

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製剤

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」
レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

レボセチリジン塩酸塩シロップ

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE

Tablets, OD Tablets, Syrup [SAWAI]

剤形	錠5mg：割線入りフィルムコーティング錠 OD錠5mg：割線入り素錠(口腔内崩壊錠) シロップ0.05%：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	錠5mg：1錠中レボセチリジン塩酸塩5mg含有 OD錠5mg：1錠中レボセチリジン塩酸塩5mg含有 シロップ0.05%：1mL中レボセチリジン塩酸塩0.5mg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 薬価基準収載年月日 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：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2025年12月改訂(錠5mg/OD錠5mg)、2023年9月改訂(シロップ0.05%)の電子添文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―

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。

(2020年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	40
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	40
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	40
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	40
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	40
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	40
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	40
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	41
1. 販売名	3	8. 副作用	42
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	43
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	43
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	43
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	44
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	45
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	45
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	45
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	46
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	1. 規制区分	46
IV. 製剤に関する項目	6	2. 有効期間	46
1. 剤形	6	3. 包装状態での貯法	46
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	46
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	5. 患者向け資材	46
4. 力価	7	6. 同一成分・同効薬	46
5. 混入する可能性のある夾雑物	8	7. 国際誕生年月日	47
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	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	47
7. 調製法及び溶解後の安定性	16	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	47
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	16	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	47
9. 溶出性	16	11. 再審査期間	47
10. 容器・包装	18	12. 投薬期間制限に関する情報	47
11. 別途提供される資材類	19	13. 各種コード	47
12. その他	19	14. 保険給付上の注意	47
V. 治療に関する項目	20	XI. 文献	48
1. 効能又は効果	20	1. 引用文献	48
2. 効能又は効果に関連する注意	20	2. その他の参考文献	49
3. 用法及び用量	20	XII. 参考資料	50
4. 用法及び用量に関連する注意	21	1. 主な外国での発売状況	50
5. 臨床成績	21	2. 海外における臨床支援情報	50
VI. 薬効薬理に関する項目	28	XIII. 備考	51
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	28	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	51
2. 薬理作用	28	2. その他の関連資料	53
VII. 薬物動態に関する項目	29		
1. 血中濃度の推移	29		
2. 薬物速度論的パラメータ	35		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	35		
4. 吸収	36		
5. 分布	36		
6. 代謝	36		
7. 排泄	37		
8. トランスポーターに関する情報	37		
9. 透析等による除去率	37		
10. 特定の背景を有する患者	37		
11. その他	39		

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錠 5 mg / OD錠 5 mg / シロップ 0.05%「サワイ」は、レボセチリジン塩酸塩を含有するアレルギー性疾患治療剤である。

レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」は、後発医薬品として、沢井製薬株式会社、共創未来ファーマ株式会社の計 2 社が共同開発を実施した。下記通知に基づき、製造方法並びに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実施のうえ、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。

レボセチリジン塩酸塩 OD錠 5 mg「サワイ」は、後発医薬品として、下記通知に基づき、沢井製薬株式会社が製造方法並びに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実施し、承認を得て上市に至った。

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「サワイ」は、後発医薬品として、沢井製薬株式会社、共和薬品工業株式会社、東亜薬品株式会社、東和薬品株式会社の計 4 社で共同開発を実施した。下記通知に基づき、製造方法並びに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実施のうえ、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。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2020年2月
上市	2020年6月

2. 製品の治療学的特性

1) 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 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬である。(VI. -2. 参照)

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、血小板減少が報告されている。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

「IV. 製剤に関する項目」及び沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」
<https://med.sawai.co.jp/> 参照

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

(2026年4月1日時点)

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

I. 概要に関する項目

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錠 5mg「サワイ」
レボセチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

2) 洋名

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets, OD Tablets [SAWAI]
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Syrup [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

レボセチリジン塩酸塩(JAN)

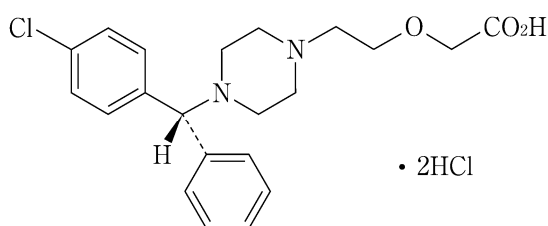
2) 洋名(命名法)

Levocetirizine Hydrochloride (JAN)
levocetirizine (INN)

3) ステム (stem)

–izine : diphenylmethyl piperazine derivatives

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)又は本質

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

Ⅱ. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号
- 特になし

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
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。
 - 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
 - 3) 塩化物の定性反応
 - <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

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」 : 割線入りフィルムコーティング錠
- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」 : 割線入り素錠(口腔内崩壊錠)
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」: シロップ剤

2) 製剤の外観及び性状

品 名	レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」	レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
外 形		
性 状	白色	白色～微黄色
直径(mm)	8.1×4.6	7.5
厚さ(mm)	3.3	3.8
重量(mg)	約103	約160

- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
芳香なし、添加剤由来の甘みを有する

品 名	レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
性 状	無色澄明の液

香料由来の特有の香り(フルーツ)、添加剤由来の甘みを有する

3) 識別コード

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
表示部位：錠剤本体(両面)
表示内容：レボセチリジン 5 サワイ
- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
表示部位：錠剤本体(両面)
表示内容：レボセチリジン OD 5 サワイ
- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
該当しない

4) 製剤の物性

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。
溶出性：日局一般試験法 溶出試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

●レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

摩損度：日本薬局方 参考情報 錠剤の摩損度試験法により試験を行う。(25rpm、4 分間)
0.14%

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

pH：4.7～5.3

比重(20度、20度)：約1.157

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

品 名	レボセチリジン塩酸塩 錠5mg「サワイ」	レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	レボセチリジン塩酸塩 5mg	
添加剤	カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース	クロスポビドン、結晶セルロース、 β -シクロデキストリン、スクラロース、炭酸Mg、フマル酸ステアリルNa、D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸Mg

品 名	レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
有効成分 [1mL中]	レボセチリジン塩酸塩 0.5mg
添加剤	還元麦芽糖水アメ、グリセリン、酢酸、酢酸Na、サッカリンNa、トコフェロール、バニリン、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸メチル、香料

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

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

IV. 製剤に関する項目

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……………

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」

1) 加速試験¹⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。
その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

PTP： [PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミニウム箔
[ピロー]アルミニウム袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の楕円形の割線入りフィルム コーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.0	100.4

※：表示量に対する含有率(%), 平均値

2) 無包装下の安定性試験²⁾

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T1S3112	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	25°C/60%RH、D65ランプ(2000lx)、開放シャーレ

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・硬度*(5錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・溶出試験・定量試験†	1回

*：本製剤の未設定規格のため参考値(長径及び短径に並行に荷重をかけて測定)

†：イニシャルのみ繰り返し3回の平均値

結果

試験項目 保存条件・期間		性状	硬度(N)		純度試験 (類縁物質)	溶出試験	定量試験※
			長径	短径			
イニシャル		(a)	123	108	適合	適合	100.0
温度(3ヵ月)		変化なし	変化なし 114	変化なし 105	変化なし	変化なし	変化なし 100.4
湿度	1ヵ月	変化なし	変化あり (規格内) 73	変化あり (規格内) 59	変化なし	変化なし	変化なし 98.1
	3ヵ月	変化なし	変化あり (規格内) 70	変化あり (規格内) 60	変化なし	変化なし	変化なし 100.2
室温	1ヵ月	変化なし	変化なし 93	変化なし 78	変化なし	変化なし	変化なし 98.1
	3ヵ月	変化なし	変化なし 90	変化あり (規格内) 75	変化なし	変化なし	変化なし 100.3
光(120万lx・hr)		変化なし	変化なし 95	変化なし 81	変化なし	変化なし	変化なし 99.2

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：白色の楕円形の割線入りフィルムコーティング錠

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験³⁾

目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T1S3112	室温	25℃/60%RH、遮光

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・硬度*(5錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・溶出試験・定量試験†	1回

*：本製剤の未設定規格のため参考値(長径及び短径に並行に荷重をかけて測定)

†：イニシャルのみ繰返し3回の平均値

IV. 製剤に関する項目

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度 (N)		純度試験 (類縁物質)	溶出試験	定量試験※
		長径	短径			
イニシャル	(a)	123	108	適合	適合	100.0
室温 (6 ヶ月)	変化なし	変化なし 112	変化なし 96	変化なし	変化なし	変化なし 100.7

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：白色の楕円形の割線入りフィルムコーティング錠

4) 分割後の安定性試験⁴⁾

目的

本製剤の分割後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を割線に沿って二分割*し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

*：分割操作は「錠剤ハサミお薬チョッキン」を使用

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T1S3112	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	25°C/60%RH、D65ランプ(2000lx)、開放シャーレ

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状 [†] ・純度試験(類縁物質)・定量試験 [‡] ・含量均一性試験	1回

†：分割面は未設定規格のため参考として記載

‡：イニシャルのみ繰返し3回の平均値

結果

試験項目 保存条件・期間		性状		純度試験 (類縁物質)	定量試験※	含量均一性 試験
		表面	分割面			
イニシャル		白色	白色	適合	100.0	適合
室温 (3 ヶ月)		変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 100.2	—
光	60万lx・hr	変化なし	帯黄白色	変化なし	変化なし 97.6	—
	120万lx・hr	変化なし	帯黄白色	変化なし	変化なし 97.3	—

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

—：実施なし

●レボセチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」

1) 長期保存試験⁵⁾

本製剤の安定性を確認するため、長期保存試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。
その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミニウム箔
[ピロー]アルミニウム袋、乾燥剤

	イニシャル	25°C60%RH・遮光 30ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.0	98.2

※：表示量に対する含有率(%), 平均値

2) 無包装下の安定性試験⁶⁾

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T2SB608	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx) + 近紫外蛍光ランプ(10W/m ²) †、開放シャーレ

†：性状・硬度・崩壊試験・溶出試験はD65ランプ(1000lx)を使用

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・硬度*(5錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・崩壊試験・溶出試験	1回
定量試験	3回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

(割線が錠剤硬度計の加圧板と平行方向になるように錠剤を置いて測定)

結果

試験項目 保存条件・期間		性状	硬度(N)	純度試験 (類縁物質)	崩壊試験	溶出試験	定量試験※
イニシャル		(a)	46	適合	適合	適合	100.0
温度	1ヵ月	変化あり (規格内) (b)	変化なし 52	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 98.1
	3ヵ月	変化あり (規格内) (b)	変化なし 47	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 97.5

IV. 製剤に関する項目

試験項目 保存条件・期間		性状	硬度(N)	純度試験 (類縁物質)	崩壊試験	溶出試験	定量試験※
湿度	1ヵ月	変化なし	変化あり (規格内) 24	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.0
	3ヵ月	変化なし	変化あり (規格内) 23	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 98.7
室温	1ヵ月	変化なし	変化なし 33	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 98.6
	3ヵ月	変化なし	変化なし 33	変化あり (規格外)	変化なし	変化なし	変化なし 98.0
光*	60万lx・hr、 100W・hr/m ²	変化あり (規格内) (c)	変化あり (規格内) 30	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 98.3
	120万lx・hr、 200W・hr/m ²	変化あり (規格内) (c)	変化あり (規格内) 29	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 97.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)、平均値

*：D65ランプ使用の場合はそれぞれ総照射量60万lx・hr及び120万lx・hr

(a)：白色の割線入り口腔内崩壊錠

(b)：白色の割線入り口腔内崩壊錠、褐色～灰色の斑点が1錠あたり1、2個程度、2錠に1錠の頻度でみられた

(c)：帯黄白色の割線入り口腔内崩壊錠

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁷⁾

目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T2SB608	室温	25℃/60%RH、遮光
	光	25℃/60%RH、D65ランプ(10000lx)

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・硬度*(5錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・崩壊試験・溶出試験	1回
定量試験	3回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

(割線が錠剤硬度計の加圧板と平行方向になるように錠剤を置いて測定)

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(N)	純度試験 (類縁物質)	崩壊試験	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	46	適合	適合	適合	100.0
室温(6ヵ月)	変化なし	変化なし 38	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 98.5
光(120万lx・hr)	—	—	変化なし	—	—	変化なし 99.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)、平均値

(a)：白色の割線入り口腔内崩壊錠

—：実施なし

4) 分割後の安定性試験⁸⁾

目的

本製剤の分割後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を割線に沿って二分割*し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

*：分割操作は「薬の錠剤カッター」を使用

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T2SB607	室温	25℃/60%RH、遮光開放
	光	25℃/60%RH、D65ランプ(2000lx)、開放シャーレ

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状 [†] ・純度試験(類縁物質)・定量試験・含量均一性試験	1回

[†]：分割面は未設定規格のため参考として記載

結果

試験項目 保存条件・期間		性状		純度試験 (類縁物質)	定量試験※	含量均一性 試験
		表面	分割面			
イニシャル		白色	白色	適合	100.0	適合
室温	1ヵ月	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.9	—
	3ヵ月	変化なし	変化なし	変化あり (規格外)	変化なし 101.5	—
光	30万lx・hr	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 99.4	—
	60万lx・hr	変化あり (規格内) 帯黄白色	帯黄白色	変化あり (規格外)	変化なし 98.2	—

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

—：実施なし

IV. 製剤に関する項目

A) 評価分類基準

【性状】

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

【硬度】

分類	評価基準
変化なし	硬度変化が30%未満の場合
変化あり(規格内)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合
変化あり(規格外)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合

【定量試験】

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

【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

1) 加速試験⁹⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。

その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

容器：[本体]褐色ガラス瓶

[キャップ]ポリプロピレン(ポリエチレン製中栓付き)

		イニシャル	40°C75%RH ・遮光6ヵ月
性状		無色澄明の液	同左
確認試験		規格に適合	同左
pH		5.1	5.1
微生物限度試験		規格に適合	同左
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	97.7	96.4
	パラオキシ 安息香酸プロピル	98.3	97.1
定量試験※		98.1	98.2

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

2) 小分け後の安定性試験⁹⁾

本製剤(無希釈)の小分け後の安定性試験(1ロット、繰り返し3回)を実施した。

その結果、規格に適合した。

小分け容器：[本体]無色透明ポリプロピレン

[キャップ]ポリエチレン

IV. 製剤に関する項目

		イニシャル	25°C60%RH ・遮光14日間
性状		無色澄明の液	同左
確認試験		規格に適合	同左
pH		5.1	5.1
微生物限度試験		規格に適合	同左
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	97.2	96.7
	パラオキシ 安息香酸プロピル	96.8	96.7
定量試験※		98.5	98.7

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

3) 横倒し状態での安定性試験⁹⁾

本製剤を横倒しにした状態にて安定性試験(1ロット、繰り返し3回)を実施した。

その結果、規格に適合した。

容器：[本体]褐色ガラス瓶

[キャップ]ポリプロピレン(ポリエチレン製中栓付き)

		イニシャル	40°C75%RH ・遮光6ヵ月
性状		無色澄明の液	同左
確認試験		規格に適合	同左
pH		5.1	5.1
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	98.7	97.5
	パラオキシ 安息香酸プロピル	100.6	99.2
定量試験※		98.9	99.2

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

4) 苛酷試験(褐色ガラス容器の安定性)¹⁰⁾

本製剤を下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し3回)を行った。

その結果、以下のとおりであった。

容器：[本体]褐色ガラス瓶

[キャップ]ポリプロピレン(ポリエチレン製中栓付き)

		イニシャル	温度		光* (総照射量 120万lx・hr)
			(50°C・ 遮光60日)	(5°C・ 遮光6ヵ月)	
性状		無色澄明の液	同左	同左	同左
確認試験		規格に適合	—	—	規格に適合
pH		5.1	5.1	5.1	5.1
パラオキシ 安息香酸 エステル含量	パラオキシ 安息香酸メチル	98.7	98.0	98.7	98.8
	パラオキシ 安息香酸プロピル	100.6	99.3	99.7	99.2
定量試験※		98.9	99.4	99.4	99.3

pH・パラオキシ安息香酸エステル含量(%)・定量試験：平均値

※：表示量に対する含有率(%)

*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(3000lx)

IV. 製剤に関する項目

7. 調製法及び溶解後の安定性
 該当しない

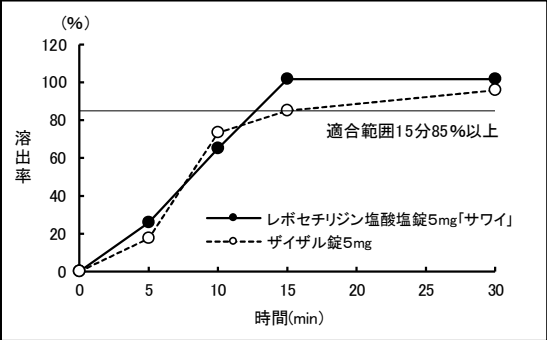
8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)
 <配合変化試験>¹¹⁾
 ●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
 XIII. -2. 参照

9. 溶出性
 <溶出挙動における同等性及び類似性>

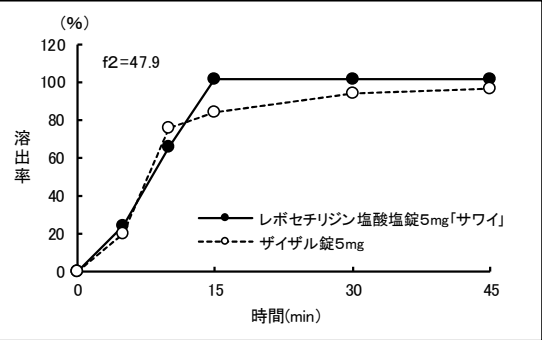
●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」¹²⁾

試験方法	「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、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	50rpm : pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」(ロット番号 : 713T1S3112)	
標準製剤	ザイザル錠 5mg(ロット番号 : 15019)	
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH4.0> f2関数の値が42以上であった。 <50rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	

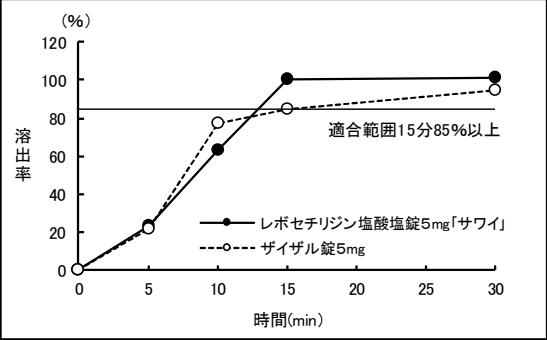
<50rpm : pH1.2>



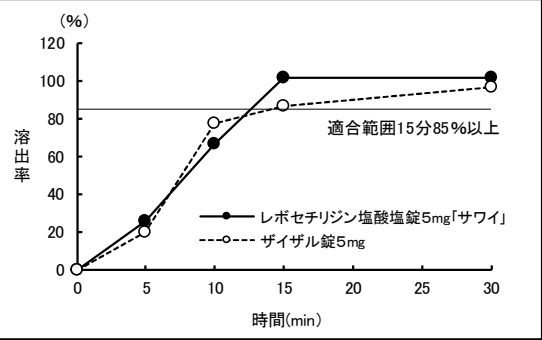
<50rpm : pH4.0>



<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>

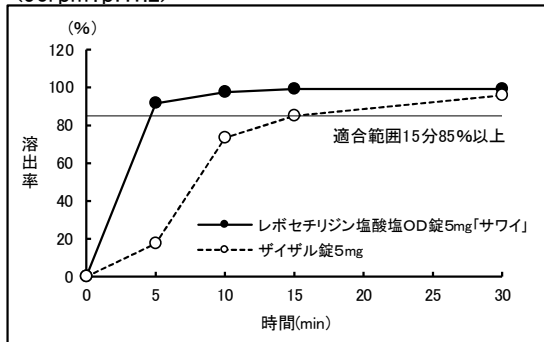


●レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」¹³⁾

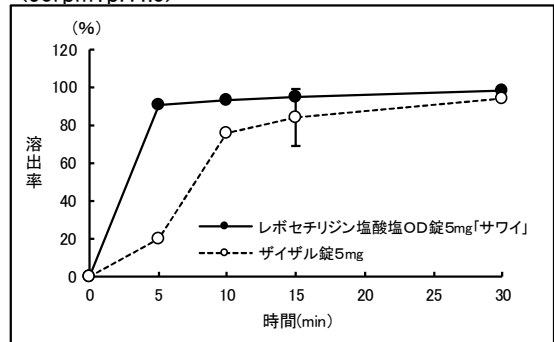
試験方法	「剤形が異なる製剤の追加のための生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に従い、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	50rpm : pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」(ロット番号: 713T2SB608)	
標準製剤	ザイザル錠5mg(ロット番号: 15019)	
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH4.0> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分※)及び85%(15分)付近において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 <50rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	

※：比較時点が15分未満となったため、比較時点が15分として溶出挙動の評価を行った。

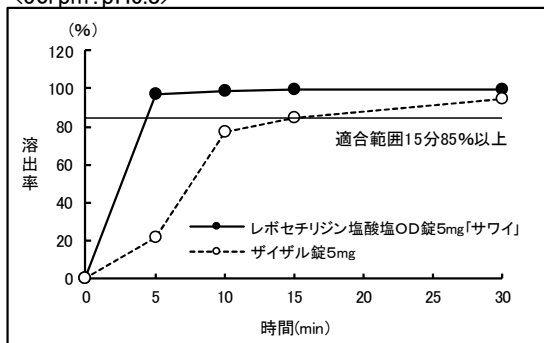
<50rpm : pH1.2>



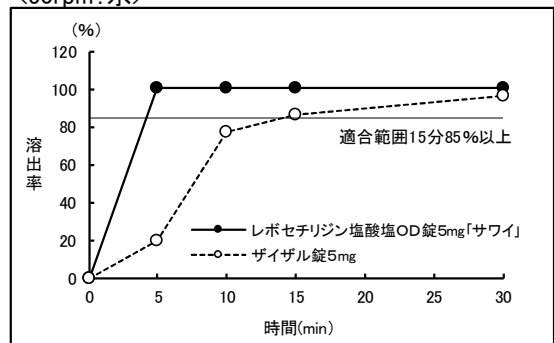
<50rpm : pH4.0>



<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



([] : 判定基準の適合範囲)

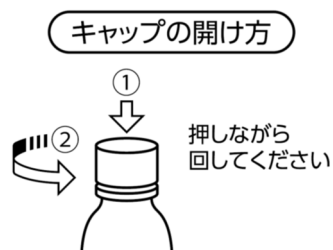
IV. 製剤に関する項目

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

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

キャップは乳幼児の誤飲防止機能(チャイルドレジスタンス機能：プッシュアンドターンタイプ)付きである。



2) 包装

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg／OD錠 5 mg「サワイ」

22. 包装

〈レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」〉

PTP〔乾燥剤入り〕：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

〈レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」〉

PTP〔乾燥剤入り〕：100錠(10錠×10)

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

22. 包装

瓶：200mL

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」

PTP：〔PTPシート〕ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミニウム箔
〔ピロー〕アルミニウム袋

●レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」

PTP：〔PTPシート〕ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミニウム箔
〔ピロー〕アルミニウム袋

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

瓶：褐色ガラス

中栓：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類
該当しない

12. その他.....

＜自動分包機錠剤落下試験＞¹⁴⁾

●レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」

【目的】

レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」について、自動錠剤分包機使用時の錠剤への影響を確認する。

【方法】

本剤の無包装品（イニシャル品および加湿下保存品）について、自動分包機の最上段のカセットから落下（1ロット、繰り返し1回）させ、分包した。

分包後、外観観察（欠け、割れ）を行い、外観変化のあった錠数を計数した。

試験機器： YS-TR-330/260FDS II（株式会社湯山製作所）

試験製剤： イニシャル品（無包装開始直後）

加湿下保存品（①25℃60%RH 2週間保存、②25℃75%RH 2週間保存）

分包条件： 各50包（1錠/包）

【結果】

試験製剤	外観変化(錠)	
	欠け	割れ
イニシャル品	0	0
加湿下保存品①	0	0
加湿下保存品②	—*	—*

(n=50)

*：カセット内に錠剤が詰まり、排出されなかった

＜参考：加湿による錠剤の物性変化＞

	イニシャル品	加湿下保存品①	加湿下保存品②
重量 (mg) ※ ¹	160.5	163.5	165.1
厚さ (mm) ※ ²	3.82	3.97	4.07
硬度 (kg) ※ ² #	5.2	2.4	1.8

(※¹：n=10、※²：n=5、平均値)

#：割線に対して水平方向

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

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg/OD錠 5mg「サワイ」

6. 用法及び用量

〔成人〕

通常、成人にはレボセチリジン塩酸塩として1回5mgを1日1回、就寝前に経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は1日10mgとする。

〔小児〕

通常、7歳以上15歳未満の小児にはレボセチリジン塩酸塩として1回2.5mgを1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

6. 用法及び用量

〔成人〕

通常、成人には1回10mL(レボセチリジン塩酸塩として5mg)を1日1回、就寝前に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は1日20mL(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2.5mL(レボセチリジン塩酸塩として1.25mg)を1日1回経口投与する。

通常、1歳以上7歳未満の小児には1回2.5mL(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経口投与する。

通常、7歳以上15歳未満の小児には1回5mL(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	5 mg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

● レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg/OD錠 5 mg/シロップ0.05%「サワイ」

17.1 有効性及び安全性に関する試験

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¹⁵⁾。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¹⁶⁾。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¹⁷⁾。

V. 治療に関する項目

表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。

<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週間後及び投与2週間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¹⁸⁾。

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週間後及び投与2週間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¹⁹⁾。

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週間後及び投与2週間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²⁰⁾。

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²¹⁾。

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²²⁾。

表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。

●レボセチリジン塩酸塩錠5mg/OD錠5mg「サワイ」

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〉

(1) 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。

表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 (-0.41, 0.17)
	セチリジン10mg	278	3.87	3.89	

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²³⁾。

(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を1日1回、2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。

V. 治療に関する項目

表 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²⁴⁾。

(3) 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^{25, 26)}。

表 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〉

(4) 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^{27, 28)}。

表 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。

●レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05% 「サワイ」

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 ヶ月以上 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 ヶ月以上 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²⁹⁾。

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 5 mg 群とセチリジン塩酸塩錠 10 mg 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 5 mg 群とセチリジン塩酸塩錠 10 mg 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。

表 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 5 mg	281	7.91	—	—
	セチリジン 10 mg	278	7.81		
全治療 期間	レボセチリジン 5 mg	280	4.03	4.00	-0.12 (-0.41, 0.17)
	セチリジン 10 mg	278	3.87	3.89	

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 10 mg 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 10 mg の調整済み平均値からレボセチリジン 5 mg 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 5 mg 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 10 mg 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²³⁾。

(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 5 mg 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 5 mg 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。

表 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 5 mg	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 5 mg 群(解析対象 119 例)で傾眠 6 件、頭痛 5 件であった²⁴⁾。

(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 5 mg を 1 日 1 回、6 週間投与した時、レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg 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^{25, 26)}。

表 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 5 mg	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 5 mg 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。

V. 治療に関する項目

〈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^{27, 28)}。

表 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

●レボセチリジン塩酸塩錠 5mg/OD錠 5mg/シロップ 0.05%「サワイ」

17.1.1 セチリジン塩酸塩の臨床試験

〈アレルギー性鼻炎〉

(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³⁰⁾。

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、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒〉

(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³¹⁾。

副作用発現頻度は 1.4% (1/73 例) であり、傾眠 1 例であった。

V. -5. -4)-(2) 参照

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

該当しない

7) その他

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg／OD錠 5 mg／シロップ0.05%「サワイ」

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^{22, 30~32)}。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¹⁷⁾。

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

抗ヒスタミン作用：

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベボタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩³³⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、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H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬である。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミンH₁受容体拮抗作用

ヒスタミンH₁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H₁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H₂、ヒスタミンH₃、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)^{34, 35)}。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³⁶⁾。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)³⁷⁾。

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)³⁸⁾。

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)³⁹⁾。

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

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg/OD錠 5 mg「サワイ」

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 5 mg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に達し、消失半減期は約7.3時間であった^{40, 41)}。

レボセチリジン塩酸塩はセチリジン塩酸塩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AUC₀₋₄₈は同等であった。

表 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-∞} (ng·hr/mL)
レボセチリジン	5 mg	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	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 5 mg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、AUC₀₋₂₄について算出した累積係数は1.08であった⁴²⁾ (外国人データ)。

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

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 5 mg(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⁴³⁾。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AUC₀₋₄₈は同等であった。

VII. 薬物動態に関する項目

表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	t _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	t _{1/2} (hr)	AUC _{0-∞} (ng·hr/mL)
レボセチリジン (シロップ)	5 mg	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、t_{max}：中央値(範囲)

健康成人男性20例にレボセチリジン塩酸塩 5 mg(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C_{max}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^{40,41)}。

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C_{max}及びAUC₀₋₄₈は同等であった。

表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	t _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	t _{1/2} (hr)	AUC _{0-∞} (ng·hr/mL)
レボセチリジン (錠剤)	5 mg	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、t_{max}：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 5 mg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、AUC₀₋₂₄について算出した累積係数は1.08であった⁴²⁾(外国人データ)。

<生物学的同等性試験>

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」^{44, 45)}

目的

レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

方法

「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号以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」とザイザル錠 5 mgをそれぞれ1錠(レボセチリジン塩酸塩として5 mg)健康成人男性に絶食下单回経口投与し、血漿中レボセチリジン濃度を測定する。

採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6、8、12、24、48hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」(ロット番号:713T1S3112)
標準製剤	ザイザル錠 5 mg(ロット番号:15019)

評価

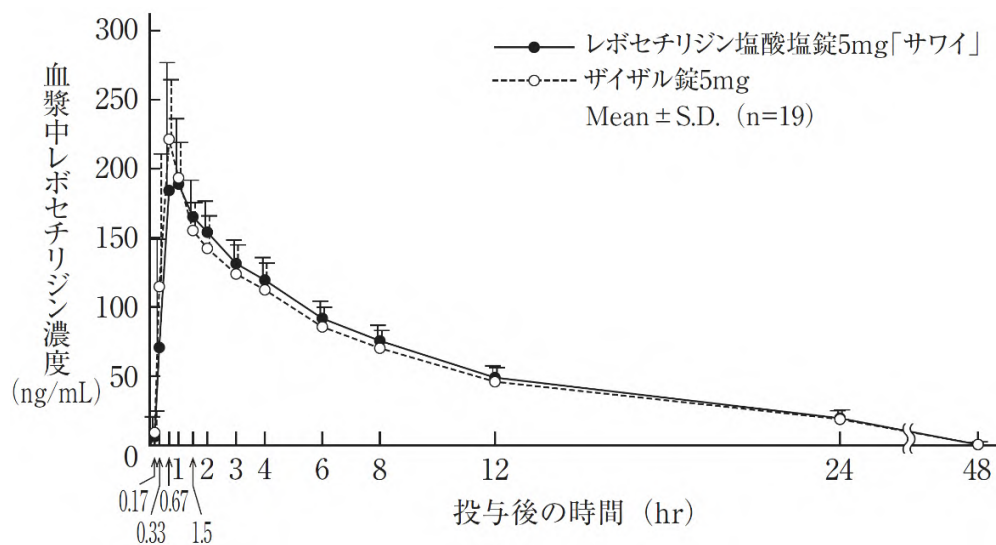
ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUC_tおよびC_{max}の対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれ $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

結果

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-48hr} (ng・hr/mL)
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「サワイ」	227±48	1.0±0.5	8.4±1.3	1830±270
ザイザル錠5mg	240±38	0.7±0.2	8.5±1.5	1759±339

(Mean±S.D., n=19)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-48hr}	$\log(1.05)$	$\log(1.00) \sim \log(1.10)$
C _{max}	$\log(0.94)$	$\log(0.86) \sim \log(1.02)$

血漿中濃度ならびにAUC_t、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。

結論

得られた薬物動態パラメータ(AUC_t、C_{max})の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準である $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

●レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」^{46, 47)}**目的**

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

VII. 薬物動態に関する項目

方法

「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号以下、ガイドラインと記載)および「剤形が異なる製剤の追加のための生物学的同等性試験ガイドライン」(平成13年5月31日 医薬審発第783号)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」とザイザル錠5mgをそれぞれ1錠(レボセチリジン塩酸塩として5mg)健康成人男性に絶食下单回経口投与(水なしで服用※および水で服用)し、血漿中レボセチリジン濃度を測定する。

※ザイザル錠5mgは水で服用

採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6、8、12、24、48hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」(ロット番号:713T2SB608)
標準製剤	ザイザル錠5mg(ロット番号:15019)

評価

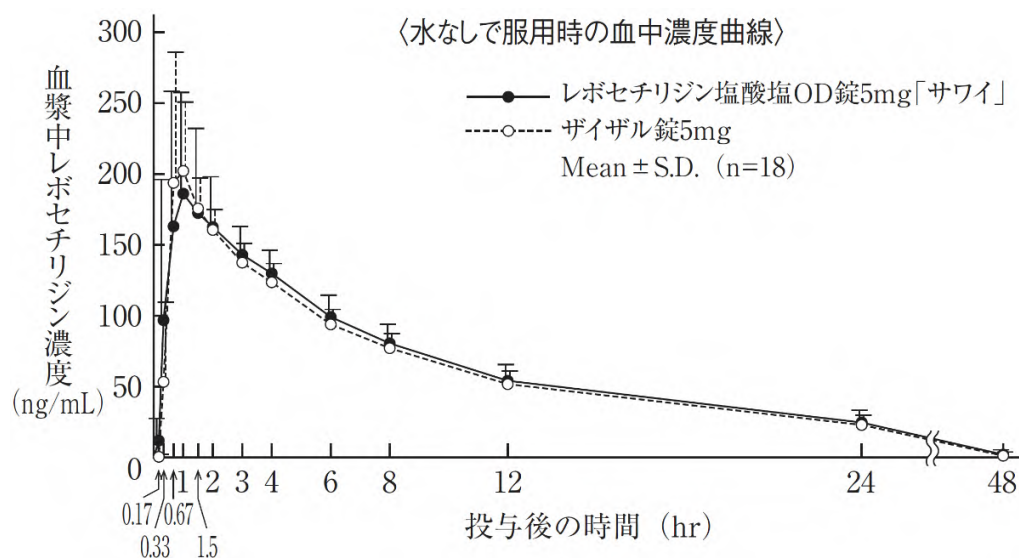
ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUC_tおよびC_{max}の対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれlog(0.80)～log(1.25)の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

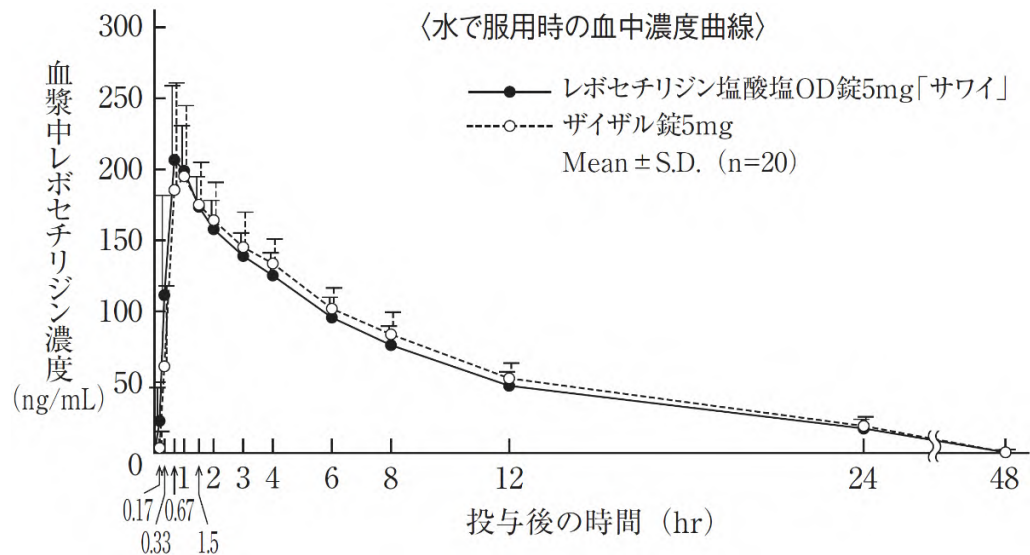
結果

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-48hr} (ng・hr/mL)
※ 水なし (n=18)	レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」	232±36	1.1±0.6	9.3±1.5	2045±400
	ザイザル錠5mg	234±45	1.0±0.6	9.2±1.4	1954±303
水あり (n=20)	レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」	225±29	0.9±0.6	7.5±1.1	1834±311
	ザイザル錠5mg	220±46	1.1±0.8	7.5±1.0	1943±355

(Mean±S.D.)





		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
※ 水 なし	AUC _{0-48hr}	log (1.05)	log (1.01) ~ log (1.08)
	Cmax	log (1.01)	log (0.92) ~ log (1.11)
水 あり	AUC _{0-48hr}	log (0.95)	log (0.91) ~ log (0.98)
	Cmax	log (1.04)	log (0.96) ~ log (1.12)

※ザイザル錠 5 mgは水で服用

血漿中濃度ならびにAUCt、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。

結論

得られた薬物動態パラメータ (AUCt、Cmax) の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準であるlog (0.80) ~ log (1.25) の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」^{48, 49)}

目的

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

方法

「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号以下、ガイドラインと記載) に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」とザイザルシロップ0.05%をそれぞれ10mL (レボセチリジン塩酸塩として5mg) 健康成人男性に絶食下单回経口投与し、血漿中レボセチリジン濃度を測定する。

採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6、12、24、30hr
休薬期間	3日間以上
測定方法	LC/MS/MS法
試験製剤	レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」(ロット番号:WA03503)
標準製剤	ザイザルシロップ0.05%(ロット番号:NP9X)

VII. 薬物動態に関する項目

評価

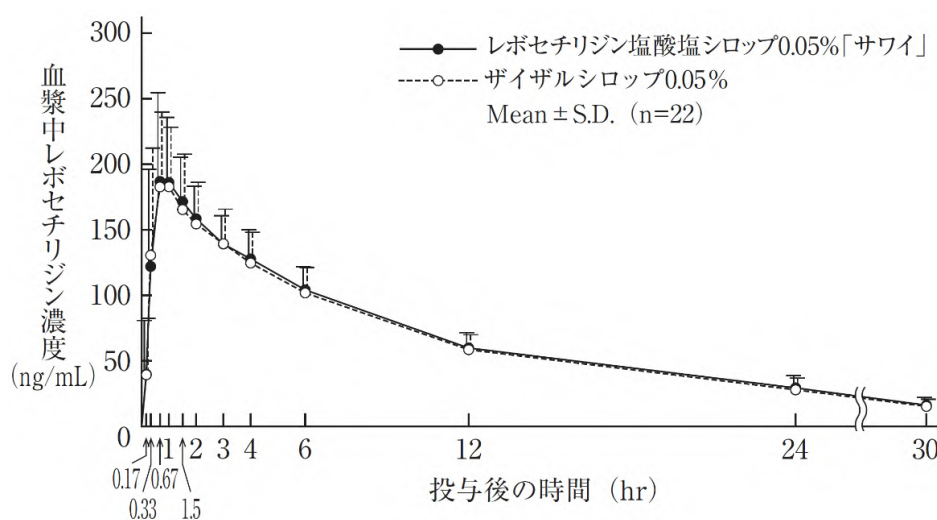
ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUCtおよびCmaxの対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれ $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

結果

各製剤10mL投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-30hr} (ng・hr/mL)
レボセチリジン塩酸塩 シロップ0.05%「サワイ」	206.8±43.71	1.0±0.5	8.9±1.4	1978±367.3
ザイザルシロップ0.05%	212.9±49.41	1.0±0.6	8.8±1.1	1930±371.5

(Mean±S.D., n=22)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-30hr}	$\log(1.0244)$	$\log(0.9835) \sim \log(1.0670)$
Cmax	$\log(0.9741)$	$\log(0.9134) \sim \log(1.0387)$

血漿中濃度ならびにAUCt、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。

結論

得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準である $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

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 5 mg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 t_{max} は約1.3時間遅延し、 C_{max} が約35%低下したが、AUCに顕著な差はみられなかった⁵⁰⁾(外国人データ)。

VIII. -7. 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

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(レボセチリジン塩酸塩として5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{44, 45)}

$0.085 \pm 0.014 \text{ hr}^{-1}$

- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(レボセチリジン塩酸塩として5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{46, 47)}

[水なし] $0.077 \pm 0.013 \text{ hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.094 \pm 0.013 \text{ hr}^{-1}$

- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」を健康成人男子に10mL(レボセチリジン塩酸塩として5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{48, 49)}

$0.079 \pm 0.013 \text{ hr}^{-1}$

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 5 mg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⁵¹⁾。

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

VII. 薬物動態に関する項目

2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

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) 参照

3) 乳汁への移行性

VIII. - 6. -6) 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 $[^{14}\text{C}]$ -レボセチリジン (0.2～5 $\mu\text{g/mL}$) のヒト血漿蛋白結合率は約92%であった⁵²⁾。

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

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⁵³⁾。

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

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C_{max}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⁵⁴⁾。

VII. - 6. -1) 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 5 mg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 ± 0.567 L/hr及び 2.482 ± 0.582 L/hrであった⁵⁵⁾。

16.5.2 健康成人20例にレボセチリジン塩酸塩 5 mg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⁵⁶⁾ (外国人データ)。

16.5.3 健康成人男性 4 例に $[^{14}\text{C}]$ -レボセチリジン塩酸塩溶液 5 mg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⁵⁷⁾。

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. 参照

10. 特定の背景を有する患者

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg/OD錠 5 mg/シロップ0.05%「サワイ」

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 $45 \sim 90$ mL/min(軽度)、 $10 \sim 45$ mL/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 5 mg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 $\text{AUC}_{0-\infty}$ 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⁵⁸⁾ (外国人データ)。^[2.2、7.1、9.2.1、9.2.2参照]

VII. 薬物動態に関する項目

表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-∞} (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^{59~61)}(外国人データ)。^[9.3.1参照]

表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

●レボセチリジン塩酸塩錠5mg/OD錠5mg「サワイ」

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⁶²⁾(外国人データ)。^[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-∞} (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)

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

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⁶¹⁾(外国人データ)。^[9.8参照]

注)本剤の承認用量は、通常、成人には1回10mL(レボセチリジン塩酸塩として5mg)を1日1回、就寝前に経口投与、最高投与量は1日20mL(レボセチリジン塩酸塩として10mg)である。

表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-∞} (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⁶³⁾。

表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. 参照

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に十分注意すること。
- 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

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg/OD錠 5 mg「サワイ」

9.7 小児等

7歳未満の小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

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。

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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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

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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	0.1～5 %未満	0.1%未満	頻度不明
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

●レボセチリジン塩酸塩錠5mg/OD錠5mg「サワイ」

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

〈製剤共通〉

14.1.1 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ある。

〈OD錠〉

14.1.2 本剤は舌の上にのせ唾液を浸潤させ、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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」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

	規制区分
製剤	処方箋医薬品 ^{注)}
有効成分	劇薬

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg／シロップ0.05%「サワイ」

有効期間：3年

- レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」

有効期間：30ヵ月

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

- レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg／OD錠 5 mg「サワイ」

20. 取扱い上の注意

〈OD錠〉

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

- レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

20. 取扱い上の注意

ガラス容器開栓後は、遮光して保存すること。

5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資料

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ザイザル錠 5 mg／シロップ0.05%

同効薬：抗ヒスタミン作用

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメタジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩³³⁾

7. 国際誕生年月日
該当しない

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.....

製品名	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錠5mg「サワイ」	2020年2月17日	30200AMX00108000	2020年6月19日	2020年6月19日
レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」	2020年2月17日	30200AMX00159000	2020年6月19日	2020年6月19日
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」	2020年2月17日	30200AMX00232000	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(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

製品名	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錠5mg「サワイ」	4490028F1116	4490028F1116	128136101	622813601
レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」	4490028F4042	4490028F4042	128137801	622813701
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」	4490028Q1010	4490028Q1052	128138501	622813801

14. 保険給付上の注意

●レボセチリジン塩酸塩錠5mg／OD錠5mg「サワイ」

本剤は診療報酬上の後発医薬品である

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

特になし

XI . 文 献

1. 引用文献……………
- 1) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験] レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[苛酷試験(褐色ガラス容器の安定性)] レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「サワイ」
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[配合変化試験成績] レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 13) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包装机錠剤落下試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 15) 奥田稔他：耳鼻咽喉科展望，1994；37：754-779
- 16) 奥田稔他：耳鼻咽喉科展望，1995；38：116-136
- 17) 斎藤博久：臨床医薬，2010；26：141-154
- 18) 吉田彦太郎他：基礎と臨床，1994；28：2107-2129
- 19) 吉田彦太郎他：基礎と臨床，1994；28：2131-2145
- 20) 吉田彦太郎他：基礎と臨床，1994；28：2163-2173
- 21) 吉田彦太郎他：基礎と臨床，1994；28：2147-2162
- 22) 中川秀己他：臨床医薬，2010；26：155-167
- 23) 海外第Ⅲ相試験(二重盲検比較試験、成人)①(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要 2.7.6.31)
- 24) 海外第Ⅲ相試験(二重盲検比較試験、成人)②(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要 2.7.6.32)
- 25) Potter, P. C. et al. : Allergy, 2003；58：893-899
- 26) 海外第Ⅲ相試験(二重盲検比較試験、成人)③(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要 2.7.6.35)
- 27) Kapp, A. et al. : Int. J. Dermatol., 2006；45：469-474
- 28) 海外第Ⅲ相試験(二重盲検比較試験、成人)④(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要 2.7.6.43)
- 29) 国内第Ⅲ相試験(非対照非盲検試験、小児)(ザイザルシロップ：2014年1月17日承認、申請資料概要 2.7.6)
- 30) 斎藤博久他：臨床医薬，2010；26：127-139
- 31) 中川秀己他：臨床医薬，2010；26：169-181

- 32) 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)
- 33) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2026/4/1 アクセス)
- 34) Gillard, M. et al. : Mol. Pharmacol., 2002 ; 61 : 391-399
- 35) ヒスタミンH₁受容体拮抗作用(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.6.2.3)
- 36) Christophe, B. et al. : Eur. J. Pharmacol., 2003 ; 470 : 87-94
- 37) Devalia, J. L. et al. : Allergy, 2001 ; 56 : 50-57
- 38) Thomson, L. et al. : Clin. Exp. Allergy, 2002 ; 32 : 1187-1192
- 39) 細胞接着分子産生抑制作用(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.6.25)
- 40) 井野比呂子他：臨床薬理, 2010 ; 41 : 309-315
- 41) 単回投与(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.6.6)
- 42) 反復投与(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.6.1)
- 43) Ino, H. et al. : J. Drug Assess., 2014 ; 3 : 38-42
- 44) 田中孝典他：診療と新薬, 2020 ; 57 : 417-422
- 45) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」
- 46) 中川美聡他：診療と新薬, 2020 ; 57 : 424-433
- 47) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 48) 信岡史将他：診療と新薬, 2020 ; 57(8) : 793-798
- 49) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」
- 50) 食事の影響(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.6.1)
- 51) 分布容積(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.5, 2.7.6.6)
- 52) 血漿蛋白結合率(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 53) 代謝酵素(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.6.4.5)
- 54) 代謝酵素阻害・誘導(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 55) 排泄①(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.5, 2.7.6.6)
- 56) 排泄②(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.6.1)
- 57) Benedetti, M. S. et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol., 2001 ; 57 : 571-582
- 58) 腎機能低下者(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 59) 肝障害のある患者(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 60) Simons, F. E. R. et al. : J. Clin. Pharmacol., 1993 ; 33 : 949-954
- 61) Matzke, G. R. et al. : Ann. Allergy, 1987 ; 59 : 25-30
- 62) 高齢者(ザイザル錠：2010年10月27日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 63) 小児等(ザイザルシロップ：2014年1月17日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 64) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」
- 65) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 66) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」
- 67) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] レボセチリジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
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。

1) 粉砕

<粉砕後の安定性試験>

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」⁶⁴⁾

目的

本製剤の粉砕後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を粉砕し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{B)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T1S3112	室温	25℃/60%RH、遮光、開放シャーレ
	光	25℃/60%RH、D65ランプ(2000lx)、開放シャーレ

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・純度試験(類縁物質)・定量試験	1回

結果

試験項目		性状	純度試験 (類縁物質)	定量試験※
保存条件・期間				
イニシャル		白色の粉末	適合	100.0
室温(3ヵ月)		変化なし	変化なし	変化なし 101.1
光	10万lx・hr	変化なし	変化なし	変化なし 100.8
	30万lx・hr	変化なし	変化あり (規格外)	変化なし 99.4

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」⁶⁵⁾

目的

本製剤の粉砕後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を粉砕し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{B)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
713T2SB612	室温	25℃/60%RH、遮光、開放シャーレ
	光	25℃/60%RH、D65ランプ(2000lx)、開放シャーレ

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・純度試験(類縁物質)・定量試験	1回

結果

試験項目 保存条件・期間		性状	純度試験 (類縁物質)	定量試験※
イニシャル		白色の粉末	適合	100.0
室温	1ヵ月	変化なし	変化なし	変化なし 99.7
	3ヵ月	変化なし	変化あり (規格外)	変化なし 100.7
光	10万lx・hr	変化なし	変化なし	変化なし 100.4
	30万lx・hr	帯黄白色の粉末	変化あり (規格外)	変化なし 98.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

B) 評価分類基準

【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり	形状変化や色調変化が認められる場合

【定量試験】

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

【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

該当しない

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

＜崩壊・懸濁性及びチューブ通過性試験＞

●レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」⁶⁶⁾

試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取した。
2. 5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

結 果

懸 濁 状 態	錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

(1ロット、繰り返し1回)

チューブ通過後のpH

3.3

●レボセチリジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」⁶⁷⁾

試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取した。
2. 錠剤崩壊後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

結 果

懸 濁 状 態	錠剤は1分20秒後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

(1ロット、繰り返し1回)

チューブ通過後のpH

9.1

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」

該当資料なし

2. その他の関連資料

患者向け資料

- ・気になる皮膚のかゆみ じんましん
- ・花粉症のセルフケアと治療法
- ・自動車運転等はしないでください・お知らせ指導箋(紙色：ピンク)

医療関係者向け資料

- ・投与量早見表_レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg/OD錠 5 mg/シロップ0.05%「サワイ」

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

<配合変化試験成績>

●レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」¹¹⁾

<配合変化試験の配合方法>

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」(以下、当社製剤)と、他剤または食品・飲料を直接配合した後、性状(外観、再分散性(他剤と配合した場合のみ))を観察し、pHおよび含量を測定(繰り返し回数：1回)した。

性状観察およびpH測定は表中記載の配合量で試験を実施し、含量測定は表中記載の配合量下段の()内の配合量で試験を実施した。

含量は、配合直後のレボセチリジン塩酸塩量を100としたときの残存率を%で示し、()には表示量に対する含有率を%で示した。

(保存条件)温度：25±2℃ 湿度：60±5%RH

期間：7日間(薬剤との配合)、6時間(食品・飲料との配合)

貯法：ガラス製試験管・密栓、遮光(性状観察およびpH測定用)

褐色メスフラスコ・密栓、遮光(含量測定用)

再分散性：試験液を入れた試験管を5秒間倒立させ、次いで5秒間正立させる。この操作を1回として、懸濁液が均質に分散するまでの回数をカウントする。

※2020年6月作成の配合変化試験成績を掲載した。

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」 配合変化試験成績

【他剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量 [†]	試験項目	配合結果			
	品 名	成分名	配合量 [†]			配合直後	3日後	7日後	
解熱鎮痛消炎剤	アセトアミノフェン細粒20% (TYK)	アセトアミノ フェン	50g (1g)	250mL (5mL)	外観	淡橙色の懸濁液	淡橙色の懸濁液	淡橙色の懸濁液	
					再分散性	—	9回	10回	
					pH	5.21	5.24	5.29	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.490	0.475	0.481
						残存率 (%)	100.0(98.0)	96.9	98.2
	カロナールシロップ2%	アセトアミノ フェン	250mL (10mL)	125mL (5mL)	外観	無色澄清の液	無色澄清の液	無色澄清の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	5.23	5.23	5.26	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.494	0.489	0.492
						残存率 (%)	100.0(98.8)	99.0	99.6
精神神経用剤	アタラックス-Pシロップ 0.5%	ヒドロキシジ ンパモ酸塩	30mL (10mL)	15mL (5mL)	外観	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液	
					再分散性	—	26回	22回	
					pH	4.78	4.79	4.80	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.490	0.485	0.483
残存率 (%)	100.0(98.0)	99.0	98.6						
鎮咳剤	クロフェドリンS配合シロップ	ジヒドロコデ インリン酸 塩・dl-メチル エフェドリン 塩酸塩・クロ ルフェニラミ ンマレイン酸 塩	100mL (2mL)	250mL (5mL)	外観	暗褐色澄清の液	暗褐色澄清の液	暗褐色澄清の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	5.94	5.94	5.98	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.493	0.495	0.491
残存率 (%)	100.0(98.6)	100.4	99.6						
去たん剤	ムコダインシロップ5%	L-カルボシ ステイン	240mL (12mL)	100mL (5mL)	外観	淡褐色澄清の液	淡褐色澄清の液	淡褐色澄清の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	5.59	5.64	5.65	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.492	0.493	0.493
						残存率 (%)	100.0(98.4)	100.2	100.2
	小児用ムコソルバン シロップ0.3%	アンブロキ ソール塩酸 塩	180mL (6mL)	150mL (5mL)	外観	無色澄清の液	無色澄清の液	無色澄清の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	4.08	4.08	4.12	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.497	0.491	0.492
						残存率 (%)	100.0(99.4)	98.8	99.0
鎮咳去たん剤	アスピリンシロップ0.5%	チペピジンヒ ベンズ酸塩	100mL (2mL)	250mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液	
					再分散性	—	4回	4回	
					pH	5.02	5.02	5.07	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.486	0.480	0.482
残存率 (%)	100.0(97.2)	98.8	99.2						
気管支拡張剤	ベネトリンシロップ0.04%	サルブタモール硫酸塩	180mL (6mL)	150mL (5mL)	外観	無色澄清の粘性のある液	無色澄清の粘性のある液	無色澄清の粘性のある液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	4.27	4.30	4.33	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.494	0.492	0.493
残存率 (%)	100.0(98.8)	99.6	99.8						
ビタミンB剤	フラビタンシロップ0.3%	フラビンアデ ニンジヌクレ オチドナトリ ウム	100mL (2mL)	250mL (5mL)	外観	黄色澄清の液	黄色澄清の液	黄色澄清の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	5.11	5.11	5.12	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.497	0.496	0.492
残存率 (%)	100.0(99.4)	99.8	99.0						

[†]含量は下段に記載の()の配合量で測定

*試験液が澄清な液であったため再分散性は確認しなかった。

【他剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量 [†]	試験項目	配合結果			
	品 名	成分名	配合量 [†]			配合直後	3日後	7日後	
副腎ホルモ ン剤	リンデロンシロップ0.01%	ベタメタゾン	75mL (1.5mL)	250mL (5mL)	外観	淡橙色澄明の液	淡橙色澄明の液	淡橙色澄明の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	4.73	4.73	4.74	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.498	0.504	0.496
						残存率 (%)	100.0(99.6)	101.2	99.6
	セレスタミン配合シロップ	ベタメタゾン・ d-クロルフェ ニラミンマレ イン酸塩	175mL (5mL)	175mL (5mL)	外観	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	4.34	4.35	4.44	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.498	0.495	0.498
						残存率 (%)	100.0(99.6)	99.4	100.0
代謝性医 薬品	ハイチオール散32%	L-システイン	14.4g (1.6g)	45mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液	
					再分散性	—	6回	1回	
					pH	4.82	4.25	4.25	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.498	0.476	0.459
						残存率 (%)	100.0(99.6)	95.6	92.2
抗ヒスタ ミン剤	ポララミンシロップ0.04%	d-クロルフェ ニラミンマレ イン酸塩	175mL (5mL)	175mL (5mL)	外観	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液	だいたい色澄明の液	
					再分散性*	—	—	—	
					pH	5.27	5.26	5.29	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.491	0.491	0.492
						残存率 (%)	100.0(98.2)	100.0	100.2
アレルギ ー用剤	アレロック顆粒0.5%	オロパタジン 塩酸塩	50g (1g)	250mL (5mL)	外観	淡赤色の顆粒を含む 懸濁液	淡赤色の顆粒を含む 懸濁液	淡赤色の顆粒を含む 懸濁液	
					再分散性	—	1回	2回	
					pH	5.03	5.02	5.04	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.492	0.491	0.492
						残存率 (%)	100.0(98.4)	99.8	100.0
抗生物質製 剤	フロモックス小児用細粒 100mg	セフカペン ピボキシル 塩酸塩水和 物	16.2g (1.8g)	45mL (5mL)	外観	赤白色の細粒を含む 懸濁液	赤白色の細粒を含む 懸濁液	赤白色の細粒を含む 懸濁液	
					再分散性	—	2回	2回	
					pH	4.74	4.02	3.68	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.441	0.323	0.268
						残存率 (%)	100.0(88.2)	73.2	60.8
	エリスロシンドライシロップ 10%	エリスロマイ シンエチルコ ハク酸エステ ル	150g (5g)	150mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液	
					再分散性	—	1回	1回	
					pH	6.45	6.47	6.47	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.474	0.473	0.475
						残存率 (%)	100.0(94.8)	99.8	100.2
	クラリスドライシロップ10% 小児用	クラリスロマ イシン	18g (2g)	45mL (5mL)	外観	赤白色の懸濁液	赤白色の懸濁液	赤白色の懸濁液	
					再分散性	—	7回	8回	
					pH	9.97	10.16	10.02	
					含量	実測値 (mg/mL)	0.311	0.313	0.301
						残存率 (%)	100.0(62.2)	100.6	96.8

†含量は下段に記載の()の配合量で測定

*試験液が澄明な液であったため再分散性は確認しなかった。

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「サワイ」 配合変化試験成績

【食品・飲料との配合】

分類	配合品		当社製剤 配合量 [†]	試験項目	配合結果		
	品名	配合量 [†]			配合直後	6時間後	
食 品 ・ 飲 料	なっちゃんオレンジジュース	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	淡黄色の懸濁液	淡黄色の懸濁液	
				pH	3.77	3.78	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.496	0.495
					残存率 (%)	100.0(99.2)	99.8
	びゅあ(粉ミルク)	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	
				pH	6.65	6.78	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.485	0.489
					残存率 (%)	100.0(97.0)	100.8
	Bigプッチンプリン	150g (25g)	30mL (5mL)	外観	淡橙黄色の懸濁液	淡橙黄色の懸濁液	
				pH	6.34	6.35	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.483	0.488
					残存率 (%)	100.0(96.6)	101.0
	ブルガリアヨーグルトL81プレーン	150g (25g)	30mL (5mL)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	
				pH	4.19	4.17	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.485	0.494
					残存率 (%)	100.0(97.0)	101.9
	エッセルスーパーカップ超バニラ	150g (25g)	30mL (5mL)	外観	微黄白色の懸濁液	微黄白色の懸濁液	
				pH	6.46	6.40	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.498	0.493
					残存率 (%)	100.0(99.6)	99.0
	健康ミネラルむぎ茶	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液	
				pH	6.50	6.64	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.482	0.482
					残存率 (%)	100.0(96.4)	100.0
	ポカリスエット	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	白色のわずかに懸濁した液	白色のわずかに懸濁した液	
				pH	3.89	3.92	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.482	0.479
					残存率 (%)	100.0(96.4)	99.4
	奥大山の天然水	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.23	5.23	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.476	0.479
					残存率 (%)	100.0(95.2)	100.6
	日局 単シロップ	150mL (25mL)	30mL (5mL)	外観	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.12	5.12	
				含量	実測値 (mg/mL)	0.482	0.482
					残存率 (%)	100.0(96.4)	100.0

[†]含量は下段に記載の()の配合量で測定

