月以上2歳未満）に、レボセチリジン塩酸塩1.25mgを生後6ヵ月以上1歳未満の小児には1日1回、1歳以上2歳未満の小児には1日2回投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は下記の通りであった[46]。

表16-7 小児におけるレボセチリジン濃度

被験者	Cmax（ng/mL）	Cmin（ng/mL）
生後6ヵ月以上1歳未満	216.1±81.7（29）	21.6±19.2（30）
1歳以上2歳未満	203.4±69.1（29）	53.8±25.8（29）

平均値±標準偏差（例数）

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2.禁忌（次の患者には投与しないこと）
2.1 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
2.2 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［7.1、9.2.1、16.6.1 参照］

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「Ⅴ．4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8.重要な基本的注意
〈効能共通〉
8.1 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。
8.2 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。
〈アレルギー性鼻炎〉
8.3 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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者
9.1.1 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。［11.1.2 参照］

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者
9.2.1 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
投与しないこと。高い血中濃度が持続するおそれがある。［2.2、7.1、16.6.1 参照］
9.2.2 腎障害のある患者（重度の腎障害のある患者を除く）
高い血中濃度が持続するおそれがある。［7.1、16.6.1 参照］

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 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。[16.6.2 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

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。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。セチリジン[注)] 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）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。

(7) 小児等

9.7 小児等

6ヵ月未満の乳児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。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。[7.2、16.6.3 参照]

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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)] 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)] 塩酸塩のクリアランスが 16%減少する。	機序は明らかではない。
リトナビル	セチリジン[注)] 塩酸塩との併用により、セチリジン[注)] 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)] 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。	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)] 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）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

11.副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 **ショック、アナフィラキシー**（いずれも頻度不明）

ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等）があらわれることがある。

11.1.2 **痙攣**（頻度不明）

［9.1.1 参照］

11.1.3 **肝機能障害**（0.6%）**、黄疸**（頻度不明）

AST、ALT、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。

11.1.4 **血小板減少**（頻度不明）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	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)]、不随意運動[注)]、意識消失[注)]、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)]、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍[注)]、心房細動）	
血液	好酸球増多[注)]	好中球減少、リンパ球増多[注)]、白血球増多、白血球減少、単球増多[注)]、血小板増加[注)]、血小板減少[注)]	
過敏症		発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、そう痒感、血管性浮腫	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 上昇、AST 上昇、総ビリルビン上昇	Al-P 上昇	
腎臓・泌尿器		尿蛋白注)、BUN 上昇、尿糖注)、ウロビリノーゲンの異常注)、頻尿、血尿注)	排尿困難、尿閉、遺尿注)
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）セチリジン塩酸塩でのみ認められている副作用。
副作用発現頻度についてはセチリジン塩酸塩の発現状況に基づき記載した。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12.臨床検査結果に及ぼす影響

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。

10. 過量投与

13.過量投与

13.1 症状

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。

13.2 処置

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。

11. 適用上の注意

設定されていない

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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 DS0.5%「杏林」　　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

有効期間：3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり
くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ザイザルシロップ 0.05%、ザイザル錠 5mg
同　効　薬：第 2 世代 H_1 受容体拮抗薬（アゼラスチン塩酸塩、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、オロパタジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、デスロラタジン、ビラスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、メキタジン、ルパタジンフマル酸塩、ロラタジン）

7. 国際誕生年月日

2001 年 1 月 3 日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」	2020 年 2 月 17 日	30200AMX00143000	2020 年 6 月 19 日	2020 年 6 月 19 日

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJ コード）	HOT（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
レボセチリジン塩酸塩 DS0.5%「杏林」	4490028R1040	4490028R1040	128006701	622800601

14. 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

1) 薬理試験の概要文（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.6.2）
2) 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）
3) 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）
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（無包装状態での安定性）
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」の溶出性に関する資料
6) 奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1994；37：754-779
7) 奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1995；38：116-136
8) 斎藤博久：臨床医薬. 2010；26：141-154
9) 斎藤博久ほか：臨床医薬. 2010；26：127-139
10) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2107-2129
11) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2131-2145
12) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2163-2173
13) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2147-2162
14) 中川秀己ほか：臨床医薬. 2010；26：155-167
15) 中川秀己ほか：臨床医薬. 2010；26：169-181
16) アレルギー性鼻炎又は皮膚疾患に伴うそう痒を有する患児を対象とした臨床試験（ザイザルシロップ 0.05%：2014 年 1 月 17 日承認、申請資料概要 2.7.6）
17) 季節性アレルギー性鼻炎を対象とした海外二重盲検比較試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.7.6.31）
18) 季節性アレルギー性鼻炎を対象とした海外二重盲検比較試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.7.6.32）
19) Potter PC, et al.：Allergy. 2003；58：893-899
20) 通年性アレルギー性鼻炎を対象とした海外二重盲検比較試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.7.6.35）
21) Kapp A, et al.：Int J Dermatol. 2006；45：469-474
22) 慢性特発性蕁麻疹を対象とした海外二重盲検比較試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.7.6.43）
23) 小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（ジルテックドライシロップ/錠：2009 年 4 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.6.3）
24) Gillard M, et al.：Mol Pharmacol. 2002；61：391-399
25) 副次的薬理試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.6.2.3）
26) Christophe B, et al.：Eur J Pharmacol. 2003；470：87-94
27) Devalia JL, et al.：Allergy. 2001；56：50-57
28) Thomson L, et al.：Clin Exp Allergy. 2002；32：1187-1192
29) 草花粉感受性アレルギー被験者を対象とした二重盲検比較試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.7.6.25）
30) Ino H, et al.：J Drug Assess. 2014；3：38-42
31) 井野比呂子ほか：臨床薬理. 2010；41：309-315
32) 日本人健康成人を対象とした単回投与試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.7.6.6）
33) 外国人健康成人を対象とした反復経口投与試験（ザイザル錠：2010 年 10 月 27 日承認、申請資料概要 2.7.6.1）

34) 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
35) 薬物動態パラメータの要約（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.5）
36) 蛋白結合（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2）
37) 推定代謝経路（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.6.4.5）
38) 代謝酵素の同定（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.6.4.5）
39) 肝代謝酵素に及ぼす影響（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2）
40) Benedetti MS, et al.：Eur J Clin Pharmacol. 2001；57：571-582
41) 腎機能が低下した成人における検討（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2）
42) 肝機能が低下した成人における検討（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2）
43) Simons, F. E. R. et al.：J Clin Pharmacol. 1993；33：949-954
44) Matzke, G. R. et al.：Ann Allergy. 1987；59：25-30
45) 高齢者を対象とした反復経口投与試験（ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2）
46) 小児患者における薬物動態（ザイザルシロップ0.05%：2014年1月17日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
47) 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」の経管投与試験に関する資料

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

XIII. 備考

1. 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。

掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関するQ&Aについて（その3)」
令和元年9月6日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡

(1) 粉砕

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

〈レボセチリジン塩酸塩DS0.5%「杏林」〉[47)]

［試験方法］

崩壊懸濁試験

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に1包内容量をそのまま入れてピストンを戻しディスペンサーに55℃の温湯20mLを吸い取り、筒先の蓋をして5分間自然放置する。5分後にディスペンサーを手で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、さらに5分間放置後、同様の操作を行う。15分後まで放置しても崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止する。

通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をサイズ8Fr.(フレンチ)の経管チューブに約2～3mL/秒の速度で注入し、通過性を観察する。懸濁液を注入した後に適量の水を同じ注入器で吸い取り、注入してチューブ内を洗う時、注入器及びチューブ内に薬が残存していなければ通過性に問題なしとする。

［結果］

崩壊懸濁試験	通過性試験
5分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし