

貯法：室温保存、気密容器
使用期限：外箱に表示の使用期限内に
使用すること。
注意：取扱い上の注意の項参照。

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「YD」
レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「YD」

	OD錠2.5mg	OD錠5mg
承認番号	30200AMX00126	30200AMX00127
薬価収載	2020年6月	2020年6月
販売開始	2020年6月	2020年6月

LEVOCETIRIZINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS

(レボセチリジン塩酸塩口腔内崩壊錠)

注)注意—医師等の処方箋により使用する
こと

[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。]

[組成・性状]

1. 組成

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「YD」

1錠中、レボセチリジン塩酸塩2.5mgを含有する。
添加物として、セルロース、クエン酸ナトリウム水和物、ケイ酸A1、ヒドロキシプロピルスターチ、香料、1-メントール、シクロデキストリン、アセシルファミカリウム、ステアリン酸Mgを含有する。

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「YD」

1錠中、レボセチリジン塩酸塩5mgを含有する。
添加物として、セルロース、クエン酸ナトリウム水和物、ケイ酸A1、ヒドロキシプロピルスターチ、香料、1-メントール、シクロデキストリン、アセシルファミカリウム、ステアリン酸Mgを含有する。

2. 性状

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「YD」

白色の素錠である。

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「YD」

片面割線入りの白色の素錠である。

	外形			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)	識別 コード (PTP)
	表	裏	側面				
レボセチリジン塩酸塩 OD錠2.5mg「YD」	YD 511	(2.5)	—	約6.5	約2.4	90	YD 511
レボセチリジン塩酸塩 OD錠5mg「YD」	YD 512	(5)	—	約8.0	約3.6	180	YD 512

[効能・効果]

[成人]

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症

[小児]

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒

[用法・用量]

[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。

(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。

[使用上の注意]

1. 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。]

2. 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。

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1) 塩酸塩などの併用により、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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リトナビル	セチリジン ^{注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。

4. 副作用

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る。

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。

(1) 重大な副作用

- 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(頻度不明)
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(いずれも頻度不明)
AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、LDH、Al-Pの上昇等の肝機能障害(初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等)、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) 血小板減少(頻度不明)
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。

(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、必要に応じて、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

	頻度不明
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、Al-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。

5. 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。

6. 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。

7. 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)。

8. 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。

9. 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

必要に応じて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。

10. 適用上の注意

(1) 薬剤交付時

P T P包装の薬剤はP T Pシートから取り出して服用するよう指導すること。(P T P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)

(2) 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

(3) 本剤は寝たまの状態で、水なしで服用しないこと。

[薬物動態]

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg[YD]

生物学的同等性試験

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg[YD]は「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)」に基づき、レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。¹⁾

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]

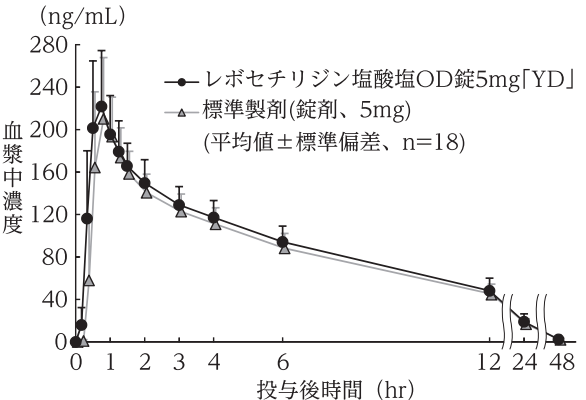
生物学的同等性試験

(1) 水で服用した場合

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]と標準製剤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18名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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)~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。²⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]	1873.13±375.25	236.10±50.22	0.76±0.25	7.98±1.42
標準製剤(錠剤、5mg)	1724.32±283.99	227.54±49.76	0.81±0.30	7.80±1.35

(平均値±標準偏差、n=18)



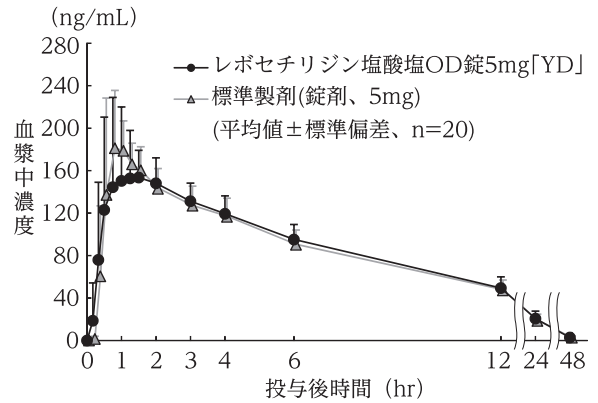
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2) 水なしで服用した場合(標準製剤は水で服用)

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]と標準製剤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20名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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)~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。²⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]	1862.93±318.78	202.18±31.99	1.10±0.68	8.46±1.21
標準製剤(錠剤、5mg)	1813.88±250.74	207.66±38.63	1.01±0.61	8.35±1.24

(平均値±標準偏差、n=20)



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。

[薬効薬理]

レボセチリジンは第二世代ピペラジン類のH₁受容体拮抗薬である。セチリジンの活性鏡像体であり、レボセチリジン2.5mgはセチリジン5mgに相当する抗ヒスタミン活性を有する。^{3),4)}

[有効成分に関する理化学的知見]

一般名：レボセチリジン塩酸塩

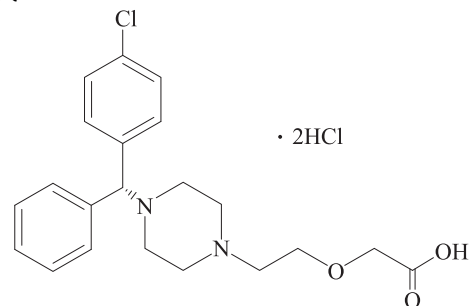
(Levocetirizine hydrochloride)

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

分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃・2HCl

分子量：461.81

構造式：



性状：白色の結晶性の粉末である。

水に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくい。

[取扱い上の注意]

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg[YD]

(1) 保管方法

アルミピロー包装の開封後は湿気を避けて保存すること。

※(2) 安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg[YD]は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。⁵⁾

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]

(1) 保管方法

アルミピロー包装の開封後は湿気を避けて保存すること。

※(2) 安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg[YD]は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。⁶⁾

[包装]

レボセチリジン塩酸塩OD錠2.5mg「YD」

PTP：100錠、500錠

レボセチリジン塩酸塩OD錠5mg「YD」


PTP：100錠、500錠

[主要文献]

- 1) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験
- 2) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験
- 3) 高折修二監修：グッドマン・ギルマン薬理書第12版,p.1179、廣川書店
- 4) Devalia JL, et al. : Allergy,56,50-57(2001)
- 5) (株)陽進堂社内資料：安定性試験
- 6) (株)陽進堂社内資料：安定性試験

[文献請求先]

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下さい。

株式会社陽進堂 お客様相談室
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号
 0120-647-734

製造販売元



株式会社 陽進堂

富山県富山市婦中町萩島3697番地8号