

医薬品インタビューフォーム

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

持続性選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

レボセチリジン塩酸塩錠

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets「MEIJI」

剤形	錠剤（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 注）注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1錠中にレボセチリジン塩酸塩5mg
一般名	和名：レボセチリジン塩酸塩（JAN） 洋名：Levocetirizine hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2020年2月17日 薬価基準収載年月日：2020年6月19日 販売開始年月日：2020年6月19日
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：Meiji Seika ファルマ株式会社 販売元：Me ファルマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室 （Me ファルマ株式会社専用ダイヤル） TEL：(0120) 261-158 FAX (03) 3272-2438 受付時間：9時～17時（土・日・祝日及び当社休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.meiji-seika-pharma.co.jp/me-pharma/medical/

本 IF は 2024 年 1 月改訂（第 1 版）の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

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

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

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

2. IFとは

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

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあ

たつては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

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

目次

I. 概要に関する項目	1	6. 製剤の各種条件下における安定性	5
1. 開発の経緯	1	7. 調製法及び溶解後の安定性	5
2. 製品の治療学的特性	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5
3. 製品の製剤学的特性	1	9. 溶出性	5
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	10. 容器・包装	7
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(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	7
(1) 承認条件	1	(2) 包装	7
(2) 流通・使用上の制限事項	1	(3) 予備容量	7
6. RMPの概要	1	(4) 容器の材質	7
II. 名称に関する項目	2	11. 別途提供される資材類	8
1. 販売名	2	12. その他	8
(1) 和名	2	V. 治療に関する項目	9
(2) 洋名	2	1. 効能又は効果	9
(3) 名称の由来	2	2. 効能又は効果に関連する注意	9
2. 一般名	2	3. 用法及び用量	9
(1) 和名（命名法）	2	(1) 用法及び用量の解説	9
(2) 洋名（命名法）	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	9
(3) ステム（stem）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	9
3. 構造式又は示性式	2	5. 臨床成績	9
4. 分子式及び分子量	2	(1) 臨床データパッケージ	9
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(2) 臨床薬理試験	10
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(3) 用量反応探索試験	10
III. 有効成分に関する項目	3	(4) 検証的試験	10
1. 物理化学的性質	3	(5) 患者・病態別試験	13
(1) 外観・性状	3	(6) 治療的使用	14
(2) 溶解性	3	(7) その他	14
(3) 吸湿性	3	VI. 薬効薬理に関する項目	15
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	15
(5) 酸塩基解離定数	3	2. 薬理作用	15
(6) 分配係数	3	(1) 作用部位・作用機序	15
(7) その他の主な示性値	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(3) 作用発現時間・持続時間	15
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	VII. 薬物動態に関する項目	16
IV. 製剤に関する項目	4	1. 血中濃度の推移	16
1. 剤形	4	(1) 治療上有効な血中濃度	16
(1) 剤形の区別	4	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	16
(2) 製剤の外観及び性状	4	(3) 中毒域	17
(3) 識別コード	4	(4) 食事・併用薬の影響	17
(4) 製剤の物性	4	2. 薬物速度論的パラメータ	18
(5) その他	4	(1) 解析方法	18
2. 製剤の組成	4	(2) 吸収速度定数	18
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添 加剤	4	(3) 消失速度定数	18
(2) 電解質等の濃度	4	(4) クリアランス	18
(3) 熱量	4	(5) 分布容積	18
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	(6) その他	18
4. 力価	4	3. 母集団（ポピュレーション）解析	18
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	(1) 解析方法	18
		(2) パラメータ変動要因	18

4. 吸収	18	2. 毒性試験	26
5. 分布	18	(1) 単回投与毒性試験	26
(1) 血液-脳関門通過性	18	(2) 反復投与毒性試験	26
(2) 血液-胎盤関門通過性	18	(3) 遺伝毒性試験	26
(3) 乳汁への移行性	18	(4) がん原性試験	26
(4) 髄液への移行性	18	(5) 生殖発生毒性試験	26
(5) その他の組織への移行性	19	(6) 局所刺激性試験	26
(6) 血漿蛋白結合率	19	(7) その他の特殊毒性	26
6. 代謝	19	X. 管理的事項に関する項目	27
(1) 代謝部位及び代謝経路	19	1. 規制区分	27
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分 子種、寄与率	19	2. 有効期間	27
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	19	3. 包装状態での貯法	27
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存 在比率	19	4. 取扱い上の注意	27
7. 排泄	19	5. 患者向け資材	27
8. トランスポーターに関する情報	19	6. 同一成分・同効薬	27
9. 透析等による除去率	19	7. 国際誕生年月日	27
10. 特定の背景を有する患者	19	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基 準収載年月日、販売開始年月日	27
11. その他	21	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加 等の年月日及びその内容	27
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目	22	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ の内容	27
1. 警告内容とその理由	22	11. 再審査期間	27
2. 禁忌内容とその理由	22	12. 投薬期間制限に関する情報	27
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	22	13. 各種コード	28
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	22	14. 保険給付上の注意	28
5. 重要な基本的注意とその理由	22	XI. 文献	29
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	22	1. 引用文献	29
(1) 合併症・既往歴等のある患者	22	2. その他の参考文献	29
(2) 腎機能障害患者	22	XII. 参考資料	30
(3) 肝機能障害患者	22	1. 主な外国での発売状況	30
(4) 生殖能を有する者	23	2. 海外における臨床支援情報	30
(5) 妊婦	23	XIII. 備考	33
(6) 授乳婦	23	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	33
(7) 小児等	23	(1) 粉碎	33
(8) 高齢者	23	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ の通過性	33
7. 相互作用	23	2. その他の関連資料	33
(1) 併用禁忌とその理由	23		
(2) 併用注意とその理由	23		
8. 副作用	24		
(1) 重大な副作用と初期症状	24		
(2) その他の副作用	24		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	25		
10. 過量投与	25		
11. 適用上の注意	25		
12. その他の注意	25		
(1) 臨床使用に基づく情報	25		
(2) 非臨床試験に基づく情報	25		
IX. 非臨床試験に関する項目	26		
1. 薬理試験	26		
(1) 薬効薬理試験	26		
(2) 安全性薬理試験	26		
(3) その他の薬理試験	26		

略語表

略語	略語内容
AL-P	アルカリホスファターゼ
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血漿中濃度－時間曲線下面積
BUN	血液尿素窒素
CI	信頼区間
Cmax	最高血漿中濃度
CYP	チトクロム P-450
LDH	乳酸脱水素酵素
RMP	医薬品リスク管理計画
T _{1/2}	消失半減期
Tmax	最高血漿中濃度到達時間
γ-GTP	γ -グルタミルトランスペプチダーゼ

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レボセチリジンは、セチリジンの鏡像異性体である¹⁾。

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」は、Meiji Seika ファルマ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成 26 年 11 月 21 日付薬食発 1121 第 2 号）」に基づき規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2020 年 2 月に承認を取得し、同年 6 月に発売した。

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」は、2024 年 1 月に Meiji Seika ファルマ株式会社から Me ファルマ株式会社へ販売移管された。

2. 製品の治療学的特性

(1) アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症（以上成人）、ならびにアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒（以上小児）に適応がある。（「V. 1. 効能又は効果」の項参照）

(2) 副作用

重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、痙攣、肝機能障害、黄疸、血小板減少があらわれることがある。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

(1) 両面印刷製剤で、両面に「レボセチ」、表面に含量「5」、裏面に「明治」を印刷している。（「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照）

(2) 両面割線の錠剤である。（「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照）

4. 適正使用に関して周知すべき特性

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

(2024年10月現在)

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 「明治」

(2) 洋名

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets 5mg 「MEIJI」

(3) 名称の由来

一般名+剤形+規格(含量)+「明治」

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

レボセチリジン塩酸塩

(2) 洋名 (命名法)

Levocetirizine hydrochloride (JAN)

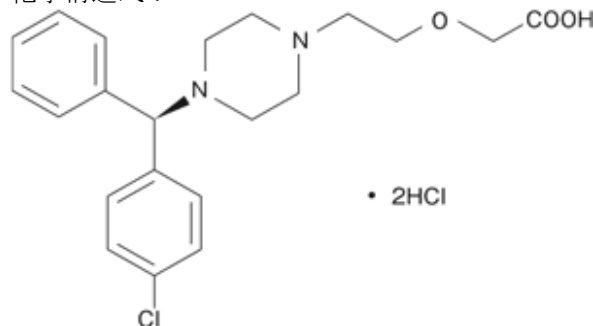
Levocetirizine (INN)

(3) ステム (stem) ²⁾

-izine(-yzine) : diphenylmethyl piperazine derivatives

3. 構造式又は示性式

化学構造式:



4. 分子式及び分子量

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

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

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

性状：レボセチリジン塩酸塩は白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

該当資料なし

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）
- (3) 塩化物の定性反応

定量法：電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠剤（フィルムコーティング錠）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	剤形	色	外形		
			表	裏	側面
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「明治」	楕円形の割線入りフィルムコーティング錠	白色			
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
			長径 : 8.1 短径 : 4.6	3.4	103

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

溶出性：「IV. 9. 溶出性」の項参照

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分（1錠中）	添加剤
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「明治」	レボセチリジン塩酸塩 5mg	乳糖水和物、結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当しない

6. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験³⁾

保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	PTP包装、アルミピロー包装、紙箱	6ヵ月	規格内

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性（含量均一性）、溶出性、含量、純度試験（類縁物質）

無包装安定性⁴⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
温度	40℃	褐色ガラス瓶・密栓	3ヵ月	判定基準の範囲内。硬度の低下は認められなかった。
湿度	25℃、75%RH	シャーレ開放	3ヵ月	判定基準の範囲内。硬度の低下が認められた（62.7→41.7N）。
光	2500lux D65ランプ 25℃、45%RH	シャーレ開放	120万lux・hr	判定基準の範囲内。硬度の低下は認められなかった。

試験項目：性状、純度試験（類縁物質）、溶出性、含量、(参考値)硬度

PTP包装状態での安定性⁵⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
湿度	25℃、60%RH	PTP包装	6ヵ月	判定基準の範囲内。硬度の低下は認められなかった。

試験項目：性状、溶出性、含量、純度試験（類縁物質）、(参考値)硬度

分割錠の安定性⁶⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
湿度	25℃、60%RH	シャーレ開放	3ヵ月	判定基準の範囲内
光	2500lux D65ランプ 25℃、45%RH		120万lux・hr	判定基準の範囲内

試験項目：性状、溶出性、含量、純度試験（類縁物質）

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

＜溶出挙動における類似性＞⁷⁾

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
試験条件

試験方法：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

試験液量：900mL

試験液温度：37±0.5℃

- 試験液：①pH1.2（日局溶出試験第1液）
 ②pH4.0（薄めた McIlvaine の緩衝液）
 ③pH6.8（日局溶出試験第2液）
 ④水

回転数：毎分 50 回転（試験液①～④）

毎分 50 回転の溶出試験で 30 分以内に標準製剤、試験製剤ともに平均 85%以上溶出したため、後発医薬品ガイドラインに従い、毎分 100 回転の試験は省略した。

試験回数：12 ベッセル

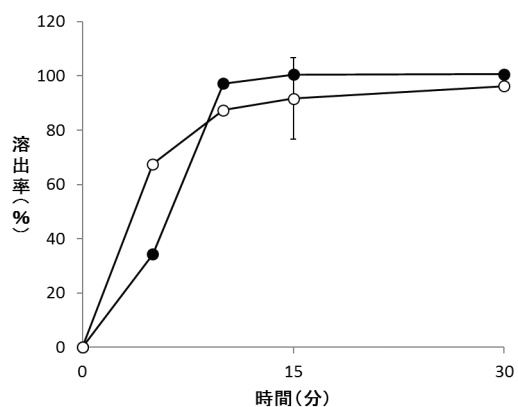
判定基準

試験条件		判定基準
pH1.2 (日局溶出試験第1液)	毎分 50 回転	標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合 試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
pH4.0 (薄めた McIlvaine の緩衝液)		
pH6.8 (日局溶出試験第2液)		
水		

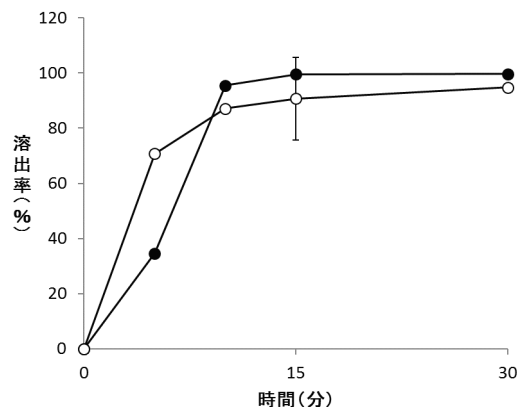
試験結果

試験製剤 レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」と標準製剤 ザイガル錠 5mg 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」に従って 4 種の試験条件で両製剤の溶出挙動の類似性を判定した結果、溶出挙動が類似していると判断された。

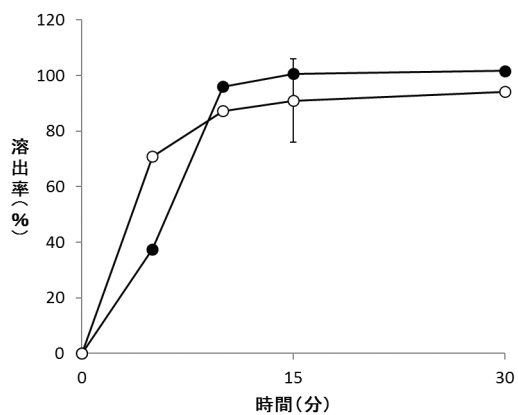
試験液①pH1.2、毎分 50 回転



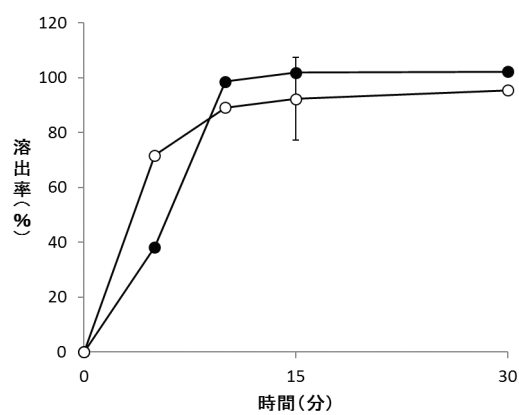
試験液②pH4.0、毎分 50 回転



試験液③pH6.8、毎分 50 回転



試験液④水、毎分 50 回転



● レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」(試験製剤)
 ○ ザイザル錠 5mg (標準製剤)
 ⊕ : 判定時点における類似性判定基準範囲
 n=12

図 レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」の溶出挙動における類似性
 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

表 試験製剤と標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件		比較時点	平均溶出率 (%)		判定*
回転数	試験液		標準製剤 (ザイザル錠 5mg)	試験製剤 (レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「明治」)	
50 回転	pH1.2	15 分	91.6	100.5	適合
	pH4.0	15 分	90.7	99.5	適合
	pH6.8	15 分	90.9	100.6	適合
	水	15 分	92.3	101.8	適合

*: それぞれの試験条件における判定基準は、6 頁参照。

(n=12)

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

PTP 包装 100 錠 (10 錠×10)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP 包装

PTP シート: ポリプロピレン、アルミニウム

ピロー: ポリエチレン、アルミニウム

バンド: ポリプロピレン

外箱: 紙

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. 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. 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

7. 用法・用量に関連する注意				
7.1 腎障害患者では、血中濃度半減期の延長が認められ、血中濃度が増大するため、クレアチニンクリアランスに応じて、下表のとおり投与量の調節が必要である。[2.2、9.2.1、9.2.2、16.6.1 参照]				
成人患者の腎機能に対応する用法及び用量の目安				
	クレアチニンクリアランス (mL/min)			
	≥80	50~79	30~49	10~29
推奨用量	5mgを1日に1回	2.5mgを1日に1回	2.5mgを2日に1回	2.5mgを週に2回 (3~4日に1回)
腎障害を有する小児患者では、各患者の腎クリアランスと体重を考慮して、個別に用量を調整すること。				
7.2 高齢者では、低用量（例えば2.5mg）から投与を開始するなど慎重に投与すること。[9.8 参照]				

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(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

セチリジン塩酸塩の臨床試験

〈アレルギー性鼻炎〉

1) 国内後期第Ⅱ相試験（二重盲検比較試験、成人）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回 2 週間投与した時、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は 53.8% (21/39 例) であった⁸⁾。

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

2) 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回 4 週間投与した時、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は 47.9% (45/94 例) であった⁹⁾。

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

3) 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、小児）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩ドライシロップ [2 歳以上 7 歳未満：1 回 0.2g (セチリジン塩酸塩として 2.5mg) を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 0.4g (セチリジン塩酸塩として 5mg) を 1 日 2 回] あるいはプラセボを 2 週間投与した。総合鼻症状スコア（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感）の変化量（解析対象 122 例）を表に示した。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¹⁰⁾。

表 全治療評価期間における総合鼻症状スコア^{注1)}の変化量

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

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

注1) 総合鼻症状スコアが 10 を超える患児は組入れから除外

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

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

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

4) 国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験、小児）

通年性アレルギー性鼻炎患者を対象として、セチリジン塩酸塩ドライシロップ [2 歳以上 7 歳未満：1 回 0.2g (セチリジン塩酸塩として 2.5mg) を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満：1 回 0.4g (セチリジン塩酸塩として 5mg) を 1 日 2 回] を 12 週間投与した。総合鼻症状スコアのベースライ

ン評価期間からの変化量の推移 (Mean±S.D.、解析対象 36 例) は、投与 4 週時 : 2.81±2.62、投与 8 週時 : 3.66±2.75、投与 12 週時 : 3.40±3.01 であり、効果は投与終了時まで減弱することなく、安定していた¹¹⁾。

副作用発現頻度は 2.8% (1/36 例) であり、主な副作用は白血球数増加 1 例であった。

〈蕁麻疹〉

5) 国内後期第Ⅱ相試験 (二重盲検比較試験、成人)

セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回投与した時、投与 3 日後、投与 1 週間及び投与 2 週間における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、47.9% (34/71 例)、64.9% (48/74 例) 及び 71.6% (48/67 例) であった¹²⁾。

副作用発現頻度は 10.8% (9/83 例) であり、主な副作用は眠気 4.8% (4/83 例) であった。

6) 国内第Ⅲ相試験 (二重盲検比較試験、成人)

セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回投与した時、投与 3 日後、投与 1 週間及び投与 2 週間における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、56.4% (53/94 例)、71.3% (77/108 例) 及び 82.2% (88/107 例) であった¹³⁾。

副作用発現頻度は 15.9% (21/132 例) であり、主な副作用は眠気 10.6% (14/132 例) であった。

7) 国内第Ⅲ相試験 (一般臨床試験、成人)

セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回投与した時、投与 3 日後、投与 1 週間及び投与 2 週間における全般改善度の中等度改善以上の割合は、それぞれ、46.7% (14/30 例)、53.2% (33/62 例) 及び 72.9% (43/59 例) であった¹⁴⁾。

副作用発現頻度は 4.4% (3/68 例) であり、主な副作用は眠気 2.9% (2/68 例) であった。

〈湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症〉

8) 国内第Ⅲ相試験 (一般臨床試験、成人)

セチリジン塩酸塩錠 10mg を 1 日 1 回 2 週間投与した時、最終全般改善度の中等度改善以上の割合は、湿疹・皮膚炎群で 65.9% (81/123 例)、痒疹群で 57.7% (30/52 例)、皮膚そう痒症で 74.5% (41/55 例) であった¹⁵⁾。

副作用発現頻度は全体で 5.5% (13/236 例) であり、主な副作用は眠気 3.4% (8/236 例) であった。

〈蕁麻疹、皮膚疾患 (湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症) に伴うそう痒〉

9) 国内第Ⅲ相試験 (二重盲検比較試験、小児)

アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験において、セチリジン塩酸塩ドライシロップ [3 歳以上 7 歳未満 : 1 回 0.2g (セチリジン塩酸塩として 2.5mg) を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満 : 1 回 0.4g (セチリジン塩酸塩として 5mg) を 1 日 2 回] あるいはケトチフェンマル酸塩ドライシロップ [3 歳以上 7 歳未満 : 1 回 0.6g (ケトチフェンとして 0.6mg) を 1 日 2 回、7 歳以上 15 歳未満 : 1 回 1g (ケトチフェンとして 1mg) を 1 日 2 回] を 2 週間投与した。そう痒の重症度の変化量 (解析対象 134 例) を表に示した。その結果から、ケトチフェンマル酸塩に対する本薬の非劣性が検証された¹⁶⁾。

表 全治療評価期間におけるそう痒の重症度の変化量

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

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

注1) 変化量が算出可能な被験者数

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

注3) ベースライン評価期間のそう痒の重症度及び年齢層を共変量とした共分散分析により算出

副作用発現頻度は2.7% (4/148例) であり、主な副作用は傾眠1.4% (2/148例) であった。

10) 国内第Ⅲ相試験 (一般臨床試験、小児)

蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症を対象とした試験において、セチリジン塩酸塩ドライシロップ [2歳以上7歳未満: 1回0.2g (セチリジン塩酸塩として2.5mg) を1日2回、7歳以上15歳未満: 1回0.4g (セチリジン塩酸塩として5mg) を1日2回] を12週間投与した。そう痒の重症度の治療期開始日からの変化量の推移 (Mean±S.D.) 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¹⁷⁾。

副作用発現頻度は1.4% (1/73例) であり、傾眠1例であった。

<電子添文 17.1.1 より転記>

レボセチリジン塩酸塩の臨床試験

<アレルギー性鼻炎>

1) 海外第Ⅲ相試験 (二重盲検比較試験、成人)

季節性アレルギー性鼻炎患者を対象として、レボセチリジン塩酸塩錠5mg群とセチリジン塩酸塩錠10mg群の臨床的同等性を検討した。主要評価項目である4症状 (くしゃみ発作、鼻汁、鼻のそう痒及び目のそう痒) の合計スコアの調整済み平均値の差は-0.12 であり、レボセチリジン塩酸塩錠5mg群とセチリジン塩酸塩錠10mg群は臨床的に同等であることが示された。また、両剤はプラセボ群に比較して有意に4症状の合計スコアを改善した¹⁸⁾。

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

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

4症状の合計スコアの調整済み平均値の差の90%CIがセチリジン10mgの4症状の合計スコアの平均値から算出した20%の範囲 (-0.78, 0.78) に含まれた。

注) セチリジン10mgの調整済み平均値からレボセチリジン5mgの調整済み平均値を減じた。

主な副作用は、レボセチリジン塩酸塩錠5mg群 (解析対象319例) で傾眠26件、頭痛9件、口内

乾燥 8 件であり、セチリジン塩酸塩錠 10mg 群（解析対象 318 例）で傾眠 20 件、頭痛 11 件、口内乾燥 6 件であった。

2) 海外第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

季節性アレルギー性鼻炎患者を対象として、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg を 1 日 1 回、2 週間投与した時、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群はプラセボ群に比し主要評価項目とした 4 症状（くしゃみ発作、鼻汁、鼻のそう痒及び眼のそう痒）の合計スコアを有意に改善した¹⁹⁾。

表 4 症状の合計スコアの平均値

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

注) 共分散分析（共変量：投与群、投与前値、施設）

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

3) 海外第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

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

表 4 症状の合計スコアの平均値

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

注) 共分散分析（共変量：投与群、投与前値、施設）

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

〈蕁麻疹〉

4) 海外第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験、成人）

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

表 そう痒重症度スコアの平均値

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

注) 共分散分析（共変量：投与群、投与前値、施設）

副作用発現頻度は、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 群で 18.5%であり、主な副作用は疲労、頭痛であった。

<電子添文 17.1.2 より転記>

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

該当しない

(7) その他

眠気に対する影響（小児）

国内4つの小児臨床試験の併合解析の結果、セチリジン塩酸塩の眠気の発現率は1.0%（5/480例）と低かった^{11, 16, 17, 22}。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¹⁰。

<電子添文 17.3.1 より転記>

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²³⁾

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

レボセチリジンは、ラセミ体であるセチリジンの *R*-エナンチオマーであり、セチリジンと同様に、持続性選択ヒスタミン H_1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬である。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用

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

<電子添文 18.2 より転記>

2) 好酸球に対する作用

In vitro において、エオタキシン刺激による好酸球の血管内皮細胞間隙遊走を抑制した（ヒト）²⁴⁾。

<電子添文 18.3 より転記>

3) 細胞接着分子産生抑制作用

花粉抗原刺激による皮膚血管内皮細胞からの VCAM-1 産生を抑制した（ヒト）²⁶⁾。

<電子添文 18.4 より転記>

(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

単回投与

健康成人男性 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を空腹時単回経口投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は投与後 1 時間には最高血漿中濃度 232.6ng/mL に到達した。血漿中濃度の消失半減期は約 7.3 時間であった。また、10mg を単回経口投与した時、投与量増量に伴う C_{max} の上昇及び AUC の増加が認められた。セチリジン塩酸塩 10mg を空腹時単回経口投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は投与後 1 時間には最高血漿中濃度 228.3ng/mL に達し、消失半減期は約 7.3 時間であった²⁶⁾。

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

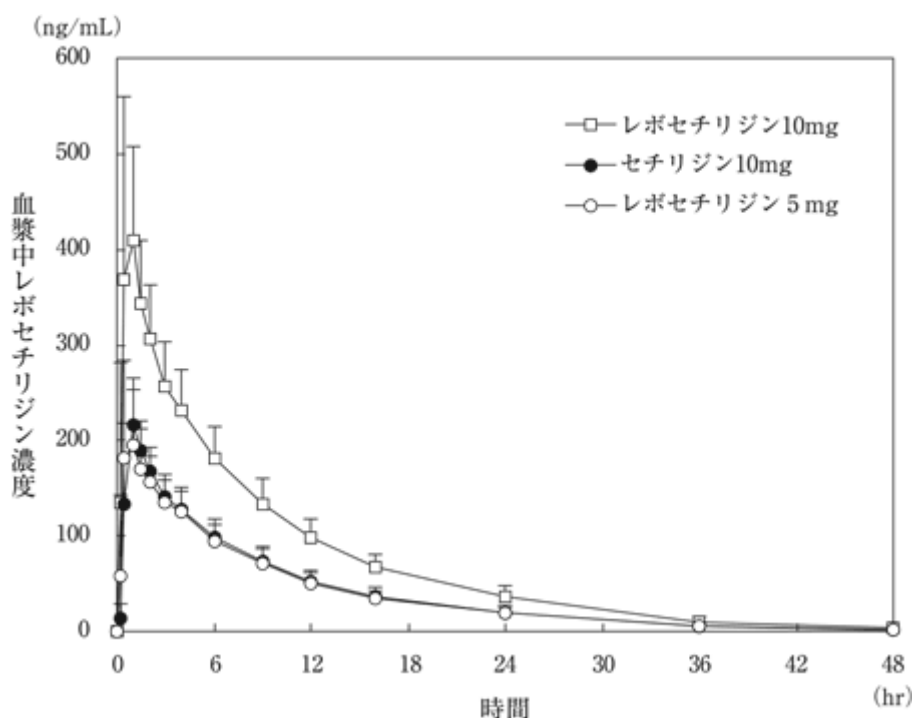


図 血漿中レボセチリジン濃度推移 (n=20、Mean±S. D.)

表 レボセチリジンの薬物動態パラメータ

投与薬剤	投与量	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-∞} (ng · hr/mL)
レボセチリジン	5mg	1.00 (0.25-4.00)	232.60±64.49	7.33±0.98	1814.06±392.49
	10mg	0.75 (0.50-2.00)	480.00±104.01	7.57±0.89	3546.51±712.14
セチリジン	10mg	1.00 (0.50-2.00)	228.30±40.67	7.32±0.78	1875.37±377.94

n=20、Mean±S. D.、T_{max}：中央値（範囲）

<電子添文 16.1.1 より転記>

反復投与

健康成人 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を 1 日 1 回 8 日間空腹時反復経口投与した時、血漿中レボセチリジン塩酸塩濃度は投与開始後 2 日までに定常状態に到達し、 AUC_{0-24} について算出した累積係数は 1.08 であった²⁶⁾ (外国人データ)。

<電子添文 16.1.2 より転記>

生物学的同等性試験

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「明治」とザイザル錠 5mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (レボセチリジン塩酸塩として 5mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、 C_{max}) 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²⁷⁾。

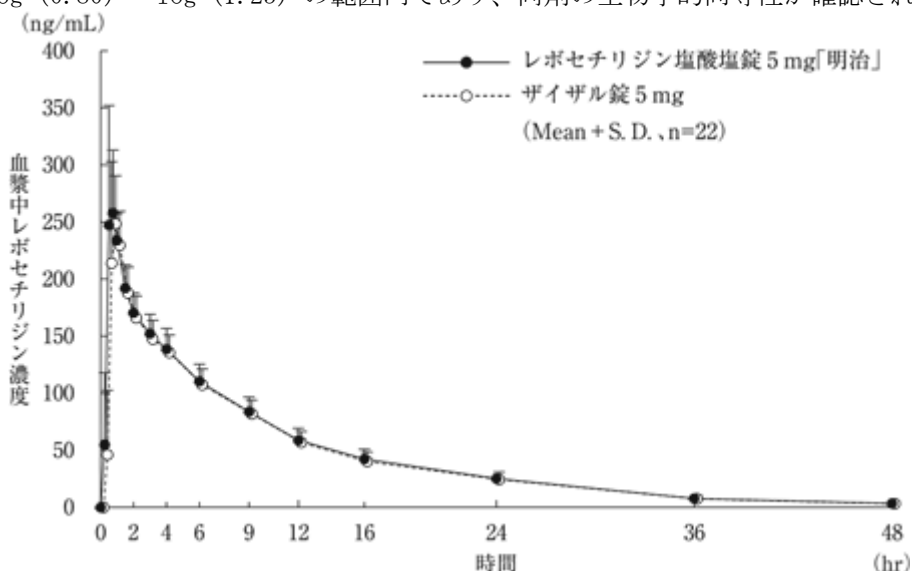


図 5mg 錠投与時の血漿中レボセチリジン濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	被験者数	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUCt (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「明治」	22	2163.34±337.16	292.54±47.16	0.7±0.2	8.32±1.19
ザイザル錠 5mg	22	2089.69±288.82	269.06±45.00	0.7±0.2	8.31±1.15

Mean ± S. D.

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

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

健康成人 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を食後 (高脂肪食) 又は空腹時に単回経口投与した時、空腹時投与と比べ、食後投与の血漿中レボセチリジン塩酸塩の T_{max} は約 1.3 時間遅延し、 C_{max} が約 35% 低下したが、AUC に顕著な差はみられなかった²⁸⁾ (外国人データ)。

<電子添文 16.2.1 より転記>

2) 併用薬の影響

「Ⅷ. 7. (2) 併用注意とその理由」の項参照

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

モーメント法

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数²⁷⁾

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「明治」経口投与時
kel (hr⁻¹) : 0.0849 ± 0.0118 (Mean ± S. D.、n=22)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

健康成人男性 20 例にレボセチリジン塩酸塩 5mg を空腹時単回経口投与した時、レボセチリジンの見かけの分布容積は 25.14L であった²⁹⁾。

<電子添文 16.3.1 より転記>

(6) その他

該当しない

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

「VII. 1. (4) 食事・併用薬の影響」の項参照

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

<参考：ラット>

「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「VIII. 6. (6) 授乳婦」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

*In vitro*での ^{14}C -レボセチリジン(0.2~5 $\mu\text{g/mL}$)のヒト血漿蛋白結合率は約92%であった²⁶⁾。

<電子添文 16.3.2より転記>

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

代謝酵素

レボセチリジンの代謝経路はフェニル基の水酸化、*N*-及び*O*-脱アルキル化並びにタウリン抱合体の生成である。*In vitro*において、レボセチリジンは主にCYP3A4で脱アルキル体に、複数のCYP分子種(未同定)でフェニル基の水酸化体に代謝された³⁰⁾。

<電子添文 16.4.1より転記>

(2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

代謝酵素阻害・誘導

*In vitro*において、レボセチリジンは臨床用量の C_{max} 付近の濃度でCYP1A2、2C9、2C19、2D6、2E1及び3A4を阻害せず、UGT1A並びにCYP1A2、2C9及び3A4を誘導しなかった³¹⁾。

<電子添文 16.4.2より転記>

(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

(1)健康成人男性20例にレボセチリジン塩酸塩5mg及び10mgを空腹時単回経口投与した時の見かけの全身クリアランスは、それぞれ $2.435 \pm 0.567\text{L/hr}$ 及び $2.482 \pm 0.582\text{L/hr}$ であった²⁹⁾。

<電子添文 16.5.1より転記>

(2)健康成人20例にレボセチリジン塩酸塩5mgを空腹時単回経口投与した時の投与後48時間までのレボセチリジン塩酸塩の累積尿中排泄率は約73%であった²⁶⁾(外国人データ)。

<電子添文 16.5.2より転記>

(3)健康成人男性4例に ^{14}C -レボセチリジン塩酸塩溶液5mgを空腹時単回経口投与した時の投与後168時間までの尿及び糞中の放射能回収率はそれぞれ85.4%及び12.9%であった²⁶⁾。

<電子添文 16.5.3より転記>

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

透析で除去されない。

10. 特定の背景を有する患者

(1)腎機能低下者

クレアチニンクリアランスが 45～90mL/min (軽度)、10～45mL/min (中等度) の腎機能低下者、及び血液透析を必要とする重度の腎機能低下者にレボセチリジン塩酸塩 5mg を単回経口投与した時、腎機能正常者に比べ、腎機能低下者では、レボセチリジン塩酸塩の AUC_{0-∞} は約 1.8～5.7 倍増加し、T_{1/2} は約 1.4～3.9 倍に延長した²⁶⁾ (外国人データ)。[2.2、7.1、9.2.1、9.2.2 参照]

表 腎機能低下者におけるレボセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

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

Mean±S. D.

CLcr：クレアチニンクリアランス

CLr：腎クリアランス

CL/f：全身クリアランス

<電子添文 16.6.1 より転記>

(2) 肝障害のある患者

肝機能低下者におけるレボセチリジン塩酸塩の薬物動態の検討は行われていない。

なお、原発性胆汁性肝硬変患者にセチリジン塩酸塩 10mg を単回経口投与した場合、肝機能正常者³²⁾に比べ、血清中濃度消失半減期の延長、Cmax の上昇、AUC の増大が認められた³³⁾ (外国人データ)。

[9.3.1 参照]

表 肝障害のある患者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

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

Mean±S. D.

<電子添文 16.6.2 より転記>

(3) 高齢者

高齢者 9 例にレボセチリジン塩酸塩 30mg^{注)} を 1 日 1 回 6 日間反復経口投与した時のレボセチリジン塩酸塩の全身クリアランスは、健康成人と比較して約 25%低かった²⁶⁾ (外国人データ)。[9.8 参照]

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

表 高齢者におけるレボセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

被験者	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)
健康成人 (n=27)	0.58 (0.58-2.08)	1635±268	6.92±1.10	13855±2340
高齢者 (n=9)	1.08 (0.58-2.08)	1596±287	8.92±1.71	20382±6025

Mean±S.D.、Tmax：中央値（範囲）
 <電子添文 16.6.3 より転記>

11. その他

該当しない

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

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

2.2 重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者 [7.1、9.2.1、16.6.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V.4.用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないように十分注意すること。

8.2 効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.3 季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者
痙攣を発現するおそれがある。[11.1.2 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重度の腎障害（クレアチニンクリアランス 10mL/min 未満）のある患者
投与しないこと。高い血中濃度が持続するおそれがある。[2.2、7.1、16.6.1 参照]

9.2.2 腎障害のある患者（重度の腎障害のある患者を除く）
高い血中濃度が持続するおそれがある。[7.1、16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 肝障害のある患者

高い血中濃度が持続するおそれがある。[16.6.2 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。動物実験（ラット）で胎盤を通過することが報告されている。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。セチリジン^注 塩酸塩において、ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。

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

(7) 小児等

9.7 小児等

7歳未満の小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

慎重に投与し、異常が認められた場合は減量又は休薬するなど適切な処置を行うこと。腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがある。[7.2、16.6.3 参照]

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
テオフィリン	セチリジン ^注 塩酸塩との併用により、テオフィリンの薬物動態に変化はないが、セチリジン ^注 塩酸塩のクリアランスが16%減少する。	機序は明らかではない。
リトナビル	セチリジン ^注 塩酸塩との併用により、セチリジン ^注 塩酸塩の曝露量の増加（40%）及びリトナビルの曝露量のわずかな変化（-11%）が報告されている。	リトナビルによりセチリジン ^注 塩酸塩の腎排泄が阻害される可能性が考えられる。
中枢神経抑制剤 アルコール	中枢神経系に影響を与える可能性がある。	中枢神経抑制作用が増強される可能性がある。

ピルシカイニド塩酸塩水和物	セチリジン ^{注)} 塩酸塩との併用により、両剤の血中濃度が上昇し、ピルシカイニド塩酸塩水和物の副作用が発現したとの報告がある。	機序は明らかではない。
---------------	---	-------------

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

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

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

11.1.2 痙攣（頻度不明）

[9.1.1 参照]

11.1.3 肝機能障害（0.6%）、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、 γ -GTP、LDH、Al-P の上昇等の肝機能障害（初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等）、黄疸があらわれることがある。

11.1.4 血小板減少（頻度不明）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

種類\頻度	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
精神神経系	眠気、倦怠感	頭痛、頭重感、ふらふら感、しびれ感、めまい、浮遊感	不眠、振戦、抑うつ、激越、攻撃性、傾眠、疲労、無力症、睡眠障害、錯感覚、幻覚、自殺念慮、失神、健忘 ^{注)} 、不随意運動 ^{注)} 、意識消失 ^{注)} 、悪夢
消化器	口渇、嘔気、食欲不振	胃不快感、下痢、消化不良、腹痛、腹部不快感、胃痛、口唇炎、便秘、口唇乾燥感、嘔吐、味覚異常、口内炎	腹部膨満感、食欲亢進
循環器		動悸、血圧上昇、不整脈（房室ブロック ^{注)} 、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍 ^{注)} 、心房細動）	
血液	好酸球增多 ^{注)}	好中球減少、リンパ球增多 ^{注)} 、白血球增多、白血球減少、単球增多 ^{注)} 、血小板増加 ^{注)} 、血小板減少 ^{注)}	
過敏症		発疹、蕁麻疹、浮腫、かぶれ、そう痒感、血管性浮腫	多形紅斑、薬疹
眼		結膜充血、霧視	視覚障害、眼球回転発作
肝臓	ALT 上昇、AST 上昇、	Al-P 上昇	

	総ビリルビン上昇		
腎臓・泌尿器		尿蛋白 ^{注)} 、BUN 上昇、尿糖 ^{注)} 、 ウロビリノーゲンの異常 ^{注)} 、 頻尿、血尿 ^{注)}	排尿困難、尿閉、遺尿 ^{注)}
その他		耳鳴、月経異常、胸痛、ほてり、 息苦しさ	関節痛、手足のこわばり、嗅覚異常、 鼻出血、脱毛、咳嗽、 体重増加、筋肉痛、呼吸困難

注) セチリジン塩酸塩でのみ認められている副作用。
副作用発現頻度についてはセチリジン塩酸塩の発現状況に基づき記載した。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

アレル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。

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

傾眠傾向があらわれることがある。特に小児では激越、落ち着きのなさがあらわれることがある。

13.2 処置

本剤の特異的な解毒剤はなく、また本剤は透析で除去されない。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」 処方箋医薬品^{注)}

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

有効成分：レボセチリジン塩酸塩 該当しない

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り

くすりのしおり：有り

その他の患者向け資材：無し

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ザイザル錠 5mg、ザイザルシロップ 0.05%

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

7. 国際誕生年月日

該当資料なし

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」	2020年2月17日	30200AMX00161000	2020年6月19日	2020年6月19日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
レボセチリジン塩 酸塩錠 5mg「明治」	4490028F1205	4490028F1205	128009802	622800901

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) グッドマン・ギルマン薬理書 第12版 廣川書店：2013
- 2) The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names(INN) for pharmaceutical substances 2018(World Health Organization)
- 3) レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」の安定性に関する資料（加速試験）（社内資料）
- 4) レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」の無包装状態における安定性に関する資料（社内資料）
- 5) レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」のPTP包装状態における安定性に関する資料（社内資料）
- 6) レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」の分割時における安定性に関する資料（社内資料）
- 7) レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」の溶出試験（生物学的同等性）に関する資料（社内資料）
- 8) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1994；37：754-779
- 9) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1995；38：116-136
- 10) ジルテック：2009年4月22日承認、CTD2.7.6.2（アレルギー性鼻炎）
- 11) ジルテック：2009年4月22日承認、CTD2.7.6.10（アレルギー性鼻炎）
- 12) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2107-2129
- 13) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2131-2145
- 14) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2163-2173
- 15) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2147-2162
- 16) ジルテック：2009年4月22日承認、CTD2.7.6.2（蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒）
- 17) ジルテック：2009年4月22日承認、CTD2.7.6.6（蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒）
- 18) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.6.31
- 19) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.6.32
- 20) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.6.35
- 21) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.6.43
- 22) ジルテック：2009年4月22日承認、CTD2.7.6.3（アレルギー性鼻炎）
- 23) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>（2024/10/1アクセス）
- 24) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.6.2.2
- 25) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.6.2.3
- 26) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.2.2
- 27) レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「明治」の生物学的同等性試験に関する資料（社内資料）
- 28) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.1.2
- 29) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.2.5
- 30) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.6.4.5
- 31) ギザル：2010年10月27日承認、CTD2.7.2.1
- 32) Matzke GR, et al. : Ann Allergy. 1987；59：25-30 (PMID: 2892446)
- 33) Simons FER, et al. : J Clin Pharmacol. 1993；33：949-954 (PMID: 7693767)

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

海外での発売状況は以下のとおりである（2024年9月時点）。

国名	販売名
米国	LEVOCETIRIZINE DIHYDROCHLORIDE - levocetirizine dihydrochloride tablet ほか

注) 上記品目については、ライセンス関係のない企業が販売している。
なお、OTC薬としても販売されている。

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における電子添付文書「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下の通りであり、米国の添付文書、オーストラリアの分類とは異なる。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。動物実験（ラット）で胎盤を通過することが報告されている。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。セチリジン^注塩酸塩において、ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。

注) ラセミ体であるセチリジンのR-エナンチオマーがレボセチリジンである。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2022年9月)	8 USE IN SPECIFIC POPULATIONS 8.1 Pregnancy <u>Risk Summary</u> Available data from published literature and postmarketing experience with levocetirizine use in pregnant women are insufficient to identify any drug-associated risks of miscarriage, birth defects, or adverse maternal or fetal outcomes. In animal reproduction studies, there was no evidence of fetal harm with administration of levocetirizine by the oral route to pregnant rats and rabbits, during the period of organogenesis, at doses up to 390 times and 470 times, respectively, the maximum recommended human dose (MRHD) in adults. In rats treated during late gestation and the lactation period, cetirizine had no effects on pup development at oral doses up to approximately 60 times the MRHD in adults. In mice treated during late gestation and the lactation period, cetirizine administered by the oral route to the dams had no effects on pup development at a dose that was approximately 25 times the MRHD in adults; however, lower pup weight gain during lactation was observed at a dose that was 95 times the MRHD in adults. The estimated background risk of major birth defects and miscarriage for the indicated population is unknown. All pregnancies have a background risk of birth defect, loss, or other adverse outcomes. In the U.S. general population, the estimated background risks of major birth defects and miscarriage in clinically recognized pregnancies is 2% to 4% and 15% to 20%, respectively. <u>Data</u>

Animal data

In embryo-fetal development studies, pregnant rats received daily doses of levocetirizine up to 200 mg/kg/day from gestation days 6 to 15 and pregnant rabbits received daily doses of levocetirizine up to 120 mg/kg/day from gestation days 6 to 18. Levocetirizine produced no evidence of fetal harm in rats and rabbits at doses up to 390 and 470 times the MRHD, respectively (on a mg/m² basis with maternal oral doses of 200 and 120 mg/kg/day in rats and rabbits, respectively).

No prenatal and postnatal development (PPND) studies in animals have been conducted with levocetirizine. In a PPND study conducted in mice, cetirizine was administered at oral doses up to 96 mg/kg/day from gestation day 15 through lactation day 21. Cetirizine lowered pup body weight gain during lactation at an oral dose in dams that was approximately 95 times the MRHD (on a mg/m basis with a maternal oral dose of 96 mg/kg/day); however, there were no effects on pup weight gain at an oral dose in dams that was approximately 25 times the MRHD (on a mg/m² basis with a maternal oral dose of 24 mg/kg/day). In a PPND study conducted in rats, cetirizine was administered at oral doses up to 180 mg/kg/day from gestation day 17 to lactation day 22. Cetirizine did not have any adverse effects on rat dams or offspring development at doses up to approximately 60 times the MRHD (on a mg/m basis with a maternal oral dose of 30 mg/kg/day). Cetirizine caused excessive maternal toxicity at an oral dose in dams that was approximately 350 times the MRHD (on a mg/m² basis with a maternal oral dose of 180 mg/kg/day).

8.2 Lactation

Risk Summary

There are no data on the presence of levocetirizine in human milk, the effects on the breastfed infant, or the effects on milk production. However, cetirizine has been reported to be present in human breast milk. In mice and beagle dogs, studies indicated that cetirizine was excreted in milk [see Data]. When a drug is present in animal milk, it is likely the drug will be present in human milk. The developmental and health benefits of breastfeeding should be considered along with the mother's clinical need for levocetirizine dihydrochloride and any potential adverse effects on the breastfed child from levocetirizine dihydrochloride or from the underlying maternal condition.

Data

Animal data

Cetirizine was detected in the milk of mice. No adverse developmental effects on pups were seen when cetirizine was administered orally to dams during lactation at a dose that was approximately 25 times the MRHD in adults [see *Use in Specific Populations (8.1)*]. Studies in beagle dogs indicated that approximately 3% of the dose of cetirizine was excreted in milk. The concentration of drug in animal milk does not necessarily predict the concentration of drug in human milk.

<https://dailymed.nlm.nih.gov/dailymed/search.cfm?labeltype=all&query=levocetirizine>
(2024年10月1日アクセス)

	分類
オーストラリア分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	B2

<https://www.tga.gov.au/prescribing-medicines-pregnancy-database> (2024年9月30日アクセス)

(2) 小児等に関する記載

本邦における電子添文「9.7 小児等」の項は以下の通りであり、米国の添付文書の記載とは異なる。

9.7 小児等

7歳未満の小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2022年9月)	<p>8 USE IN SPECIFIC POPULATIONS</p> <p>8.4 Pediatric Use</p> <p>The recommended dose of levocetirizine dihydrochloride for the treatment of the uncomplicated skin manifestations of chronic idiopathic urticaria in patients 6 months to 17 years of age is based on extrapolation of efficacy from adults 18 years of age and older. The recommended dose of levocetirizine dihydrochloride in patients 6 months to 2 years of age for the treatment of the symptoms of perennial allergic rhinitis and 6 months to 11 years of age with chronic idiopathic urticaria is based on cross-study comparisons of the systemic exposure of levocetirizine dihydrochloride in adults and pediatric patients and on the safety profile of levocetirizine dihydrochloride in both adult and pediatric patients at doses equal to or higher than the recommended dose for patients 6 months to 11 years of age.</p> <p>The safety of levocetirizine dihydrochloride 5 mg once daily was evaluated in 243 pediatric patients 6 to 12 years of age in two placebo-controlled clinical trials lasting 4 and 6 weeks. The safety of levocetirizine dihydrochloride 1.25 mg twice daily was evaluated in one 2-week clinical trial in 114 pediatric patients 1 to 5 years of age and the safety of levocetirizine dihydrochloride 1.25 mg once daily was evaluated in one 2-week clinical trial in 45 pediatric patients 6 to 11 months of age.</p> <p>The effectiveness of levocetirizine dihydrochloride 1.25 mg once daily (6 months to 5 years of age) and 2.5 mg once daily (6 to 11 years of age) for the treatment of the symptoms of perennial allergic rhinitis and chronic idiopathic urticaria is supported by the extrapolation of demonstrated efficacy of levocetirizine dihydrochloride 5 mg once daily in patients 12 years of age and older based on the pharmacokinetic comparison between adults and children. Cross-study comparisons indicate that administration of a 5 mg dose of levocetirizine dihydrochloride to 6 to 12 year old pediatric patients resulted in about 2-fold the systemic exposure (AUC) observed when 5 mg of levocetirizine dihydrochloride was administered to healthy adults. Therefore, in children 6 to 11 years of age the recommended dose of 2.5 mg once daily should not be exceeded. In a population pharmacokinetics study the administration of 1.25 mg once daily in children 6 months to 5 years of age resulted in systemic exposure comparable to 5 mg once daily in adults.</p>

<https://dailymed.nlm.nih.gov/dailymed/search.cfm?labeltype=all&query=levocetirizine>
(2024年10月1日アクセス)

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

(1) 粉碎

個別に照会すること。

問い合わせ先：Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

(Me ファルマ株式会社専用ダイヤル)

TEL：(0120)261-158、FAX：(03)3272-2438

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること。

問い合わせ先：Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

(Me ファルマ株式会社専用ダイヤル)

TEL：(0120)261-158、FAX：(03)3272-2438

2. その他の関連資料

製造販売元

Meiji Seika ファルマ株式会社

東京都中央区京橋 2 - 4 - 16

販売元

Me ファルマ株式会社

東京都中央区京橋 2-4-16