

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2.5mg「KN」

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets 2.5mg「KN」・5mg「KN」

レボセチリジン塩酸塩錠

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Syrup 0.05%「KN」

レボセチリジン塩酸塩シロップ

剤形	レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」・5mg「KN」：フィルムコーティング錠 レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」：シロップ剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意一医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	錠2.5mg「KN」：1錠中、レボセチリジン塩酸塩2.5mg含有 錠5mg「KN」：1錠中、レボセチリジン塩酸塩5mg含有 シロップ0.05%「KN」：1mL中、レボセチリジン塩酸塩0.5mg含有
一般名	和名：レボセチリジン塩酸塩（JAN） 洋名：Levocetirizine Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	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 発売年月日：2020年6月19日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元： 小林化工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	小林化工株式会社 学術部 ☎ 0120-37-0690、TEL：0776-73-0901、FAX：0776-73-0677 医療関係者向けホームページ： https://www.kobayashikako.co.jp/product/

本IFは2020年6月改訂（第2版）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、医薬品医療機器総合機構（PMDA）ホームページ「医薬品に関する情報」
<https://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 ー日本病院薬剤師会ー

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(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>)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 を掲載する医薬品医療機器総合機構(PMDA)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 判、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（PMDA）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総合機構（PMDA）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もあり、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、薬機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、薬機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・一部変更)

目 次

I. 概要に関する項目		V. 治療に関する項目	
1. 開発の経緯	1	1. 効能又は効果	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 用法及び用量	14
II. 名称に関する項目		3. 臨床成績	15
1. 販売名	2	(1) 臨床データパッケージ	15
(1) 和名	2	(2) 臨床効果	15
(2) 洋名	2	(3) 臨床薬理試験	15
(3) 名称の由来	2	(4) 探索的試験	15
2. 一般名	2	(5) 検証的試験	15
(1) 和名 (命名法)	2	1) 無作為化並行用量反応試験	15
(2) 洋名 (命名法)	2	2) 比較試験	15
(3) ステム	2	3) 安全性試験	15
3. 構造式又は示性式	2	4) 患者・病態別試験	15
4. 分子式及び分子量	2	(6) 治療の使用	15
5. 化学名 (命名法)	3	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)	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	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	15
7. CAS登録番号	3	VI. 薬効薬理に関する項目	
III. 有効成分に関する項目		1. 薬理的に関連ある化合物又は 化合物群	16
1. 物理化学的性質	4	2. 薬理作用	16
(1) 外観・性状	4	(1) 作用部位・作用機序	16
(2) 溶解性	4	(2) 薬効を裏付ける試験成績	16
(3) 吸湿性	4	(3) 作用発現時間・持続時間	16
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	4	VII. 薬物動態に関する項目	
(5) 酸塩基解離定数	4	1. 血中濃度の推移・測定法	17
(6) 分配係数	4	(1) 治療上有効な血中濃度	17
(7) その他の主な示性値	4	(2) 最高血中濃度到達時間	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	17
3. 有効成分の確認試験法	4	(4) 中毒域	19
4. 有効成分の定量法	4	(5) 食事・併用薬の影響	19
IV. 製剤に関する項目		(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	19
1. 剤形	5	2. 薬物速度論的パラメータ	19
(1) 剤形の区別、外観及び性状	5	(1) 解析方法	19
(2) 製剤の物性	5	(2) 吸収速度定数	19
(3) 識別コード	5	(3) バイオアベイラビリティ	19
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、 無菌の旨及び安定なpH域等	5	(4) 消失速度定数	20
2. 製剤の組成	6	(5) クリアランス	20
(1) 有効成分(活性成分)の含量	6	(6) 分布容積	20
(2) 添加物	6	(7) 血漿蛋白結合率	20
(3) その他	6	3. 吸収	20
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	4. 分布	20
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	(1) 血液-脳関門通過性	20
5. 調製法及び溶解後の安定性	9	(2) 血液-胎盤関門通過性	20
6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)	9	(3) 乳汁への移行性	20
7. 溶出性	9	(4) 髄液への移行性	20
8. 生物学的試験法	12	(5) その他の組織への移行性	20
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	13	5. 代謝	21
10. 製剤中の有効成分の定量法	13	(1) 代謝部位及び代謝経路	21
11. 力価	13	(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の 分子種	21
12. 混入する可能性のある夾雑物	13		
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に 関する情報	13		
14. その他	13		

(3) 初回通過効果の有無及びその割合	21	3. 貯法・保存条件	28
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	21	4. 薬剤取扱い上の注意点	28
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	21	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	28
6. 排泄	21	(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)	28
(1) 排泄部位及び経路	21	(3) 調剤時の留意点について	28
(2) 排泄率	21	5. 承認条件等	29
(3) 排泄速度	21	6. 包装	29
7. トランスポーターに関する情報	21	7. 容器の材質	29
8. 透析等による除去率	21	8. 同一成分・同効薬	29
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目		9. 国際誕生年月日	29
1. 警告内容とその理由	22	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	29
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	22	11. 薬価基準収載年月日	30
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	22	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	30
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	22	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	30
5. 慎重投与内容とその理由	22	14. 再審査期間	30
6. 重要な基本的注意とその理由及び 処置方法	22	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	30
7. 相互作用	22	16. 各種コード	30
(1) 併用禁忌とその理由	22	17. 保険給付上の注意	30
(2) 併用注意とその理由	23	XI. 文献	
8. 副作用	23	1. 引用文献	31
(1) 副作用の概要	23	2. その他の参考文献	31
(2) 重大な副作用と初期症状	23	XII. 参考資料	
(3) その他の副作用	24	1. 主な外国での発売状況	32
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	24	2. 海外における臨床支援情報	32
(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	24	XIII. 備考	
(6) 薬物アレルギーに対する注意 及び試験法	25	その他の関連資料	33
9. 高齢者への投与	25		
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	25		
11. 小児等への投与	25		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	26		
13. 過量投与	26		
14. 適用上の注意	26		
15. その他の注意	26		
16. その他	26		
IX. 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	27		
(1) 薬効薬理試験 （「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）	27		
(2) 副次的薬理試験	27		
(3) 安全性薬理試験	27		
(4) その他の薬理試験	27		
2. 毒性試験	27		
(1) 単回投与毒性試験	27		
(2) 反復投与毒性試験	27		
(3) 生殖発生毒性試験	27		
(4) その他の特殊毒性	27		
X. 管理的事項に関する項目			
1. 規制区分	28		
2. 有効期間又は使用期限	28		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レボセチリジンは、ラセミ体であるセチリジンの R-エナンチオマーであり、セチリジンと同様に、持続性選択ヒスタミン H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬である。

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」は、薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日付)に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法の設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2020 年(令和 2 年)2 月に後発医薬品として承認を取得し、同年 6 月の薬価収載とともに発売に至った。なお、本剤は小林化工株式会社、セオリアファーマ株式会社の 2 社が共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有して承認を得ている。

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」は、小林化工株式会社が開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日付)に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法の設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2020 年(令和 2 年)2 月に後発医薬品として承認を取得し、同年 6 月の薬価収載とともに発売に至った。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

① ヒスタミン H₁ 受容体に選択的に結合することにより、ヒスタミンの作用を阻害する。

② 副作用(頻度不明)

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たとの報告がある。

<レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」>

- ・錠剤両面に「レボセチリジン KN」の文字及び含量を印刷した両面印刷錠である。
- ・両面に割線の入った錠剤であり、分割後も分割前と同様の印字が確認可能である(錠 5mg)。
- ・錠 2.5mg 規格がある。

<レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」>

- ・甘みを加えたミックスフルーツ風味である。
- ・100mL 及び 200mL 包装がある。
- ・乳幼児の誤飲防止の為、チャイルドレジスタントキャップを採用している。

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 2.5mg「KN」
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」

(2) 洋名

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets 2.5mg「KN」
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Tablets 5mg「KN」
LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE Syrup 0.05%「KN」

(3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。
一般名＋剤形＋規格＋「KN」
Kobayashi Kako Nippon

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

レボセチリジン塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名（命名法）

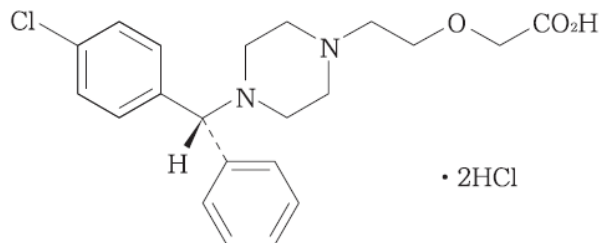
Levocetirizine hydrochloride (JAN)
levocetirizine (INN)

(3) ステム¹⁾

diphenylmethyl piperazine derivatives : -izine

3. 構造式又は示性式

構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃ · 2HCl

分子量：461.81

5. 化学名 (命名法)

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

記号番号:KLV0 (治験薬コード)

7. CAS 登録番号

130018-87-0 (Levocetirizine dihydrochloride)

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。

0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

(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

4. 有効成分の定量法





電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」・5mg「KN」：

製品名	有効成分の 名称・含量	性状	外形		
			直径	厚さ	重量
レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」	1錠中、 レボセチリジン 塩酸塩2.5mg含有	白色の円形のフィルム コーティング錠	 約6.1mm	 約2.7mm	約77.5mg
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」	1錠中、 レボセチリジン 塩酸塩5mg含有	白色の両面に割線のある 楕円形のフィルムコー ティング錠	  長径：約8.1mm 短径：約4.6mm	 約3.2mm	約93mg

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

製品名	有効成分の 名称・含量	性状
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」	1mL中、 レボセチリジン 塩酸塩 0.5 mg含有	無色澄明の液

(2) 製剤の物性

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：

溶出性：「IV. 製剤に関する項目 7. 溶出性」の項参照

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

該当しない

(3) 識別コード

製品名	識別コード
レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」	レボセチリジン 2.5 KN
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」	レボセチリジン 5 KN

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg・5mg「KN」：

該当しない

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」：

pH：4.7～5.3

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」：

1錠中、レボセチリジン塩酸塩2.5mg含有

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」：

1錠中、レボセチリジン塩酸塩5mg含有

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」：

1mL中、レボセチリジン塩酸塩0.5mg含有

(2) 添加物

製品名	添加物
レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」	乳糖水和物、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、カルナウバロウ
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」	
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」	パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、サッカリンナトリウム水和物、還元麦芽糖水アメ、濃グリセリン、香料、酢酸ナトリウム水和物、氷酢酸

(3) その他

該当資料なし

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¹⁾

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」：

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果	
					試験開始時	試験終了時
苛酷試験	25℃、75%RH	無包装品	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 個々の類縁物質の最大(%)	-	-
				溶出試験(%)	99.4~102.6	100.5~102.6
				定量試験(対表示量%)	99.8	100.4
	40℃	無包装品	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 個々の類縁物質の最大(%)	-	-
				溶出試験(%)	99.4~102.6	98.8~104.1
				定量試験(対表示量%)	99.8	101.4
	蛍光灯照射 (1000lux)	無包装品	50日 (120万lux・hr)	性状	*1	*1
				純度試験 個々の類縁物質の最大(%)	-	0.072
				溶出試験(%)	99.4~102.6	96.9~99.6
				定量試験(対表示量%)	99.8	100.0

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果		
					試験開始時	試験終了時	
加速試験	40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1、*2	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	0.062~0.074
					光学異性体(%)	-	-
				製剤均一性試験	*3	*3	
				溶出試験(%)	94.1~103.4	82.9~101.8※	
定量試験(対表示量%)	100.3~100.8	98.4~99.8					
長期保存試験	25℃、60%RH	PTP包装品 (最終包装品)	30ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	0.037~0.088
					光学異性体(%)	-	-
				製剤均一性試験	*3	-	
				溶出試験(%)	94.1~103.4	90.6~105.4	
定量試験(対表示量%)	100.3~100.8	98.6~100.1					

*1 : 白色の円形のフィルムコーティング錠であった。

*2 : 「IV. 製剤に関する項目 9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3 : 日局一般試験法 製剤均一性試験法 1. 含量均一性試験に適合した。

- : 定量限界未滿

※設定規格から外れた試料が1個あった為、新たに試料6個をとって試験を繰り返したところ、12個中、11個の試料の個々溶出率が規定する値であった為適合とした。

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)及び長期保存試験(25℃、60%RH、30ヵ月)の結果、レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」は通常の市場流通下において3年6ヵ月間安定であることが推測された。

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」:

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果		
					試験開始時	試験終了時	
苛酷試験	25℃、75%RH	無包装品	3ヵ月	性状	*1	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	-
					溶出試験(%)	100.0~105.0	101.3~104.3
				定量試験(対表示量%)	100.9	101.7	
	40℃	無包装品	3ヵ月	性状	*1	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	-
					溶出試験(%)	100.0~105.0	100.6~102.7
				定量試験(対表示量%)	100.9	101.2	
	蛍光灯照射 (1000lux)	無包装品	50日 (120万lux・hr)	性状	*1	*1	
純度試験				個々の類縁物質 の最大(%)	-	0.041	
				溶出試験(%)	100.0~105.0	99.0~101.6	
定量試験(対表示量%)				100.9	101.0		
加速試験	40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1、*2	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	0.032~0.052
					光学異性体(%)	-	-
				製剤均一性試験	*3	*3	
				溶出試験(%)	97.7~106.9	93.8~105.7	
定量試験(対表示量%)	100.0~101.2	97.4~99.5					

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果		
					試験開始時	試験終了時	
長期保存試験	25℃、60%RH	PTP包装品 (最終包装品)	30ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	-~0.145
					光学異性体(%)	-	-
				製剤均一性試験	*3		
				溶出試験(%)	97.7~106.9	97.2~109.1	
定量試験(対表示量%)	100.0~101.2	99.1~101.4					

*1 : 白色の両面に割線のある楕円形のフィルムコーティング錠であった。

*2 : 「IV. 製剤に関する項目 9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3 : 日局一般試験法 製剤均一性試験法 1. 含量均一性試験に適合した。

- : 定量限界未満

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)及び長期保存試験(25℃、60%RH、30ヵ月)の結果、レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」は通常の市場流通下において3年6ヵ月間安定であることが推測された。

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」:

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果		
					試験開始時	試験終了時	
苛酷試験	4℃	200mL 褐色ガラス瓶 (開栓前)	3ヵ月	性状	*1	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	-
					pH	5.103	5.129
				定量試験(対表示量%)	100.0	100.4	
	40℃	200mL 褐色ガラス瓶 (開栓前)	3ヵ月	性状	*1	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	0.057
					pH	5.103	5.124
				定量試験(対表示量%)	100.0	100.1	
	蛍光灯照射 (1000lux)	200mL 褐色ガラス瓶 (開栓前)	50日 (120万lux・hr)	性状	*1	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	-
					pH	5.103	5.089
				定量試験(対表示量%)	100.0	99.2	
	なりゆき室温	200mL 褐色ガラス瓶 (開栓後)	3ヵ月	性状	*1	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.039	0.033
					pH	5.036	5.048
				定量試験(対表示量%)	100.6	100.8	
	40℃	200mL 褐色ガラス瓶 (開栓後)	3ヵ月	性状	*1	*1	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.039	-
					pH	5.036	5.055
				定量試験(対表示量%)	100.6	100.4	
蛍光灯照射 (1000lux)	200mL 褐色ガラス瓶 (開栓後)	50日 (120万lux・hr)	性状	*1	*1		
			純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	0.039	0.033	
				pH	5.036	5.061	
			定量試験(対表示量%)	100.6	101.6		

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果		
					試験開始時	試験終了時	
加速試験	40℃、75%RH	100mL 褐色ガラス瓶 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1、*2	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	-~0.031
					光学異性体(%)	-	-
				pH	5.035~5.044	5.044~5.055	
				生菌数試験	*3	*3	
				特定微生物試験	*4	*4	
				定量試験(対表示量%)	97.8~101.8	97.8~98.9	
		200mL 褐色ガラス瓶 (最終包装品)	6ヵ月	性状・確認試験	*1、*2	*1、*2	
				純度試験	個々の類縁物質 の最大(%)	-	-~0.037
					光学異性体(%)	-	-
				pH	5.035~5.044	5.038~5.050	
				生菌数試験	*3	*3	
				特定微生物試験	*4	*4	
				定量試験(対表示量%)	97.8~101.8	97.9~99.0	

*1 : 無色澄明の液であった。

*2 : 「IV. 製剤に関する項目 9. 製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3 : 日局一般試験法 微生物限度試験法 I. 生菌数試験に適合した。

*4 : 日局一般試験法 微生物限度試験法 II. 特定微生物試験に適合した。

- : 定量限界未満

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」は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. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

「XIII. 備考 その他の関連資料」の項参照。

7. 溶出性²⁾

<溶出挙動における同等性及び類似性：生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験>
レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」:

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について 薬食審査発0229第10号(平成24年2月29日付)」の別紙1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び別紙2「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じる。なお、試験製剤の処方変更水準をガイドラインに従い確認したところ、B水準であった。

試験条件

試験方法：日本薬局方一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験液量：900mL

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：50rpm

判定基準

(1) 平均溶出率

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±10%の範囲にある。

(2) 個々の溶出率

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

試験結果

レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」の溶出挙動は、レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、両剤の生物学的同等性が確認された。

図 レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」の溶出挙動における同等性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

● 試験製剤 (レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」)
○ 標準製剤 (レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」)
n=12

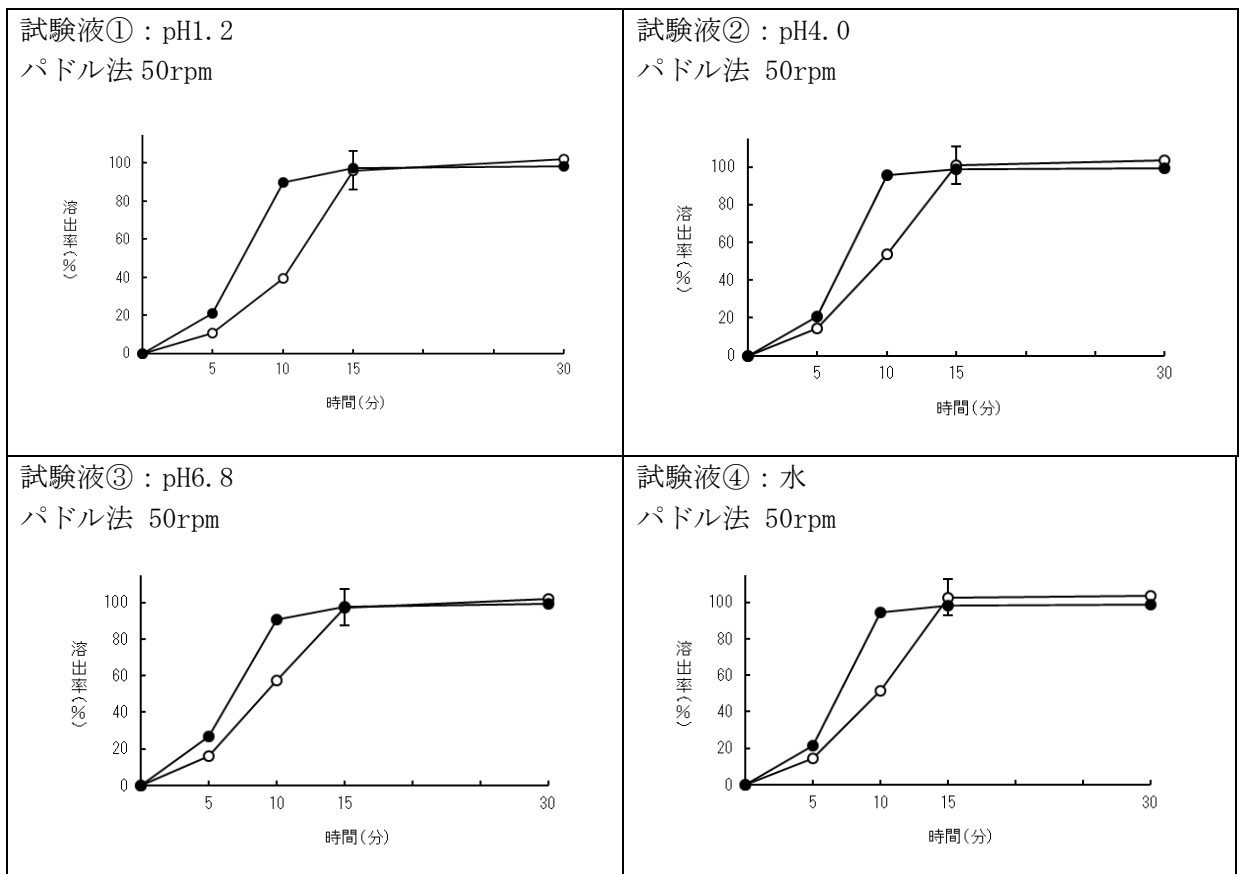


表 レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」の溶出挙動における同等性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」)	標準製剤 (レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率(%)	平均溶出率(%)	
パドル法	50rpm	①pH1.2	15分	97.5	96.2	適合
		②pH4.0	15分	98.8	100.9	適合
		③pH6.8	15分	97.4	97.3	適合
		④水	15分	98.4	102.6	適合

(n=12)

(試験製剤の個々の溶出率の比較)

試験条件				レボセチリジン塩酸塩錠2.5mg「KN」		判定
方法	回転数	試験液	判定時点	個々の溶出率(%)	平均溶出率±S.D.(%)	
パドル法	50rpm	①pH1.2	15分	92.5、99.6、97.4、96.9、96.6、95.8、98.3、99.4、98.4、98.5、98.9、97.5	97.5±1.94	適合
		②pH4.0	15分	102.6、99.1、93.6、98.4、99.9、99.2、100.9、96.6、98.4、99.0、97.6、100.2	98.8±2.26	適合
		③pH6.8	15分	97.2、99.3、97.0、97.0、97.2、101.1、91.7、98.2、98.0、94.0、99.6、98.8	97.4±2.51	適合
		④水	15分	99.4、100.1、98.0、97.2、96.5、100.2、97.4、98.6、99.3、97.7、98.2、98.5	98.4±1.16	適合

(n=12)

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」:

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について 薬食審査発0229第10号(平成24年2月29日付)」の別紙1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じる。

試験条件

試験方法：日本薬局方一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験液量：900mL

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：50rpm

判定基準

試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

試験結果

レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」の溶出挙動は、各試験液において標準製剤と類似していることが確認された。

図 レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」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)

● 試験製剤 (レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「KN」)
○ 標準製剤 (錠剤、5mg)
n=12

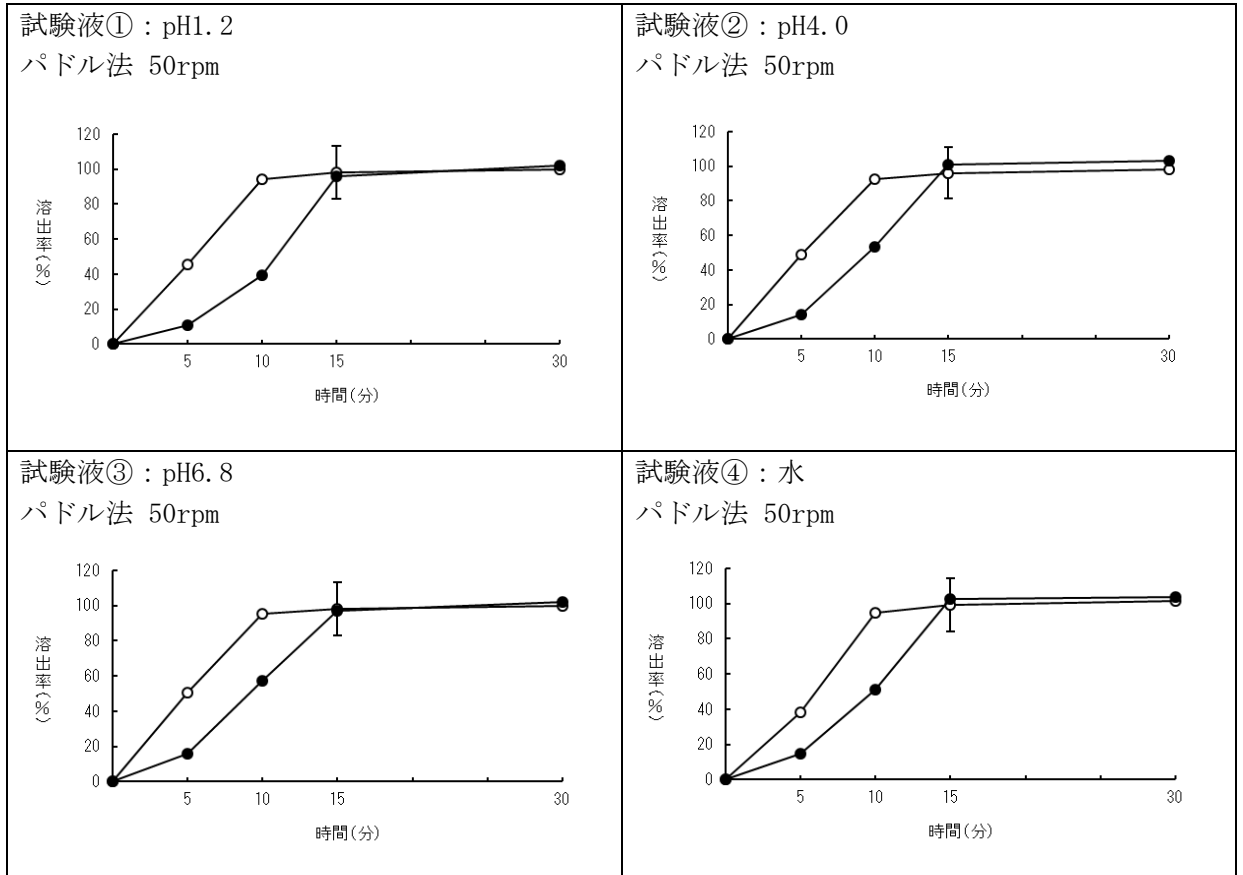


表 レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」の溶出挙動における類似性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (レボセチリジン塩酸塩錠 5 mg「KN」)	標準製剤 (錠剤、5mg)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50rpm	①pH1.2	15分	96.2	98.3	適合
		②pH4.0	15分	100.9	96.1	適合
		③pH6.8	15分	97.3	98.3	適合
		④水	15分	102.6	99.4	適合

(n=12)

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」：
該当しない

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

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：

紫外可視吸光度測定法

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

液体クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

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

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」：

乳幼児の誤飲防止の為、チャイルドレジスタントキャップ※を採用している。

※キャップを押し下げながら回さないと開けられず、押し下げずに開けようとした場合はクリック音が発生し、開栓行為を周囲の人に伝えることで乳幼児の誤飲を防ぐ。

〈キャップの開け方〉



① キャップを押しながら

② 回して開けてください。

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

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：

〔成人〕

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

〔小児〕

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

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

〔成人〕

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

〔小児〕

通常、6ヵ月以上1歳未満の小児には1回2.5mL（レボセチリジン塩酸塩として1.25mg）を1日1回経口投与する。

通常、1歳以上7歳未満の小児には1回2.5mL（レボセチリジン塩酸塩として1.25mg）を1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。

通常、7歳以上15歳未満の小児には1回5mL（レボセチリジン塩酸塩として2.5mg）を1日2回、朝食後及び就寝前に経口投与する。

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」、

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

<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、個別に用量を調整すること。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

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

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

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)

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試験の概要

該当しない

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³⁾

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

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用

好酸球に対する作用

細胞接着分子産生抑制作用

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1. ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用

ヒスタミン H₁ 受容体に選択的に結合することにより、ヒスタミンの作用を阻害する。ヒスタミン H₁ 受容体に対する親和性はセチリジンよりも約 2 倍高い。ヒスタミン H₂、ヒスタミン H₃、アドレナリン、ドパミン、アセチルコリン、セロトニンの各受容体に対する親和性は低い(ヒト、ラット、モルモット)。⁴⁾ 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。⁵⁾ 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)。⁶⁾

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)。⁷⁾

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)。⁸⁾

(3) 作用発現時間・持続時間

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)。⁶⁾

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⁹⁾

製品名	投与量 (レボセチリジン 塩酸塩として)	tmax (h)
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」	5mg	1.3±0.9

(Mean±S. D.、n=24)

製品名	投与量 (レボセチリジン 塩酸塩として)	tmax (h)
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」	5mg	0.8±0.4

(Mean±S. D.、n=24)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁹⁾

<生物学的同等性試験>

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」:

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5 mg「KN」は「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について 薬食審査発第 0229 第 10 号(平成 24 年 2 月 29 日付)」の別紙 1 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」及び別紙 2 「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」を標準製剤とした溶出試験の結果、溶出挙動は同等と判定され、生物学的に同等とみなされた。

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」:

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について 薬食審査発第 0229 第 10 号 (平成 24 年 2 月 29 日付)」の別紙 1 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じる。

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」と標準製剤それぞれ 1 錠(レボセチリジン塩酸塩 5mg)を、2 剤 2 期のクロスオーバー法により健康成人男性に水 150mL とともに絶食単回経口投与した。第 I 期と第 II 期の休薬期間は 7 日間とした。血漿中未変化体濃度は、投与前 1 回、投与後 0.17、0.33、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、12、24 及び 48 時間目の計 15 時点に採血を行い、LC/MS/MS 法にて測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(図、表)。

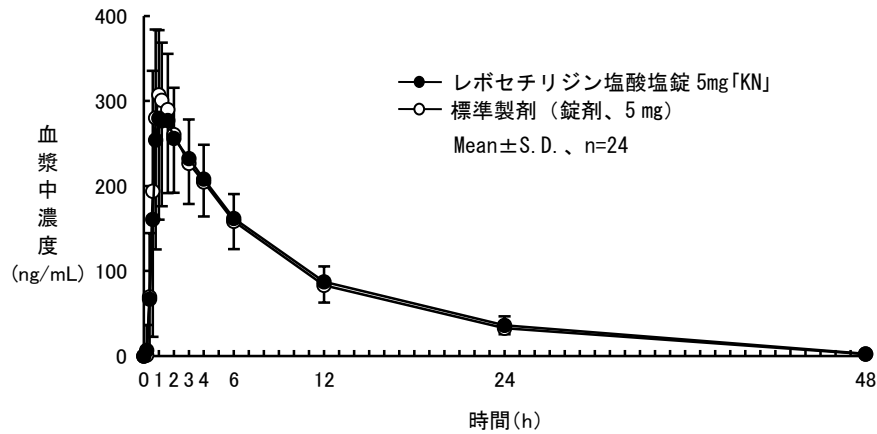


図 レボセチリジン塩酸塩の血漿中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→48h} (ng・h/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (h)	t _{1/2} (h)
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」	3199.31 ± 650.68	344.78 ± 94.61	1.3 ± 0.9	8.3 ± 1.0
標準製剤 (錠剤、5mg)	3107.02 ± 606.07	346.90 ± 71.58	1.1 ± 0.5	8.2 ± 1.0

(Mean ± S. D.、n=24)

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。

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について 薬食審査発第 0229 第 10 号 (平成 24 年 2 月 29 日付)」の別紙 1「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に準じる。

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」と標準製剤それぞれ 10mL (レボセチリジン塩酸塩 5mg) を、2 剤 2 期のクロスオーバー法により健康成人男性に水 150mL とともに絶食単回経口投与した。第 I 期と第 II 期の休薬期間は 7 日間とした。血漿中未変化体濃度は、投与前 1 回、投与後 0.17、0.33、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、12、24 及び 48 時間目の計 15 時点に採血を行い、LC/MS/MS 法にて測定し、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) ~ 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 (図、表)。

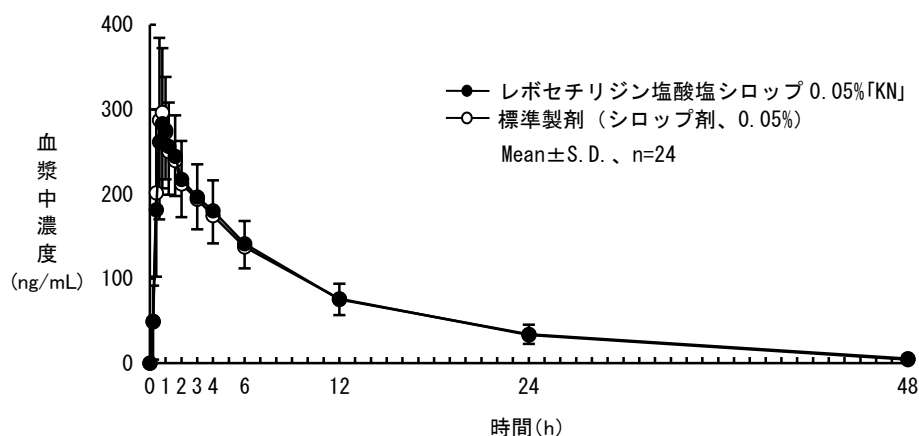


図 レボセチリジン塩酸塩の血漿中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→48h} (ng・h/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (h)	t _{1/2} (h)
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」	2932.19± 676.70	311.80± 73.54	0.8±0.4	9.5±1.8
標準製剤（シロップ剤、0.05%）	2898.33± 647.99	315.73± 77.53	0.7±0.3	9.1±1.4

(Mean±S.D.、n=24)

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

Moment 法

(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⁹⁾

製品名	投与量 (レボセチリジン 塩酸塩として)	Kel (h ⁻¹)
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」	5mg	0.0849±0.01028

(Mean±S. D.、n=24)

製品名	投与量 (レボセチリジン 塩酸塩として)	Kel (h ⁻¹)
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」	5mg	0.0762±0.01636

(Mean±S. D.、n=24)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

セチリジン[※]はよく吸収されるとの報告がある。¹⁰⁾

※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. 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>

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[※]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。

※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

5. 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（CYP450 等）の分子種

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比率

該当資料なし

(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

該当資料なし

以下の報告がある。¹⁰⁾

セチリジン^{*}は未変化体で尿中に排泄される。

※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。

(2) 排泄率

該当資料なし

(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

該当資料なし

8. 透析等による除去率

本剤は透析で除去されない。

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

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(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

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 2. 用法及び用量」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」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

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。

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

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1)} 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1)} 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1)} 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1)} 塩酸塩との併用により、セチリジン ^{注1)} 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1)} 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1)} 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1) 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

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。
- 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、A1-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

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2)} 、不随意運動 ^{注2)} 、意識消失 ^{注2)} 、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2)} 、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍 ^{注2)} 、心房細動）
血液	好酸球増多 ^{注2)} 、好中球減少、リンパ球増多 ^{注2)} 、白血球増多、白血球減少、単球増多 ^{注2)} 、血小板増加 ^{注2)} 、血小板減少 ^{注2)}
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、A1-P 上昇
腎臓・泌尿器	尿蛋白 ^{注2)} 、BUN 上昇、尿糖 ^{注2)} 、ウロビリノーゲンの異常 ^{注2)} 、頻尿、血尿 ^{注2)} 、排尿困難、尿閉、遺尿 ^{注2)}
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2) セチリジン塩酸塩でのみ認められている副作用。

(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

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。

その他の副作用

	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

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

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1} 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1) 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

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：

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）。

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

小児等への投与

低出生体重児、新生児又は 6 ヶ月未満の乳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

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

過量投与

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。

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

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：

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。]

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

該当しない

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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2.5mg「KN」 処方箋医薬品^{注)}
レボセチリジン塩酸塩錠5mg「KN」 処方箋医薬品^{注)}
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」 処方箋医薬品^{注)}
注)注意－医師等の処方箋により使用すること
有効成分：レボセチリジン塩酸塩 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：
使用期限：3年6ヵ月(外箱に表示)(安定性試験結果に基づく)
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：
使用期限：3年(外箱等に表示)(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：
貯法：室温保存
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：
貯法：室温保存、遮光

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)

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」、
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

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。

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「KN」：

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。]

- ・くすりのしおり：有り
- ・患者向医薬品ガイド：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

該当しない

6. 包装

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」:

PTP : 100錠(10錠×10シート)

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」:

PTP : 100錠(10錠×10シート)、500錠(10錠×50シート)

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」:

100mL、200mL

7. 容器の材質

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」・5mg「KN」:

PTP 包装

シート: ポリ塩化ビニル(PVC)、ポリ塩化ビニリデン(PVDC)、ポリエチレン(PE)、金属

ピロー: ポリエチレン(PE)、金属

箱 : 紙

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」:

瓶

キャップ: ポリエチレン(PE)、ポリプロピレン(PP)

ラベル : 紙

パッキン: ポリエチレンテレフタレート(PET)

ボトル : ガラス(褐色)

箱 : 紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬: ザイザル錠 5mg、ザイザル OD 錠 2.5mg、ザイザル OD 錠 5mg、ザイザルシロップ 0.05%

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

9. 国際誕生年月日

2001年1月3日(ドイツ)

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」	2020年2月17日	30200AMX00134000
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」	2020年2月17日	30200AMX00135000
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」	2020年2月17日	30200AMX00217000

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg 「KN」	2020年6月19日
レボセチリジン塩酸塩錠 5mg 「KN」	2020年6月19日
レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05% 「KN」	2020年6月19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

該当しない

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

16. 各種コード

製品名	包装	HOT(13桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
レボセチリジン塩酸塩 錠 2.5mg「KN」	100錠(PTP)	1281484010101	4490028F2031	622814801
レボセチリジン塩酸塩 錠 5mg「KN」	100錠(PTP)	1281491010101	4490028F1060	622814901
	500錠(PTP)	1281491010102		
レボセチリジン塩酸塩 シロップ 0.05%「KN」	100mL	1281507010101	4490028Q1036	622815001
	200mL	1281507010201		

17. 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。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 小林化工株式会社・社内資料(安定性試験)
- 2) 小林化工株式会社・社内資料(溶出試験)
- 3) 薬剤分類情報閲覧システム<<http://www.iryohoken.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>
(2019/12/23 アクセス)
- 4) Gillard M, et al. : Mol Pharmacol、61 (2002)
- 5) Christophe B, et al. : Eur J Pharmacol、470(2003)
- 6) Devalia JL, et al. : Allergy、56(2001)
- 7) Thomson L, et al. : Clin Exp Allergy、32(2002)
- 8) 効力を裏付ける試験(ザイザル錠、承認年月日：2010年10月27日、申請資料概要
2.6.2.6.1)
- 9) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- 10) グッドマン・ギルマン薬理書 第12版 (2013)

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

その他の関連資料

- ・製品情報URL

レボセチリジン塩酸塩錠 2.5mg「KN」：

<https://www.kobayashikako.co.jp/product/detail.php?prodcid=23159>

レボセチリジン塩酸塩錠 5mg「KN」：

<https://www.kobayashikako.co.jp/product/detail.php?prodcid=23160>

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」：

<https://www.kobayashikako.co.jp/product/detail.php?prodcid=23156>

- ・配合変化資料

※2020年5月作成の配合変化に関する資料を次頁に掲載した。

2020年5月作成


持続性選択 H_1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05% 「KN」

—— 配合変化に関する資料 ——

小林化工株式会社

〒919-0603 福井県あわら市矢地 5-15
TEL 0776-73-0690(代)
FAX 0776-73-0692
URL <https://www.kobayashikako.co.jp/>

*製品に関するお問い合わせ先：学術部
 0120-37-0690 TEL 0776-73-0901
FAX 0776-73-0677
(月～金 8:30～17:30/土日祝・会社休日除く)

1. 配合薬剤

薬剤 5 種類、飲食物 7 種類を選択した。(品名及び製造販売元の名称は、2020 年 4 月時点の名称で記載した。)

2. 配合試験

(1) 配合方法

レボセチリジン塩酸塩シロップ 0.05%「KN」と各薬剤及び飲食物を表中の配合比率で混和し、配合溶液とした。

(2) 保存条件

1) 薬剤との配合変化

A：配合溶液を透明なポリプロピレン製の投薬瓶に入れ、 $4 \pm 2^\circ\text{C}$ (冷蔵)、暗所にて 7 日間保存。

B：配合溶液を透明なポリプロピレン製の投薬瓶に入れ、 $25 \pm 2^\circ\text{C} \cdot 60 \pm 5\% \text{RH}$ 、暗所にて 7 日間保存。

薬剤名	保存条件	A	B
		$4 \pm 2^\circ\text{C}$ (冷蔵)、暗所、7 日間	$25 \pm 2^\circ\text{C}$ 、 $60 \pm 5\% \text{RH}$ 、暗所、7 日間
アスピリンシロップ 0.5%		○	○
ベネトリンシロップ 0.04%		○	○
小児用ムコソルバンシロップ 0.3%		○	○
カロナールシロップ 2%		○	○
ムコダインシロップ 5%		○	○

2) 飲食物との配合変化

C：配合溶液を透明なポリプロピレン製の投薬瓶に入れ、 $4 \pm 2^\circ\text{C}$ (冷蔵)、暗所にて 6 時間保存。

D：配合溶液を透明なポリプロピレン製の投薬瓶に入れ、 $25 \pm 2^\circ\text{C} \cdot 60 \pm 5\% \text{RH}$ 、暗所にて 6 時間保存。

E：配合溶液を透明なポリプロピレン製の投薬瓶に入れ、 $-20 \pm 2^\circ\text{C}$ (冷凍)、暗所にて 6 時間保存。

飲食物名	保存条件	C	D	E
		4±2℃(冷蔵)、 暗所、6時間	25±2℃・60±5%RH、 暗所、6時間	-20±2℃(冷凍)、 暗所、6時間
Dole アップル 100% (アップルジュース)		○	○	—
Dole オレンジ 100% (オレンジジュース)		○	○	—
明治 おいしい牛乳		○	○	—
明治 ブルガリアヨーグルト		○	○	—
伊藤園 健康ミネラルむぎ茶		○	○	—
水道水		○	○	—
明治 エッセルスーパーカップ超バニラ (アイスクリーム)		—	—	○

(3) 試験項目及び試験方法

- 1) 性状 : (外観) 色の変化、濁り及び沈殿等の有無を目視により観察した。
(味) 飲食物のみ味の変化を観察した。
- 2) pH : 日局一般試験法の pH 測定法により測定した。
- 3) 定量値 : 液体クロマトグラフィーにより測定した。
- 4) 残存率 : 配合直後の含量を 100%としたときの、各測定時間の残存率を算出した。
- 5) 再分散性 : アスベリンシロップ 0.5%のみ 3 日目及び 7 日目に再分散性について確認した。
(再分散性 : 5 秒間倒立+5 秒間正立を 1 回とし、均一に分散するまでの回数)

(4) 測定時間

- 1) 薬剤との配合変化 : 配合直後、3 日目、7 日目
- 2) 飲食物との配合変化 : 配合直後、6 時間後

3. 試験実施施設

小林化工株式会社

4. 試験実施期間

2020年2月14日～2020年3月26日

5. その他

[注意]

本剤の添付文書【使用上の注意】（抜粋）

3.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	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。

添付文書 2020年2月作成(第1版)より

(1)本剤について

品名	成分・含量	Lot No.	性状	pH
レボセチリジン塩酸塩シロップ0.05%「KN」	1mL中、レボセチリジン塩酸塩0.5g含有	R9LPZ1	無色澄明の液	5.130

(2)薬剤との配合変化

薬効分類番号	配合液					保存条件	測定項目	保存期間			
	薬剤名 (製造/販売)	一般名	性状	配合量	本剤の量			配合直後	3日間	7日間	
114	カロナールシロップ2% (あゆみ製薬(株))	アセトアミノフェン	無色～淡黄褐色澄明のシロップ剤 (pH4.9～6.0)	40mL	40mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
							pH	5.194	5.154	5.206	
							定量値 (mg/mL)	0.4945	0.4934	0.5053	
							残存率 (%)	100.0	99.8	102.2	
							4±2℃	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
								pH	5.205	5.154	5.202
定量値 (mg/mL)	0.4956	0.5065	0.5010								
223	小児用ムコソルバンシロップ0.3% (帝人ファーマ(株))	アンプロキシソール塩酸塩	無色～微黄色澄明の液 (pH2.3～3.3)	40mL	40mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
							pH	4.189	4.174	4.226	
							定量値 (mg/mL)	0.4922	0.4888	0.5042	
							残存率 (%)	100.0	99.3	102.4	
							4±2℃	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
								pH	4.128	4.173	4.227
定量値 (mg/mL)	0.4906	0.4961	0.4993								
223	ムコダインシロップ5% (杏林製薬(株))	L-カルボシステイン	褐色のシロップ剤 (pH5.5～7.5)	40mL	40mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液	
							pH	5.395	5.393	5.439	
							定量値 (mg/mL)	0.4955	0.5104	0.5007	
							残存率 (%)	100.0	103.0	101.0	
							4±2℃	性状	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液
								pH	5.403	5.392	5.427
定量値 (mg/mL)	0.4902	0.5041	0.4999								
							残存率 (%)	100.0	102.8	102.0	

つづき

薬効 分類 番号	配合液					保存条件	測定項目	保存期間		
	薬剤名 (製造/販売元)	一般名	性状	配合量	本剤の量			配合直後	3日間	7日間
224	アスピリン シロップ 0.5% (ニプロES ファーマ(株))	チペピジンヒ ベンズ酸塩	白色～ 淡黄灰白色の 懸濁液 (pH4.3～5.5)	40mL	40mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液
							pH	4.987	4.947	4.998
							定量値 (mg/mL)	0.5182	0.4945	0.5014
							残存率 (%)	100.0	95.4	96.8
							再分散性 (回)		7	6
						4±2℃	性状	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液
							pH	5.018	4.942	4.984
							定量値 (mg/mL)	0.5210	0.5169	0.5000
							残存率 (%)	100.0	99.2	96.0
							再分散性 (回)		7	7
225	ベネトリン シロップ 0.04% (グラクソ・スミ スクライン(株))	サルプタモー ル硫酸塩	無色～淡黄色 澄明で濃稠な 液体 (pH3.0～4.0)	40mL	40mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
							pH	4.396	4.349	4.405
							定量値 (mg/mL)	0.4851	0.4870	0.4892
							残存率 (%)	100.0	100.4	100.8
							性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
						4±2℃	pH	4.404	4.346	4.403
							定量値 (mg/mL)	0.4879	0.5014	0.4955
							残存率 (%)	100.0	102.8	101.6

(3) 飲食物との配合変化

配合液/物			保存条件	測定項目		保存期間	
飲食物名 (製造/販売元)	配合量	本剤の量				配合直後	6時間後
Dole アップル 100% (雪印メグミルク)	150mL	30mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	外観	微黄色の懸濁液	
					味	甘く、わずかな酸味があった。	
				pH	3.903		
				定量値 (mg/mL)	0.4926		
			残存率 (%)	100.0			
			4±2℃	性状	外観	微黄色の懸濁液	
					味	甘く、わずかな酸味があった。	
				pH	3.903		
定量値 (mg/mL)	0.4926						
残存率 (%)	100.0						
Dole オレンジ 100% (雪印メグミルク)	150mL	30mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	外観	黄色の懸濁液	
					味	甘く、酸味があった。	
				pH	3.948		
				定量値 (mg/mL)	0.4890		
			残存率 (%)	100.0			
			4±2℃	性状	外観	黄色の懸濁液	
					味	甘く、酸味があった。	
				pH	3.948		
定量値 (mg/mL)	0.4890						
残存率 (%)	100.0						
明治 おいしい牛乳 (明治)	150mL	30mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	外観	乳白色の液	
					味	甘味があった。	
				pH	6.569		
				定量値 (mg/mL)	0.4974		
			残存率 (%)	100.0			
			4±2℃	性状	外観	乳白色の液	
					味	甘味があった。	
				pH	6.569		
定量値 (mg/mL)	0.4974						
残存率 (%)	100.0						

つづき

配合液/物			保存条件	測定項目		保存期間	
飲食物名 (製造/販売元)	配合量	本剤の量				配合直後	6時間後
明治 ブルガリア ヨーグルト (明治)	150g	30mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液
					味	わずかに甘く、酸味があった。	わずかに甘く、酸味があった。
				pH	4.219	4.228	
				定量値 (mg/mL)	0.4810	0.4655	
			残存率 (%)	100.0	96.8		
			4±2℃	性状	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液
					味	わずかに甘く、酸味があった。	わずかに甘く、酸味があった。
				pH	4.219	4.267	
定量値 (mg/mL)	0.4810	0.4661					
残存率 (%)	100.0	96.9					
伊藤園 健康ミネラル むぎ茶 (伊藤園)	150mL	30mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	外観	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液
					味	甘く、香ばしい味であった。	甘く、香ばしい味であった。
				pH	6.061	6.233	
				定量値 (mg/mL)	0.4971	0.4871	
			残存率 (%)	100.0	98.0		
			4±2℃	性状	外観	淡褐色澄明の液	淡褐色澄明の液
					味	甘く、香ばしい味であった。	甘く、香ばしい味であった。
				pH	6.061	6.140	
定量値 (mg/mL)	0.4971	0.5031					
残存率 (%)	100.0	101.2					
水道水	150mL	30mL	25±2℃ 60±5%RH	性状	外観	無色澄明の液	無色澄明の液
					味	甘味があった。	甘味があった。
				pH	4.992	5.076	
				定量値 (mg/mL)	0.4963	0.4965	
			残存率 (%)	100.0	100.0		
			4±2℃	性状	外観	無色澄明の液	無色澄明の液
					味	甘味があった。	甘味があった。
				pH	4.992	5.053	
定量値 (mg/mL)	0.4963	0.5011					
残存率 (%)	100.0	101.0					
明治 エッセル スーパーカップ 超バニラ (明治)	150g	30mL	-20±2℃	性状	外観	微黄白色の懸濁液	微黄白色の懸濁液
					味	強い甘味があった。	強い甘味があった。
				pH	6.434	6.428	
				定量値 (mg/mL)	0.4712	0.4877	
残存率 (%)	100.0	103.5					

製造販売元



小林化工株式会社

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15