

2020年6月改訂 (第2版)

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会 IF 記載要領 2018 (2019年更新版) に準拠して作成 (一部記載要領 2013 に準拠)

持続性選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「KMP」
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets 「KMP」
レボセチリジン塩酸塩錠

剤形	割線入りフィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品 (注意-医師等の処方箋により使用すること)
規格・含量	1錠中、レボセチリジン塩酸塩 5mg を含有
一般名	和名：レボセチリジン塩酸塩 (JAN) 洋名：Levocetirizine Hydrochloride (JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2020年2月17日 薬価基準収載年月日：2020年6月19日 発売開始年月日：2020年6月19日
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：共創未来ファーマ株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室 TEL 050-3383-3846 受付時間：9時～17時 (土、日、祝祭日、弊社休日を除く) 医療関係者向けホームページ http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html

本 IF は 2020 年 6 月作成 (第 1 版) の添付文書の記載に基づき作成した。
 最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページ
 (<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) で確認してください。

Lcet-IF②

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）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医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）が誕生した。1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。IF記載要領2008以降、IFは紙媒体の冊子としての提供方式からPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA と略す）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されて入手可能となっている。日病薬では、2008年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切に審査・検討している。この度、2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、新たに日病薬医薬情報委員会が記載要領を改め、「IF記載要領2018」として公表された。

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。IF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。ただし、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（以下、薬機法と略す）に基づく承認事項を逸脱するもの、製薬企業の機密等に関わ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の提供は、電子媒体を基本とし、必要に応じて薬剤師が印刷して使用する。製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより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、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。しかし、薬機法の広告規制や医療用医薬品プロモーションコード等により、製薬企業が提供できる情報の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。

(2018年10月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯.....	1
2. 製品の治療学的特性.....	1
3. 製品の製剤学的特性.....	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1
6. RMPの概要.....	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名.....	2
2. 一般名.....	2
3. 構造式又は示性式.....	2
4. 分子式及び分子量.....	2
5. 化学名（命名法）又は本質.....	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質.....	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	3
IV. 製剤に関する項目	4
1. 剤形.....	4
2. 製剤の組成.....	4
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	5
4. 力価.....	5
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	6
6. 製剤の各種条件下における安定性 ¹⁾	7
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	8
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	8
9. 溶出性 ²⁾	8
10. 容器・包装.....	10
11. 別途提供される資材類.....	10
12. その他.....	10
V. 治療に関する項目	11
1. 効能又は効果.....	11
2. 効能又は効果に関連する注意.....	11
3. 用法及び用量.....	11
4. 用法及び用量に関連する注意.....	11
5. 臨床成績.....	11
VI. 薬効薬理に関する項目	13
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群.....	13
2. 薬理作用.....	13
VII. 薬物動態に関する項目	14
1. 血中濃度の推移.....	14
2. 薬物速度論的パラメータ.....	15
3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	15
4. 吸収.....	15
5. 分布.....	15
6. 代謝.....	16
7. 排泄.....	16

8. トランスポーターに関する情報.....	16
9. 透析等による除去率.....	16
10. 特定の背景を有する患者.....	16
11. その他.....	16
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
1. 警告内容とその理由.....	17
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	17
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17
5. 慎重投与内容とその理由	17
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法.....	18
7. 相互作用.....	18
8. 副作用.....	18
9. 高齢者への投与	20
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	20
11. 小児等への投与	20
12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	20
13. 過量投与.....	20
14. 適用上の注意.....	21
15. その他の注意.....	21
16. その他.....	21
IX. 非臨床試験に関する項目	22
1. 薬理試験.....	22
2. 毒性試験.....	22
X. 管理的事項に関する項目	23
1. 規制区分.....	23
2. 有効期間.....	23
3. 包装状態での貯法.....	23
4. 取扱い上の注意	23
5. 患者向け資材	23
6. 同一成分・同効薬.....	23
7. 国際誕生年月日	23
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	23
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容.....	23
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	23
11. 再審査期間.....	24
12. 投薬期間制限に関する情報	24
13. 各種コード.....	24
14. 保険給付上の注意	24
X I. 文献.....	25
1. 引用文献.....	25
2. その他の参考文献.....	25
X II. 参考資料.....	26
1. 主な外国での発売状況.....	26
2. 海外における臨床支援情報	26
X III. 備考.....	27
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報.....	27
2. その他の関連資料	28

略語表

なし（個別に各項目において解説する。）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KMP」は、後発医薬品として薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2020 年 2 月に承認を取得した。なお、本剤は後発医薬品として、共創未来ファーマ株式会社、沢井製薬株式会社との合計 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し承認を得て、2020 年 6 月に上市した。

2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤は、血液脳関門を通過しにくい非鎮静性 H₁ 受容体拮抗薬である。ヒスタミンと受容体を競合しその作用を遮断することでアレルギー反応を抑制する薬剤である。（「VI.薬効薬理に関する項目 2.薬理作用」を参照）
- 2) 重大な副作用（頻度不明）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」を参照）

3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有 無	タイトル、参照先
医薬品リスク管理計画 (以下 RMP)	無	
追加のリスク最小化活動として作 成されている資料	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1)承認条件

該当しない

(2)流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「KMP」

(2) 洋名

Levocetirizine Hydrochloride Tablets 5mg 「KMP」

(3) 名称の由来

一般名+剤形+規格(含量)+「KMP」

薬食審査発第 0922001 号(平成 17 年 9 月 22 日)に基づく

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

レボセチリジン塩酸塩(JAN)

(2) 洋名(命名法)

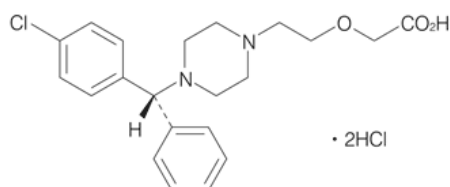
Levocetirizine hydrochloride (JAN)

(3) ステム(stem)

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

構造式:



4. 分子式及び分子量

分子式: $C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot 2HCl$

分子量: 461.81

5. 化学名(命名法)又は本質

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

・各種溶媒における溶解度：水に極めて溶けやすく、エタノール (99.5) に溶けにくい。0.1 mol/L 塩酸試液に溶ける。

・各種 pH 溶媒に対する溶解度：該当資料なし

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法 (塩化カリウム錠剤法)

(3) 塩化物の定性反応

定量法：電位差滴定法



IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	色・剤形	外形			サイズ		
		表面	裏面	側面	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
レボセチリジン塩 酸塩錠5mg「KMP」	白色・割線入りフィル ムコーティング錠				長径：8.1 短径：4.6	3.3	約103

(3) 識別コード

販売名	レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「KMP」
識別表示	表面：レボセチリジン 5 KMP 裏面：レボセチリジン 5 KMP
記載場所	錠剤

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「KMP」
有効成分 (1錠中)	レボセチリジン塩酸塩 5mg
添加剤	カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース

添加剤添加目的

添加剤	添加目的
カルナウバロウ	光沢化剤
軽質無水ケイ酸	滑沢剤
結晶セルロース	賦形剤
酸化チタン	コーティング剤
ステアリン酸マグネシウム	滑沢剤
タルク	コーティング剤
乳糖水和物	賦形剤
低置換度ヒドロキシプロピルセルロース	崩壊剤
ヒプロメロース	コーティング剤

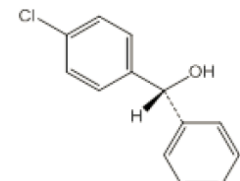
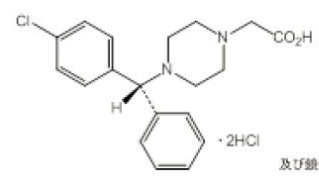
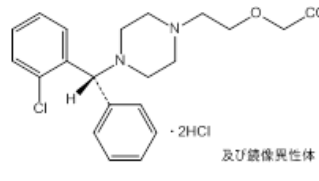
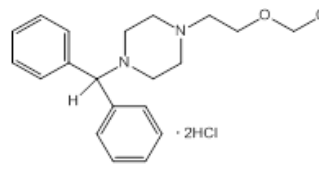
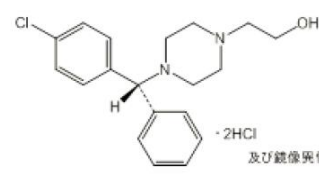
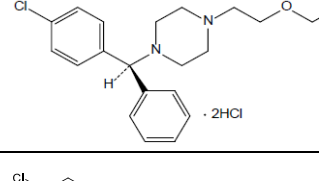
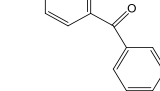
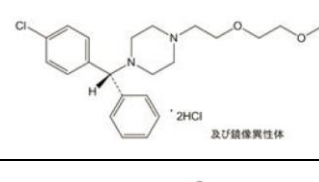
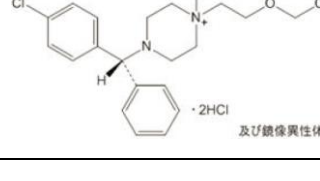
(2) 電解質等の濃度
該当しない

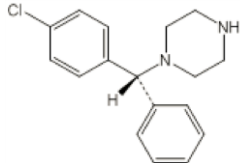
(3) 熱量
該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量
該当しない

4. 力価
該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

名称・化合物名	化学式	構造式	起源
類縁物質 1	(<i>RS</i>)-4-Chlorobenzhydrol	 及び鏡像異性体	分解物
類縁物質 2	(<i>RS</i>)-2-{4-[(4-Chloro-phenyl)phenylmethyl] piperazin-1-yl}acetic acid dihydrochloride	 · 2HCl 及び鏡像異性体	副生成物
類縁物質 3	(<i>RS</i>)-2-(2-{4-[(2-Chloro-phenyl)phenylmethyl] piperazin-1-yl}ethoxy) acetic acid dihydrochloride	 · 2HCl 及び鏡像異性体	副生成物
類縁物質 4	2-(4-Benzhydryl-1-piperazinyl) ethoxyacetic acid dihydrochloride	 · 2HCl	副生成物及び分解物
類縁物質 5	(<i>RS</i>)-2-{4-[(4-Chlorophenyl)phenylmethyl] piperazin-1-yl} ethanoldihydrochloride	 · 2HCl 及び鏡像異性体	分解物
類縁物質 6	(<i>S</i>)-2-(2-{4-[(4-Chloro-phenyl)phenylmethyl]piperazin-1-yl}ethoxy) acetic acid dihydrochloride	 · 2HCl	副生成物
類縁物質 7	4-Chlorobenzophenone		分解物
類縁物質 8	(<i>RS</i>)-2-[2-(2-{4-[(4-Chlorophenyl)phenylmethyl]piperazin-1-yl}ethoxy)ethoxy]acetic acid dihydrochloride	 · 2HCl 及び鏡像異性体	副生成物
類縁物質 9	2-(2-{4-[(4-Chlorophenyl)phenylmethyl]-1-oxidopiperazin-1-ium-1-yl} ethoxy)acetic acid	 · 2HCl 及び鏡像異性体	分解物

類縁物質 10	(R)-1-[(4-Chlorophenyl)(phenyl)methyl]piperazine		出発物質
---------	--	--	------

6. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

加速試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果
40°C75%RH	PTP 包装 (PTP シート/アルミ ピロー包装 (乾燥剤入り))	6 ヶ月	規格内

項目：性状、確認試験、製剤均一性、溶出試験、定量試験、純度試験 (類縁物質)

一次包装の安定性試験：

保存条件	保存形態	保存期間	結果*
25°C60%RH 遮光	PTP 包装品 (ピロー包装無し)	6 ヶ月	変化なし (規格内)

項目：性状、硬度 (参考値)、純度試験、溶出試験、定量試験

無包装状態の安定性試験：

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果*
室温	25°C60%RH・遮光	褐色ガラス瓶 (開放)	1 ヶ月	変化なし (規格内)
			3 ヶ月	硬度にやや変化あり
加温	40°C・遮光	褐色ガラス瓶 (気密)	3 ヶ月	変化なし (規格内)
加湿	25°C75%RH・遮光	褐色ガラス瓶 (開放)	1 ヶ月	硬度にやや変化あり
			3 ヶ月	硬度にやや変化あり
曝光	25°C60%RH・D ₆₅ ランプ 2000lux 照射	開放シャーレ	120 万 lux・hr 照射時点	変化なし (規格内)

項目：性状、硬度 (参考値)、純度試験、溶出試験、定量試験

錠剤分割後の安定性試験：

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果*	備考
室温	25°C60%RH 遮光	褐色ガラス瓶 (開放)	3 ヶ月	変化なし (規格内)	—
曝光	25°C60%RH、D ₆₅ ランプ 2000lux 照射	ガラスシャーレ (開放)	60 万 lux・hr 照射時点	性状 (分割面)、含量に変化あり (規格内)	光の照射量に依存して類縁物質の増加を認めた (規格内)
		ガラスシャーレ (開放)	120 万 lux・hr 照射時点	性状 (分割面)、含量に変化あり (規格内)	

項目：性状 (参考規格)、純度試験 (類縁物質)、製剤均一性 (開始時のみ)、溶出試験、定量試験

*判定基準

項目	分類	評価基準
性状	変化なし（規格内）	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
	変化あり（規格内）	わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合
	変化あり（規格外）	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合
硬度（参考値）	変化なし	硬度変化が30%未満の場合
	やや変化あり	硬度変化が30%以上であるが、2kg以上の硬度を有している場合
	変化あり	硬度変化が30%以上であり、硬度が2kg未満の場合
純度試験 （類縁物質）	変化なし（規格内）	規格値内の場合
	変化あり（規格外）	規格値外の場合
製剤均一性	変化なし（規格内）	規格値内の場合
	変化あり（規格外）	規格値外の場合
溶出試験	変化なし（規格内）	規格値内の場合
	変化あり（規格外）	規格値外の場合
定量試験	変化なし（規格内）	含量低下が3%未満の場合
	変化あり（規格内）	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
	変化あり（規格外）	規格値外の場合

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性²⁾

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KMP」について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号）（以下、ガイドライン）に従い溶出試験を行った。

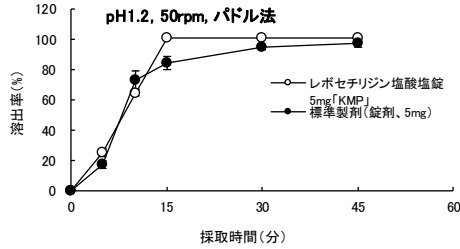
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
 回転数 : 50rpm

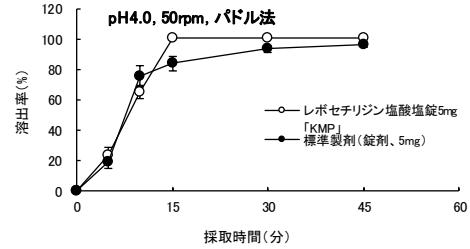
試験製剤 : レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KMP」

検体数 : n=12

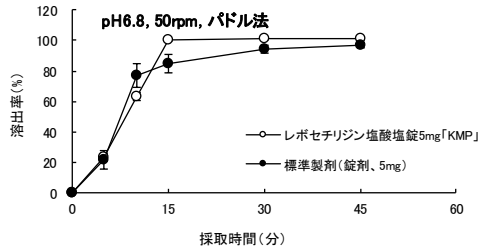
試験法 : パドル法
 標準製剤 : 錠剤、5mg



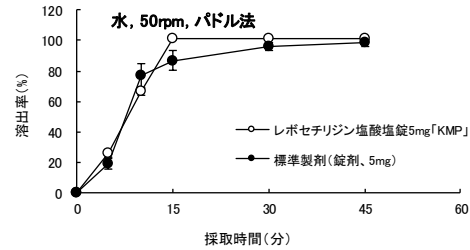
時間(分)	0	5	10	15	30	45
レボセチリジン塩酸塩錠	0	25.4	64.9	101.0	101.3	101.2
標準偏差	0	2.8	2.3	0.8	0.8	0.7
標準製剤(錠剤、5mg)	0	17.5	73.4	84.6	95.1	97.4
標準偏差	0	2.7	6.0	4.6	2.0	2.0



時間(分)	0	5	10	15	30	45
レボセチリジン塩酸塩錠	0	24.1	65.1	100.9	101.3	101.4
標準偏差	0	4.6	3.7	0.9	0.9	0.9
標準製剤(錠剤、5mg)	0	19.4	75.9	84.2	93.7	96.6
標準偏差	0	4.5	6.5	4.7	2.2	1.6



時間(分)	0	5	10	15	30	45
レボセチリジン塩酸塩錠	0	23.5	63.3	100.6	101.1	101.1
標準偏差	0	2.5	2.3	0.7	0.6	0.6
標準製剤(錠剤、5mg)	0	21.9	77.1	84.9	94.4	97.2
標準偏差	0	6.2	7.8	6.2	2.6	1.7



時間(分)	0	5	10	15	30	45
レボセチリジン塩酸塩錠	0	25.9	66.3	100.9	101.1	101.0
標準偏差	0	2.0	2.4	0.8	0.7	0.8
標準製剤(錠剤、5mg)	0	19.4	77.0	86.7	95.9	98.4
標準偏差	0	3.5	7.7	6.4	2.8	2.1

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較 (パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		類似性の判定基準	判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験製剤	標準製剤		
50	pH1.2	15	101.0	84.6	15分以内に平均85%以上溶出 試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15% f2関数の値が42以上	適
	pH4.0	15	100.9	84.2		不適
		30	101.3	93.7		適
		45	101.4	96.6		適
	pH6.8	15	100.6	84.9		15分以内に平均85%以上溶出
水	15	100.9	86.7	15分以内に平均85%以上溶出	適	

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。従って、レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KMP」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報
該当資料なし

(2) 包装

PTP : 100 錠 (10 錠×10)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP : ポリクロロトリフルオロエチレン、アルミニウム箔

アルミピロー : アルミニウム箔 (乾燥剤 (ゼオライト) 入り)

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

〔成人〕

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症

〔小児〕

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

〔成人〕

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

〔小児〕

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

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

<用法・用量に関連する使用上の注意>

腎障害患者では、血中濃度半減期の延長が認められ、血中濃度が増大するため、クレアチニンクリアランスに応じて、下表のとおり投与量の調節が必要である。

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

成人患者の腎機能に対応する用法・用量の目安（外国人データ）

	クレアチニンクリアランス (mL/min)			
	≥80	50～79	30～49	10～29
推奨用量	5mgを 1日に1回	2.5mgを 1日に1回	2.5mgを 2日に1回	2.5mgを週に2回 (3～4日に1回)

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

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

- (2) 臨床薬理試験
該当資料なし
- (3) 用量反応探索試験
該当資料なし
- (4) 検証的試験
 - 1) 有効性検証試験
該当資料なし
 - 2) 安全性試験
該当資料なし
- (5) 患者・病態別試験
該当資料なし
- (6) 治療的使用
 - 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容
該当資料なし
 - 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要
該当資料なし
- (7) その他
該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

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、メキタジン、デスロラタジン、ビラスチン等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序³⁾

レボセチリジンは血液脳関門を通過しにくい非鎮静性 H₁ 受容体拮抗薬である。ヒスタミンと受容体を競合しその作用を遮断することでアレルギー反応を抑制する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

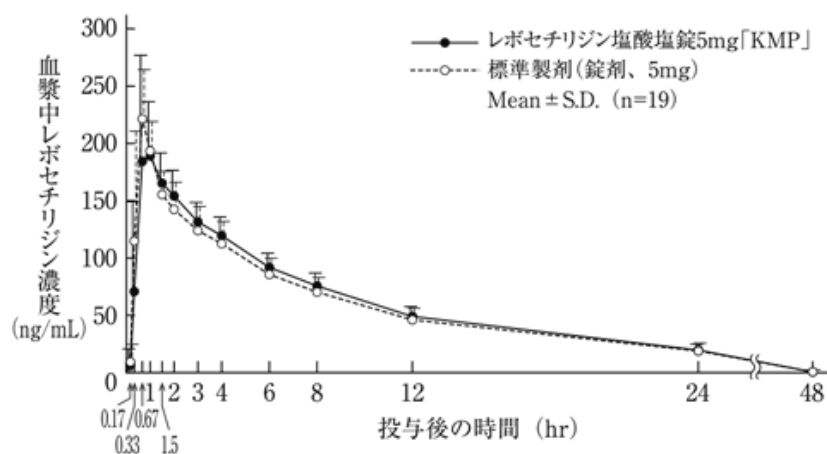
生物学的同等性試験⁴⁾

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「KMP」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠（レボセチリジン塩酸塩として 5mg）空腹時単回経口投与（クロスオーバー法）し、血漿中レボセチリジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0→48hr} (ng·hr/mL)
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「KMP」	227 ± 48	1.0 ± 0.5	8.4 ± 1.3	1830 ± 270
標準製剤 (錠剤、5mg)	240 ± 38	0.7 ± 0.2	8.5 ± 1.5	1759 ± 339

(Mean ± S.D., n=19)



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

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「VIII.安全性（使用上の注意等）に関する項目 7.相互作用」を参照

2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) 吸収速度定数
該当資料なし
- (3) 消失速度定数
Kel : $0.085 \pm 0.014 \text{ hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食経口投与)
- (4) クリアランス
該当資料なし
- (5) 分布容積
該当資料なし
- (6) その他
該当資料なし

3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) パラメータ変動要因
該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

- (1) 血液-脳関門通過性
該当資料なし
- (2) 血液-胎盤関門通過性
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。
- (3) 乳汁への移行性
セチリジン^{注)} 塩酸塩において、ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。
注) ラセミ体であるセチリジンの *R*-エナンチオマーがレボセチリジンである。
- (4) 髄液への移行性
該当資料なし
- (5) その他の組織への移行性
該当資料なし

- (6) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

6. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
該当資料なし
- (2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率
該当資料なし
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
該当資料なし
- (4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率
該当資料なし

7. 排泄

本剤は、主として腎臓から排泄される。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

本剤は透析で除去されない。

10. 特定の背景を有する患者

腎障害患者：血中濃度半減期の延長が認められ、血中濃度が増大する。

高齢者：本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがある。

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

（インタビューフォーム記載要領 2013 に準拠）

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由（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（セチリジン、ヒドロキシジンを含む）に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) 重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

腎障害患者では、血中濃度半減期の延長が認められ、血中濃度が増大するため、クレアチニンクリアランスに応じて、下表のとおり投与量の調節が必要である。

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

成人患者の腎機能に対応する用法・用量の目安（外国人データ）

	クレアチニンクリアランス (mL/min)			
	≥80	50～79	30～49	10～29
推奨用量	5mg を 1日に1回	2.5mg を 1日に1回	2.5mg を 2日に1回	2.5mg を週に2回 (3～4日に1回)

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

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- 1) 腎障害のある患者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。（「用法・用量に関連する使用上の注意とその理由」の項参照）〕
- 2) 肝障害のある患者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。〕
- 3) 高齢者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。（「高齢者への投与」の項参照）〕
- 4) てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者〔痙攣を発現するおそれがある。〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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

7. 相互作用

- (1) 併用禁忌とその理由
設定されていない

- (2) 併用注意とその理由

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

注) ラセミ体であるセチリジンの *R*-エナンチオマーがレボセチリジンである。

8. 副作用

- (1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

(頻度不明)

- (1) **ショック、アナフィラキシー**：ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、血圧低下、蕁麻疹、発赤等）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (2) **痙攣**：異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (3) **肝機能障害、黄疸**：AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTP、LDH、Al-Pの上昇等の肝機能障害（初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等）、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (4) **血小板減少**：血小板減少があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

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。

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

注) セチリジン塩酸塩でのみ認められている副作用（ラセミ体であるセチリジンのR-エナンチオマーがレボセチリジンである。）

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【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（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

4. 副作用

1) 重大な副作用（頻度不明）

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

4. 副作用

2) 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。

	頻度不明
過 敏 症	発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、そう痒感、血管浮腫、多形紅斑、薬疹

9. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、低用量（例えば 2.5mg）から投与を開始するなど慎重に投与すること。異常が認められた場合は減量又は休薬するなど適切な処置を行うこと。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔動物実験（ラット）で胎盤を通過することが報告されている。〕
- 2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔セチリジン^注塩酸塩において、ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。〕
- 注）ラセミ体であるセチリジンの *R*-エナンチオマーがレボセチリジンである。

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は7歳未満の小児に対する安全性は確立していない（国内における使用経験はない）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルギー皮内反応を抑制するため、アレルギー皮内反応検査を実施する3～5日前より本剤の投与を中止することが望ましい。

13. 過量投与

- 1) 徴候、症状：本剤の過量投与により傾眠傾向があらわれることがある。特に小児では激越、落ち着きのなさがあらわれることがある。
- 2) 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

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

15. その他の注意

設定されていない

16. その他

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験
該当資料なし
- (2) 安全性薬理試験
該当資料なし
- (3) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験
該当資料なし
- (3) 遺伝毒性試験
該当資料なし
- (4) がん原性試験
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験
該当資料なし
- (7) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：該当しない

2. 有効期間

使用期限：3年（外箱に表示）

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

・安定性試験¹⁾

PTP包装（PTPシートをアルミピロー包装(乾燥剤入り)）したものをを用いた加速試験（40°C75%RH、6ヶ月）の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：有、くすりのしおり：準備中

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ザイザル錠 5mg

同効薬：セチリジン塩酸塩、ロラタジン、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン、デスロラタジン、ビラスチン

7. 国際誕生年月日

2001年1月3日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
製造販売承認	2020年2月17日	30200AMX00107000	2020年6月19日	2020年6月19日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
レボセチリジン塩 酸塩錠 5mg「KMP」	4490028F1051	〃	127926901	622792601

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 共創未来ファーマ (株) 社内資料 [安定性試験]
- 2) 共創未来ファーマ (株) 社内資料 [溶出試験]
- 3) 田中千賀子他編, NEW 薬理学, 改訂第 7 版, 南江堂, 2017, p. 157.
- 4) 共創未来ファーマ (株) 社内資料 [生物学的同等性試験]
- 5) 共創未来ファーマ (株) 社内資料 [粉碎時安定性試験]
- 6) 共創未来ファーマ (株) 社内資料 [簡易懸濁法]

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

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

(1) 粉碎⁵⁾

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
室温	25°C60%RH・遮光	開放シャーレ (アルミ箔で覆う)	3 ヶ月	規格内
曝光	25°C60%RH・D65 蛍光 ランプ 2000lux/hr 照射	開放シャーレ	10 万 lux・hr 照射時点	規格内
			30 万 lux・hr 照射時点	不純物増加

項目：性状、純度試験、定量試験

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性⁶⁾

1) 簡易懸濁試験

試験方法

本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55°C)20mLを採取した。

5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)

- ③ シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。
- ④ チューブ通過後のpHを測定した。

結果

懸濁状態	錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した
チューブ通過後のpH	3.3

(1ロット, 繰り返し1回)

2) 経管投与試験(乳鉢で粉碎した場合)

試験方法

- ① 本剤を1錠とり、乳鉢で粉碎してビーカーに移したものに、温湯(約55°C)20mLを注ぎ、軽く攪拌して懸濁状態を観察した。
- ② 得られた液をシリンジで吸い取り、8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。
- ③ チューブ通過後のpHを測定した。

結果


懸濁状態	均一に懸濁した
チューブ通過性	通過した
チューブ通過後のpH	3.4

(1ロット, 繰り返し1回)

2. その他の関連資料

- ・ 共創未来ファーマ株式会社 製品情報ホームページ「医療関係者の方へ」
<http://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html>

- ・ 主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。
共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室
〒155-8655 東京都世田谷区代沢 5-2-1
TEL 050-3383-3846

製造販売元
 **共創未来ファーマ株式会社**
東京都品川区広町 1-4-4