2019年4月改訂（第12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（2013年）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

ジルテック®錠5
ジルテック®錠10

日本薬局方　セチリジン塩酸塩錠

ジルテック®ドライシロップ1.25%

セチリジン塩酸塩ドライシロップ

Zyrtec®

剤形	ジルテック錠5、10：フィルムコート錠 ジルテックドライシロップ1.25%：ドライシロップ剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠5：1錠中日局セチリジン塩酸塩5mg含有 錠10：1錠中日局セチリジン塩酸塩10mg含有 ドライシロップ1.25%：1g中日局セチリジン塩酸塩12.5mg含有
一般名	和名：セチリジン塩酸塩（JAN） 洋名：Cetirizine Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	ジルテック錠5、錠10 製造販売承認年月日：1998年6月30日 薬価基準収載年月日：1998年8月28日 発売年月日：1998年9月1日 ジルテックドライシロップ1.25% 製造販売承認年月日：2005年10月21日 薬価基準収載年月日：2006年7月7日 発売年月日：2006年7月13日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ユーシービージャパン株式会社 販売元：グラクソ・スミスクライン株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	グラクソ・スミスクライン株式会社　カスタマー・ケア・センター TEL：0120-561-007（9:00～17:45/土日祝日及び当社休業日を除く） FAX：0120-561-047（24時間受付） 医療関係者向けホームページ https://gskpro.com

本IFは2019年4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
http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要

―日本病院薬剤師会―

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

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

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、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-IF が提供されることとなった。

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

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

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

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

［IF の様式］

①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

［IF の作成］

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

［IF の発行］

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

3. IF の利用にあたって

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

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

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

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

4. 利用に際しての留意点

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

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（2013 年 4 月改訂）

目　　次

Ⅰ．概要に関する項目 …… 1
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 …… 1

Ⅱ．名称に関する項目 …… 2
1. 販売名 …… 2
(1) 和名 …… 2
(2) 洋名 …… 2
(3) 名称の由来 …… 2
2. 一般名 …… 2
(1) 和名（命名法） …… 2
(2) 洋名（命名法） …… 2
(3) ステム …… 2
3. 構造式又は示性式 …… 2
4. 分子式及び分子量 …… 2
5. 化学名（命名法） …… 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 …… 3
7. CAS登録番号 …… 3

Ⅲ．有効成分に関する項目 …… 4
1. 物理化学的性質 …… 4
(1) 外観・性状 …… 4
(2) 溶解性 …… 4
(3) 吸湿性 …… 4
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点 …… 4
(5) 酸塩基解離定数 …… 4
(6) 分配係数 …… 4
(7) その他の主な示性値 …… 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …… 5
(1) 各種条件下における安定性 …… 5
(2) 強制分解による生成物 …… 5
3. 有効成分の確認試験法 …… 5
4. 有効成分の定量法 …… 5

Ⅳ．製剤に関する項目 …… 6
1. 剤形 …… 6
(1) 剤形の区別、外観及び性状 …… 6
(2) 製剤の物性 …… 6
(3) 識別コード …… 6
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等 …… 6
2. 製剤の組成 …… 6
(1) 有効成分（活性成分）の含量 …… 6
(2) 添加物 …… 6
(3) その他 …… 7
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 …… 7
4. 製剤の各種条件下における安定性 …… 7
5. 調製法及び溶解後の安定性 …… 9
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 9
7. 溶出性 …… 9
8. 生物学的試験法 …… 9
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 …… 9
10. 製剤中の有効成分の定量法 …… 10
11. 力価 …… 10
12. 混入する可能性のある夾雑物 …… 10
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 …… 10
14. その他 …… 10

Ⅴ．治療に関する項目 …… 11
1. 効能又は効果 …… 11
2. 用法及び用量 …… 11
3. 臨床成績 …… 12
(1) 臨床データパッケージ …… 12
(2) 臨床効果 …… 13
(3) 臨床薬理試験 …… 16
(4) 探索的試験 …… 17
(5) 検証的試験 …… 17
(6) 治療的使用 …… 28

Ⅵ．薬効薬理に関する項目 …… 29
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 29
2. 薬理作用 …… 29
(1) 作用部位・作用機序 …… 29
(2) 薬効を裏付ける試験成績 …… 29
(3) 作用発現時間・持続時間 …… 34

Ⅶ．薬物動態に関する項目 …… 35
1. 血中濃度の推移・測定法 …… 35
(1) 治療上有効な血中濃度 …… 35
(2) 最高血中濃度到達時間 …… 35
(3) 臨床試験で確認された血中濃度 …… 35
(4) 中毒域 …… 40
(5) 食事・併用薬の影響 …… 41
(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 …… 41
2. 薬物速度論的パラメータ …… 41
(1) 解析方法 …… 41
(2) 吸収速度定数 …… 41
(3) バイオアベイラビリティ …… 41
(4) 消失速度定数 …… 42
(5) クリアランス …… 42
(6) 分布容積 …… 42
(7) 血漿蛋白結合率 …… 42
3. 吸収 …… 42
4. 分布 …… 42
(1) 血液－脳関門通過性 …… 42
(2) 血液－胎盤関門通過性 …… 42
(3) 乳汁への移行性 …… 42
(4) 髄液への移行性 …… 43
(5) その他の組織への移行性 …… 43
5. 代謝 …… 43
(1) 代謝部位及び代謝経路 …… 43
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種 …… 44

(3) 初回通過効果の有無及びその割合 ‥ 44
(4) 代謝物の活性の有無及び比率 ‥‥‥ 44
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ ‥ 44
6. 排泄 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 44
(1) 排泄部位及び経路 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 44
(2) 排泄率 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 44
(3) 排泄速度 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 45
7. トランスポーターに関する情報 ‥‥‥ 45
8. 透析等による除去率 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 45

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目‥ 46
1. 警告内容とその理由 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 46
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）
‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 46
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意
とその理由 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 46
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意
とその理由 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 46
5. 慎重投与内容とその理由 ‥‥‥‥‥‥ 46
6. 重要な基本的注意とその理由及び
処置方法 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 47
7. 相互作用 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 47
(1) 併用禁忌とその理由 ‥‥‥‥‥‥‥ 47
(2) 併用注意とその理由 ‥‥‥‥‥‥‥ 48
8. 副作用 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 51
(1) 副作用の概要 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 51
(2) 重大な副作用と初期症状 ‥‥‥‥‥ 51
(3) その他の副作用 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 52
(4) 項目別副作用発現頻度及び
臨床検査値異常一覧 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 53
(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 ‥ 56
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び
試験法 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 57
9. 高齢者への投与 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 57
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 ‥‥‥ 57
11. 小児等への投与 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 58
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 ‥‥‥‥‥ 58
13. 過量投与 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 58
14. 適用上の注意 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 59
15. その他の注意 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 59
16. その他 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 59

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
1. 薬理試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
(1) 薬効薬理試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
(2) 副次的薬理試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
(3) 安全性薬理試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
(4) その他の薬理試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
2. 毒性試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
(1) 単回投与毒性試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 60
(2) 反復投与毒性試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 61
(3) 生殖発生毒性試験 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 61
(4) その他の特殊毒性 ‥‥‥‥‥‥‥‥ 61

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 ‥‥‥‥‥‥‥ 62
1. 規制区分 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 62
2. 有効期間又は使用期限‥‥‥‥‥‥‥‥ 62
3. 貯法・保存条件 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 62
4. 薬剤取扱い上の注意点‥‥‥‥‥‥‥‥ 62
(1) 薬局での取扱い上の留意点について‥ 62
(2) 薬剤交付時の取扱いについて
（患者等に留意すべき必須事項等）‥ 62
(3) 調剤時の留意点について‥‥‥‥‥‥ 62
5. 承認条件等 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 62
6. 包装 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 62
7. 容器の材質 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 63
8. 同一成分・同効薬‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 63
9. 国際誕生年月日 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 63
10. 製造販売承認年月日及び承認番号‥‥‥ 63
11. 薬価基準収載年月日‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 63
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‥‥‥‥‥ 64
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日
及びその内容 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 64
14. 再審査期間 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 64
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報‥‥‥ 64
16. 各種コード ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 65
17. 保険給付上の注意‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 65

ⅩⅠ. 文献 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 66
1. 引用文献 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 66
2. その他の参考文献‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 67

ⅩⅡ. 参考資料 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 68
1. 主な外国での発売状況‥‥‥‥‥‥‥‥ 68
2. 海外における臨床支援情報‥‥‥‥‥‥ 69
(1) 妊婦への投与に関する海外情報‥‥‥ 69

ⅩⅢ. 備考 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 71
その他の関連資料 ‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥‥ 71

Ⅰ．概要に関する項目

1. 開発の経緯

ジルテックはベルギーの UCB 社で開発された抗アレルギー薬で、1986 年ベルギーにおいてアレルギー性鼻炎、蕁麻疹の治療薬として承認された。その後ヨーロッパ、アメリカをはじめ 100 ヵ国以上で販売又は承認されており、豊富な臨床実績がある。

本邦においては 1988 年より臨床試験を開始し、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症に有用性が認められ、1998 年に承認された。

海外では錠剤の服用が困難な患者や小児に対する製剤として内服滴剤（Oral drops, solution）や内服液剤（Oral solution）があるが、海外で使用されている製剤は日本の医療環境との違いや添加剤等の問題があるため日本の市場には不向きであると判断し、本邦用には携帯、服薬の利便性、高齢者及び嚥下機能が低下した患者についても服用に適した剤形であるドライシロップ剤を開発し、本邦において 2005 年に成人用ドライシロップ剤が承認され、2009 年には 2 歳以上、15 歳未満の小児への用法・用量が承認された。また、同時にジルテック錠 5 については 7 歳以上 15 歳未満の小児への用法・用量が承認された。

2008 年 10 月にジルテック錠 5、同錠 10 の成人に対する用法・用量が、2016 年 6 月に同錠 5 及びドライシロップの小児に対する用法・用量が医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しないとの再審査結果を得た。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

（1）速く、強く、長く、選択的なヒスタミン H_1 受容体拮抗作用を示す（海外データ、*in vitro*）。
（「Ⅵ．薬効薬理に関する項目 2．薬理作用（2）薬効を裏付ける試験成績」の項参照）

（2）アレルギー反応の遅発相における好酸球遊走を臨床用量で抑制する（海外データ）。
（「Ⅵ．薬効薬理に関する項目 2．薬理作用（2）薬効を裏付ける試験成績」の項参照）

（3）2 歳から使用できる第 2 世代抗ヒスタミン薬である（ドライシロップの適応年齢は 2 歳以上、5mg 錠は 7 歳以上）。
（「Ⅴ．治療に関する項目 2．用法及び用量」の項参照）

（4）成人は 1 日 1 回、小児は 1 日 2 回の投与で十分な効果を発揮する。
（「Ⅴ．治療に関する項目 3．臨床成績（5）検証的試験」の項参照）

（5）アトピー性皮膚炎患児が長期間服用しても精神運動発達に影響しなかった（外国人データ）。
（「Ⅴ．治療に関する項目 3．臨床成績（5）検証的試験」の項参照）

（6）〔成人〕ジルテック錠の承認時までの成人を対象とした調査 1,396 例中 189 例（13.5%）に副作用又は臨床検査値の異常変動が認められた。副作用は 1,396 例中 140 例（10.0%）にみられ、主なものは眠気 84 例（6.0%）、倦怠感 12 例（0.9%）、口渇 9 例（0.6%）、嘔気 7 例（0.5%）であった。また、主な臨床検査値の異常変動は AST（GOT）上昇 1.4%（17/1,182 例）、ALT（GPT）上昇 1.5%（18/1,181 例）、好酸球増多 0.8%（9/1,114 例）、総ビリルビン上昇 0.5%（6/1,133 例）であった。ジルテック錠の成人を対象とした市販後の使用成績調査 5,759 例（小児 163 例を含む）中 207 例（3.6%）に臨床検査値異常を含む副作用が認められた。主な副作用は眠気 149 件（2.6%）、倦怠感 9 件（0.2%）、口渇 9 件（0.2%）、浮動性めまい 8 件（0.1%）、頭痛 6 件（0.1%）等であった。（ジルテック錠再審査終了時）

〔小児〕ジルテックドライシロップの承認時までの小児を対象とした臨床試験 602 例中 25 例（4.2%）に臨床検査値異常変動を含む副作用が認められた。主なものは ALT（GPT）上昇 8 例（1.3%）、眠気 6 例（1.0%）であった。

小児を対象とした市販後の特定使用成績調査 3,157 例中 42 例（1.3%）に副作用が認められた。主な副作用は傾眠 22 件（0.7%）であった。（ジルテック錠 5 及びドライシロップ 1.25%再審査終了時）

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」の項参照）

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名

（1）和名

ジルテック®錠 5、錠 10

ジルテック®ドライシロップ 1.25％

（2）洋名

Zyrtec® Tablet 5，Tablet 10

Zyrtec® Dry syrup 1.25％

（3）名称の由来

cetirizine の下線部の逆順 Ziritec より命名した。

2．一般名

（1）和名（命名法）

セチリジン塩酸塩（JAN）

（2）洋名（命名法）

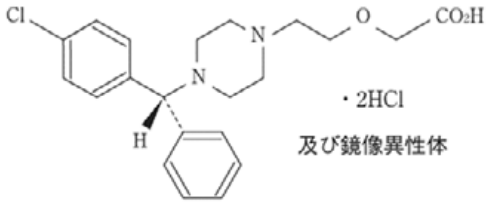
Cetirizine Hydrochloride（JAN）

Cetirizine（INN）

（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：$C_{21}H_{25}ClN_2O_3$・2HCl

分子量：461.81

5．化学名（命名法）

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

治験番号：SM-12800

7. CAS 登録番号

83881-52-1（Cetirizine Hydrochloride）
83881-51-0（Cetirizine）

Ⅲ．有効成分に関する項目

1．物理化学的性質

（1）外観・性状

白色の結晶性の粉末でにおいはなく、味はわずかに苦い。

（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。

セチリジン塩酸塩の各種溶媒に対する溶解性（22～23℃）

溶媒	1g を溶かすのに要する溶媒量（mL）	溶解性
水	1 未満	極めて溶けやすい
メタノール	9～11	やや溶けやすい
エタノール（99.5）	110～130	溶けにくい
アセトニトリル	2800～3000	極めて溶けにくい
アセトン	5400～5900	極めて溶けにくい
エーテル	10000 以上	ほとんど溶けない

（3）吸湿性

25℃、RH50％及び 75％、42 日間で調べた結果、吸湿性を示さなかった。
25℃、RH94％での吸湿性は 24 時間で 0.8％まで経時的に増大し、その後は一定となり 0.5～0.8％の値で推移した。

（4）融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：204～210℃（分解）

（5）酸塩基解離定数

pKa_1=2.85、pKa_2=8.33

（6）分配係数

pH3～9 付近では有機層に分配されやすく、pH1 及び pH11 では両層に分配される。
オクタノール：水（容量比 1：2、1：1、2：1）

pH	1	3	5	7	9	11
分配係数	1.0	12.5	24.7	24.3	12.8	1.1

（3 種の容量比における平均値）

（7）その他の主な示性値

紫外吸収スペクトル：波長 230～234nm に吸収の極大を示す。
結晶多形：存在しないと推定される。
旋光性：ラセミ体であり光学的に不活性なため旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

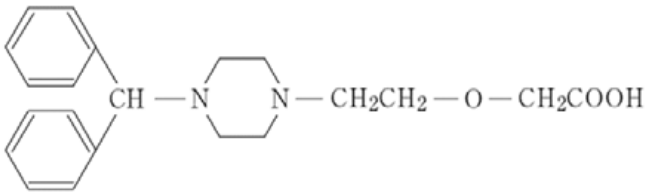
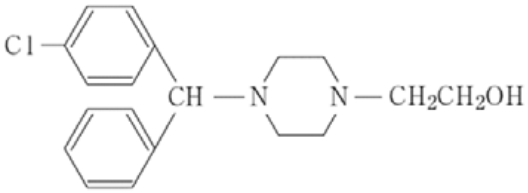
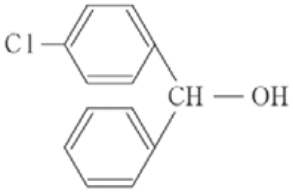
（1）各種条件下における安定性

試験		条件			保存状態	保存期間	結果*
		温度	湿度	光			
苛酷試験	温度	50℃	—	暗所	褐色ガラス瓶（密栓）	3 ヵ月	変化なし
	湿度	25℃	85%RH	暗所	褐色ガラス瓶（開栓）	3 ヵ月	変化なし
		40℃	75%RH	暗所	褐色ガラス瓶（開栓）	3 ヵ月	変化なし
	光	室温	—	蛍光灯 1000lx	無色ガラスシャーレ（密閉）	50 日	変化なし
長期保存試験		室温	—	暗所	褐色ガラス瓶（密栓）	36 ヵ月	変化なし

＊測定項目：性状、確認試験、乾燥減量、含量、分解物の検索

（2）強制分解による生成物

次の 3 種であった。

名称	化学構造
デスクロロセチリジン	
1410	
p-クロロベンズヒドロール	

3. 有効成分の確認試験法

日局「セチリジン塩酸塩」による。

4. 有効成分の定量法

日局「セチリジン塩酸塩」による。

Ⅳ．製剤に関する項目

1．剤形

（1）剤形の区別、外観及び性状

錠 5、錠 10：錠剤（フィルムコート錠）

	外観	外形	直径	厚さ	質量
錠 5	白色		約 6mm	約 3mm	約 88mg
錠 10	白色		約 7mm	約 3mm	約 119mg

ドライシロップ 1.25％：ドライシロップ剤

主薬含量	外観	におい	味
12.5mg/g	白色～微灰白色	芳香がある	甘く、わずかに苦い

（本剤は、用時溶解して服用するシロップ剤である。）

（2）製剤の物性

ドライシロップ：

粒度：18 号（850μm）残留　0％
18 号通過 30 号（500μm）残留　5％以下
200 号（75μm）通過　10％以下

（3）識別コード

錠 5：622、錠 10：623［本体、包装（PTP）に記載］

（4）pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

ドライシロップ剤：本品のセチリジン塩酸塩 12.5mg に対する量（粉末 1g）を正確に量り、水 10mL を正確に加えて溶かした液につき、pH 測定法により試験を行うとき、pH は 5.0～7.0 である。

2．製剤の組成

（1）有効成分（活性成分）の含量

錠 5：1 錠中日局セチリジン塩酸塩 5mg を含有する。
錠 10：1 錠中日局セチリジン塩酸塩 10mg を含有する。
ドライシロップ 1.25％：1g 中日局セチリジン塩酸塩 12.5mg を含有する。

（2）添加物

錠 5、錠 10

乳糖水和物、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 400

ドライシロップ 1.25％

β-シクロデキストリン、アセスルファムカリウム、クエン酸ナトリウム水和物、乳糖水和物、D-マンニトール、香料

（3）その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

錠 5、錠 10

温度、湿度、光に対して安定であった。

	試験		条件			保存状態	保存期間	結果*
			温度	湿度	光			
錠 5	苛酷試験	温度	50℃	—	暗所	褐色ガラス瓶（密栓）	3 ヵ月	変化なし
		湿度	25℃	85%RH	暗所	褐色ガラス瓶（開栓）	3 ヵ月	変化なし
		光	室温	—	蛍光灯 1000 lx	無色ガラスシャーレ（密閉）	50 日	変化なし
	長期保存試験		25℃	—	暗所	PTP 包装 1)	36 ヵ月	変化なし
	加速試験		40℃	75%RH	暗所	PTP 包装 1)	6 ヵ月	変化なし
						輸送形態 2)	6 ヵ月	
錠 10	加速試験		40℃	75%RH	暗所	PTP 包装 1)	6 ヵ月	変化なし
						輸送形態 2)	6 ヵ月	

1）材質：ポリ塩化ビニル、アルミニウム箔

2）ポリエチレン袋に入れポリエチレン容器包装（乾燥剤入）

＊測定項目：性状、確認試験、崩壊試験、含量、分解物の検索

ドライシロップ 1.25%

本品はボトル包装（ポリエチレン製ボトル容器（乾燥剤入り））又は分包（ポリエチレン/アルミ袋）にて室温で 36 ヵ月間保存するとき、分解物が総量で約 0.3%増加するが規格範囲内であるため問題となる程度ではなく、長期間安定であると推察された。

試験		条件			保存状態	保存期間	結果*
		温度	湿度	光			
苛酷試験	温度	40℃	—	暗所	無包装	3 ヵ月	1 ヵ月目より白色の塊を認め、分解物の含量は総量で約 0.1%認められた。
		70℃	—	暗所	無包装	1 ヵ月	2 週目より微黄色の塊を認め、分解に伴う含量の低下及び多くの分解物の生成が認められた。
	湿度	25℃	75%RH	暗所	無包装	3 ヵ月	1 ヵ月目より水分の増加が観察され、分解物の含量は増加傾向を認め、3 ヵ月の保存で総量が約 1.3%認められた。また 1 ヵ月目より白色の塊を認めた。
		40℃	75%RH	暗所	無包装	1 ヵ月	2 週目より白色の塊を認め、水分の増加が認められた。
	光	25℃	60%RH	オプション2[1)]	無包装	60 万 lx・hr	表面が微黄色に着色した。
						120 万 lx・hr	表面が微黄色に着色した。
					ボトル包装[2)]	60 万 lx・hr	変化なし
						120 万 lx・hr	変化なし
長期保存試験		25℃	60%RH	暗所	ボトル包装[2)]	36 ヵ月	分解物の含量は総量で最大約 0.3%認められた。
中間的試験		30℃	60%RH	暗所	ボトル包装[2)]	12 ヵ月	分解物の含量は総量で最大約 0.2%認められた。
加速試験		40℃	75%RH	暗所	ボトル包装[2)]	6 ヵ月	分解物の含量は総量で最大約 0.3%認められた。
相対加速試験		40℃	75%RH	暗所	ボトル包装[2)]	6 ヵ月	ボトル包装と 0.8g 分包は同等であった。
					0.8g 分包[3)]	6 ヵ月	
相対比較試験		40℃	75%RH	暗所	ボトル包装[2)]	3 ヵ月	ボトル包装と 0.4g 分包は同等であった。
					0.4g 分包[3)]	3 ヵ月	

1）オプション 2：次の白色蛍光ランプと近紫外蛍光ランプによる照射を同一の試料に用いた。

①ISO10977（1993）に類似の出力を示す白色蛍光ランプ

②320～400nm にスペクトル分布を持ち、350～370nm に放射エネルギーの極大を示す近紫外蛍光ランプ

2）材質：ポリエチレン製ボトル容器包装（乾燥剤入り）

3）材質：ポリエチレン/アルミ袋

＊測定項目：性状、純度試験・類縁物質、含量、水分

5. 調製法及び溶解後の安定性

ジルテックドライシロップ 1.25%

溶解後の安定性については、セチリジン塩酸塩として 10mg 相当量を 10mL の精製水に溶解後 24 時間室温保存し、溶状、pH 及び含量を測定した（(　) 内は 24 時間後のセチリジン塩酸塩残存率)。

ロット	溶状	pH	含量（%）
A	無色透明	6.2	97.6（99.6）
B	無色透明	6.0	99.3（99.4）
C	無色透明	6.0	98.5（98.7）

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

ジルテックドライシロップ 1.25%との併用が予想される薬剤につき配合変化試験を行った。
詳しくは「XⅢ．備考」の項参照。

7. 溶出性

錠 5、錠 10

日本薬局方溶出試験法パドル法

条件：回転数 50rpm

試験液：水

結果：5mg 錠では試験開始後 15 分で溶出率が 85%以上である。
10mg 錠では試験開始後 30 分で溶出率が 80%以上である。

ドライシロップ 1.25%

日本薬局方溶出試験法パドル法

条件：回転数 50rpm

試験液：水

結果：試験開始後 15 分で溶出率が 85%以上である。

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

錠 5、錠 10

日局「セチリジン塩酸塩錠」による。

ドライシロップ 1.25%

(1) 呈色反応：N, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド・無水エタノール試液により赤褐色を呈する。
(2) 薄層クロマトグラフィー：試料溶液は、標準溶液と同じ Rf 値にスポットを認める。

10. 製剤中の有効成分の定量法

錠5、錠10

日局「セチリジン塩酸塩錠」による。

ドライシロップ1.25%

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

強制分解による分解物が考えられる。

（「Ⅲ．有効成分に関する項目　2．有効成分の各種条件下における安定性（2）強制分解による生成物」の項参照）

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

該当しない

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

［10mg 錠］

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として 1 回 10mg を 1 日 1 回、就寝前に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は 1 日 20mg とする。

［5mg 錠］

〔成人〕

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として 1 回 10mg を 1 日 1 回、就寝前に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、最高投与量は 1 日 20mg とする。

〔小児〕

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

［ドライシロップ剤］

〔成人〕

通常、成人には 1 回 0.8g（セチリジン塩酸塩として 10mg）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 1.6g（セチリジン塩酸塩として 20mg）とする。

〔小児〕

通常、2 歳以上 7 歳未満の小児には 1 回 0.2g（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。

通常、7 歳以上 15 歳未満の小児には 1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 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（「薬物動態」の項参照）。
なお、クレアチニンクリアランスが 10mL/min 未満の患者への投与は禁忌である。

成人患者の腎機能に対応する用法・用量の目安（外国人データ）

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

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

解説：企業中核データシートに基づいて記載した。

3. 臨床成績

（1）臨床データパッケージ

〔成人〕

該当しない

〔小児〕

臨床試験一覧表

試験の種類	試験目的	試験デザイン	被験者
薬物動態（PK）	日本人成人並びに外国人成人及び小児における単回及び反復投与時の薬物動態	12 試験の統合解析	日本人成人並びに外国人成人及び小児
母集団薬物動態解析（PPK）	日本人小児における薬物動態	4 試験の統合解析	アレルギー素因を有する小児（日本人）
母集団薬物動態解析（PPK）	日本人小児及び外国人小児における薬物動態	7 試験の統合解析	アレルギー素因を有する小児（日本人及び外国人）
薬力学（PD）	抗ヒスタミン作用の強さ及び持続時間の検討	二重盲検クロスオーバー、用量比較	健康小児 6～12 歳（外国人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	プラセボに対する優越性の検証	二重盲検並行群間比較	通年性アレルギー性鼻炎 2 歳以上 15 歳未満（日本人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	ケトチフェンに対する非劣性の検証	二重盲検並行群間比較	通年性アレルギー性鼻炎 3 歳以上 15 歳未満（日本人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	有効性及び安全性についてケトチフェンとの比較検討	二重盲検並行群間比較	通年性アレルギー性鼻炎 7 歳以上 15 歳未満（日本人）
有効性 安全性	有効性及び安全性についてプラセボとの比較検討	二重盲検並行群間比較	通年性アレルギー性鼻炎 6～12 歳（外国人）
有効性 安全性	有効性及び安全性についてプラセボとの比較検討	二重盲検並行群間比較	季節性アレルギー性鼻炎 6～12 歳（外国人）
有効性 安全性	有効性及び安全性について用量反応性の検討	二重盲検並行群間比較	通年性アレルギー性鼻炎 6～12 歳（外国人）
有効性 安全性	有効性及び安全性についてオキサトミドとの比較検討	二重盲検並行群間比較	通年性アレルギー性鼻炎 2～6 歳（外国人）
有効性 安全性	有効性及び安全性についてプラセボとの比較検討	二重盲検並行群間比較	季節性アレルギー性鼻炎 6 歳以上 11 歳（外国人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	長期投与における有効性及び安全性の検討	非盲検	通年性アレルギー性鼻炎 2 歳以上 15 歳未満（日本人）

試験の種類	試験目的	試験デザイン	被験者
安全性	臨床試験での安全性併合解析	海外小児臨床試験のまとめ	0.5 歳以上 13 歳未満（外国人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	ケトチフェンに対する非劣性の検証	二重盲検並行群間比較	アトピー性皮膚炎 3 歳以上 15 歳未満（日本人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	長期投与における有効性及び安全性の検討	非盲検	各種皮膚疾患 2 歳以上 15 歳未満（日本人）
有効性 安全性	有効性及び安全性についてプラセボとの比較検討	二重盲検並行群間比較	慢性特発性蕁麻疹 2～16 歳（外国人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	有効性及び安全性についてオキサトミドとの比較検討	二重盲検並行群間比較	慢性特発性蕁麻疹 2～6 歳（外国人）
第Ⅲ相 有効性 安全性	有効性及び安全性についてロラタジンとの比較検討	二重盲検並行群間比較	急性蕁麻疹 2～12 歳（外国人）

(2) 臨床効果

〔成人〕

国内延べ 178 施設で実施されたアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症 636 例における一般臨床試験及び二重盲検比較試験の概要は次のとおりであった[1～4]。

疾患名	症例数	著明改善	中等度改善	軽度改善	不変	悪化	改善率*
アレルギー性鼻炎	133	17	49	34	31	2	49.6%
蕁麻疹	273	118	93	37	23	2	77.3%
湿疹・皮膚炎	123	20	61	31	7	4	65.9%
痒疹	52	11	19	14	7	1	57.7%
皮膚そう痒症	55	19	22	10	4	0	74.5%

（10mg1 日 1 回投与例について集計）

*：中等度改善以上

1）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望 1994；37：754
2）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 1994；28：2107
3）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 1994；28：2147
4）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 1994；28：2163

また、アレルギー性鼻炎及び蕁麻疹を対象とした二重盲検比較試験において本剤の有用性が確認されている。

〔小児〕

1）アレルギー性鼻炎

国内延べ 47 施設で実施されたアレルギー性鼻炎 158 例を対象とした二重盲検比較試験及び一般臨床試験の概要は次のとおりであった。

①二重盲検比較試験（投与期間 2 週間、解析対象 122 例）

国内 28 施設で通年性アレルギー性鼻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「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）の変化量を下表に示した。その結果から、

プラセボに対する本薬の優越性が検証された[5)]。なお、小児の通年性アレルギー性鼻炎に対するケトチフェンフマル酸塩を対照とする二重盲検比較試験では、有効性について非劣性は示されなかった[6)]。

全治療評価期間における総合鼻症状スコアの変化量

群	症例数	スコア[a)]		変化量[b)]	
		ベースライン評価期間	全治療評価期間		
		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[c)]（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	変化量の差の点推定値[c)]	95%信頼区間[c)]	p 値
	0.60	［0.15～1.05］	p=0.0087

a) 総合鼻症状スコアが 10 を超える患児は組入れから除外

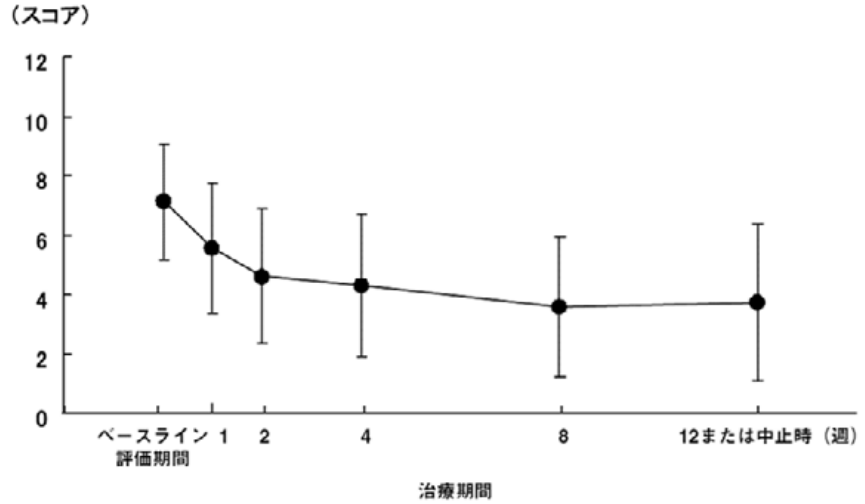
b) 変化量=｛ベースライン評価期間（治験薬投与開始日の前 3 日間）－全治療評価期間｝

c) 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

5）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2007）
6）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2005）

②一般臨床試験（投与期間 12 週間、解析対象 36 例）

国内 19 施設で通年性アレルギー性鼻炎を対象に実施され、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）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[7)]。



7）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした長期投与試験（2005）

2）蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

国内延べ 54 施設で実施された蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症 207 例を対象とした二重盲検比較試験及び一般臨床試験の概要は次のとおりであった。

①二重盲検比較試験（投与期間 2 週間、解析対象 134 例）

国内 29 施設で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」2 週間投与した。そう痒の重症度の変化量を下表に示した。その結果から、ケトチフェンフマル酸塩に対する本薬の非劣性が検証された [8)]。

全治療評価期間における「そう痒の重症度」の変化量

群	症例数 [a)]	「そう痒の重症度」		変化量 [b)]	
		ベースライン評価期間	全治療評価期間		
		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 [c)]（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	変化量の差の点推定値[c)]	95%信頼区間[c)]
	-0.08	［-0.22～0.06］

a) 変化量が算出可能な被験者数

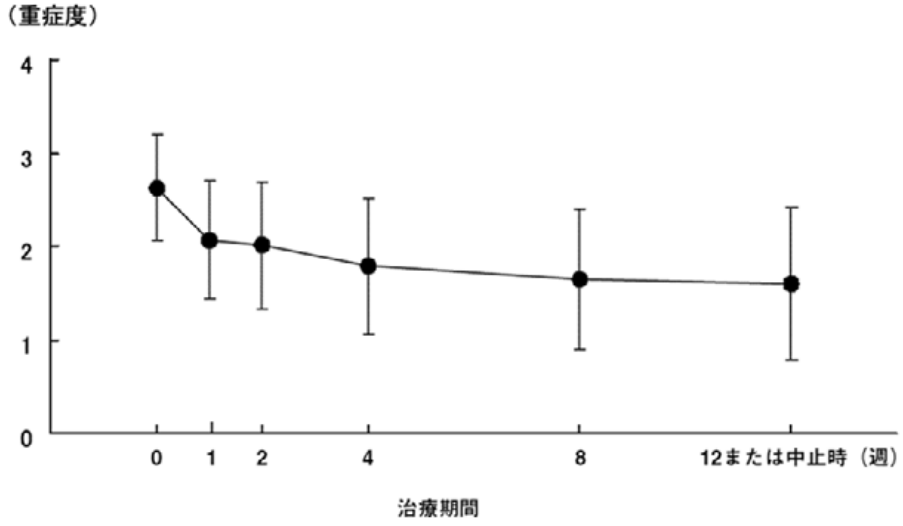
b) 変化量=｛ベースライン評価期間（治験薬投与開始日の前 3 日間）－全治療評価期間｝

c) 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

8）社内資料：小児アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験

②一般臨床試験（投与期間 12 週間、解析対象 73 例）

国内 25 施設で蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症を対象に実施され、そう痒の重症度の治療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 [9)]。



9）社内資料：小児各種皮膚疾患を対象とした長期投与試験

3）眠気に対する影響

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[6、7、8、9]。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[5]。

5）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2007）
6）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2005）
7）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした長期投与試験（2005）
8）社内資料：小児アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験
9）社内資料：小児各種皮膚疾患を対象とした長期投与試験

(3) 臨床薬理試験

〔成人〕

健康成人 15 例を対象に、セチリジン塩酸塩 2.5mg（2.5mg 錠 1 錠）、5mg（5mg 錠 1 錠）、10mg（10mg 錠 1 錠）、20mg（10mg 錠 2 錠）、30mg（10mg 錠 3 錠）を単回投与した結果、一般症状、血圧、心拍数及び臨床検査所見に影響は認められなかった。

また、健康成人 22 例を対象に、セチリジン塩酸塩 20mg（10mg 錠 2 錠）×1 回/日、10mg（10mg 錠 1 錠）×2 回/日、30mg（10mg 錠 3 錠）×1 回/日を 7 日間反復投与した結果も、単回投与と同様の結果であった[10]。

10）笹　征史ほか：臨床薬理 1995；26：509

注）本剤の成人における承認用法・用量は、1 回 10mg を 1 日 1 回である。（適宜増減可能であるが、最高投与量は 1 日 20mg である。）

〔小児〕

該当資料なし

(4) 探索的試験

〔成人〕

該当資料なし

〈参考〉本剤はアレルギー性鼻炎、慢性蕁麻疹に対し、海外において 1 日 1 回投与で承認されている。
また、本邦で行った忍容性試験（第 I 相試験）で検討した体内動態パラメータ、安全性等は海外の成績とよく一致していた。そこで、海外のデータを参考に臨床上の有効性・安全性を推定することは可能であると考えられたことから、用量反応探索試験（前期第 II 相試験）を省略し、無作為化並行用量反応試験（後期第 II 相試験）から開始した。

〔小児〕

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

〔成人〕

①通年性アレルギー性鼻炎を対象とした至適用量検討のための二重盲検比較試験

成人通年性アレルギー性鼻炎患者を対象に、セチリジン塩酸塩を 1 日 1 回 5mg（5mg 錠 1 錠、52 例）、10mg（10mg 錠 1 錠、51 例）、20mg（10mg 錠 2 錠、53 例）を 2 週間投与で検討した結果、最終全般改善度の「中等度改善」以上の改善率で 10mg 群が 5mg 群に比べ優れる傾向が認められた。また、概括安全度に差は認められなかったものの、20mg で倦怠感の発現が認められた。
これらから至適用量は 1 日 1 回 10mg 投与が適当と考えられた [1)]。

1）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望 1994；37：754

②慢性蕁麻疹を対象とした至適用量検討のための二重盲検比較試験

成人慢性蕁麻疹患者を対象に、セチリジン塩酸塩を 1 日 1 回 5mg（5mg 錠 1 錠、85 例）、10mg（10mg 錠 1 錠、87 例）、20mg（10mg 錠 2 錠、87 例）を 2 週間投与で検討した結果、全般改善度での「中等度改善」以上の改善率と概括安全度で 3 群間に差は認められなかったが、副作用の件数は用量の増加に伴い上昇した。
これらから至適用量は 1 日 1 回 10mg 投与が適当と考えられた [2)]。

2）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 1994；28：2107

注）本剤の成人における承認用法・用量は、1 回 10mg を 1 日 1 回である。（適宜増減可能であるが、最高投与量は 1 日 20mg である。）

〔小児〕

〈参考：外国人データ（実施国：ドイツ、オランダ)〉 [11)]

目的：本剤の有効性、安全性、用量反応関係の検証

試験デザイン	多施設共同、ランダム化、二重盲検、並行群間比較、用量反応試験
対象	外国人の 6～12 歳の通年性アレルギー性鼻炎患児
主な登録基準	非季節性抗原に対する皮膚試験又は RAST が陽性で、くしゃみ、鼻汁、鼻閉塞の症状がある患児

<table>
<tr><td>主な除外基準</td><td>アレルギーを示す花粉の飛散期、治療の変更又はベタメタゾン 200μg/日以上に相当する副腎皮質ホルモンの投与を要する気管支喘息、治療の変更又は副腎皮質ホルモンの投与を要するアトピー性皮膚炎、血管運動性及び感染性鼻炎の患児</td></tr>
<tr><td>試験方法</td><td>セチリジン塩酸塩 2.5、5 又は 10mg を含む錠剤あるいはプラセボ錠を 1 日 1 回 2 週間投与</td></tr>
<tr><td>主要評価項目</td><td>くしゃみ、鼻汁、鼻閉、鼻粘膜のそう痒、眼のそう痒の 5 症状のスコア［代表者が 0（なし）～3（高度）の 4 段階で判定］のうち最も高いものが 1 以下であった日の割合</td></tr>
<tr><td>副次評価項目</td><td>全般改善度［医師が 0（悪化）～4（著明改善）の 5 段階で判定］</td></tr>
<tr><td>結果</td><td>主要評価項目
最も高いスコアが 1 以下であった日の割合（%）
<table>
<tr><th>群</th><th>平均値±標準誤差</th></tr>
<tr><td>プラセボ群</td><td>37.4±3.94</td></tr>
<tr><td>2.5mg 群</td><td>46.4±3.75</td></tr>
<tr><td>5mg 群</td><td>46.9±3.99</td></tr>
<tr><td>10mg 群</td><td>50.3±4.26</td></tr>
</table>
副次評価項目
全般改善度（%）
<table>
<tr><th>群</th><th>「中等度改善」以上/「著明改善」</th></tr>
<tr><td>プラセボ群</td><td>37.5/11.3</td></tr>
<tr><td>2.5mg 群</td><td>51.8/10.8</td></tr>
<tr><td>5mg 群</td><td>66.3/15.7</td></tr>
<tr><td>10mg 群</td><td>66.2/21.6</td></tr>
</table>
安全性
<table>
<tr><th></th><th>プラセボ群
（n=83）</th><th>2.5mg 群
（n=84）</th><th>5mg 群
（n=85）</th><th>10mg 群
（n=76）</th></tr>
<tr><td>有害事象発現例数</td><td>15（18.1%）</td><td>21（25.0%）</td><td>12（14.1%）</td><td>17（22.4%）</td></tr>
<tr><td>因果関係</td><td></td><td></td><td></td><td></td></tr>
<tr><td>どちらともいえない</td><td>2（2.4%）</td><td>3（3.6%）</td><td>2（2.4%）</td><td>7（9.2%）</td></tr>
<tr><td>多分関連あり</td><td>1（1.2%）</td><td>0（0.0%）</td><td>0（0.0%）</td><td>0（0.0%）</td></tr>
<tr><td>関連あり</td><td>0（0.0%）</td><td>1（1.2%）</td><td>0（0.0%）</td><td>0（0.0%）</td></tr>
<tr><td>治験薬の投与中止に至った有害事象発現例数</td><td>1（1.2%）</td><td>4（4.8%）</td><td>2（2.4%）</td><td>1（1.3%）</td></tr>
</table></td></tr>
</table>

注）本剤の小児における承認用法・用量は以下のとおりである。

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

ドライシロップ：通常、2 歳以上 7 歳未満の小児には 1 回 0.2g（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。

通常、7 歳以上 15 歳未満の小児には 1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 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。

11）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（1992）

〈参考：外国人データ（実施国：ベルギー）〉[12)]

目的：本剤 10mg 1 日 1 回投与と 5mg 1 日 2 回投与の作用の強さ及び持続時間の比較検討

<table>
<tr><td>試験デザイン</td><td>ランダム化、二重盲検、クロスオーバー、用量比較試験</td></tr>
<tr><td>対象</td><td>5～13 歳の外国人健康小児</td></tr>
<tr><td>主な登録基準</td><td>ヒスタミン誘発皮膚反応試験でベースラインの膨疹が平均直径 8mm 以上の小児</td></tr>
<tr><td>主な除外基準</td><td>アトピー、腎、肝、心機能不全、血液学的疾患、感染症、ヒドロキシジン又は本剤に対する過敏症、試験結果に影響する可能性がある薬剤投与が疑われる疾患の小児</td></tr>
<tr><td>試験方法</td><td>一群にセチリジン塩酸塩を第 1 期に 10mg 1 日 1 回（OD）、第 2 期に 5mg 1 日 2 回（BID）各々3 日間投与、他方の群には逆の順に投与し、ヒスタミン誘発皮膚反応試験を実施</td></tr>
<tr><td>主要評価項目</td><td>初回投与 24 時間後及び最終投与 12 時間後の膨疹の表面積</td></tr>
<tr><td>副次評価項目</td><td>膨疹及び紅斑の抑制率</td></tr>
<tr><td rowspan="3">結果</td><td>主要評価項目
<table>
<tr><td rowspan="2">評価項目</td><td rowspan="2">評価時期</td><td colspan="3">表面積</td></tr>
<tr><td colspan="2">幾何平均値（mm^2）</td><td>比［95%信頼区間］</td></tr>
<tr><td></td><td></td><td>OD</td><td>BID</td><td>OD/BID</td></tr>
<tr><td rowspan="2">膨疹</td><td>初回投与　24 時間後</td><td>25.94</td><td>12.53</td><td>2.08［1.46～2.94］</td></tr>
<tr><td>最終投与　12 時間後</td><td>38.55</td><td>6.85</td><td>5.63［3.62～8.76］</td></tr>
</table>
膨疹の抑制効果は 5mg 1 日 2 回投与の方が強かった。</td></tr>
<tr><td>副次評価項目
<table>
<tr><td rowspan="2">評価項目</td><td rowspan="2">評価時期</td><td colspan="2">抑制率（%）
（中央値）</td></tr>
<tr><td>OD</td><td>BID</td></tr>
<tr><td rowspan="2">膨疹</td><td rowspan="2">最終投与</td><td>12 時間後</td><td>47.8</td><td>88.6</td></tr>
<tr><td>36 時間後</td><td>1.9</td><td>21.8</td></tr>
<tr><td rowspan="2">紅斑</td><td rowspan="2">最終投与</td><td>12 時間後</td><td>60.7</td><td>84.1</td></tr>
<tr><td>36 時間後</td><td>17.9</td><td>38.6</td></tr>
</table>
5mg 1 日 2 回投与の方が強い効果が長時間維持されていた。</td></tr>
<tr><td>安全性
<table>
<tr><td>用法</td><td>有害事象の発現率（%）
（発現症例数/評価対象症例数）</td></tr>
<tr><td>OD</td><td>17.5（11/63）</td></tr>
<tr><td>BID</td><td>11.1（7/63）</td></tr>
</table>
治験薬との因果関係は、いずれも「関連なし」あるいは「おそらく関連なし」であった。</td></tr>
</table>

5mg 1 日 2 回投与（BID）の方が 10mg 1 日 1 回投与（OD）よりも強い効果が長時間維持されていることが確認された。

注）本剤の小児における承認用法・用量は以下のとおりである。

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

ドライシロップ：通常、2 歳以上 7 歳未満の小児には 1 回 0.2g（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。

通常、7 歳以上 15 歳未満の小児には 1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 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。

12）社内資料：健康小児を対象とした二重盲検比較試験（1991）

2）比較試験

〔成人〕

①通年性アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験

成人通年性アレルギー性鼻炎患者を対象に、本剤 1 日 1 回 10mg（10mg 錠 1 錠、117 例）をケトチフェン 1mg×2 回/日（113 例）を対照として 4 週間投与で検討した結果、最終全般改善度では本剤群の「中等度改善」以上は 47.9%で、ケトチフェン群の 38.3%と同等であった（p=0.004、同等性検定）が、概括安全度については本剤の「安全性に問題なし」は 93.6%でケトチフェン群 76.2%に比し有意に優れていた（p<0.003、U 検定）[13)]。

13）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望 1995；38：116

②慢性蕁麻疹を対象とした二重盲検比較試験

成人慢性蕁麻疹患者を対象に、本剤 1 日 1 回 10mg（10mg 錠 1 錠、135 例）をケトチフェン 1mg×2 回/日(134 例)を対照として 2 週間投与で検討した結果､最終全般改善度では本剤の｢中等度改善｣以上は 82.2%でケトチフェン群 79.0%と同等であった（p=0.007、同等性検定）が、概括安全度では本剤の「安全性に問題なし」が 83.3%でケトチフェン群に比し有意に優れていた（p=0.033、U 検定）[14)]。

14）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 1994；28：2131

〔小児〕

①アレルギー性鼻炎を有する小児を対象とした二重盲検並行群間比較試験 [5)]

目的：本剤のプラセボに対する優越性の検証

試験デザイン	多施設共同、ランダム化、二重盲検、並行群間比較試験
対象	通年性アレルギー性鼻炎患児（2 歳以上、15 歳未満）
主な登録基準	・鼻炎症状が 6 ヵ月以上持続している患児 ・性別不問 ・外来 ・ハウスダスト及びダニに対する特異的 IgE 抗体検査の少なくとも一方が陽性の患児 ・鼻汁中好酸球数検査が陽性の患児 ・鼻症状スコアに基づいて算出した重症度スコアが 4 以上の患児
主な除外基準	・セチリジン塩酸塩製剤の成分又はヒドロキシジン、シクリジン、メクリジン、ブクリジンに対し過敏症の既往歴のある患児 ・治験期間が重複アレルゲンの花粉の飛散期に該当する患児 ・血管運動性鼻炎、好酸球増多性鼻炎の患児 ・治験薬の評価に影響を及ぼす程度と判断される鼻疾患を合併している患児 ・副腎皮質ステロイド薬による薬物治療を要する喘息を合併する患児 ・薬効評価に影響を及ぼす可能性がある薬剤を使用した患児 ・特異的免疫療法又は非特異的免疫療法を開始し、維持治療に達していない患児 ・鼻粘膜の縮小と変調を目的とした手術、鼻腔通気度の改善を目的とした鼻腔整復術又は鼻漏の改善を目的とした手術を施行されたことのある患児 ・急性上気道炎を併発した患児 ・ベースライン評価期間の鼻症状スコアを基に算出した総合鼻症状スコア（TNSS）の重症度スコアが 10 を超える患児
試験方法	セチリジン塩酸塩ドライシロップ（セチリジン塩酸塩として 2.5mg 又は 5mg）又はプラセボを 1 日 2 回 2 週間投与

<table>
<tr><td>主要評価項目</td><td>全治療評価期間における TNSS 変化量</td></tr>
<tr><td>副次評価項目</td><td>①TNSS の経時変化
②平均鼻症状スコアの経時変化
③各鼻症状スコアの 1 日平均の 4 症状合計（TDNSS）の経時変化
④全般改善度
⑤患者（被験者又は代諾者）の印象
⑥鼻所見</td></tr>
<tr><td rowspan="2">結果</td><td>主要評価項目
セチリジン群のプラセボ群に対する優越性が認められた（p=0.0087、共分散分析）。
（「(2) 臨床効果　〔小児〕1) アレルギー性鼻炎　①二重盲検比較試験」の項参照）</td></tr>
<tr><td>副次評価項目
①TNSS の経時変化
治療期第 2 週におけるベースライン評価期間からの変化量は、セチリジン群 2.23、プラセボ群 1.64 で、プラセボ群よりもセチリジン群において TNSS の改善が認められた。
②平均鼻症状スコアの経時変化
くしゃみ発作、鼻汁、鼻内そう痒感の各平均鼻症状スコアは、両群共に治療期開始翌日より速やかに減少したが、治療期を通してセチリジン群の方がプラセボ群よりも低値で推移し、治療期終了時までセチリジン群で持続的な減少が認められた。
③TDNSS の経時変化
両群共に治療期開始翌日より速やかに減少し、セチリジン群で治療期終了時まで持続的な減少が認められた。
④全般改善度
<table>
<tr><th rowspan="2">評価時期</th><th rowspan="2">群</th><th rowspan="2">症例数</th><th>「中等度改善」以上の改善率</th></tr>
<tr><th>症例数（%）</th></tr>
<tr><td rowspan="2">治療期第 2 週
開始日</td><td>セチリジン群</td><td>122</td><td>26（21.7）</td></tr>
<tr><td>プラセボ群</td><td>117</td><td>15（12.9）</td></tr>
<tr><td rowspan="2">最終観察日
又は中止時</td><td>セチリジン群</td><td>122</td><td>43（35.2）</td></tr>
<tr><td>プラセボ群</td><td>117</td><td>34（29.1）</td></tr>
</table>
両評価時期共に両群間に有意差は認められなかった。
⑤患者（被験者又は代諾者）の印象
<table>
<tr><th rowspan="2">評価時期</th><th rowspan="2">群</th><th rowspan="2">症例数</th><th>「よくなった」以上の好印象率</th></tr>
<tr><th>症例数（%）</th></tr>
<tr><td rowspan="2">治療期第 2 週
開始日</td><td>セチリジン群</td><td>122</td><td>13（10.8）</td></tr>
<tr><td>プラセボ群</td><td>117</td><td>10（8.6）</td></tr>
<tr><td rowspan="2">最終観察日
又は中止時</td><td>セチリジン群</td><td>122</td><td>30（24.6）</td></tr>
<tr><td>プラセボ群</td><td>117</td><td>29（24.8）</td></tr>
</table>
⑥鼻所見（下甲介粘膜の腫脹、下甲介粘膜の色調、水性分泌量）
各スコアが 0 又は 1 と判定された被験者の割合は、両群共に増加したが、推移に明らかな違いは認められなかった。</td></tr>
</table>

<table>
<tr><td>結果</td><td>安全性
<table>
<tr><td></td><td>セチリジン群
（n=122）</td><td>プラセボ群
（n=117）</td></tr>
<tr><td>有害事象発現件数</td><td>46</td><td>25</td></tr>
<tr><td>有害事象発現例数</td><td>33（27.0%）</td><td>22（18.8%）</td></tr>
<tr><td>因果関係を否定できない有害事象発現例数</td><td>12（9.8%）</td><td>2（1.7%）</td></tr>
<tr><td>重篤な有害事象発現例数</td><td>0</td><td>0</td></tr>
<tr><td>治験薬の投与中止に至った有害事象発現例数</td><td>2（1.6%）</td><td>1（＜1%）</td></tr>
</table>
重篤な有害事象や重症度が高度の有害事象は認められず、通年性アレルギー性鼻炎小児患者に対するセチリジンの忍用性は良好であると考えられた。抗ヒスタミン薬の副作用として傾眠、倦怠感、口渇の症状が知られているが、セチリジン投与で傾眠 1 例（1%未満）が認められたのみであった。</td></tr>
</table>

5）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2007）

②アトピー性皮膚炎を有する小児を対象とした二重盲検並行群間比較試験 [8)]

目的：本剤のケトチフェンに対する非劣性の検証

試験デザイン	多施設共同、ランダム化、ダブルダミー、二重盲検、並行群間比較試験
対象	アトピー性皮膚炎を有する小児（3 歳以上、15 歳未満）
主な登録基準	日本皮膚科学会「アトピー性皮膚炎の定義・診断基準（アトピー性皮膚炎治療ガイドライン 2004 改訂版）」に準じて、アトピー性皮膚炎と診断された患児
主な除外基準	（1）セチリジン塩酸塩製剤、ケトチフェンフマル酸塩製剤及び酪酸ヒドロコルチゾン製剤の成分、又はヒドロキシジン、シクリジン、メクリジン、ブクリジンに対し過敏症の既往歴のある患児 （2）癲癇等の痙攣性疾患、又はこれらの既往歴のある患児 （3）細菌・真菌・スピロヘータ・ウイルス皮膚感染症、及び動物性皮膚疾患（疥癬、けじらみ等）を有する患児 （4）鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎を有する患児 （5）潰瘍（ベーチェット病は除く）、第 2 度深在性以上の熱傷・凍傷を有する患児
試験方法	セチリジン塩酸塩ドライシロップ（セチリジン塩酸塩として 2.5mg 又は 5mg）又はケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ（ケトチフェンとして 0.6mg 又は 1mg）を 1 日 2 回 2 週間投与
主要評価項目	全治療評価期間における「そう痒の重症度」の変化量
副次評価項目	①そう痒の重症度の経時変化 ②総合そう痒スコア ③主要そう痒スコアの経時変化 ④患者（被験者又は代諾者）の印象 ⑤そう痒を伴う部位の範囲の改善度

結果

主要評価項目
セチリジン群のケトチフェン群に対する非劣性が検証された。
（「(2) 臨床効果　〔小児〕2）蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒　①二重盲検比較試験」の項参照）

副次評価項目
①そう痒の重症度の経時変化
　両群共に経時的に低下しており、両群間に大きな違いは認められなかった。
②総合そう痒スコア
　両群の推移に大きな違いは認められなかった。
③主要そう痒スコアの経時変化
　両群共に経時的に減少し、推移に大きな違いは認められなかった。
④患者（被験者又は代諾者）の印象

評価時期	群	症例数	「よくなった」以上の好印象率 症例数（%） ［95%信頼区間］
治療期第 2 週 開始日	セチリジン群	136	40（29.6） ［22.1～38.1］
	ケトチフェン群	126	47（37.3） ［28.9～46.4］
最終観察日 又は中止時	セチリジン群	136	64（47.8） ［39.1～56.6］
	ケトチフェン群	126	64（50.8） ［41.7～59.8］

⑤そう痒を伴う部位の範囲の改善度

評価時期	群	症例数	75%以上の減少率 症例数（%） ［95%信頼区間］
治療期第 2 週 開始日	セチリジン群	136	18（13.3） ［8.1～20.3］
	ケトチフェン群	126	23（18.3） ［11.9～26.1］
最終観察日 又は中止時	セチリジン群	136	47（35.1） ［27.0～43.8］
	ケトチフェン群	126	40（31.7） ［23.7～40.6］

安全性

	セチリジン群 (n=148)	ケトチフェン群 (n=135)
有害事象発現件数	31	38
有害事象発現例数	27（18.2%）	32（23.7%）
因果関係を否定できない有害事象発現例数	4（2.7%）	13（9.6%）
重篤な有害事象発現例数	2（1.4%）	0
治験薬の投与中止に至った有害事象発現例数	3（2.0%）	0

副作用の種類及び発現頻度において、セチリジン群に特異的に発現した副作用はなく、臨床的に問題となるものは認められなかった。

8）社内資料：小児アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験

③精神運動発達

〈参考：外国人データ（実施国：英国、フランス、ベルギー他）〉[15、16、17)]

目的：本剤の精神運動発達に与える影響のプラセボとの比較評価

<table>
<tr><td>試験デザイン</td><td>多施設共同、ランダム化、二重盲検、並行群間比較試験</td></tr>
<tr><td>対象</td><td>アトピー性皮膚炎患児（組み入れ時：1～2 歳）</td></tr>
<tr><td>主な登録基準</td><td>両親又は兄弟、姉妹のうち少なくとも 1 名にアトピー性疾患歴を有する患児</td></tr>
<tr><td>主な除外基準</td><td>喘息、慢性肺疾患、重篤な神経学的又は精神学的障害の患児等</td></tr>
<tr><td>試験方法</td><td>セチリジン塩酸塩 0.25mg/kg 又はプラセボを 1 日 2 回 18 ヵ月間投与</td></tr>
<tr><td>主要評価項目</td><td>喘息の発現</td></tr>
<tr><td>副次評価項目</td><td>行動及び認知</td></tr>
<tr><td rowspan="3">結果</td><td>主要評価項目</td></tr>
<tr><td>副次評価項目
投与中又は投与後における精神運動発達に 2 群間で有意差はなかった（反復測定分散分析）。</td></tr>
<tr><td>安全性
<table>
<tr><td></td><td>セチリジン群
（n=399）</td><td>プラセボ群
（n=396）</td></tr>
<tr><td>有害事象発現例数</td><td>393（98.5%）</td><td>391（98.7%）</td></tr>
<tr><td>重篤な有害事象発現例数</td><td>37（9.3%）</td><td>54（13.6%）</td></tr>
<tr><td>因果関係を否定できない重篤な有害事象発現例数</td><td>1（0.3%）</td><td>5（1.3%）</td></tr>
<tr><td>治験薬の投与中止に至った有害事象発現例数</td><td>11（2.8%）</td><td>15（3.8%）</td></tr>
<tr><td>神経学的症状</td><td>65（16.3%）</td><td>55（13.9%）</td></tr>
<tr><td>因果関係を否定できない神経学的症状</td><td>1（0.3%）</td><td>2（0.5%）</td></tr>
</table></td></tr>
</table>

注）本剤の小児における承認用法・用量は以下のとおりである。

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

ドライシロップ：通常、2 歳以上 7 歳未満の小児には 1 回 0.2g（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。

通常、7 歳以上 15 歳未満の小児には 1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 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。

15）ETAC Study Group：Pediatr Allergy Immunol 1998；9：116
16）Simons FER，et al：J Allergy Clin Immunol 1999；104：433
17）Stevenson J，et al：Pediatric Research 2002；52：251

3）安全性試験

〔成人〕

該当資料なし（長期投与試験及び薬物依存性試験について該当資料なし）

〔小児〕

①アレルギー性鼻炎を有する小児を対象とした長期投与試験[7)]

目的：本剤の長期投与（12 週間）における有効性、安全性の検討

試験デザイン	非盲検、長期投与試験
対象	通年性アレルギー性鼻炎患児（2 歳以上、15 歳未満）
主な登録基準	・鼻炎症状が 6 ヵ月以上持続している患児 ・性別不問 ・外来 ・ハウスダスト及びダニに対する特異的 IgE 抗体検査の少なくとも一方が陽性の患児 ・鼻汁中好酸球数検査が陽性の患児 ・鼻症状スコアに基づいて算出した重症度スコアが 4 以上の患児
主な除外基準	・セチリジン塩酸塩製剤の成分又はヒドロキシジン、シクリジン、メクリジン、ブクリジンに対し過敏症の既往歴のある患児 ・治験期間が重複アレルゲンの花粉の飛散期に該当する患児 ・血管運動性鼻炎、好酸球増多性鼻炎の患児 ・治験薬の評価に影響を及ぼす程度と判断される鼻疾患を合併している患児 ・副腎皮質ステロイド薬による薬物治療を要する喘息を合併する患児 ・薬効評価に影響を及ぼす可能性がある薬剤を使用した患児 ・特異的免疫療法又は非特異的免疫療法を開始し、維持治療に達していない患児 ・鼻粘膜の縮小と変調を目的とした手術、鼻腔通気度の改善を目的とした鼻腔整復術又は鼻漏の改善を目的とした手術を施行されたことのある患児 ・抗ヒスタミン薬による治療を要するアトピー性皮膚炎又は蕁麻疹を合併する患児 ・急性上気道炎を併発した患児
試験方法	セチリジン塩酸塩ドライシロップ（セチリジン塩酸塩として 2.5mg 又は 5mg）を 1 日 2 回 12 週間投与
評価項目	有効性 ①総合鼻症状スコア（TNSS）の経時変化 ②平均鼻症状スコアの経時変化 ③各鼻症状スコアの 1 日平均の 4 症状合計（TDNSS）の経時変化 ④全般改善度 ⑤患者（被験者又は代諾者）の印象 ⑥鼻所見 安全性

<table>
<tr><td rowspan="2">結果</td><td>有効性</td><td>
①TNSS の経時変化
（「(2) 臨床効果　〔小児〕1）アレルギー性鼻炎　②一般臨床試験」の項参照）
②平均鼻症状スコアの経時変化
くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感の各平均鼻症状スコアは、治療期第 2 週までは速やかに、その後は緩やかに減少し、治療期第 12 週まで安定して低値が持続した。
③TDNSS の経時変化
治療期第 2 週までは速やかに、その後は緩やかに減少し、治療期第 12 週まで安定してスコアの改善が持続した。
④全般改善度
<table>
<tr><td rowspan="2">評価時期</td><td rowspan="2">症例数</td><td>「中等度改善」以上の改善率</td></tr>
<tr><td>症例数（%）
［95%信頼区間］</td></tr>
<tr><td>治療期 12 週後
又は中止時</td><td>36</td><td>13（36.1）
［20.8～53.8］</td></tr>
</table>
⑤患者（被験者又は代諾者）の印象
<table>
<tr><td rowspan="2">評価時期</td><td rowspan="2">症例数</td><td>「よくなった」以上の好印象率</td></tr>
<tr><td>症例数（%）
［95%信頼区間］</td></tr>
<tr><td>治療期 12 週後
又は中止時</td><td>36</td><td>16（44.4）
［27.9～61.9］</td></tr>
</table>
⑥鼻所見（下甲介粘膜の腫脹、下甲介粘膜の色調、水性分泌量）
下甲介粘膜の腫脹及び下甲介粘膜の色調の各スコアが 0 又は 1 と判定された被験者の割合は、治療期 4 週後まで持続的に増加し、その後は 12 週後までほぼ一定の値で推移した。また、水性分泌量のスコアが 0 又は 1 と判定された被験者の割合は、治療期開始日から治療期 1 週後にかけて約 2 倍に増加し、その後は 12 週後までほぼ一定であった。
</td></tr>
<tr><td>安全性</td><td>
<table>
<tr><td></td><td>例数（n=36）</td></tr>
<tr><td>有害事象発現件数</td><td>51</td></tr>
<tr><td>有害事象発現例数</td><td>26（72.2%）</td></tr>
<tr><td>因果関係を否定できない有害事象発現例数</td><td>1（2.8%）</td></tr>
<tr><td>重篤な有害事象発現例数</td><td>0</td></tr>
<tr><td>治験薬の投与中止に至った有害事象発現例数</td><td>1（2.8%）</td></tr>
</table>
有害事象は 72.2%に認められ、最も多く認められた有害事象は鼻咽頭炎 14 例（38.9%）であった。
長期投与による有害事象発現頻度の持続的増加は認められなかった。
副作用は「軽度」の白血球数増加が 1 例（2.8%）に認められた。
</td></tr>
</table>

7）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした長期投与試験（2005）

②各種皮膚疾患を有する小児を対象とした長期投与試験[9)]

目的：本剤の長期投与（12 週間）における有効性、安全性の検討

<table>
<tr><td colspan="2">試験デザイン</td><td>多施設共同、非盲検、長期投与試験</td></tr>
<tr><td colspan="2">対象</td><td>各種皮膚疾患患児（2 歳以上、15 歳未満）</td></tr>
<tr><td colspan="2">主な登録基準</td><td>下記疾患に伴うそう痒を有し、12 週間の長期治療が必要と判断される患児
・慢性蕁麻疹
・湿疹・皮膚炎群：アトピー性皮膚炎など［アトピー性皮膚炎は、日本皮膚科学会「アトピー性皮膚炎の定義・診断基準（アトピー性皮膚炎治療ガイドライン 2004 改訂版）」に準じて診断する。］
・痒疹群：急性痒疹（ストロフルス、蕁麻疹様苔癬など）、亜急性痒疹、慢性痒疹（結節性痒疹など）
・皮膚そう痒症：全身性皮膚そう痒症、局所性皮膚そう痒症</td></tr>
<tr><td colspan="2">主な除外基準</td><td>セチリジン塩酸塩製剤の成分又はヒドロキシジン、シクリジン、メクリジン、ブクリジンに対し過敏症の既往歴のある患児</td></tr>
<tr><td colspan="2">試験方法</td><td>セチリジン塩酸塩ドライシロップ（セチリジン塩酸塩として 2.5mg 又は 5mg）を 1 日 2 回 12 週間投与</td></tr>
<tr><td colspan="2">評価項目</td><td>有効性
①そう痒の重症度の経時変化
②総合そう痒スコアの経時変化
③患者（被験者又は代諾者）の印象
④皮疹の重症度の経時変化
安全性</td></tr>
<tr><td>結果</td><td>有効性</td><td>①そう痒の重症度の経時変化
投与初期からそう痒の改善が認められ、そう痒に対する効果は投与終了時まで減弱することなく、安定して持続した。
（「(2) 臨床効果　〔小児〕2）蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒　②一般臨床試験」の項参照）
②総合そう痒スコアの経時変化
経時的に減少した。
③患者（被験者又は代諾者）の印象
<table>
<tr><td rowspan="2">評価時期</td><td rowspan="2">症例数</td><td>「よくなった」以上の好印象率</td></tr>
<tr><td>症例数（%）
［95%信頼区間］</td></tr>
<tr><td>治療期 12 週後
又は中止時</td><td>73</td><td>37（50.7）
［38.7～62.6］</td></tr>
</table>
④皮疹の重症度の経時変化
治療期 4 週後まで経時的に低下した後、治療期 12 週後までほぼ一定の値を維持した。</td></tr>
</table>

<table>
<tr><td>結果</td><td>安全性</td><td>
<table>
<tr><td></td><td>例数（n=73）</td></tr>
<tr><td>有害事象発現件数</td><td>63</td></tr>
<tr><td>有害事象発現例数</td><td>38（52.1%）</td></tr>
<tr><td>因果関係を否定できない有害事象発現例数</td><td>1（1.4%）</td></tr>
<tr><td>重篤な有害事象発現例数</td><td>1（1.4%）</td></tr>
<tr><td>治験薬の投与中止に至った有害事象発現例数</td><td>1（1.4%）</td></tr>
</table>
有害事象は 52.1%に認められ、最も多くみられた有害事象は鼻咽頭炎 14 例（19.2%）であった。長期投与による有害事象発現頻度の持続的増加は認められなかった。
副作用は「軽度」の傾眠が 1 例（1.4%）に認められた。
</td></tr>
</table>

9）社内資料：小児各種皮膚疾患を対象とした長期投与試験

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）

〔成人〕

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目　8．副作用」の項参照

〔小児〕

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目　8．副作用」の項参照

2）承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

レボセチリジン塩酸塩、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オキサトミド、ケトチフェンフマル酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン等のヒスタミン H_1 受容体拮抗薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

〈作用部位〉

1) 鼻及び皮膚組織に存在するヒスタミン H_1 受容体

2) 好酸球、肥満細胞、好中球などの細胞

〈作用機序〉

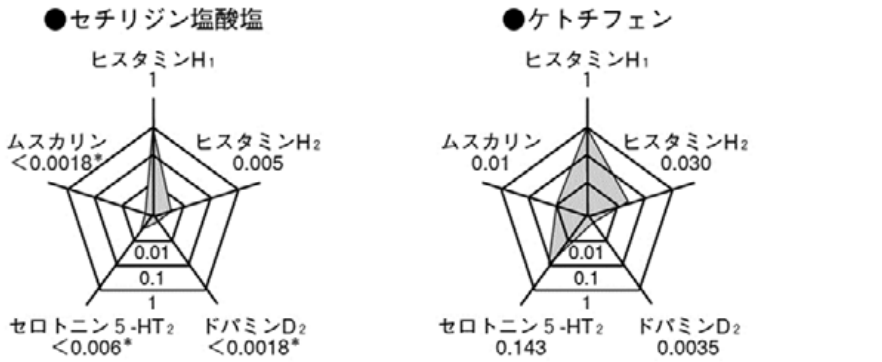
本剤はアレルギー反応の即時相と遅発相の両相に作用する。即時相では、選択的かつ強い抗ヒスタミン作用と肥満細胞からのロイコトリエン遊離抑制作用によりアレルギーの諸症状を速やかに改善する。遅発相では、好酸球の遊走と活性化を抑制することによりアレルギー性炎症の持続と進展を抑制すると考えられている。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 抗ヒスタミン作用

①ヒスタミン H_1 受容体選択性

i) セチリジン塩酸塩は受容体結合試験において、ヒスタミン H_1 受容体に選択的に結合した。ヒスタミン H_2、ドパミン D_2、セロトニン $5HT_2$、ムスカリン各受容体に対する親和性は極めて低く、ケトチフェンよりも H_1 受容体選択性が高い（*in vitro*、ラット・モルモット）[18]。



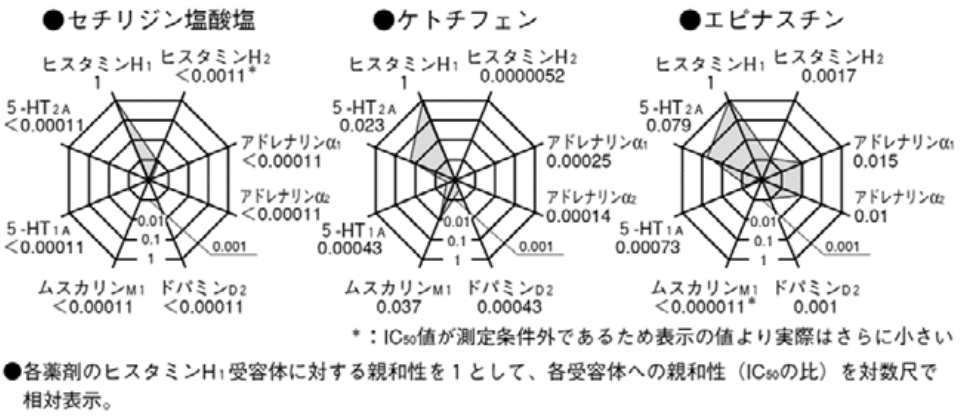
*：IC_{50}値が測定条件外であるため表示の値より実際はさらに小さい

●常法にしたがい、各受容体との親和性を測定。各薬剤のヒスタミンH_1に対する親和性を1として、各受容体への親和性（IC_{50}の比）を対数尺で相対表示。

各種受容体へのリガンド結合阻害（IC_{50}値・μM）

薬物＼受容体	ヒスタミン H_1	ヒスタミン H_2	ドパミン D_2	セロトニン $5HT_2$	ムスカリン
セチリジン塩酸塩	0.18	36	＞100	＞30	＞100
ケトチフェン	0.02	0.67	5.7	0.14	2.0

ii）セチリジン塩酸塩はヒスタミン H_1 受容体への[^{3}H] (Z)-11[-3(-dimethylamino) propylidene]-6,11-dihydrodibenz[b, e]oxepin-2-acetic acid hydrochloride 結合を抑制しその Ki 値は 11nM であった。一方、ヒスタミン H_2 受容体をはじめとしたその他の受容体に対しては検討した濃度ではほとんど親和性を示さず、セチリジン塩酸塩のヒスタミン H_1 受容体に対する高い選択性が認められた（*in vitro*）[19]。



各種受容体へのリガンド結合阻害（IC_{50} 値・nM）

受容体／薬物	ヒスタミン H_1	ヒスタミン H_2	アドレナリン α_1	アドレナリン α_2	ドパミン D_2	ムスカリン M_1	5-HT_{1A}	5-HT_{2A}
セチリジン塩酸塩	11±0.67	＞10000	＞100000	＞100000	＞100000	＞100000	＞100000	＞100000
ケトチフェン	0.52±0.06	2200±450	2100±120	3600±100	1200±280	14±0.15	1200±60	23±1.5
エピナスチン	1.1±0.16	640±62	75±19	110±35	1100±250	＞10000	1500±220	14±0.32

方法：ヒト組換え型 H_1 受容体を発現させた CHO（Chinese Hamster Ovary）細胞膜、モルモット大脳皮質、ラットの大脳皮質を用い、ヒスタミン H_1、H_2 受容体、アドレナリン α_1、α_2、ドパミン $_{D2}$、ムスカリン M_1、5-HT_{1A}、5-HT_{2A} の各受容体に対する、各種薬剤の結合親和性を測定した。

②脳内ヒスタミン H_1 受容体親和性（*ex vivo*、ラット）

セチリジン塩酸塩をラットに腹腔内投与し、1 時間後に脳を取り出し、放射性ラベルしたピリラミンのヒスタミン H_1 受容体結合試験を行った。

セチリジン塩酸塩の脳内ヒスタミン H_1 受容体の占有率は、*d*-クロルフェニラミンに比べ低く、本剤の脳内受容体への到達は少ないことが示唆された[20]。

ラット脳内ヒスタミン H_1 受容体占有率

	^{3}H-ピリラミン結合 fmol/mg 湿重量		
	平均	標準誤差	占有率（%）
生理食塩液	2.374	0.061	
セチリジン塩酸塩（10mg/kg）	2.169	0.227	8.6
d-クロルフェニラミン（10mg/kg）	0.355***	0.053	85.0
ヒドロキシジン（10mg/kg）	0.373***	0.082	84.3

被験薬物は生理食塩液に溶解して腹腔内投与し、1 時間後にラットを屠殺した。

直ちに脳を取り出し、ホモジナイズして ^{3}H-ピリラミンの結合試験に供した。

（生理食塩液群との比較、***：$p<0.001$）

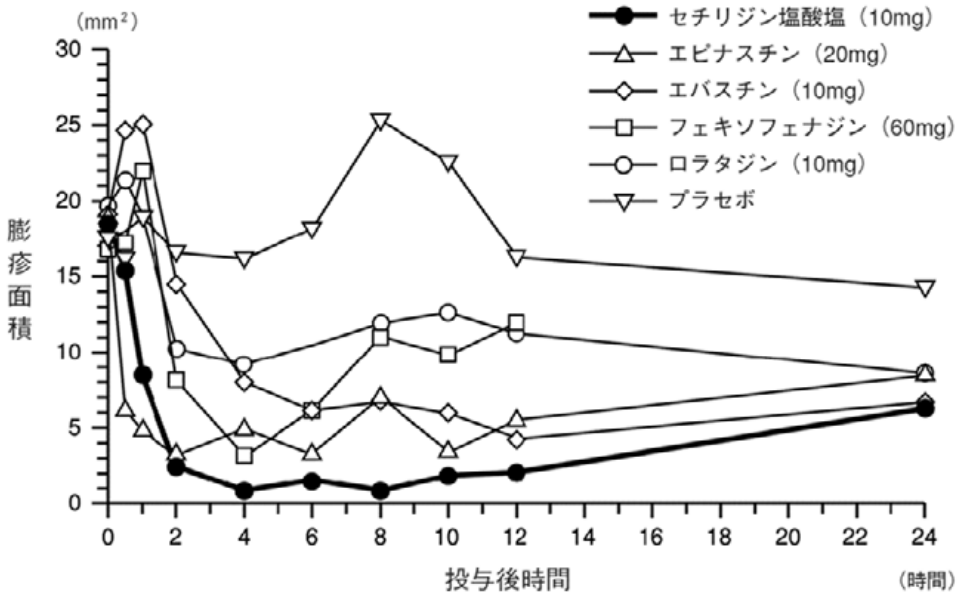
③ヒスタミンH_1受容体拮抗作用（摘出臓器）

セチリジン塩酸塩は、モルモット及びヒト摘出気管支平滑筋のヒスタミン収縮を濃度依存的に抑制し、アセチルコリン収縮に対してはほとんど作用を示さなかった[18、21)]。

④ヒスタミン誘発皮膚反応抑制作用（ヒト、外国人データ）

i）健康成人男子（n=20）に本剤と他の抗ヒスタミン剤をクロスオーバー法により投与し、ヒスタミン皮膚反応に対する効果を二重盲検法で検討した。セチリジン塩酸塩はヒスタミン誘発膨疹を投与後 40 分から有意に抑制し、その効果は 5 時間後に最大（94±9%）となり、以後 24 時間まで持続した。すなわち、本剤の膨疹抑制作用の発現は速やかで、その作用は最も強く、かつ持続的であった[22)]。

ii）健康成人男子（n=14）で同様に検討した結果、セチリジン塩酸塩は投与 1 時間後には膨疹抑制効果を示し、その後 24 時間まで強力な抑制効果を持続した。各種抗ヒスタミン薬の 0～24 時間の膨疹面積曲線下面積（AUC）からみたヒスタミン受容体拮抗作用の効力は、セチリジン塩酸塩、エピナスチン、エバスチン、ロラタジン、プラセボの順であった[23)]。



（注：1 日 2 回投与の薬剤については投与後 12 時間までの成績を表示）

ヒスタミン誘発膨疹形成抑制作用

〈参考〉比較薬剤の国内における通常の用法・用量は次のとおりである。
（詳細は製品添付文書を参照すること）

薬剤	用法・用量
エピナスチン	喘息・皮膚疾患：1 回 20mg、1 日 1 回（増減） 鼻炎：1 回 10～20mg、1 日 1 回（増減）
エバスチン	1 回 5～10mg、1 日 1 回（増減）
フェキソフェナジン	1 回 60mg、1 日 2 回（増減）
ロラタジン	1 回 10mg、1 日 1 回（増減）

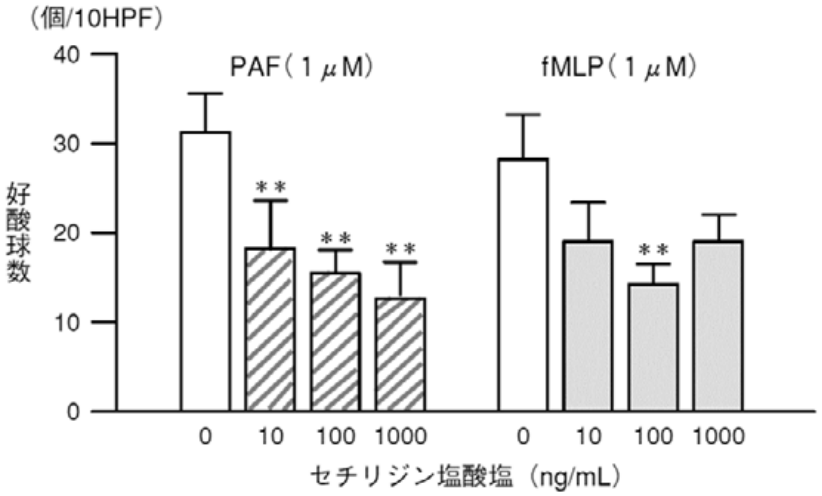
⑤ヒスタミン誘発鼻反応抑制作用（ヒト、外国人データ）

健康成人とアレルギー性鼻炎患者（症状発現期）において、セチリジン塩酸塩はヒスタミン誘発によるくしゃみをほぼ完全に消失させ、鼻腔気道抵抗上昇を有意に抑制した（$p<0.001$、二元配置分散分析）[24)]。

2）好酸球に対する作用

①好酸球遊走抑制作用

セチリジン塩酸塩はアレルギー患者の末梢血好酸球の PAF（血小板活性化因子）又は fMLP（N-ホルミルメチオニルロイシルフェニルアラニン；白血球遊走ペプチド）による遊走活性を抑制した（*in vitro*, ヒト）[25]。



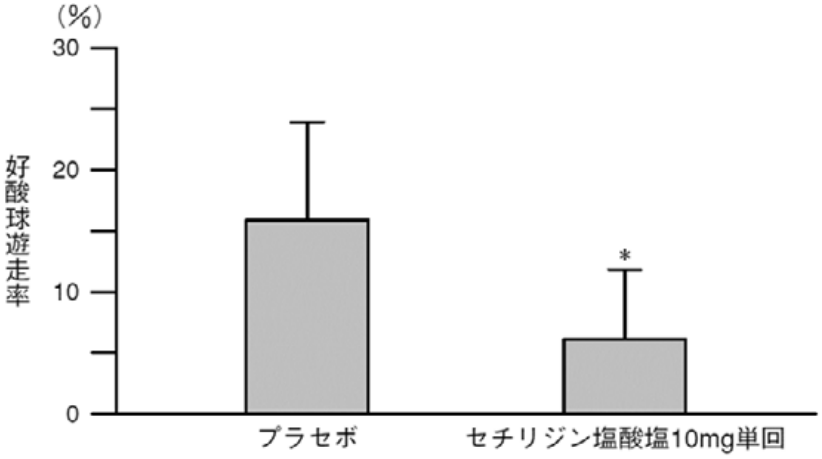
セチリジン塩酸塩のヒト好酸球遊走抑制作用

（n=13、平均値±標準誤差）

**：p＜0.01（対照群との比較、t 検定）

10HPF：3 強拡大で顕微鏡の 10 視野

セチリジン塩酸塩は通常の臨床用量で、花粉アレルゲン誘発による皮膚接種部位への好酸球遊走を抑制した（*in vivo*、ヒト）[26]。



花粉アレルゲン誘発によるヒト好酸球遊走に対するセチリジン塩酸塩の抑制作用

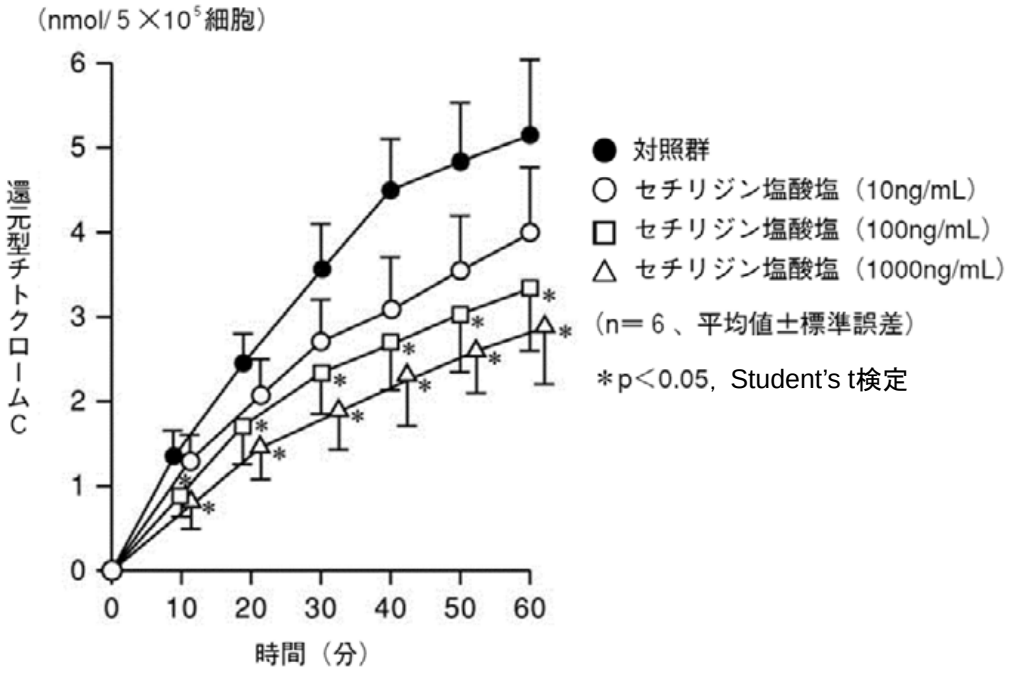
各群 8 例　平均±標準誤差

＊：p=0.006（プラセボとの比較）

また、卵白アルブミンを抗原として能動感作したラットの胸腔内に抗原を注入したときに生じる好酸球の浸潤は、あらかじめセチリジン塩酸塩を腹腔内投与しておくことにより抑制された（*in vivo*、ラット）[27]。

②好酸球の活性化抑制（*in vitro*）

アレルギー患者の末梢血好酸球は活性化しており、スーパーオキサイド産生が亢進している。セチリジン塩酸塩は活性化している好酸球からのスーパーオキサイド産生を有意に抑制した[25)]。



ヒト好酸球からの Superoxide anion 産生抑制作用

③好酸球遊走因子産生抑制作用（*ex vivo*、*in vitro*）

アレルギー性鼻炎患者の好中球をカルシウムイオノフォアで刺激した時に生じる LTB_4 産生は、セチリジン塩酸塩の投与により有意に抑制された[28)]。

④好酸球の接着抑制作用（*in vitro*）

セチリジン塩酸塩は、PAF 刺激によるヒト好酸球のヒト臍帯静脈血管内皮細胞（HUVEC）への過剰接着をほぼ完全に抑制し、好酸球遊走に対するセチリジン塩酸塩の抑制効果が接着分子発現の調節と関連している可能性が示唆された[29)]。

3）メディエーター遊離抑制作用（*in vitro*）

セチリジン塩酸塩は、ヒト肺切片の抗原刺激によるロイコトリエン C_4、D_4 及びプロスタグランジン D_2 の遊離を抑制した[30)]。

(3) 作用発現時間・持続時間

（外国人データ）

ヒスタミン誘発皮膚反応抑制作用

〔成人〕[22)]

作用発現時間・持続時間：膨疹抑制 1～24 時間、紅斑抑制 40 分～24 時間

〔小児〕[12)]

健康小児（5～13 歳）66 例を対象に二重盲検下クロスオーバー法で無作為に 2 群（各 33 例）に分け、1 群にセチリジンを第 1 期に 10mg1 日 1 回（OD）、第 2 期に 5mg1 日 2 回（BID）各々3 日間投与、他方の群には逆の順に投与し、ヒスタミン誘発皮膚反応試験を実施した。

作用発現時間：初回投与 4 時間後

作用持続時間：初回投与 24 時間後及び最終投与 12 時間後（OD の場合、最終投与 24 時間後）における BID の膨疹の表面積は、OD の約 1/2～1/5 以下であった。また、最終投与 12 時間後における膨疹の抑制率（中央値、以下同様）は OD で 47.8%、BID で 88.6%、紅斑の抑制率はそれぞれ 60.7%、84.1%であり、いずれも BID の方が優れていた。さらに最終投与 36 時間後（OD の場合、最終投与 48 時間後）における膨疹の抑制率は OD で 1.9%、BID で 21.8%、紅斑の抑制率はそれぞれ 17.9%、38.6%であり、BID では最終投与から長時間経過した後にも抗ヒスタミン作用が認められた。

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

「(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

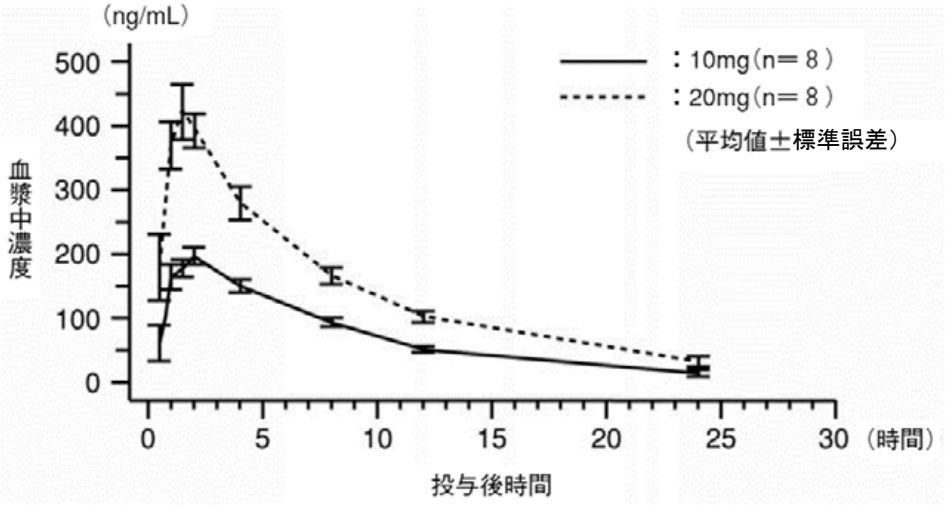
1) 健康成人男子・単回経口投与

①セチリジン塩酸塩錠

セチリジン塩酸塩錠 10mg（10mg 錠 1 錠）を単回経口投与した場合、速やかに吸収され、投与約 1.4 時間後に最高血漿中濃度（C_{max}）214.5ng/mL に達し、血漿中濃度消失半減期は約 7 時間であった。

また、セチリジン塩酸塩錠 20mg（10mg 錠 2 錠）を単回経口投与した場合、投与量の増加に伴って C_{max} の上昇、AUC の増大が認められた [10)]。

成人におけるセチリジン塩酸塩錠単回投与時の血漿中濃度の推移



成人におけるセチリジン塩酸塩錠単回投与時の薬物動態パラメータ

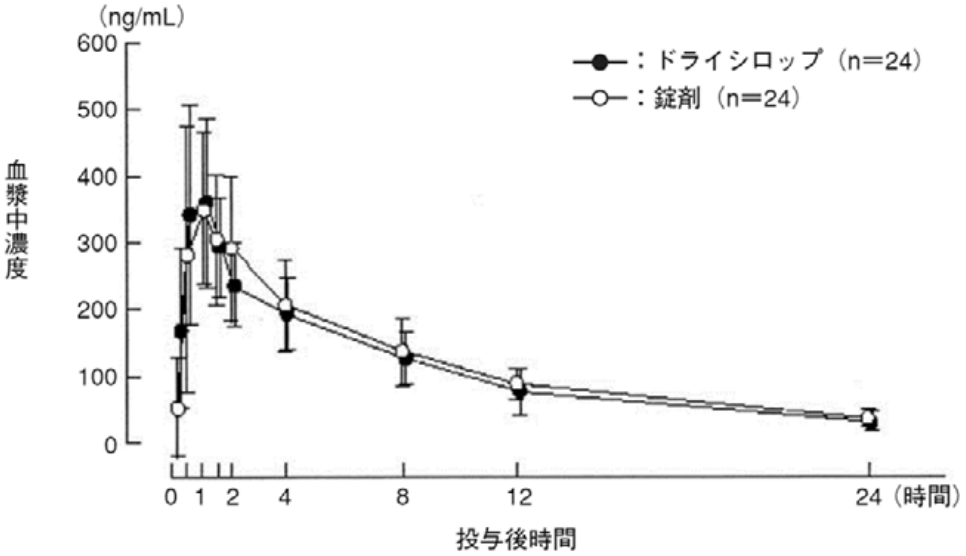
投与量 (mg)	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	AUC (mg・hr/L)	$T_{1/2}$ (hr)
10	1.44±0.50	214.5±35.3	2.0±0.3	6.73±2.30
20	1.50±0.38	438.1±111.8	3.9±0.9	6.79±1.85

(平均値±標準偏差、n=8)

②セチリジン塩酸塩ドライシロップ

健康成人にセチリジン塩酸塩ドライシロップ 0.8g を単回投与した場合、速やかに吸収され、投与約 0.82 時間（中央値：0.75 時間）後に最高血漿中濃度（C_{max}）413.6ng/mL に達し、血漿中濃度消失半減期は約 8 時間であった [31)]。

成人におけるセチリジン塩酸塩錠・ドライシロップ単回投与時の血漿中濃度の推移



成人におけるセチリジン塩酸塩錠・ドライシロップ単回投与時の薬物動態パラメータ

投与量	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	AUC (mg・hr/L)	$T_{1/2}$ (hr)
10mg 錠	1.13±0.52	440.9±144.7	3.0±0.8	8.36±1.63
ドライシロップ 0.8g	0.82±0.39	413.6±130.5	2.8±0.8	8.03±1.45

（平均値±標準偏差、n=24）

③生物学的同等性

健康成人男子 16 例にセチリジン塩酸塩錠 10mg（5mg 錠 2 錠及び 10mg 錠 1 錠）をクロスオーバー法で単回経口投与した結果、生物学的に同等と判断された[32)]。

5mg 錠と 10mg 錠投与後の血漿中濃度の C_{max} と AUC

項目	製剤	平均値±標準偏差	5mg 錠に対する%
C_{max} (ng/mL)	5mg 錠（2 錠）	323.6±50.1	100
	10mg 錠（1 錠）	310.1±77.7	95.8
$AUC_{(0-24)}$ (mg・hr/L)	5mg 錠（2 錠）	2.381±0.343	100
	10mg 錠（1 錠）	2.379±0.491	99.9

検出力（1-β）：有意水準（α）=0.1、Δ=0.2 で AUC99.9%、C_{max}89.4%

最小検出差（Δ）：α=0.1、1-β=0.8 で AUC10.2%、C_{max}17.2%

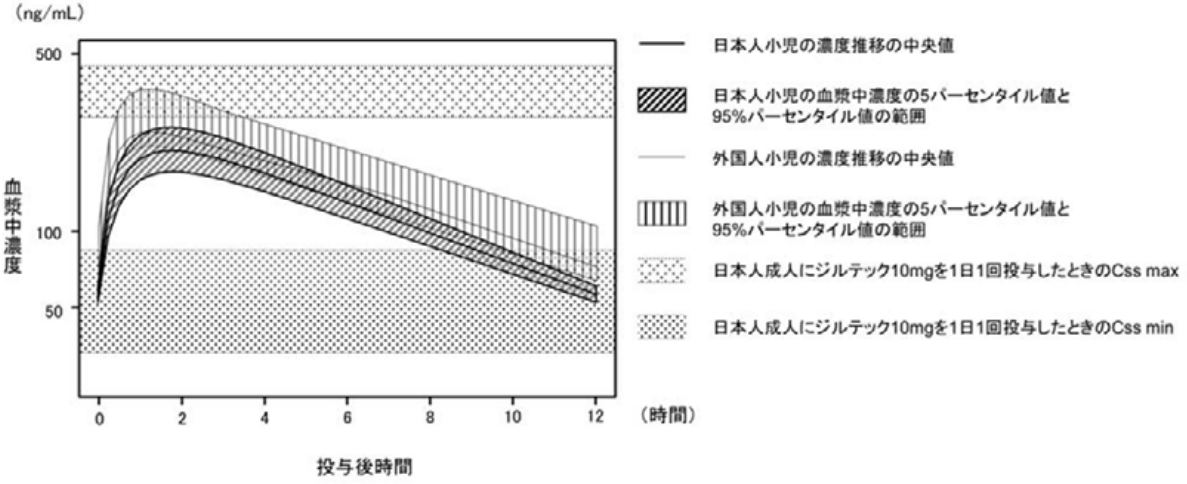
差の 95%信頼区間：AUC±8.3%、C_{max}±16.2%

2）小児

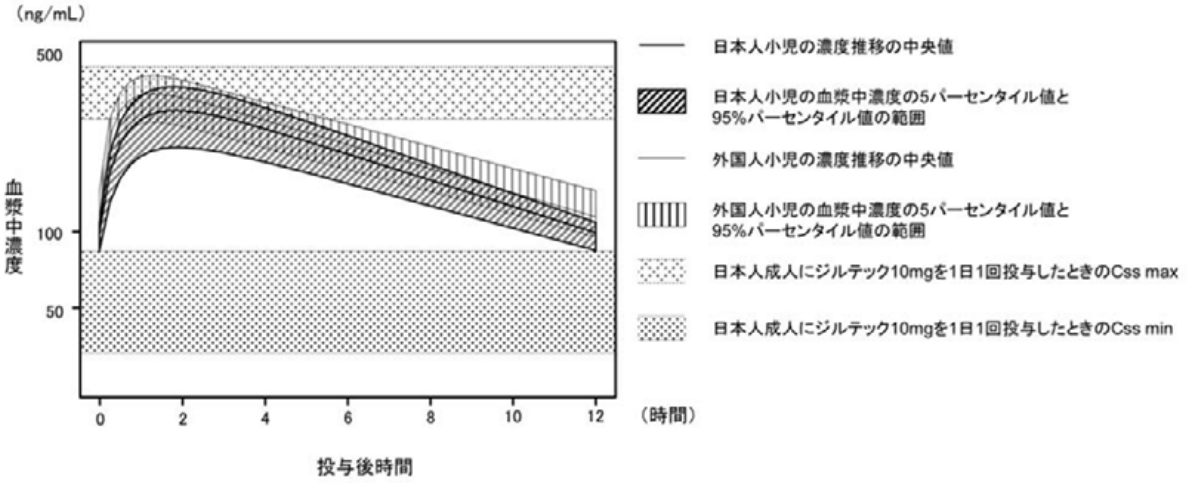
日本人の通年性アレルギー性鼻炎患児又は皮膚疾患患児を対象とした臨床試験 5 試験、570 例から得られた血清中濃度値 994 点を用い、母集団薬物動態解析（非線形混合効果モデル法、NONMEM）を行った。その結果、体重が共変量として認められ、2～6 歳の小児（本年齢層における体重の中央値：18.0kg）の全身クリアランス（CL/F）は 1.64L/hr、分布容積（V/F）は 11.9L、7～14 歳の小児（同：31.0kg）の CL/F は 2.11L/hr、V/F は 17.7L と推定された。また、2.5mg1 日 2 回投与時の定常状態時最低血清中濃度（Css min）及び最高血清中濃度（Css max）は、それぞれ 58±25ng/mL 及び 214±50ng/mL（平均±標準偏差*、以下同様）と推定され、5mg 1 日 2 回投与時の Css min 及び Css max は、それぞれ 100±40ng/mL 及び 308±74ng/mL と推定された[33)]。

＊）1000 例の血清中濃度推移をシミュレーションしたときの推定値

2～6 歳の小児（体重 18.0kg）における血中セチリジン濃度推移の推定



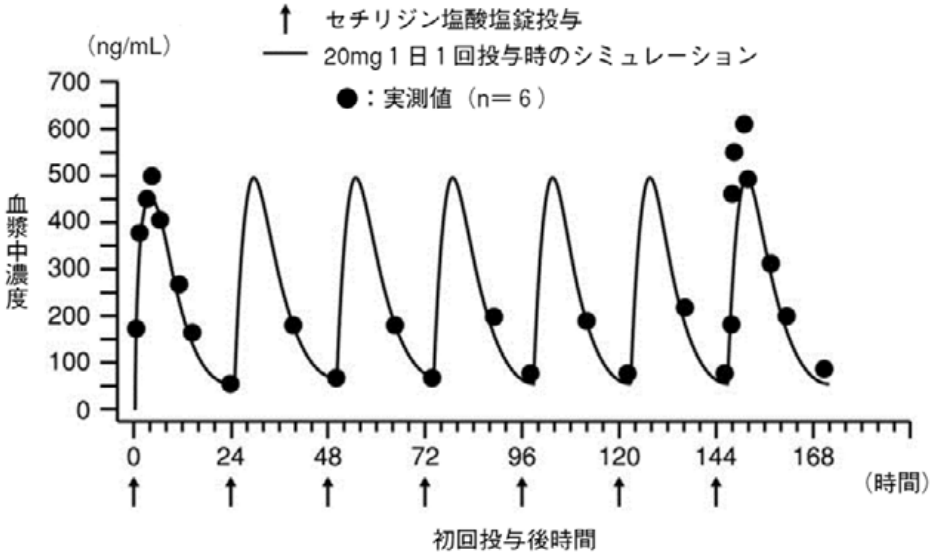
7～14 歳の小児（体重 31.0kg）における血中セチリジン濃度推移の推定



3）健康成人男子・反復経口投与

セチリジン塩酸塩錠 20mg（10mg 錠 2 錠）を 1 日 1 回 7 日間反復経口投与後の血漿中未変化体濃度の推移と薬物動態パラメータは次のとおりであった。投与 1 日目に得られたパラメータを用いたシミュレーションでは血中濃度は投与 2 日目以降は定常状態となり、以降 7 日目までに得られた実測値はシミュレーションの結果とほぼ一致しており、連続投与による蓄積性は認められなかった[10)]。

セチリジン塩酸塩錠 7 日間反復投与時の血漿中濃度の推移



セチリジン塩酸塩錠 7 日間反復投与時の薬物動態パラメータ

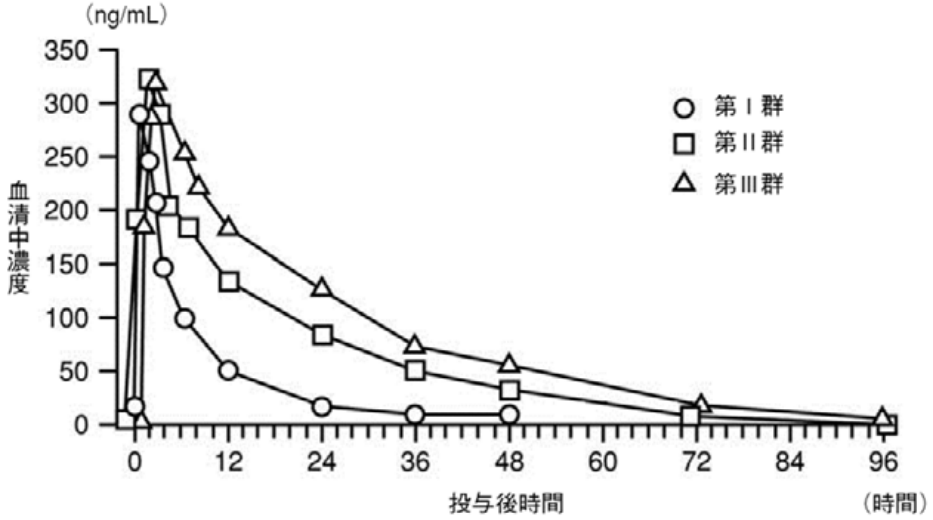
投与日数	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	AUC (mg・hr/L)	$T_{1/2}$ (hr)
1	1.83	547.8±50.4	5.8±0.3	7.27
7	1.75	624.5±26.4	6.5±0.6	8.48

（平均値±標準誤差、n=6）

4）腎障害患者（参考：外国人データ）

腎機能正常者及び腎障害患者 15 例にセチリジン塩酸塩 10mg（10mg カプセル 1 カプセル）を単回経口投与し、排泄に及ぼす影響を検討した。第Ⅰ群はクレアチニンクリアランス（Ccr）＞90mL/min、第Ⅱ群は Ccr31～60mL/min、第Ⅲ群は Ccr7～30mL/min であった。セチリジンの血清中濃度消失半減期は中等度及び高度の腎障害患者において有意に延長したことより、セチリジンの排泄は腎機能に影響されることが示唆された[34]。

セチリジン塩酸塩の腎障害患者における血清中濃度



セチリジン塩酸塩の腎障害患者における薬物動態パラメータ

Ccr (mL/min)	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	AUC (mg・hr/L)	$T_{1/2}$ (hr)
第Ⅰ群：＞90	0.9±0.2	313±45	2.7±0.4	7.4±3.0
第Ⅱ群：31－60	1.1±0.2	356±64	6.9±1.8	19.2±3.3
第Ⅲ群：7－30	2.2±1.1	357±172	10.7±2.4	20.9±4.4

（平均値±標準偏差、n=5）

また、血液透析患者 5 例（Ccr≦7mL/min）にセチリジン塩酸塩 10mg（10mg カプセル 1 カプセル）を透析開始 3 時間前に単回経口投与した場合、血清中濃度消失半減期は平均 19.3 時間と腎機能正常者に比べ延長が認められた[35]。

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

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目　4．用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由」の項参照

5）肝障害患者（参考：外国人データ）

原発性胆汁性肝硬変患者にセチリジン塩酸塩 10mg（10mg 錠 1 錠）を単回経口投与した場合、肝機能正常成人[33]に比べ、血清中濃度消失半減期の延長、C_{max}の上昇及び AUC の増大がみられた[36]。

セチリジン塩酸塩の肝障害患者における薬物動態パラメータ

投与量（被験者、例数）	T_{max}（hr）	C_{max}（ng/mL）	AUC（mg・hr/L）	$T_{1/2}$（hr）
10mg（肝機能正常成人、n=14）	1.0±0.5	384±103	3.3±0.9	7.4±1.6
10mg（原発性胆汁性肝硬変患者、n=6）	1.0±0.4	498±118	6.4±1.6	13.8±1.8

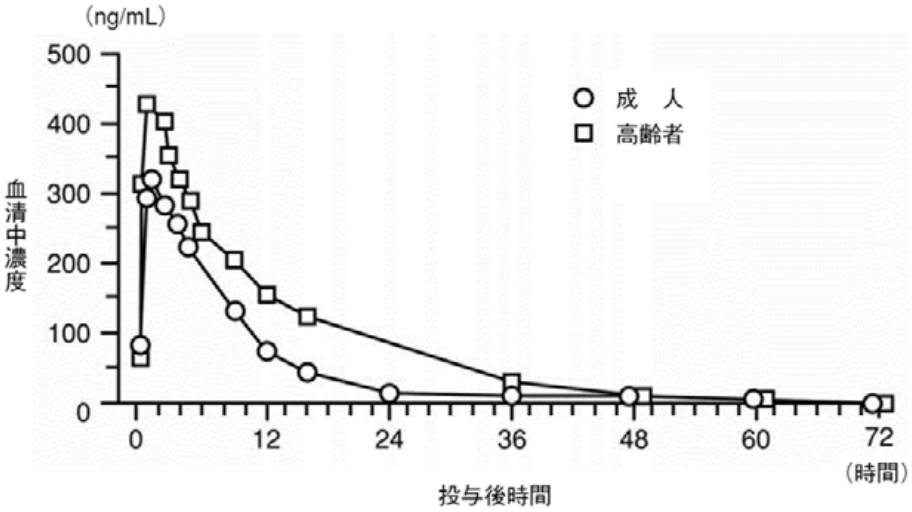
（平均値±標準偏差）

また、アルコール性肝硬変あるいは壊死後肝硬変（postnecrotic liver cirrhosis）患者及び慢性胆汁うっ滞性肝疾患（原発性胆汁性肝硬変、膵癌性総胆管圧迫）患者にセチリジン塩酸塩 20mg を単回経口投与した場合、$T_{1/2}$の延長と AUC の増大が認められている[37]。これらの成績から、高度の肝障害患者では、低用量（例えば通常用量の半量）から投与を開始するなど慎重に投与すること。

6）高齢者（参考：外国人データ）

健康診断で健康とみなされた 37～86 歳の 30 例にセチリジン塩酸塩 10mg（10mg カプセル 1 カプセル）を単回経口投与し、加齢による体内動態への影響を検討した。C_{max}は成人（平均年齢 53 歳）に比べて高齢者（平均年齢 77 歳）で有意に高く、$T_{1/2}$は成人に比べて有意に長かったが、T_{max}には差を認めなかった。成人のクレアチニンクリアランス（平均 87mL/min）に比べ高齢者のクレアチニンクリアランス（平均 53mL/min）は低値で、高齢者における本剤の薬物動態パラメータの変化は、腎機能の低下によるものと考えられた[34]。

セチリジン塩酸塩の高齢者における血清中濃度



セチリジン塩酸塩の高齢者における薬物動態パラメータ

投与量（被験者、例数）	T_{max}（hr）	C_{max}（ng/mL）	AUC（mg・hr/L）	$T_{1/2}$（hr）
10mg（成人、n=14）	1.0±0.5	384±103	3.3±0.9	7.4±1.6
10mg（高齢者、n=16）	0.9±0.3	460±59	5.6±1.8	11.8±5.4

（平均値±標準偏差）

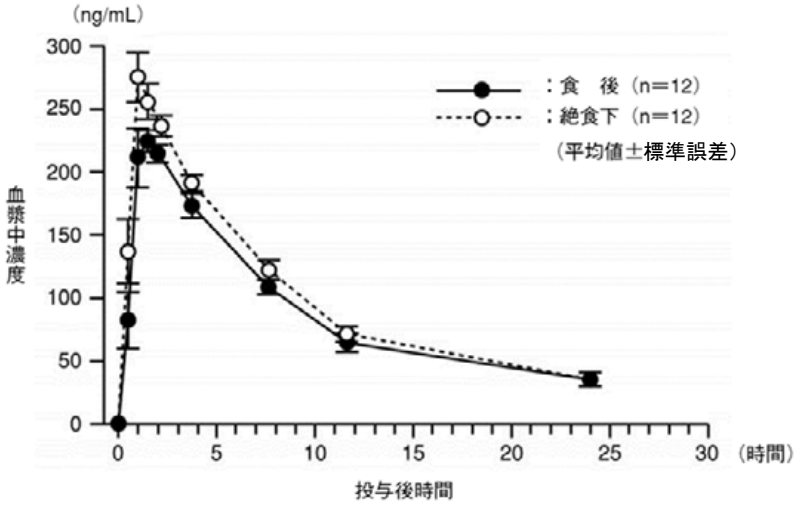
（4）中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

セチリジン塩酸塩錠 10mg（10mg 錠 1 錠）を健康成人男子に絶食下及び食後のクロスオーバー法で単回経口投与し、血漿中濃度推移に対する食事の影響を検討した。絶食下での AUC 及び C_{max} は食後投与の値の約 1.1 倍で大差はなかった[32]。

セチリジン塩酸塩錠の血漿中濃度に及ぼす食事の影響



セチリジン塩酸塩錠の薬物動態パラメータ（食事の影響）

投与条件	T_{max}（hr）	C_{max}（ng/mL）	$AUC_{(0-24)}$（mg・hr/L）	尿中排泄率$_{(0-24)}$（%）
絶食	1.38	288.7±45.2	2.4±0.2	50.6
食後	1.46	256.9±38.3	2.2±0.3	52.0

（平均値±標準偏差、n=12）

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目　7. 相互作用」の項参照

(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

〔小児〕

通年性アレルギー性鼻炎患児又は皮膚疾患患児を対象とした臨床試験 5 試験、570 例から得られた血清中濃度値 994 点を用い、母集団薬物動態解析を行ったところ、体重が共変量として認められた[33]。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

〔小児〕

通年性アレルギー性鼻炎患児又は皮膚疾患患児を対象とした臨床試験 5 試験から得られた血清中濃度を用い、母集団薬物動態解析（非線形混合効果モデル法、NONMEN）を行った[33]。

(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
〔成人〕
健康成人 10mg 単回経口投与：87.10±6.17mL/min（平均値±標準偏差、n=8）[10)]

(6) 分布容積
〔成人〕
（参考：外国人データ）
健康成人 10mg 単回経口投与：0.50±0.07L/kg（平均値±標準偏差、n=5）[34)]

(7) 血漿蛋白結合率
セチリジン 0.1、1 及び 10μg/mL 濃度の *in vitro* におけるヒト血漿蛋白との結合率（平衡透析法）は平均 92%（それぞれ 92.5±0.28、90.7±1.62、92.2±0.15%、平均値±標準誤差、n=3）であった[38)]。

〈参考〉ワルファリンのヒト血漿蛋白結合率及びアルブミンとの結合率、また、テオフィリン、フェノテロール、ハイドロコルチゾン、ジアゼパムの血漿蛋白結合率に本剤は影響を及ぼさないことが明らかになっている。

3. 吸収
吸収部位：消化管
吸 収 率：推定 70%以上[39)]
腸肝循環の存在が推定されている[39)]。

4. 分布
(1) 血液－脳関門通過性
該当資料なし
〈参考〉
ラットに ^{14}C 標識セチリジン 1mg/kg を単回経口投与した時、脳及び中枢神経系への移行はほとんど認められなかった[40)]。

(2) 血液－胎盤関門通過性
該当資料なし
〈参考〉
妊娠 16 日のラット及び妊娠 18 日のウサギに ^{14}C 標識セチリジン 1mg/kg を単回経口投与した時、胎児に放射能の移行が認められたが、胎児及び羊水中濃度は胎盤中及び母体血漿中濃度より低かった。

(3) 乳汁への移行性
該当資料なし
〈参考〉
分娩後 9～11 日のラットに ^{14}C 標識セチリジン 1 又は 10mg/kg を単回経口投与した時、乳汁中に放射能が認められた。乳汁中濃度/血漿中濃度比は 1mg/kg 投与時は 0.2～0.8、10mg/kg 投与時は 0.9～1.6 であった[40)]。イヌにおいて静脈内投与した場合も同様の成績であった。

(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

〈参考〉

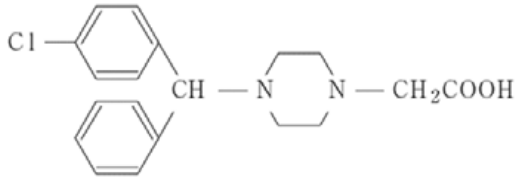
ラットに ^{14}C 標識セチリジン 1mg/kg を単回経口投与した時、^{14}C 分布は、肝臓、腎臓、胆汁に高かったが、ほとんどの組織中 ^{14}C 濃度は血液より低く、消失は速やかであった[40]。

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

セチリジン塩酸塩を健康成人に 7 日間連続経口投与した場合､大部分が未変化体として尿中に排泄された。代謝物としては、血漿及び糞便中に微量の酸化的 *o*－脱アルキル体（P026）が検出されている[10､39]。

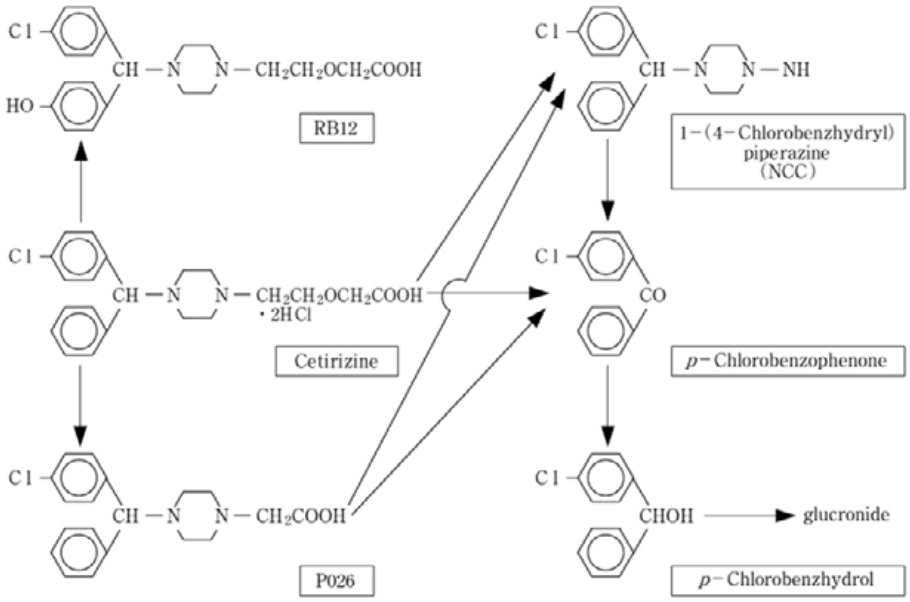
P026：



〈参考〉

ラット、マウス、ウサギ及びイヌに経口投与後の尿、糞中において、以下に示す代謝体が同定された。血中・尿中・糞中の代謝物として、酸化的 *o*－脱アルキル化、ピペラジン環の両側の結合の開裂又はベンゼン環の水酸化を受けた 5 種の代謝物、P026、RB12、1-(4-chlorobenzhydryl)piperazine（Nor-chlorcylizine, NCC）、*p*-chlorobenzophenone、*p*-chlorobenzhydrol が認められ、そのうち主な代謝物は P026 であった。

セチリジン塩酸塩の推定代謝経路は次のとおりである。



(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

〈参考〉

イヌにセチリジン塩酸塩 4～60mg/kg/日を 52 週間経口投与、カニクイザルに 17～150mg/kg/日を 4 週間経口投与した場合、チトクローム P450 活性に変化は認められなかった。

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

ほとんど無い[39]。

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

主要代謝物 P026 の抗ヒスタミン作用は、*in vitro* ではセチリジンの約 1/8、*in vivo* では約 1/20 であった（モルモット）[41]。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

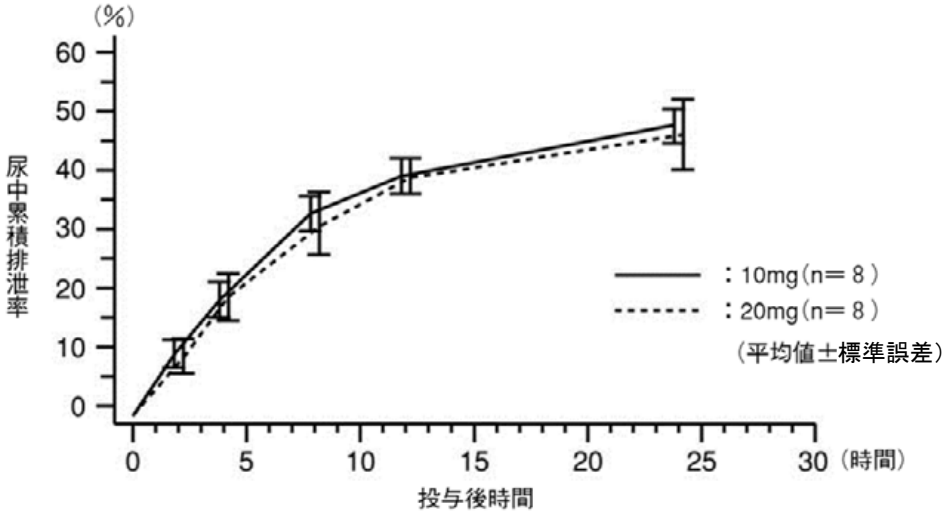
6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

主として腎臓

(2) 排泄率

セチリジン塩酸塩錠 10mg（10mg 錠 1 錠）、20mg（10mg 錠 2 錠）を健康成人男子各 8 例に単回経口投与した。投与後 24 時間までの未変化体の尿中累積排泄率はいずれも約 50%であり、投与量に依存した排泄率の変動は認められなかった[10]。



セチリジン塩酸塩錠単回投与時の尿中排泄

健康成人にセチリジン塩酸塩錠 1 日 1 回 20mg（10mg 錠 2 錠）を 7 日間連続経口投与した場合、未変化体の 1 日投与量に対する尿中排泄率は、1 日目 24 時間後までに約 58%、7 日目 24 時間後までに約 70%であった[10]。

（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

セチリジンはP糖蛋白質の基質となる可能性が示唆されている[42)]。

8. 透析等による除去率

重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者は禁忌である。［高い血中濃度が持続するおそれがある。］

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目　2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」の項参照。

血液透析

〈参考：外国人データ〉

血液透析患者にセチリジン塩酸塩 10mg（10mg カプセル 1 カプセル）を透析開始 3 時間前に単回経口投与した時の透析による除去率は約 10％であった[35)]。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

（1）本剤の成分又はピペラジン誘導体（レボセチリジン、ヒドロキシジンを含む）に対し過敏症の既往歴のある患者

（2）重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者［高い血中濃度が持続するおそれがある。］

（解説）

類薬及び企業中核データシート（CCDS）の記載を踏まえ、追記及び記載を整備した。

ジルテック錠の承認時までの成人を対象とした臨床試験において、過敏症と考えられる発疹等の副作用が発現しており、また外国においてショック及び血管浮腫が報告されている。

腎障害患者にセチリジン塩酸塩 10mg を単回経口投与した場合、正常者に比べて腎障害患者では、セチリジン塩酸塩の $AUC_{0-\infty}$は約 1.5～1.7 倍増加し、$T_{1/2}$ は約 1.1～3.1 倍に延長した結果が認められている（外国人データ）。そのため、重度の腎障害患者（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）に対して、本剤の投与は禁忌と設定した。

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」の項参照

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

（1）腎障害のある患者
〔高い血中濃度が持続するおそれがある。（「用法・用量に関連する使用上の注意」及び「薬物動態」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。（「薬物動態」の項参照）〕

（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」及び「薬物動態」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。〕

（解説）

（1）腎障害患者〔クレアチニンクリアランス：7～60mL/min〕にセチリジン塩酸塩 10mg（10mg カプセル 1 カプセル）を単回経口投与した場合、腎機能正常者に比べ血清中濃度は持続し、血清中濃度消失半減

期（$T_{1/2}$）の延長が認められている（外国人データ）[34)]。
腎障害のある患者では、クレアチニンクリアランスに応じて投与量の調節が必要である。
なお、重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者への投与は禁忌である。［高い血中濃度が持続するおそれがある。］

(2) 原発性胆汁性肝硬変患者にセチリジン塩酸塩 10mg（10mg 錠 1 錠）を単回経口投与した場合、肝機能正常成人に比べ、血清中濃度消失半減期（$T_{1/2}$）の延長、最高血清中濃度（C_{max}）の上昇、血清中濃度時間曲線下面積（AUC）の増大が認められている（外国人データ）[36)]。
また、アルコール性肝硬変あるいは壊死後肝硬変（postnecrotic liver cirrhosis）患者及び慢性胆汁うっ滞性肝疾患（原発性胆汁性肝硬変、膵癌性総胆管圧迫）患者にセチリジン塩酸塩 20mg を単回経口投与した場合、$T_{1/2}$ の延長と AUC の増大が認められている[37)]。
これらの成績から、高度の肝障害のある患者では、低用量（例えば 5mg）から投与を開始するなど慎重な投与が必要である。

(3)「9. 高齢者への投与」の項参照。

(4) 2008 年 4 月、企業中核データシートに「てんかん患者及び痙攣の危険性がある患者の使用に際しては、慎重投与が望ましい」と追記されたことに基づいて記載した。痙攣については、外国で本剤との関連性が疑われた症例が報告されている。一般に、ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用のある薬剤は、中枢神経刺激作用を示すことがあり、痙攣や発作が出現することがあること、これらは特に小児、てんかん患者等でみられると報告されている[43、44)]。
本剤投与中に異常がみられた場合は、本剤の投与を中止し適切な処置を行う必要がある。
「8. 副作用（2）重大な副作用と初期症状」の項参照。

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

(1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。
(2) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
(3) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

（解説）

(1) 本剤の承認時までの調査症例 1,396 例において、眠気が 6.0%（84 例）に発現したので、本剤投与中には危険を伴う機械の操作は行わないよう患者に十分注意させる必要がある。
(2) 花粉症の初期治療における注意事項である日本アレルギー学会監修の「アレルギー疾患治療ガイドライン」（1995 年改訂版）には、「花粉飛散 1～2 週間前より遊離抑制薬または新抗ヒスタミン薬で治療を開始し、季節終了まで続ける」との記載がある。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

相互作用

併用注意（併用に注意すること）

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

〈参考：外国人データ〉

・併用注意の薬剤との試験

本剤とテオフィリン及びアルコールとの相互作用に関する試験成績は次のとおりであった。

1）テオフィリン併用時の薬物動態への影響

健康成人男子6例に本剤10mg錠を1日2回3.5日間投与し、最終投与1時間後にテオフィリン240mgを1時間点滴静注し、薬物動態学的相互作用を検討した。本剤の投与によりテオフィリンの消失半減期がわずかに延長したが、健康成人の基準範囲内であった[45)]。

また、セチリジン塩酸塩20mgを1日1回とテオフィリン400mgを1日1回を併用する試験において、テオフィリンの薬物動態に変化はなかったが、本剤の曝露量の増加が報告されているため、併用する際は注意すること。

2）リトナビル併用時の薬物動態への影響

健康成人男子16例に本剤10mg、1日1回とリトナビル1回600mgを1日2回を併用する試験において、本剤の曝露量の増加（40%）及びリトナビルの曝露量のわずかな変化（－11%）が認められた[46)]と報告されているため、併用する際は注意すること。

3）アルコール併用時の薬物動態及び精神機能への影響

健康成人36例にセチリジン塩酸塩10mg（10mg錠1錠）又はプラセボをクロスオーバー法で投与し、アルコールとの相互作用を注意力、集中力、学習機能、短期記憶力などに関する5種類の精神運動パフォーマンステスト、「ビジュアルアナログスケールによる気分（mood）」の自己チェック及びアンケート調査を指標にした二重盲検法により検討した。本剤の作用はプラセボと有意差を認めず、アルコールとの相互作用は認められなかった。また、投与4時間後のセチリジンとアルコールの相互作用による両薬物の血中濃度の変化も認められなかった[47)]。

アルコールとの併用時の血漿中濃度

	プラセボ	セチリジン	プラセボ ＋ アルコール	セチリジン ＋ アルコール
セチリジン塩酸塩（ng/mL）	検出不能	374±14	検出不能	393±97
セチリジン塩酸塩＋アルコール（mg/mL）	0.02	0.02	0.381±0.10	0.370±0.08

（平均値±標準偏差）

（血中アルコール濃度は Lereboullet の式に従い 1-1.5mg/mL の濃度範囲で算出した投与後の濃度）

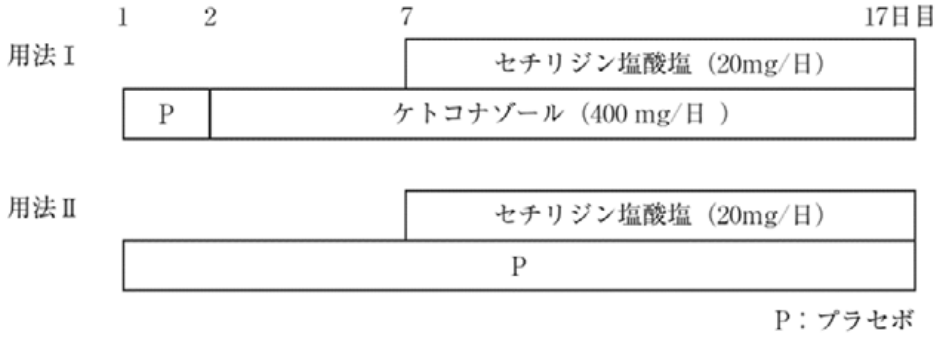
なお、中枢神経系に影響を与える可能性があるため、中枢神経抑制剤あるいはアルコールと併用する際は注意すること。

・その他の薬剤との試験

本剤とケトコナゾール及びエリスロマイシンとの相互作用に関する試験成績は次のとおりであった。

1）ケトコナゾール併用時の薬物動態及び心電図への影響

本剤（20mg/日）とケトコナゾール（400mg/日）の薬物動態学的相互作用の有無を健康成人男子 16 例による無作為、反復投与、二元交差試験により検討した。その結果、本剤とケトコナゾールとの間に有意な薬物動態学的相互作用は認められなかった。また、心電図上の変化も通常の変動範囲内にあり、相互作用は認められなかった[48)]。



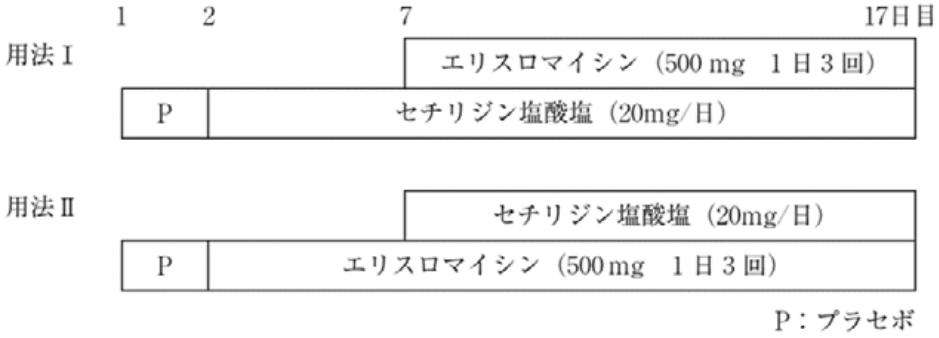
セチリジン塩酸塩（20mg/日）とケトコナゾール（400mg/日）の薬物動態学的相互作用

	セチリジン塩酸塩		ケトコナゾール	
	単独 〔16 日目〕	ケトコナゾール併用 〔16 日目〕	単独 〔6 日目〕	セチリジン塩酸塩併用 〔16 日目〕
AUC[a)] （hr・ng/mL）	4950.1±698.9 （15）	5325.0±903.8 （15）	82186.1±22788 （8）	79762.6±19505 （8）
C_{max} （ng/mL）	495.8±77.4 （15）	516.5±99.7 （15）	10045.9±2181.9 （16）	9279.1±1930.3 （16）
T_{max} （hr）	2.7±1.0 （15）	2.7±1.0 （15）	3.1±1.0 （16）	3.8±1.0 （16）
$T_{1/2}$ （hr）	8.1±1.3 （15）	7.8±1.4 （15）	4.7±1.0 （8）	5.6±2.3 （8）

（　）：n、平均値±標準偏差　a）：$AUC_{(0-24)}$

2）エリスロマイシン併用時の薬物動態及び心電図への影響

本剤（20mg/日）とエリスロマイシン（500mg×3/日）の薬物動態学的相互作用の有無を健康成人男子16例による無作為、反復投与、二元交差試験により検討した。その結果、本剤とエリスロマイシンとの間に有意な薬物動態学的相互作用は認められなかった。また、心電図上も有意な変化は認められなかった[49)]。



セチリジン塩酸塩（20mg/日）とエリスロマイシン（500mg×3/日）の薬物動態学的相互作用

	セチリジン塩酸塩			エリスロマイシン		
	単位	単独〔6日目〕	エリスロマイシン併用〔16日目〕	単位	単独〔6日目〕	セチリジン塩酸塩併用〔16日目〕
AUC	(hr・ng/mL)	4758.7±913.0[a)] (8)	5305.5±1089.0[a)] (8)	(hr・μg/mL)	7.7±4.3[b)] (14)	7.7±3.8[b)] (14)
C_{max}	(ng/mL)	438.8±100.6 (14)	460.8±100.9 (14)	(μg/mL)	2.0±1.2 (14)	2.0±0.9 (14)
T_{max}	(hr)	2.0±0.0 (14)	2.3±0.7 (14)	(hr)	2.0±0.0 (14)	2.0±0.0 (14)

（　）：n、平均値±標準偏差　a）：$AUC_{(0-24)}$　b）：$AUC_{(0-8)}$

8. 副作用

(1) 副作用の概要

副作用

〔成人〕

ジルテック錠の承認時までの成人を対象とした調査 1,396 例中 189 例（13.5%）に副作用又は臨床検査値の異常変動が認められた。副作用は 1,396 例中 140 例（10.0%）にみられ、主なものは眠気 84 例（6.0%）、倦怠感 12 例（0.9%）、口渇 9 例（0.6%）、嘔気 7 例（0.5%）であった。また、主な臨床検査値の異常変動は AST（GOT）上昇 1.4%（17／1,182 例）、ALT（GPT）上昇 1.5%（18／1,181 例）、好酸球増多 0.8%（9／1,114 例）、総ビリルビン上昇 0.5%（6／1,133 例）であった。

成人を対象とした市販後の使用成績調査 5,759 例（小児 163 例を含む）中 207 例（3.6%）に臨床検査値異常を含む副作用が認められた。主な副作用は眠気 149 件（2.6%）、倦怠感 9 件（0.2%）、口渇 9 件（0.2%）、浮動性めまい 8 件（0.1%）、頭痛 6 件（0.1%）等であった。（再審査終了時）

〔小児〕

ジルテックドライシロップの承認時までの小児を対象とした臨床試験 602 例中 25 例（4.2%）に臨床検査値異常変動を含む副作用が認められた。主なものは ALT（GPT）上昇 8 例（1.3%）、眠気 6 例（1.0%）であった。

小児を対象とした市販後の特定使用成績調査 3,157 例中 42 例（1.3%）に副作用が認められた。主な副作用は傾眠 22 件（0.7%）であった。（ジルテック錠 5 及びドライシロップ 1.25%再審査終了時）

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用

1) **ショック、アナフィラキシー**（頻度不明[注)]）

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

2) **痙攣**（0.1%未満）

異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

3) **肝機能障害、黄疸**（頻度不明[注)]）

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**（頻度不明[注)]）

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。

注）市販後の自発報告等又は外国での報告のため頻度不明。

（解説）

ショック、アナフィラキシーの初期症状としては「呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等」が、肝機能障害、黄疸の初期症状としては「全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等」が考えられる。

(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。

	副作用発現頻度		
	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明[注)]
精神神経系	眠気、倦怠感	頭痛、頭重感、ふらふら感、しびれ感、めまい、浮遊感	不眠、振戦、抑うつ、激越、攻撃性、無力症、錯感覚、幻覚、不随意運動、意識消失、健忘、自殺念慮、悪夢
消化器	口渇、嘔気、食欲不振	胃不快感、下痢、消化不良、腹痛、腹部不快感、胃痛、口唇炎、便秘、口唇乾燥感、嘔吐、味覚異常、口内炎	腹部膨満感、食欲亢進
循環器		動悸、血圧上昇、不整脈（房室ブロック、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍、心房細動）	
血液	好酸球増多	好中球減少、リンパ球増多、白血球増多、白血球減少、単球増多、血小板増加、血小板減少	
過敏症		発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、そう痒感、血管浮腫	多形紅斑
眼		結膜充血、霧視	眼球回転発作
肝臓	ALT（GPT）上昇、AST（GOT）上昇、総ビリルビン上昇	Al-P 上昇	
腎臓・泌尿器		尿蛋白、BUN 上昇、尿糖、ウロビリノーゲンの異常、頻尿、血尿	排尿困難、遺尿、尿閉
その他		耳鳴、月経異常、胸痛、ほてり、息苦しさ	関節痛、手足のこわばり、嗅覚異常、鼻出血、脱毛、咳嗽、体重増加、筋肉痛

注）市販後の自発報告等又は外国での報告のため頻度不明。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

（成人）

承認時まで及び承認後の副作用調査調査例数の累計 7,155 例中 396 例（5.53%）に 473 件の副作用又は臨床検査値の異常変動が認められた。

	承認時迄の状況	使用成績調査の累計	合計
調査症例数（症例）	1396	5759	7155
副作用等の発現症例数（症例）	189	207	396
副作用等の発現件数（件）	240	233	473
副作用等の発現症例率（%）	13.54%	3.59%	5.53%

副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例数又は件数（%）※		
	承認時までの状況	使用成績調査の累計	合計
感染症および寄生虫症	**－**	**3（0.05）**	**3（0.04）**
せつ	－	1（0.02）	1（0.01）
咽頭炎	－	2（0.03）	2（0.03）
副鼻腔炎	－	1（0.02）	1（0.01）
免疫系障害	**－**	**2（0.03）**	**2（0.03）**
過敏症	－	1（0.02）	1（0.01）
アレルギー性浮腫	－	1（0.02）	1（0.01）
代謝および栄養障害	**5（0.36）**	**2（0.03）**	**7（0.10）**
食欲不振	5（0.36）	2（0.03）	7（0.10）
神経系障害	**93（6.66）**	**161（2.80）**	**254（3.55）**
浮動性めまい	1（0.07）	8（0.14）	9（0.13）
味覚異常	1（0.07）	1（0.02）	2（0.03）
頭痛	6（0.43）	6（0.10）	12（0.17）
感覚鈍麻	3（0.21）	2（0.03）	5（0.07）
鎮静	－	1（0.02）	1（0.01）
傾眠	84（6.02）	149（2.59）	233（3.26）
眼障害	**2（0.14）**	**－**	**2（0.03）**
霧視	1（0.07）	－	1（0.01）
結膜充血	1（0.07）	－	1（0.01）
耳および迷路障害	**1（0.07）**	**1（0.02）**	**2（0.03）**
耳鳴	1（0.07）	1（0.02）	2（0.03）
心臓障害	**4（0.29）**	**2（0.03）**	**6（0.08）**
不整脈	1（0.07）	－	1（0.01）
動悸	2（0.14）	2（0.03）	4（0.06）
頻脈	1（0.07）	－	1（0.01）
血管障害	**1（0.07）**	**1（0.02）**	**2（0.03）**
ほてり	1（0.07）	1（0.02）	2（0.03）
呼吸器、胸郭および縦隔障害	**1（0.07）**	**1（0.02）**	**2（0.03）**
鼻乾燥	－	1（0.02）	1（0.01）
呼吸窮迫	1（0.07）	－	1（0.01）

※ゴシック太字は例数、明朝細字は件数

副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例数又は件数（%）※		
	承認時までの状況	使用成績調査の累計	合計
胃腸障害	**36（2.58）**	**13（0.23）**	**49（0.68）**
腹部不快感	2（0.14）	－	2（0.03）
腹痛	3（0.21）	－	3（0.04）
上腹部痛	2（0.14）	1（0.02）	3（0.04）
アフタ性口内炎	－	1（0.02）	1（0.01）
口唇炎	1（0.07）	－	1（0.01）
便秘	－	2（0.03）	2（0.03）
下痢	1（0.07）	2（0.03）	3（0.04）
口内乾燥	－	2（0.03）	2（0.03）
消化不良	3（0.21）	－	3（0.04）
口唇乾燥	2（0.14）	－	2（0.03）
悪心	7（0.50）	3（0.05）	10（0.14）
胃不快感	5（0.36）	－	5（0.07）
嘔吐	1（0.07）	－	1（0.01）
頬粘膜のあれ	1（0.07）	1（0.02）	2（0.03）
口唇のひび割れ	－	1（0.02）	1（0.01）
口の味覚鈍麻	－	1（0.02）	1（0.01）
腹部症状	－	1（0.02）	1（0.01）
肝胆道系障害	**－**	**2（0.03）**	**2（0.03）**
肝機能異常	－	2（0.03）	2（0.03）
皮膚および皮下組織障害	**3（0.21）**	**6（0.10）**	**9（0.13）**
水疱性皮膚炎	－	1（0.02）	1（0.01）
接触性皮膚炎	1（0.07）	1（0.02）	2（0.03）
そう痒症	1（0.07）	1（0.02）	2（0.03）
発疹	1（0.07）	3（0.05）	4（0.06）
蕁麻疹	－	1（0.02）	1（0.01）
筋骨格系および結合組織障害	**－**	**2（0.03）**	**2（0.03）**
筋痙縮	－	1（0.02）	1（0.01）
筋骨格硬直	－	1（0.02）	1（0.01）
腎および尿路障害	**－**	**2（0.03）**	**2（0.03）**
血尿	－	1（0.02）	1（0.01）
頻尿	－	1（0.02）	1（0.01）
生殖系および乳房障害	**1（0.07）**	**1（0.02）**	**2（0.03）**
不規則月経	1（0.07）	1（0.02）	2（0.03）
全身障害および投与局所様態	**16（1.15）**	**21（0.36）**	**37（0.52）**
胸部不快感	－	1（0.02）	1（0.01）
胸痛	2（0.14）	－	2（0.03）
死亡	－	1（0.02）	1（0.01）
異常感	－	1（0.02）	1（0.01）
倦怠感	12（0.86）	9（0.16）	21（0.29）
浮腫	2（0.14）	－	2（0.03）
口渇	9（0.64）	9（0.16）	18（0.25）

※ゴシック太字は例数、明朝細字は件数

副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例数又は件数（%）※		
	承認時までの状況	使用成績調査の累計	合計
臨床検査値異常発現症例数※（%）	**54（－）**	**1（0.02）**	**55（－）**
アラニンアミノトランスフェラーゼ増加	18/1181（1.52）	1（0.02）	19/6940（0.27）
アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加	17/1182（1.44）	1（0.02）	18/6941（0.26）
血中ビリルビン増加	6/1133（0.53）	－	6/6892（0.09）
血圧上昇	1/1396（0.07）	－	1/7155（0.01）
血中尿素増加	4/1172（0.34）	－	4/6931（0.06）
好酸球数増加	9/1114（0.81）	－	9/6873（0.13）
尿中ブドウ糖陽性	2/1063（0.19）	－	2/6822（0.03）
リンパ球数増加	2/1117（0.18）	－	2/6876（0.03）
単球数増加	1/1114（0.09）	－	1/6873（0.01）
好中球数減少	3/1114（0.27）	－	3/6873（0.04）
白血球数減少	2/1175（0.17）	－	2/6934（0.03）
血小板数増加	1/1148（0.09）	－	1/6907（0.01）
尿中血陽性	1/483（0.21）	－	1/6242（0.02）
尿中蛋白陽性	4/1063（0.38）	－	4/6822（0.06）
尿中ウロビリン陽性	1/1057（0.09）	－	1/6816（0.01）
血中アルカリホスファターゼ増加	2/1170（0.17）	1（0.02）	3/6929（0.04）

※ゴシック太字は例数、明朝細字は件数
器官別大分類の例数は、重複集計しない
同一の副作用が同一症例で繰り返し認められた場合には、初発の事例を 1 件とした。

（小児）
承認時まで及び承認後の副作用調査調査例数の累計 3,759 例中 67 例（1.78%）に 72 件の副作用又は臨床検査値の異常変動が認められた。

	承認時迄の状況	特定使用成績調査の累計	合計
調査施設数（施設）	98	492	590
調査症例数（症例）	602	3157	3759
副作用の発現症例数（症例）	25	42	67
副作用の発現件数（件）	28	44	72
副作用等の発現症例率（%）	4.15%	1.33%	1.78%

副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例数又は件数（%）		合計
	承認時迄の状況	特定使用成績調査の累計	
感染症および寄生虫症	**－**	**4（0.13）**	**4（0.11）**
気管支炎	－	1（0.03）	1（0.03）
鼻咽頭炎	－	1（0.03）	1（0.03）
副鼻腔炎	－	3（0.10）	3（0.08）
神経系障害	**6（1.00）**	**24（0.76）**	**30（0.80）**
頭痛	－	2（0.06）	2（0.05）
傾眠	6（1.00）	22（0.70）	28（0.74）
呼吸器、胸郭および縦隔障害	**1（0.17）**	**2（0.06）**	**3（0.08）**
鼻出血	1（0.17）	－	1（0.03）
上気道の炎症	－	2（0.06）	2（0.05）
胃腸障害	**2（0.33）**	**4（0.13）**	**6（0.16）**
呼気臭	－	1（0.03）	1（0.03）
下痢	1（0.17）	2（0.06）	3（0.08）
排便回数増加	－	1（0.03）	1（0.03）
嘔吐	1（0.17）	－	1（0.03）
肝胆道系障害	**－**	**1（0.03）**	**1（0.03）**
肝機能異常	－	1（0.03）	1（0.03）

副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例数又は件数（%）		合計
	承認時迄の状況	特定使用成績調査の累計	
皮膚および皮下組織障害	**－**	**5（0.16）**	**5（0.13）**
湿疹	－	1（0.03）	1（0.03）
紅斑	－	1（0.03）	1（0.03）
発疹	－	2（0.06）	2（0.05）
蕁麻疹	－	1（0.03）	1（0.03）
腎および尿路障害	**－**	2（0.06）	2（0.05）
頻尿	－	1（0.03）	1（0.03）
尿失禁	－	1（0.03）	1（0.03）
一般・全身障害および投与部位の状態	**1（0.17）**	**1（0.03）**	**2（0.05）**
異常感	1（0.17）	－	1（0.03）
発熱	－	1（0.03）	1（0.03）
臨床検査	**16（2.66）**	**－**	**16（0.43）**
アラニンアミノトランスフェラーゼ増加	8（1.33）	－	8（0.21）
アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加	2（0.33）	－	2（0.05）
血中ビリルビン増加	2（0.33）	－	2（0.05）
血中クレアチニン増加	1（0.17）	－	1（0.03）
肝機能検査異常	2（0.33）	－	2（0.05）
好中球数減少	1（0.17）	－	1（0.03）
白血球数増加	1（0.17）	－	1（0.03）
尿中蛋白陽性	1（0.17）	－	1（0.03）

※ゴシック太字は例数、明朝細字は件数
器官別大分類の例数は、重複集計しない
同一の副作用が同一症例で繰り返し認められた場合には、初発の事例を１件とした。

(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

（成人）〈参考〉

承認時までの試験において、患者背景別の副作用発現率は以下のとおりである。

患者背景		評価例数	副作用発現例数	発現率
疾患	アレルギー性鼻炎	253	20	7.9%
	蕁麻疹	504	60	11.9%
	瘙痒性皮膚疾患	236	13	5.5%
	その他	403	47	11.7%
性	男	652	54	8.3%
	女	744	86	11.6%
年齢	11－19 歳	131	8	6.1%
	20－64 歳	1097	117	10.7%
	65－88 歳	168	15	8.9%
投与期間	≦2 週	922	104	11.3%
	2－8 週	411	33	8.0%
	≧9 週	63	3	4.8%

（6）薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【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（レボセチリジン、ヒドロキシジンを含む）に対し過敏症の既往歴のある患者

重大な副作用
1）ショック、アナフィラキシー（頻度不明注））
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。
注）市販後の自発報告等又は外国での報告のため頻度不明。

9. 高齢者への投与

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

（解説）
「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　6）高齢者」の項参照

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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

（解説）
（1）ラット及びウサギにおける妊娠前・妊娠初期投与試験、器官形成期投与試験及び周産期・授乳期投与試験では、母動物、胎児及び出生児ともに特記すべき異常は認められていない[50]。
臨床的には、胎児の器官形成期にセチリジン塩酸塩を服用した妊婦 39 例を対象としたプロスペクティブ・コホート・スタディー（prospective cohort study）において、本剤投与は催奇形性のリスクを増大させないとの外国における報告があり[51]、また、現在までにヒトでの催奇形性を肯定する症例報告もない。
しかし、国内における承認時までの臨床試験では、妊婦又は妊娠している可能性のある女性は投与対象から除外されており、外国においても妊婦におけるデータは十分ではない。
従って、本剤の妊婦又は妊娠している可能性のある患者への適用は、有効性と安全性を考慮のうえ使用される必要がある。
（2）産後の被験者 6 例を対象としたセチリジン塩酸塩 20mg 単回経口投与試験において、血中濃度より低かったものの、乳汁中にセチリジン塩酸塩が検出され、乳汁に移行することが示されている。
分娩後 9～11 日のラットに 10mg/kg を単回経口投与した場合、血漿中濃度とほぼ同様の乳汁中移行が認められた[40]。イヌ（静脈内投与）でも同様であった。
ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用のある薬剤は、一般に中枢神経系に対し興奮と抑制の両作用を示し、通

常用量では抑制的に作用し眠気等がみられるが、過量投与により痙攣等の興奮作用があらわれることがある。特に、乳・幼児では中毒によって痙攣を起こすことが報告されている[43、44]ので、授乳中の患者には本剤投与中は授乳を避けさせる必要がある。

11. 小児等への投与

小児等への投与

（1）2 歳以上 7 歳未満の小児に対してはセチリジン塩酸塩ドライシロップ 1.25%を投与すること。

（2）低出生体重児、新生児、乳児又は 2 歳未満の幼児に対する安全性は確立していない（国内における使用経験が少ない）。

（解説）

（1）ジルテック錠 5、ジルテック錠 10 には 7 歳未満の適応がないため、2 歳以上 7 歳未満の小児に対してはドライシロップ製剤を投与すること。

（2）これまでに国内では低出生体重児、新生児、乳児又は 2 歳未満の幼児を対象とした試験は実施していない。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、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。

（解説）

一般に抗ヒスタミン作用や免疫抑制作用のある薬剤はアレルギー反応を修飾するため、皮内テスト等を実施する場合は、これらの薬剤が投与されていない時期を選ぶか、あるいはアレルゲンの皮内反応に影響しないよう投与を一時中止することが望ましい。

季節性アレルギー性鼻炎患者 13 例にセチリジン塩酸塩 1 日 10mg を 14 日間投与し、投与終了後 3、7 及び 14 日目にヒスタミン皮内反応試験を行ったところ、投与終了後 3 日目にはヒスタミン誘発膨疹は投与前値の約 90%に回復し、皮内反応の抑制はみられなかった（外国人データ）[52]。

従って、アレルゲン皮内反応検査を実施するときに必要な本剤の休薬期間については、季節性アレルギー性鼻炎患者における臨床試験成績より、3～5 日間が必要である。

13. 過量投与

過量投与

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

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

14. 適用上の注意

適用上の注意〔ジルテック錠 5、ジルテック錠 10〕
薬剤交付時
PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。
（PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。）

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当資料なし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

本剤の一般薬理試験の要約は次のとおりであった。セチリジン塩酸塩で認められた作用は、総じて高用量でのみ認められた[53)]。

(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

1) 中枢神経系

100mg/kg（経口投与）で脳波の睡眠・覚醒周期で覚醒期の減少が認められた（ウサギ）他、特記すべき作用なし。

2) 自律神経系及び平滑筋

10mg/kg（静脈内投与）でノルアドレナリン昇圧反応の増強を示した（ラット）他、特記すべき作用なし。

3) 呼吸・循環器系

対照としたテルフェナジン（販売中止）で用量依存的に血圧の低下、呼吸数の増加、心拍数の減少及び心電図への影響が認められたのに対し、セチリジン 10mg/kg（静脈内投与）では一過性の血圧低下後の軽度な血圧上昇及び大腿動脈血流量の減少を示したが、心拍数や心電図には影響を与えなかった（イヌ）。

4) 消化器系

100mg/kg（十二指腸内投与）で胃液量及び酸分泌量の減少と pH の上昇を示したが、経口投与で肉眼的に消化管粘膜に対する作用は認められなかった（ラット）。

(4) その他の薬理試験

1) 一般症状及び行動

特記すべき作用なし。

2) 体性神経系

特記すべき作用なし。

3) 腎機能

100mg/kg（経口投与）で軽度の利尿又はその傾向が認められた（ラット）。

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

（LD_{50}　mg/kg）

動物種 / 投与経路	ラット[54)]		イヌ[54)]		幼若ラット		幼若イヌ	
	♂	♀	♂	♀	♂	♀	♂	♀
経口	447	365	＞320		200～300		＞300	

(2) 反復投与毒性試験

1) 亜急性毒性：1ヵ月投与試験（ラット、サル）

ラットに1ヵ月連続投与（10、40、160、320mg/kg/日）及びサル（17、50、150mg/kg/日）に1ヵ月連続投与した結果、ラットでは死亡が発現した320mg/kgで赤血球系及び脂質系パラメータの低値が、肝臓、腎臓、甲状腺に組織学的変化が認められた。サルでは50mg/kg以上で体重減少及び血液生化学的パラメータの軽度の変動がみられ、150mg/kgで嘔吐及び腎臓、肺重量の高値がみられた。
無毒性量はラットでは雄10mg/kg、雌40mg/kg、サルでは17mg/kgであった。

2) 慢性毒性：12ヵ月投与試験（ラット[55]、サル、イヌ）

ラット（2、10、50mg/kg/日）、サル（5、15、45mg/kg/日）及びイヌ（4、15、60mg/kg/日）に12ヵ月間連続投与した結果、亜急性毒性試験（1ヵ月投与試験）でみられた変化と同様の変化がみられたが、投与期間の延長による新たな毒性の発現や毒性の増強は認められなかった。
無毒性量はラットで雄2mg/kg、雌10mg/kg、サルで15mg/kgであった。イヌでは嘔吐頻度の増加のみが主な症状で無毒性量は15mg/kgであった。

(3) 生殖発生毒性試験

1) 妊娠前・妊娠初期投与試験

（ラット：5、30、200mg/kg経口投与）：
200mg/kgで雌雄ともF_0に死亡が認められたが、催奇形作用、胎児致死作用、また、黄体数、交尾率、胎内発育に及ぼす影響は認められなかった[50]。

2) 器官形成期投与試験

（ラット：5、30、200mg/kg、JW-KBLウサギ：5、30、180mg/kg経口投与）：
ラットでは200mg/kgでF_0に死亡が認められ、また、ウサギでは180mg/kgでF_0に死亡が認められたが、催奇形作用、胎児致死作用及び胎内発育に及ぼす影響は認められなかった[50]。

3) 周産期・授乳期投与試験

（ラット：5、30、180mg/kg経口投与）：
180mg/kgでF_0に死亡が認められたが、分娩、妊娠期間、出生率及び胎児の発育、生殖能に影響は認められなかった[50]。

(4) その他の特殊毒性

1) 依存性

実施していない。

2) 抗原性

モルモットを用いた全身性アナフィラキシー反応、PCA反応、ゲル内沈降反応及び赤血球凝集反応による検討を行ったが、いずれの試験においても抗原性は認められなかった[56]。

3) 変異原性

細菌による復帰変異試験、培養細胞による染色体異常試験、小核試験において変異原性は認められなかった[57]。

4) がん原性

がん原性はみられなかった。

Ⅹ．管理的事項に関する項目

1．規制区分

製　　剤：該当しない
有効成分：セチリジン塩酸塩　劇薬

2．有効期間又は使用期限

錠 5、錠 10
　使用期限：3 年（安定性試験結果に基づく）
ドライシロップ 1.25％
　使用期限：3 年（安定性試験結果に基づく）

3．貯法・保存条件

室温保存

4．薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

（2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目　6．重要な基本的注意とその理由及び処置方法、14．適用上の注意」の項参照

くすりのしおり：有り

（3）調剤時の留意点について

該当しない

5．承認条件等

なし

6．包装

ジルテック錠 5　　：PTP100 錠（10 錠×10）、PTP500 錠（10 錠×50）
（日本薬局方セチリジン塩酸塩錠）
ジルテック錠 10　　：PTP100 錠（10 錠×10）、PTP280 錠（14 錠×20）
（日本薬局方セチリジン塩酸塩錠）
ジルテックドライシロップ 1.25％（1g 中 12.5mg 含有）：
　0.4g×100 包（2 包×50）
　100g（瓶）

7. 容器の材質

錠 5、錠 10

PTP 包装

PTP の材質：ポリ塩化ビニル、アルミニウム箔

ドライシロップ 1.25%

瓶

瓶の材質：ポリエチレン

蓋の材質：ポリプロピレン

分包

ポリエチレン/アルミ袋

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同　効　薬：レボセチリジン塩酸塩、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オキサトミド、ケトチフェンフマル酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン等のヒスタミン H_1 受容体拮抗薬

9. 国際誕生年月日

1986 年 11 月 6 日（ベルギー）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

錠 5：1998 年 6 月 30 日、21000AMY00144

錠 10：1998 年 6 月 30 日、21000AMY00145

ドライシロップ 1.25%：2005 年 10 月 21 日、21700AMZ00754

11. 薬価基準収載年月日

錠 5、錠 10：1998 年 8 月 28 日

ドライシロップ 1.25%：2006 年 7 月 7 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

（1）ジルテック錠 5

用法・用量追加年月日：2009 年（平成 21 年）4 月 22 日

追加用法・用量（小児）

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

（2）ジルテックドライシロップ 1.25％

用法・用量追加年月日：2009 年（平成 21 年）4 月 22 日

追加用法・用量（小児）

通常、2 歳以上 7 歳未満の小児には 1 回 0.2g（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。

通常、7 歳以上 15 歳未満の小児には 1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 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。

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

ジルテック錠 5、錠 10［成人］

再審査結果公表年月日：2008 年 10 月 3 日

再審査結果：薬事法第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しないものと判定された。

ジルテック錠 5、ジルテックドライシロップ 1.25％［小児］

再審査結果公表年月日：2016 年 6 月 24 日

再審査結果：医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しないものと判定された。

14. 再審査期間

ジルテック錠 5、錠 10［成人］：1998 年 6 月 30 日～2004 年 6 月 29 日（終了）

ジルテック錠 5、ジルテックドライシロップ 1.25%［小児］：2009 年 4 月 22 日～2013 年 4 月 21 日（終了）

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、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

販売名	包装	HOT（13 桁）番号	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト電算コード
ジルテック錠 5	5mg×100 （10 錠×10）	1095531030101	4490020F1020	610421326
	5mg×500 （10 錠×50）	1095531030102		
ジルテック錠 10	10mg×100 （10 錠×10）	1095548030101	4490020F2027	610421327
	10mg×280 （14 錠×20）	1095548030201		
ジルテックドライシロップ 1.25%	100g （瓶入り）	1172621010101	4490020R1027	620003961
	0.4g×100 包	1172621010301		

17. 保険給付上の注意

該当しない

ＸＩ．文献

1. 引用文献

1）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望1994；37：754
2）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床1994；28：2107
3）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床1994；28：2147
4）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床1994；28：2163
5）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2007）
6）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2005）
7）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした長期投与試験（2005）
8）社内資料：小児アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験
9）社内資料：小児各種皮膚疾患を対象とした長期投与試験
10）笹　征史ほか：臨床薬理1995；26：509
11）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（1992）
12）社内資料：健康小児を対象とした二重盲検比較試験（1991）
13）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望1995；38：116
14）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床1994；28：2131
15）ETAC Study Group：Pediatr Allergy Immunol 1998；9：116
16）Simons FER，et al：J Allergy Clin Immunol 1999；104（2．Part I）：433
17）Stevenson J，et al：Pediatric Research 2002；52：251
18）内田昌子ほか：基礎と臨床1994；28：1795
19）Nonaka H，et al.：Eur J Pharmacol 1998；345：111
20）Snyder SH，et al.：Ann Allergy 1987；59（6．Part II）：4
21）Advenier C，et al.：J Allergy Clin Immunol 1991；88：104
22）Simons FER，et al.：J Allergy Clin Immunol 1990；86（4．Part I）：540
23）Grant JA，et al.：Allergy 1999；54：700
24）Braunstein G，et al.：Br J Clin Pharmacol 1992；33：445
25）Okada C，et al.：Int Arch Allergy Immunol 1994；103：384
26）Fadel R，et al.：Clin Allergy* 1987；17：373
27）Pasquale CP，et al.：Eur J Pharmacol 1992；223：9
28）Cheria-Sammari S，et al.：Clin Exp Allergy 1995；25：729
29）Sehmi R，et al.：Pediatr Allergy Immunol 1993；4（S-4）：13
30）Fabre JM，et al.：Allergy 1995；50：362
31）社内資料：ドライシロップ剤及び錠剤の生物学的同等性試験
32）浦江明憲ほか：基礎と臨床1994；28：2175
33）社内資料：Retrospective population pharmacokinetic analysis of cetirizine in Japanese children
34）Matzke GR，et al.：Ann Allergy 1987；59（6．Part II）：25
35）Awni WM，et al.：Eur J Clin Pharmacol 1990；38：67
36）Simons FER，et al.：J Clin Pharmacol 1993；33：949
37）Horsmans Y，et al.：J. Clin Pharmacol 1993；33：929
38）水野佳子ほか：基礎と臨床1994；28：1951
39）Wood SG，et al.：Ann Allergy 1987；59（6．Part II）：31
40）水野佳子ほか：基礎と臨床1994；28：1925
41）内田昌子ほか：基礎と臨床1994；28：1843
42）Abbasi MM，et al.：Adv Pharm Bull 2016；6：111
43）澤田康文ほか：薬局1994；45：2209
44）澤田康文ほか：薬局1994；45：2413
45）Hulhoven R，et al.：Amer J Therapeutics 1995；2：71

46） Peytavin G，et al.：Eur J Clin Pharmacol 2005；61：267
47） Doms M，et al.：Eur J Clin Pharmacol 1988；34：619
48） 社内資料：ケトコナゾール併用時の薬物動態及び心電図への影響
49） 社内資料：エリスロマイシン併用時の薬物動態及び心電図への影響
50） 上島みゆきほか：基礎と臨床1994；28：1887
51） Einarson A，et al.：Ann Allergy Asthma Immunol 1997；78：183
52） Berkowitz RB，et al.：Ann Allergy Asthma Immunol 1996；76：363
53） 宮岸　明ほか：基礎と臨床1994；28：1813
54） 野崎善弘ほか：基礎と臨床1994；28：1859
55） 野崎善弘ほか：基礎と臨床1994；28：1865
56） 和田　浩ほか：基礎と臨床1994；28：1905
57） 中嶋　圓ほか：基礎と臨床1994；28：1915

* 「Clin Allergy」は1989年以降「Clin Exp Allergy」に誌名変更されている

2. その他の参考文献

特になし

ⅩⅡ．参考資料

1．主な外国での発売状況

セチリジン塩酸塩は世界 100 ヵ国以上で発売又は承認されている（2011 年 7 月現在）。
なお、米国では 2008 年にスイッチ OTC 薬として承認され、現在は OTC 薬として販売されている。米国及び英国における発売状況は下表のとおりである。

外国での発売状況（2016 年 9 月調査）

国名 承認年月 [a]	販売名	会社名	剤形・規格	効能・効果	用法・用量
米国 1996 年 2 月	ZYRTEC TABLETS (OTC)	Healthy Essentials	錠剤 10mg	季節性アレルギー性鼻炎及び他の呼吸器系のアレルギーに伴う症状（鼻水、くしゃみ、痒み、涙目、鼻及びのどの痒み）の緩和	成人及び 6 歳以上の小児： 1 回 10mg 1 日 1 回
	ZYRTEC Liquid Gels (OTC)		カプセル剤 10mg		
	ZYRTEC Dissolve Tabs (OTC)		口腔内崩壊錠 10mg		
	Children's ZYRTEC Dissolve Tabs (OTC)		口腔内崩壊錠 10mg（シトラスフレーバー）		
	Children's ZYRTEC Allergy Syrup (OTC)		シロップ剤 1mg/mL		成人及び 6 歳以上の小児： 5mL 又は 10mL 1 日 1 回 65 歳以上の成人： 5mL 1 日 1 回 2 歳以上 6 歳未満の小児： 2.5mL 1 日 1 回 2 歳未満は医師に相談
英国 1998 年 10 月	Zirtek Allergy 10mg film-coated Tablets	UCB Pharma Limited	錠剤 10mg	季節性アレルギー性鼻炎・通年性アレルギー性鼻炎の鼻・眼症状の緩和 慢性特発性蕁麻疹の症状緩和	成人：10mg 1 日 1 回 12 歳以上の青少年：10mg 1 日 1 回 6 歳から 12 歳の小児：5mg 1 日 2 回
	Zirtek Allergy Relief 10mg film-coated tablets (OTC)				
	Zirtek Allergy Solution, 1mg/mL oral solution		内服液 1mg/mL		成人：10mg 1 日 1 回 12 歳以上の青少年：10mg 1 日 1 回 6 歳から 12 歳の小児：5mg 1 日 2 回 2 歳から 6 歳の小児：2.5mg 1 日 2 回
	Zirtek Allergy Relief for Children 1mg/mL oral solution (OTC)				成人：10mg 1 日 1 回 12 歳以上の青少年：10mg 1 日 1 回 6 歳から 12 歳の小児：5mg 1 日 2 回

a：初回承認時の発売年月

日本における効能・効果、用法・用量は下記のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

〈効能・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

〈用法・用量〉

[10mg 錠]

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

[5mg 錠]

〔成人〕

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

〔小児〕

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

[ドライシロップ剤]

〔成人〕

通常、成人には 1 回 0.8g（セチリジン塩酸塩として 10mg）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 1.6g（セチリジン塩酸塩として 20mg）とする。

〔小児〕

通常、2 歳以上 7 歳未満の小児には 1 回 0.2g（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。
通常、7 歳以上 15 歳未満の小児には 1 回 0.4g（セチリジン塩酸塩として 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. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦に関する海外情報

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリア分類とは異なる。

【使用上の注意】「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」

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

	分類
オーストラリアの分類 （An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）	B2（2016 年 7 月）

参考：分類の概要

オーストラリアの分類：（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

B2：Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

ⅩⅢ．備考

その他の関連資料

ジルテックドライシロップ 1.25%と他剤との配合変化（成人）

注）①本データは他剤と配合した時の外観変化、懸濁性及びジルテックドライシロップ 1.25%の残存率を示したもので他剤の定量は行っていない。

②また、この資料は他の薬剤との配合を推奨するものではない。併用に関しては、配合薬剤の効能・効果、用法・用量及び使用上の注意を十分確認のこと。

③販売名、製造販売会社名は試験実施時のものである。

1. 試験方法

ジルテックドライシロップ 1.25%と配合薬剤とを配合した試料（以下、配合試料）について、25℃±2℃/60%RH±5%RH 条件下に一定期間保存後、外観、懸濁性、残存率（%）（セチリジン塩酸塩の定量）を観察した。

外観、懸濁性については粉末約 0.8g、残存率については粉末約 1.0g を採取し、配合される薬剤と配合した（結果の表中にはジルテックドライシロップ 0.8g に対する配合量を記載。ジルテックドライシロップ 1.0g に対する配合量も同じ比率で配合した。）。

2. 測定時期

外観、懸濁性は混合直後、1、3、7、15、30 日目、残存率は混合直後、7 日、30 日目に観察を行った。

3. 試験項目

（1）外観：色調、凝集、湿潤などの変化を肉眼で観察した。

－：変化の全く認められないもの

±：変化の有無の疑わしいもの

＋：明らかに変化が認められるもの

（2）懸濁性：配合試料に水 30mL を加え、10 回倒立・正立操作後の懸濁状態を肉眼で観察した。

良：均一に懸濁するもの

不良：均一に懸濁しないもの

（3）残存率：配合試料中のセチリジン塩酸塩含量を算出し、配合直後の配合試料中のセチリジン塩酸塩含量を 100%としたときの残存率を算出した。

4．結果

（1）他剤との配合により、外観に変化が見られたもの（ツムラ補中益気湯エキス顆粒（医療用）のみ）、及び沈殿等が確認されたものを以下に示す。沈殿等が確認されたものはいずれも配合開始直後から懸濁不良であった。

分類	配合薬剤	配合量*	試験項目	測定時期					
	販売名（製造販売会社）			直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
抗ヒスタミン薬・抗アレルギー薬	タベジール散 0.1%	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ノバルティスファーマ）		残存率（%）	100	/	/	93.9	/	90.4
漢方製剤	ツムラ小柴胡湯エキス顆粒（医療用）	2.5g	外観	白色/淡黄褐色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ツムラ）		残存率（%）	100	/	/	100.0	/	94.8
	ツムラ補中益気湯エキス顆粒（医療用）	2.5g	外観	白色/淡褐色	－	－	－	＋（凝集）	＋（凝集）
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ツムラ）		残存率（%）	100	/	/	94.9	/	88.3
気管支拡張薬	テオドール顆粒 20%	2.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	101.7	/	93.4
	テオドールドライシロップ 20%	0.4g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	97.6	/	92.7
	テオロング顆粒 50%	0.4g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（エーザイ）		残存率（%）	100	/	/	101.2	/	96.0
	メプチン顆粒 0.01%	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（大塚製薬）		残存率（%）	100	/	/	99.4	/	92.0
強心薬	カルグート細粒 5%	0.1g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	101.3	/	105.0
緩下薬	アローゼン顆粒	1.0g	外観	白色/茶褐色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ポーラファルマ）		残存率（%）	100	/	/	98.2	/	105.5
胃腸薬	S・M 配合散	1.3g	外観	白色/灰褐色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（第一三共エスファー第一三共）		残存率（%）	100	/	/	97.6	/	96.9
	ベリチーム配合顆粒	0.4g	外観	白色/淡黄色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	95.5	/	108.8
	重質酸化マグネシウム.OI（細粒）	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（日医工ファーマー岩城製薬）		残存率（%）	100	/	/	98.1	/	108.7
血圧降下薬	10%アプレゾリン散「チバ」	0.1g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ノバルティスファーマ）		残存率（%）	100	/	/	102.8	/	110.1
抗ウイルス薬	ゾビラックス顆粒 40%	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（グラクソ・スミスクライン）		残存率（%）	100	/	/	97.1	/	102.7
解熱鎮痛消炎薬	アセトアミノフェン「JG」原末	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（日本ジェネリック－長生堂製薬）		残存率（%）	100	/	/	94.3	/	102.5

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.8g に対する配合量

分類	配合薬剤 販売名（製造販売会社）	配合量*	試験項目	測定時期 直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
精神 神経用薬	インプロメン細粒 1%	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ヤンセンファーマ－田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	101.9	/	110.5
	ドグマチール細粒 50%	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（アステラス製薬）		残存率（%）	100	/	/	90.6	/	94.1
冠循環 改善薬	ジピリダモール散 12.5%「JG」	0.2g	外観	白色/黄色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）
	（日本ジェネリック－長生堂製薬）		残存率（%）	100	/	/	96.9	/	105.7
抗生物質	クラビット細粒 10%	1.0g	外観	白色/黄白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（第一三共）		残存率（%）	100	/	/	88.7	/	99.3
抗てんかん 薬	エクセグラン散 20%	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（大日本住友製薬）		残存率（%）	100	/	/	90.1	/	93.4
抗パーキン ソン病薬	ドプス細粒 20%	1.0g	外観	白色/淡褐色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（大日本住友製薬）		残存率（%）	100	/	/	95.2	/	100.1
胃炎・潰瘍 治療薬	アプレース細粒 20%	0.5g	外観	白色/微黄色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（杏林製薬）		残存率（%）	100	/	/	92.4	/	94.7
	ゲファニール細粒 10%	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（大日本住友製薬）		残存率（%）	100	/	/	95.7	/	97.8
	コランチル配合顆粒	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	94.6	/	100.2
	セルベックス細粒 10%	1.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（エーザイ）		残存率（%）	100	/	/	93.8	/	95.9
	ソロン細粒 20%	0.5g	外観	白色/淡黄色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（大正製薬－大正富山医薬品）		残存率（%）	100	/	/	100.7	/	98.0
	タガメット細粒 20%	2.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）
	（大日本住友製薬）		残存率（%）	100	/	/	95.1	/	98.5
	トロキシン細粒 20%	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（大原薬品工業）		残存率（%）	100	/	/	92.5	/	93.5
	ノイエル細粒 40%	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（第一三共エスファー－第一三共）		残存率（%）	100	/	/	102.9	/	97.3
	マーズレン S 配合顆粒	0.5g	外観	白色/青色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（寿製薬－ゼリア新薬工業）		残存率（%）	100	/	/	99.4	/	94.3
鎮咳・去痰薬	リン酸コデイン散 1%「ヒシヤマ」	2.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ニプロファーマ）		残存率（%）	100	/	/	100.4	/	97.6
	アストミン散 10%	0.2g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（アステラス製薬）		残存率（%）	100	/	/	103.4	/	92.1
	コルドリン顆粒 4.17%	0.6g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（日本新薬）		残存率（%）	100	/	/	101.5	/	93.3
	フスタゾール散 10%	0.2g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	103.7	/	95.7

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.8g に対する配合量

分類	配合薬剤 販売名（製造販売会社）	配合量*	試験項目	測定時期					
				直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
整腸薬	エンテロノン－R 散	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（味の素製薬）		残存率（%）	100	/	/	104.2	/	94.1
脳循環・代謝改善薬	グラマリール細粒 10%	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）	不良（沈殿・浮遊物）
	（アステラス製薬）		残存率（%）	100	/	/	105.9	/	97.3
ビタミン製剤	ビタミン C 散「フソー」－100mg	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（扶桑薬品工業）		残存率（%）	100	/	/	97.2	/	89.9
	メチコバール細粒 0.1%	1.0g	外観	白色/桃赤色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（エーザイ）		残存率（%）	100	/	/	99.1	/	94.2
	ユベラ顆粒 20%	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（サンノーバーエーザイ）		残存率（%）	100	/	/	98.3	/	85.2
副腎皮質ホルモン薬	プレドニゾロン散「タケダ」1%	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（武田薬品工業）		残存率（%）	100	/	/	96.0	/	89.0
利尿薬	アルダクトン A 細粒 10%	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（ファイザー）		残存率（%）	100	/	/	99.3	/	94.4
	ラシックス細粒 4%	1.0g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（サノフィ・アベンティス）		残存率（%）	100	/	/	101.6	/	92.4

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.8g に対する配合量

(2) 他剤との配合により、均一に懸濁したものを以下に示す。

分類	配合薬剤 販売名（製造販売会社）	配合量*	試験項目	測定時期 直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
カルシウム拮抗薬	ペルジピン散 10%	0.2g	外観	白色/淡黄色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（アステラス製薬）		残存率（%）	100	/	/	95.6	/	91.3
	セパミット細粒 1%	1.0g	外観	白色/黄色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（MSD）		残存率（%）	100	/	/	103.0	/	96.3
βブロッカー	ミケラン細粒 1%	0.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（大塚製薬）		残存率（%）	100	/	/	90.6	/	90.6
抗ヒスタミン薬・抗アレルギー薬	ピレチア細粒 10%	0.25g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	96.7	/	93.3
	ヒベルナ散 10%	0.25g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	98.0	/	96.4
	ペリアクチン散 1%	0.4g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（日医工）		残存率（%）	100	/	/	91.6	/	92.3
	ポララミン散 1%	0.1g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（MSD）		残存率（%）	100	/	/	89.4	/	87.1
気管支拡張薬	イノリン散 1%	0.4g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	104.4	/	93.9
	スピロペント顆粒 0.002%	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（帝人ファーマ）		残存率（%）	100	/	/	108.9	/	95.0
	ベラチンドライシロップ小児用 0.1%	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（田辺三菱製薬－田辺製薬販売）		残存率（%）	100	/	/	97.5	/	101.3
	ホクナリンドライシロップ 0.1%小児用	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（アボット ジャパン）		残存率（%）	100	/	/	102.1	/	103.1
強心薬	ジゴシン散 0.1%	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（中外製薬）		残存率（%）	100	/	/	94.8	/	103.7
	ノイキノン顆粒 1%	1.0g	外観	黄色/白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（エーザイ）		残存率（%）	100	/	/	97.3	/	105.3
去痰薬	ビソルボン細粒 2%	0.2g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（日本ベーリンガーインゲルハイム）		残存率（%）	100	/	/	100.8	/	105.5
	ムコソルバン DS3%	0.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（帝人ファーマ）		残存率（%）	100	/	/	99.9	/	106.7
胃腸薬	沈降炭酸カルシウム	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（山田製薬）		残存率（%）	100	/	/	100.3	/	109.5
血圧降下薬	カプトリル細粒 5%	0.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（第一三共エスファー第一三共）		残存率（%）	100	/	/	97.3	/	101.9

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.8g に対する配合量

分類	配合薬剤 販売名（製造販売会社）	配合量*	試験項目	測定時期 直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
高脂血症改善薬	メバロチン細粒 1%	0.5g	外観	白色/微紅色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（第一三共）		残存率（%）	100	/	/	96.1	/	103.1
解熱鎮痛消炎薬	ロキソニン細粒 10%	0.6g	外観	白色/ごく薄い紅色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（第一三共）		残存率（%）	100	/	/	94.0	/	103.5
抗生物質	セフスパン細粒 50mg	2.0g	外観	白色/淡橙色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（長生堂製薬－田辺製薬販売）		残存率（%）	100	/	/	99.8	/	106.4
	エリスロシンドライシロップ 10%	2.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（アボット ジャパン）		残存率（%）	100	/	/	81.6	/	89.3
	ミノマイシン顆粒 2%	1.0g	外観	白色/淡橙色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（ファイザー－武田薬品工業）		残存率（%）	100	/	/	105.5	/	99.4
抗結核薬	イスコチン原末	0.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（第一三共）		残存率（%）	100	/	/	96.0	/	100.4
抗パーキンソン病薬	シンメトレル細粒 10%	2.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（ノバルティスファーマ）		残存率（%）	100	/	/	89.8	/	87.3
骨代謝改善薬	アルファロール散 1μg/g	0.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（中外製薬）		残存率（%）	100	/	/	87.5	/	91.3
胃炎・潰瘍治療薬	ガスター散 2%	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（アステラス製薬）		残存率（%）	100	/	/	92.9	/	97.5
	ガスロン N 細粒 0.8%	0.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（日本新薬）		残存率（%）	100	/	/	90.1	/	94.6
鎮咳・去痰薬	メジコン散 10%	0.3g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	101.6	/	99.1
	アスベリン散 10%	0.6g	外観	白色/橙色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（田辺三菱製薬－田辺製薬販売）		残存率（%）	100	/	/	100.3	/	94.3
脳循環・代謝改善薬	サアミオン散 1%	0.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	98.4	/	92.0
副腎皮質ホルモン薬	リンデロン散 0.1%	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	100.0	/	96.3
その他	局　乳糖水和物	1.0g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（丸石製薬）		残存率（%）	100	/	/	98.2	/	97.2
	ジルテックドライシロップ 1.25%	―	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（ユーシービージャパン）		残存率（%）	100	/	/	102.6	/	101.2

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.8g に対する配合量

ジルテックドライシロップ 1.25%と他剤との配合変化（小児）

注）①本データは他剤と配合した時の外観変化、懸濁性及びジルテックドライシロップ 1.25%の残存率を示したもので他剤の定量は行っていない。

②また、この資料は他の薬剤との配合を推奨するものではない。併用に関しては、配合薬剤の効能・効果、用法・用量及び使用上の注意を十分確認のこと。

③販売名、製造販売会社名は試験実施時のものである。

1. 試験方法

ジルテックドライシロップ 1.25%と配合薬剤とを配合した試料（以下、配合試料）について、25℃±2℃/60%RH±5%RH 条件下に一定期間保存後、外観、懸濁性、残存率（%）（セチリジン塩酸塩の定量）を観察した。

外観、懸濁性については粉末約 0.4g、残存率については粉末約 0.5g を採取し、配合される薬剤と配合した（結果の表中にはジルテックドライシロップ 0.4g に対する配合量を記載。ジルテックドライシロップ 0.5g に対する配合量も同じ比率で配合した。）。

2. 測定時期

外観、懸濁性は混合直後、1、3、7、15、30 日目、残存率は混合直後、7 日、30 日目に観察を行った。

3. 試験項目

（1）外観：色調、凝集、湿潤などの変化を肉眼で観察した。

－：変化の全く認められないもの

±：変化の有無の疑わしいもの

＋：明らかに変化が認められるもの

（2）懸濁性：配合試料に水 30mL を加え、10 回倒立・正立操作後の懸濁状態を肉眼で観察した。

良：均一に懸濁するもの

不良：均一に懸濁しないもの

（3）残存率：配合試料中のセチリジン塩酸塩含量を算出し、配合直後の配合試料中のセチリジン塩酸塩含量を 100%としたときの残存率を算出した。

4．結果

（1）他剤との配合により沈殿等が確認されたものを以下に示す。

分類	配合薬剤 販売名（製造販売会社）	配合量*	試験項目	測定時期 直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
抗ヒスタミン薬・抗アレルギー薬	ポララミンシロップ 0.04%	1.63mL	外観	白色/だいだい色澄明	－	－	－	/	/
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	良	/	/
	（MSD）		残存率（%）	100	/	/	97.7	/	/
	ポララミン散 1%	0.07g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（MSD）		残存率（%）	100	/	/	104.4	/	100.9
	ゼスラン小児用シロップ 0.03%	3mL	外観	白色/無色澄明	－	－	－	/	/
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	良	良	/	/
	（旭化成ファーマ）		残存率（%）	100	/	/	93.8	/	/
	ゼスラン小児用シロップ 0.03%	6mL	外観	白色/無色澄明	－	－	/	/	－
			懸濁性	不良（沈殿）	良	良	良	/	/
	（旭化成ファーマ）		残存率（%）	100	/	/	91.3	/	/
気管支拡張薬	テオドールドライシロップ 20%	0.6g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（田辺三菱製薬）		残存率（%）	100	/	/	100.5	/	104.2
鎮咳・去痰薬	メジコン配合シロップ	3mL	外観	白色/淡黄褐色澄明	－	－	－	/	/
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	良	良	/	/
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	98.0	/	/
鎮咳薬	アストミンシロップ 0.25%	5mL	外観	白色/だいだい色澄明	－	－	－	/	/
			懸濁性	不良（沈殿）	良	良	良	/	/
	（アステラス製薬）		残存率（%）	100	/	/	96.3	/	/
	アスベリンシロップ 0.5%	3mL	外観	白色/淡黄灰白色	－	－	－	/	/
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	/	/
	（田辺三菱製薬－田辺製薬販売）		残存率（%）	100	/	/	103.1	/	/
気道潤滑去痰剤	小児用ムコソルバンシロップ 0.3%	4.5mL	外観	白色/無色澄明	－	－	－	/	/
			懸濁性	不良（沈殿）	良	良	良	/	/
	（帝人ファーマ）		残存率（%）	100	/	/	96.1	/	/
抗ウイルス薬	ゾビラックス顆粒 40%	3g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（グラクソ・スミスクライン）		残存率（%）	100	/	/	89.7	/	95.9
解熱鎮痛消炎薬	ポンタールシロップ 3.25%	3mL	外観	白色/白色	－	－	－	/	/
			懸濁性	不良（沈殿）	良	良	良	/	/
	（第一三共）		残存率（%）	100	/	/	97.3	/	/
総合感冒剤	幼児用 PL 配合顆粒	4g	外観	白色/うすい橙色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	107.7	/	99.5
抗生物質	フロモックス小児用細粒 100mg	1.35g	外観	白色/赤白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿・浮遊）	不良（沈殿・浮遊）	不良（沈殿・浮遊）	不良（沈殿・浮遊）	不良（沈殿・浮遊）	不良（沈殿・浮遊）
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	101.6	/	102.1
	ホスミシンドライシロップ 200	3g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（MeijiSeika ファルマ）		残存率（%）	100	/	/	96.6	/	105.9
抗生物質	クラリスドライシロップ 10%小児用	1.5g	外観	白色/微赤白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）	不良（沈殿）
	（大正製薬－大正富山医薬品）		残存率（%）	100	/	/	100.1	/	106.0

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.4g に対する配合量

（2）他剤との配合により、均一に懸濁したものを以下に示す。

分類	配合薬剤 販売名（製造販売会社）	配合量*	試験項目	測定時期 直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
抗ヒスタミン薬・抗アレルギー薬	ポララミンドライシロップ 0.2% （高田製薬－MSD）	0.33g	外観	白色/淡黄赤色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	104.5	/	103.3
	ザジテンドライシロップ 0.1% （ノバルティスファーマ）	1.2g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	93.0	/	98.3
	セルテクトドライシロップ 2% （協和発酵キリン）	0.75g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	109.0	/	104.2
	オノンドライシロップ 10% （小野薬品工業）	1.05g	外観	白色/微黄色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	98.1	/	95.5
	アレギサール ドライシロップ 0.5% （田辺三菱製薬－田辺製薬販売）	1g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	97.8	/	86.1
	アレギサール ドライシロップ 0.5% （田辺三菱製薬－田辺製薬販売）	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	97.8	/	98.6
	リザベンドライシロップ 5% （キッセイ薬品工業）	1.5g	外観	白色/淡黄色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	計算せず	/	/	計算せず	/	計算せず
気管支拡張薬	ベラチンドライシロップ 小児用 0.1% （田辺三菱製薬－田辺製薬販売）	0.5g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	105.1	/	110.6
	メプチンシロップ 5μg/mL （大塚製薬）	7.5mL	外観	白色/無色澄明	－	－	－	/	/
			懸濁性	良	良	良	良	/	/
			残存率（%）	100	/	/	100.6	/	/
	ブリカニールシロップ 0.5mg/mL （アストラゼネカ）	6mL	外観	白色/無色澄明	－		－	/	/
			懸濁性	良	良	良	良	/	/
			残存率（%）	100	/	/	98.9	/	/
	ベネトリンシロップ 0.04% （グラクソ・スミスクライン）	9mL	外観	白色/無色澄明	－		－	/	/
			懸濁性	良	良	良	良	/	/
			残存率（%）	100	/	/	98.9	/	/
気道粘液調整・粘膜正常化剤	ムコダインシロップ 5% （杏林製薬）	9mL	外観	白色/褐色	－	－	－	/	/
			懸濁性	良	良	良	良	/	/
			残存率（%）	100	/	/	96.9	/	/
気道潤滑去痰剤	ムコサールドライシロップ 1.5% （日本ベーリンガーインゲルハイム）	0.9g	外観	白色	－	－	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
			残存率（%）	100	/	/	99.8	/	100.1

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.4g に対する配合量

分類	配合薬剤 販売名（製造販売会社）	配合量*	試験項目	測定時期					
				直後	1 日	3 日	7 日	15 日	30 日
抗生物質	ケフラール細粒小児用 100mg	3g	外観	白色/うすい黄色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（塩野義製薬）		残存率（%）	100	/	/	83.0	/	82.4
	セフゾン細粒小児用 10%	1.35g	外観	白色/淡赤白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（アステラス製薬）		残存率（%）	100	/	/	98.6	/	97.5
	バナンドライシロップ 5%	1.8g	外観	白色/赤みの橙色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（第一三共－グラクソ・スミスクライン）		残存率（%）	100	/	/	98.9	/	98.0
	メイアクト MS 小児用細粒 10%	1.35g	外観	白色/橙色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（MeijiSeika ファルマ）		残存率（%）	100	/	/	99.3	/	97.6
	エリスロシンドライシロップ 10%	3.75g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（アボット ジャパン）		残存率（%）	100	/	/	90.6	/	115.1
	エリスロシンドライシロップ W20%	1.88g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（アボット ジャパン）		残存率（%）	100	/	/	101.5	/	99.5
乳糖分解酵素剤	ミルラクト細粒 50%	0.25g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（高田製薬）		残存率（%）	100	/	/	95.4	/	97.9
消化管運動改善剤	ナウゼリンドライシロップ 1%	1.5g	外観	白色	―	―	―	―	―
			懸濁性	良	良	良	良	良	良
	（協和発酵キリン）		残存率（%）	100	/	/	98.3	/	101.4

*配合量：ジルテックドライシロップ 0.4g に対する配合量

ホクナリンドライシロップ 0.1%小児用については、「ジルテックドライシロップ 1.25%と他剤との配合変化（成人）」を参照すること。

グラクソ・スミスクライン株式会社
〒107-0052　東京都港区赤坂１－８－１

ZYCMIF01-D1904D
改訂年月2019年4月
JP-N-ZI-ALY-1900006