スイッチ OTC 医薬品の候補成分の成分情報等

1．候補成分に関連する事項

候補成分の情報	成分名（一般名）	レボセチリジン塩酸塩
	スイッチ OTC とした場合の効能・効果	鼻炎、皮膚炎
候補成分に対する医療用医薬品の情報	販売名	ザイザル錠 5mg、ザイザルシロップ 0.05% （投与経路：経口） （剤形：錠剤、シロップ剤）
	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〕 ＜錠剤＞ 通常、成人にはレボセチリジン塩酸塩として 1 回 5 mg 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 10 mg とする。 ＜シロップ剤＞ 通常、成人には 1 回 10 mL（レボセチリジン塩酸塩として 5 mg）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 20 mL（レボセチリジン塩酸塩として 10 mg）とする。 〔小児〕 ＜錠剤＞ 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 2.5 mg を 1 日 2 回、朝食後及び就寝前に経口投与する。 ＜シロップ剤＞ 通常、6 ヵ月以上 1 歳未満の小児には 1 回 2.5 mL（レボセチリジン塩酸塩として 1.25 mg）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 2.5 mL（レボセチリジン塩酸塩として 1.25 mg）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 5 mL（レボセチリジン塩酸塩として 2.5 mg）を 1 日 2 回、朝食後及び就寝前に経口投与する。
	会社名	グラクソ・スミスクライン株式会社

２．スイッチ OTC 化の妥当性評価にあたっての必要情報

医療用医薬品の特徴・概要	承認年月日	＜錠剤＞2010 年 10 月 27 日 ＜シロップ剤＞2014 年 1 月 17 日
	再審査期間	＜錠剤＞2010 年 10 月 27 日～2018 年 10 月 26 日 ＜シロップ剤＞錠剤の残余期間（2014 年 1 月 17 日～2018 年 10 月 26 日）
	再審査結果通知日	2020 年 5 月 14 日
	再審査結果	医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項第3号イからハまでのいずれにも該当しない。
	開発の経緯（インタビューフォーム等より）	レボセチリジン塩酸塩（以下、レボセチリジン）はラセミ体であるセチリジン塩酸塩（以下、セチリジン）の *R*-エナンチオマーであり、第 2 世代の抗ヒスタミン薬としてのセチリジンの治療効果を単一で担う。レボセチリジンは、もう 1 つのエナンチオマーであるデキストロセチリジンと比べ、ヒトヒスタミン H_1受容体に対する親和性が 30 倍高く、解離速度は緩徐である（解離半減時間はデキストロセチリジンの 7 分に対してレボセチリジンでは 115 分）。 欧州及び米国では、キラル構造を有する医薬品開発の指針を発行しており、UCB 社はこの指針に基づき、セチリジンを光学分割して単一のエナンチオマーとすることでヒスタミン H_1受容体により選択性の高い製剤を開発することを目指して、レボセチリジンの臨床開発を開始した。レボセチリジンは 2001 年にドイツにて承認されて以来、2018 年 11 月時点で米国を含む世界 60 ヵ国以上でアレルギー性鼻炎及び蕁麻疹を適応症として承認されている。 グラクソ・スミスクライン株式会社（GSK 社）は、レボセチリジンがラセミ体であるセチリジンの治療上の活性本体であり、ラセミ体から単一のエナンチオマーへ光学分割することで用量がセチリジンの半量になることから、レボセチリジンが経口抗ヒスタミン薬として日本人に対するアレルギー疾患の治療に有用であると考え、UCB 本社との共同開発契約を締結し日本国内でレボセチリジンの開発を進めることを決定した。 レボセチリジンはセチリジンの半量で同様の臨床効果を有することが海外の薬物動態試験及び臨床試験により裏付けられている。日本でのレボセチリジンの開発にあたり、日本人健康成人を対象としたレボセチリジン 5mg 錠及びセチリジン 10mg 錠の薬物動態試験を実施し、両製剤間におけるレボセチリジンの薬物動態の同等性が示されたことにより、国内でのセチリジンの成人及び小児に対する臨床試験成績を国内のレボセチリジンの成績として外挿することが可能であると考えた。また、海外で実施された数多くのレボセチリジンの臨床試験における重要な知見を既承認セチリジンの国内臨床試験成績に加えることにより、国内でレボセチリジンの新医薬品としての製造承認申請を行い、2010 年 10 月にセチリジンと同様の適応症で承認を取得した。

		また、近年のアレルギー性疾患の低年齢化に伴い、7 歳未満の小児でも服用しやすい剤形の開発が求められていることから、レボセチリジンの小児用製剤として海外で既に市販され、日本でもよく用いられているシロップ剤を、生後 6 ヵ月以上 7 歳未満の小児に対する新用法・用量並びに 7 歳以上の小児及び成人に対する剤形追加として開発し、2014 年 1 月に承認を取得した。
	治療学的･製剤学的特性（インタビューフォーム等より）	（1）ヒスタミンH1受容体に高い親和性を示し、強力な抗ヒスタミン作用を示す。（*in vitro*、マウス、ラット、イヌ） （2）生後6ヵ月からの使用が認められた第2世代抗ヒスタミン薬である。（レボセチリジン塩酸塩の剤形別の適応年齢は、シロップ剤が生後6ヵ月以上、錠剤が7歳以上） （3）成人において1日1回、6ヵ月以上1歳未満の小児において1日1回、1歳以上15歳未満の小児において1日2回の経口投与で、アレルギー性鼻炎及びアレルギー性皮膚疾患に対して、優れた効果を示す。 （4）投与早期より抗ヒスタミン作用を発揮し、24時間安定した効果が持続する。 （5）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。 （6）生後6ヵ月以上の小児および嚥下に困難を持つ患者にも服用が可能で、用量調節が容易なシロップ剤
	臨床での使われ方	要望された効能に関連した一部の疾患の治療法を示す。 （通年性アレルギー性鼻炎）[3)] 治療法は病型と重症度の組み合わせで選択するが選択は画一的ではない。軽症例には病型によらず①第 2 世代抗ヒスタミン薬、②ケミカルメディエーター遊離抑制薬、③Th2 サイトカイン阻害薬、④鼻噴霧用ステロイド薬のいずれかを選択する（副作用を考慮して速効性のある第 1 世代抗ヒスタミン薬も可）。中等症例では、くしゃみ・鼻漏型は①第 2 世代ヒスタミン薬、②ケミカルメディエーター遊離抑制薬、③鼻噴霧用ステロイド薬のいずれかを選択し、必要に応じて①または②に③を併用する。鼻閉型または充全型のうち鼻閉が強い症例は①LTRA、②抗 PGD_2・TXA_2 薬、③Th2 サイトカイン阻害薬、④第 2 世代ヒスタミン薬・血管収縮薬配合剤、⑤鼻噴霧用ステロイド薬のいずれかを選択し、必要に応じて①、②、③に⑤を併用する。重症例で、くしゃみ、鼻漏が強い場合は鼻噴霧用ステロイド薬に第 2 世代抗ヒスタミン薬を併用する。鼻閉型または充全型のうち鼻閉が強い症例は鼻噴霧用ステロイド薬に LTRA または抗 PGD_2・TXA_2 薬を併用するか、第 2 世代抗ヒスタミン薬・血管収縮薬配合剤を投与する。また、点鼻用血管収縮薬を最少回数（1～2 回/日）、1～2 週間に限り使用する。継続治療が可能な症例ではアレルゲン免疫療法も選択できる。鼻中隔弯曲症等の形態異常が明らかな症例や鼻閉に対する薬物療法の効果が不十分な症例には手術療法も選択できる。 （蕁麻疹）[4)] 抗ヒスタミン薬はすべての蕁麻疹の基本的治療薬である。

		ただし、その意義と効果は病型毎に異なる。抗ヒスタミン薬には第 1 世代と第 2 世代があるが、効果と副作用の両面で中枢組織移行性が少なく、鎮静性の低い第 2 世代の経口抗ヒスタミン薬が推奨される。また、その効果には個人差があり、1 種類の抗ヒスタミン薬で十分な効果が得られない場合でも他に 1～2 種類を追加、変更または通常量である程度効果の得られた薬剤を増量するとさらなる効果が期待できる。十分な効果が得られない場合に他の治療薬を追加すべきか否かは、症状の程度、追加する薬剤の効果、副作用、経済的負担などのバランスを踏まえて判断する。薬物の反応性は病型毎に異なり、特徴を踏まえて方針を立てる。 （アトピー性皮膚炎）[5)] 1．外用療法 外用療法は、保湿剤を中心としたスキンケアとステロイド外用薬、タクロリムス軟膏を中心とした炎症制御に分けられる。急性期の炎症の制御の基本はステロイド外用薬であるが、寛解維持期には、保湿剤外用と組み合わせて、週 2~3 回間歇的にタクロリムス軟膏やステロイド外用薬を使用する方法が有用である。これは皮疹の悪化時にのみ外用療法を行うリアクティブ療法に対してプロアクティブ療法と呼ばれ、皮膚症状の再燃を抑制できるだけでなく、医療経済的にも効果的であることが示されている。 2．内服薬 抗ヒスタミン薬・抗アレルギー薬を中心とする内服療法は外用療法を補助する治療と位置づけられる。 （接触皮膚炎）[6)] 全身性接触皮膚炎、接触皮膚炎症候群ではステロイド外用とともに抗ヒスタミン薬、ステロイド内服薬（プレドニゾロン 20 mg/日）も選択の 1 つとなり得るが、限局性接触皮膚炎ではステロイド外用、保湿剤の外用とともに日常品、化粧品では代替品の推奨などが必要である。限局性の時は、ステロイド内服薬は重症のときに限られ、抗ヒスタミン薬は補助的療法となる。原因除去、排除とステロイド外用薬を主体とした治療法で 2 週間以内に軽快しないときは、まだ原因物質が不明で除去されていない可能性、もしくは原因物質が生活環境、職場にある可能性を考えてパッチテストなどの原因特定の検査が必要となる。検査により原因が特定できたときには原因を含む物質、交叉性のある物質をできる限り排除・回避する。 特定できないときには治療で使用しているステロイド外用薬による接触皮膚炎の可能性も疑う必要がある。石鹸、洗剤による手湿疹などでは原因に接触しないようにゴム手袋、ビニール手袋、予防クリームで予防する必要がある。 原因物質の特定ができないとき、もしくは特定されても職業性皮膚炎など原因物質が職場にあり排除できないときは産業医に連絡し、場合によって職場の配置転換も考慮するが、改善が見られないときにはステロイド内服療法、免疫抑制薬、紫外線療法が必要となる。

<table>
<tr><td rowspan="5"></td><td></td><td>歯科金属などの金属が原因と考えられる全身性接触皮膚炎では金属ダイエット、歯科金属除去、クロモグリク酸ナトリウム内服が有効なことがある。</td></tr>
<tr><td>安全性に関する情報（添付文書より）</td><td>＜副作用＞
<table>
<tr><td>重大な副作用</td><td>高頻度（5%以上）の副作用</td></tr>
<tr><td>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</td><td>該当なし</td></tr>
</table></td></tr>
<tr><td>禁忌・注意事項（添付文書より）</td><td>【警告】該当なし
【禁忌】
（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10 mL/min未満）のある患者
【使用上の注意】
１．慎重投与
（1）腎障害のある患者
（2）肝障害のある患者
（3）高齢者
（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
【相互作用】
併用禁忌：なし
併用注意：テオフィリン、リトナビル、中枢神経抑制剤、アルコール、ピルシカイニド塩酸塩水和物</td></tr>
<tr><td>習慣性、依存性、耽溺性について</td><td>該当なし</td></tr>
<tr><td>毒薬、劇薬等への該当性について</td><td>該当なし</td></tr>
<tr><td>推定使用者数等</td><td colspan="2">患者数：鼻が詰まる・鼻水が出る：約 621.6 万人 [1)]
アレルギー性鼻炎有病率：39.4%[2)]</td></tr>
<tr><td>同種同効薬・類薬のスイッチ OTC 化の状況について</td><td colspan="2">以下の成分について、記載の年に既にスイッチ OTC 化されている。
ケトチフェンフマル酸塩　2007 年（平成 19 年）
フェキソフェナジン塩酸塩　2012 年（平成 24 年）
セチリジン塩酸塩　2012 年（平成 24 年）
エバスチン　2013 年（平成 25 年）
エピナスチン塩酸塩　2015 年（平成 27 年）
ロラタジン　2017 年（平成 29 年）
ベポタスチンベシル酸塩　2017 年（平成 29 年）</td></tr>
</table>

OTC 化された場合の使われ方	花粉、ハウスダストによるアレルギーを対象とした内服剤においては、上述の同種同効薬が既にスイッチ化されている。本剤は、これらの OTC と同様に、アレルギー性鼻炎に対するセルフメディケーションの選択肢の一つとなると考える。 なお、上述の同種同効薬では、効能・効果をアレルギー性鼻炎に限ってスイッチ化されている。抗ヒスタミン薬の内服剤において、アレルギー性鼻炎に加え「蕁麻疹、湿疹・かぶれによる次の症状の緩和：皮膚のはれ、かゆみ」を効能・効果とする OTC は塩酸アゼラスチン及びエメダスチンフマル酸塩等が存在する。
関連するガイドライン等	鼻アレルギー診療ガイドライン 2016 年版（改定第 8 版） アレルギー総合ガイドライン 2016
その他	

３．候補成分の欧米等での承認状況

欧米等 6 か国での承認状況

一般用医薬品としての承認状況

☐ 英国　☐ 仏国　☐ 独国　☑ 米国　☐ 加国　☑ 豪州

〔欧米等 6 か国での承認内容〕

	欧米各国での承認内容	
英国	販売名（企業名）	－
	効能・効果	
	用法・用量	
	備考	
仏国	販売名（企業名）	－
	効能・効果	
	用法・用量	
	備考	
独国	販売名（企業名）	－
	効能・効果	
	用法・用量	
	備考	
米国[7]	販売名（企業名）	Xyzal Allergy 24HR（SANOFI）（剤形：tablet, oral solution）
	効能・効果	temporarily relieves these symptoms due to hay fever or other respiratory allergies: runny nose; itchy, watery eyes; sneezing; itching of the nose or throat 花粉症またはその他の呼吸器アレルギーによる下記の症状の一時的な緩和： 鼻水、眼のかゆみ、涙目、くしゃみ、 鼻または咽頭のかゆみ
	用法・用量	＜錠剤＞ adults 65 years of age and older: ask a doctor

				adults and children 12-64 years of age: ・ take 1 tablet (5 mg) once daily in the evening ・ do not take more than 1 tablet (5 mg) in 24 hours ・ ½ tablet (2.5 mg) once daily in the evening may be appropriate for less severe symptoms children 6-11 years of age: ・ take ½ tablet (2.5 mg) once daily in the evening ・ do not take more than ½ tablet (2.5 mg) in 24 hours children under 6 years of age: do not use consumers with kidney disease: do not use 65 歳以上の成人：医師に相談すること。 12～64 歳の小児および成人：1 錠（5mg）を 1 日 1 回夜服用。24 時間に 1 錠（5mg）を超える量を服用しないこと。症状が軽度の場合は 1/2 錠（2.5mg）を 1 日 1 回投与してもよい。 6～11 歳の小児：1/2 錠（2.5mg）を 1 日 1 回夜服用。24 時間に 1/2 錠（2.5mg）を超える量を服用しないこと。 6 歳未満の小児：使用しないこと。 腎臓病のある人：使用しないこと。 ＜シロップ剤＞ adults 65 years of age and older: ask a doctor adults and children 12-64 years of age: ・ take 5 mL or 10 mL once daily in the evening depending upon severity of symptoms ・ do not take more than 10 mL in 24 hours children 6-11 years of age: ・ take 5 mL once daily in the evening ・ do not take more than 5 mL in 24 hours children 2-5 years of age: ・ take 2.5 mL once daily in the evening ・ do not take more than 2.5 mL in 24 hours children under 2 years of age: do not use consumers with kidney disease: do not use 65 歳以上の成人：医師に相談すること。 12～64 歳の小児および成人：症状の重症度に応じて 5mL または 10mL を 1 日 1 回夜服用。24 時間に 10mL を超える量を服用しないこと。 6～11 歳の小児：5mL を 1 日 1 回夜服用。24 時間に 5mL を超える量を服用しないこと。 2～5 歳の小児：2.5 mL を 1 日 1 回夜服用。24 時間に 2.5 mL を超える量を服用しないこと。 2 歳未満の小児：使用しないこと。

		腎臓病のある人：使用しないこと。
	備考	2017 年 OTC 化
加国	販売名（企業名）	ー
	効能・効果	
	用法・用量	
	備考	
豪州[8]	販売名（企業名）	XYZAL tablets（UCB Pharma）
	効能・効果	Hay fever (seasonal allergic rhinitis), including asociated eye complaints Year round allergies such as dust or pet allergies (perennial allergic rhinitis), and Hives (urticaria). 花粉症（季節性アレルギー性鼻炎）、眼の症状を含む ハウスダストやペットアレルギーのような通年性アレルギー（通年性アレルギー性鼻炎） 蕁麻疹
	用法・用量	The usual dose of Xyzal for adults and adolescents (12 years and older) is one tablet daily. Xyzal tablets should not be given to children under 12 years of age. Tell your doctor or pharmacist if you have impaired kidney function before taking Xyzal. 成人および青年（12 歳以上）の服用量は、1 日 1 錠です。 12 歳未満の小児にはザイザルを投与しないでください。 腎機能障害がある人は、ザイザル服用前に医師または薬剤師にお知らせください。
	備考	2010 年 OTC 化 (S2) Pharmacy Medicine

医療用医薬品としての承認状況

☑ 英国　☑ 仏国　☑ 独国　☑ 米国　☐ 加国　☐ 豪州

〔備考〕

レボセチリジンは2001年にドイツで承認されて以来、現在までに世界60ヵ国以上の国又は地域で承認されている（2018年11月時点）。（インタビューフォームより）

参考資料一覧

1） “2019 年国民生活基礎調査の概況” p.35. 厚生労働省. https://www.mhlw.go.jp/toukei/saikin/hw/k-tyosa/k-tyosa19/dl/14.pdf,（参照 2018-08-18）

2） 鼻アレルギー診療ガイドライン作成委員会. “疫学”. 鼻アレルギー診療ガイドライン―通年性鼻炎と花粉症―2016 年版（改定第 8 版）. 株式会社ライフサイエンス, 2017, p.11

3） 一般社団法人日本アレルギー学会. “治療法の選択”. アレルギー総合ガイドライン 2016. 株式会社共和企画, 2016, p.242-243

4） 一般社団法人日本アレルギー学会. “薬物療法”. アレルギー総合ガイドライン 2016. 株式会社共和企画, 2016, p.391

5） 一般社団法人日本アレルギー学会. “アトピー性皮膚炎の薬物療法”. アレルギー総合ガイドライン 2016. 株式会社共和企画, 2016, p.322-329

6） 一般社団法人日本アレルギー学会.“療法と今後”. アレルギー総合ガイドライン 2016. 株式会社共和企画, 2016, p.377-379

7） FDA. “Approval Date(s) and History, Letters, Labels, Reviews for NDA 209089”. Drugs@FDA: FDA-Approved Drug, https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2017/209089Orig1s000,209090Orig1s000lbl.pdf,（参照 2018-08-18）

8） 豪州　OTC 添付文書：Xyzal tablets (UCB pharma)

＊2021年8月改訂（第1版）

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錠

日本標準商品分類番号
87449

貯法：室温保存
有効期間：5年

ザイザル®錠5mg

Xyzal® Tablets 5mg

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

承認番号	22200AMX00949
販売開始	2010年12月

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．組成・性状
3.1 組成

販売名	ザイザル錠5mg
有効成分	1錠中 レボセチリジン塩酸塩5mg
添加剤	結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、乳糖水和物、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール400

3.2 製剤の性状

販売名	ザイザル錠5mg
剤形・性状	白色の両面割線入りのフィルムコーティング錠
識別コード	XX
表 （長径×短径）	 8mm×4.5mm
裏	
側面 （厚さ）	 3.2mm
質量	103mg

4．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

6．用法及び用量
［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。

7．用法及び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］

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。

9．特定の背景を有する患者に関する注意
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］
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］
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］
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。
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。
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］

10．相互作用
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。

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)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。

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。

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）

11.2 その他の副作用

	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、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。

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。

12．臨床検査結果に及ぼす影響

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

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。

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。

16．薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 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Cmax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[1)]。

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Cmax及びAUC_{0-48}は同等であった。

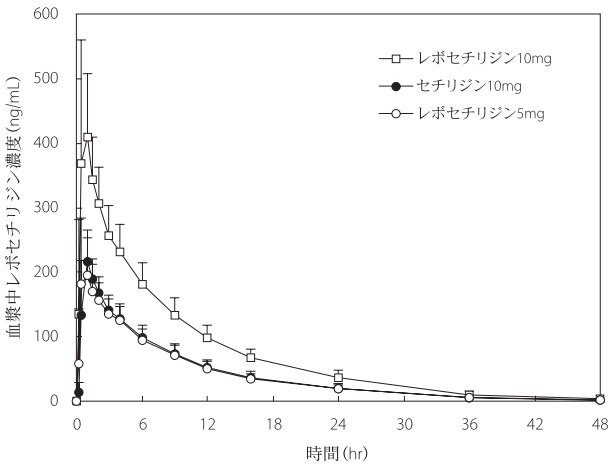


図1　血漿中レボセチリジン濃度推移（20例、平均値＋標準偏差）

表1　レボセチリジンの薬物動態パラメータ

投与薬剤	投与量	tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (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

20例、平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

16.1.2 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（外国人データ）。

16.2 吸収

16.2.1 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tmaxは約1.3時間遅延し、Cmaxが約35%低下したが、AUCに顕著な差はみられなかった（外国人データ）。

16.3 分布

16.3.1 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。

16.3.2 血漿蛋白結合率

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

16.4 代謝

16.4.1 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。

16.4.2 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Cmax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。

16.5 排泄

16.5.1 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±0.567L/hr及び2.482±0.582L/hrであった。

16.5.2 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（外国人データ）。

16.5.3 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[2)]。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 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$AUC_{0-\infty}$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（外国人データ）。[2.2、7.1、9.2.1、9.2.2参照]

表2　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 (6例)	軽度低下 (6例)	中等度低下 (6例)	重度低下 (5例)
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
$AUC_{0-\infty}$ (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

平均値±標準偏差
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

16.6.2 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（外国人データ）。[9.3.1参照]

表3　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 (14例)	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 (6例)	1.0±0.4	498±118	13.8±1.8	6.4±1.6

平均値±標準偏差

16.6.3 高齢者

高齢者（年齢：平均68歳）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（年齢：平均40歳）と比較して約25%低かった（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4　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)	$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)
健康成人 (27例)	0.58 (0.58-2.08)	1635±268	6.92±1.10	13855±2340
高齢者 (9例)	1.08 (0.58-2.08)	1596±287	8.92±1.71	20382±6025

平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 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[3)]。

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[4)]。

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1に示した。その結果から、プラセボに対する本薬の優越性が検証された[5)]。

表1　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（平均値±標準偏差、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[6]。
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週後及び投与2週後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[7]。
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週後及び投与2週後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[8]。
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週後及び投与2週後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[9]。
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。

(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回投与した時、投与3日後、投与1週後及び投与2週後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、66.7%（24/36例）、70.8%（34/48例）及び80.0%（32/40例）であった[10]。
副作用発現頻度は7.8%（4/51例）であり、主な副作用は眠気3.9%（2/51例）であった。

〈湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症〉

(9) 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[11]。
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〉

(10) 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フマル酸塩ドライシロップ［3歳以上7歳未満：1回0.6g（ケトチフェンとして0.6mg）を1日2回、7歳以上15歳未満：1回1g（ケトチフェンとして1mg）を1日2回］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2に示した。その結果から、ケトチフェンフマル酸塩に対する本薬の非劣性が検証された[12]。

表2　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。

(11) 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（平均値±標準偏差）は、投与4週時：0.83±0.79、投与8週時：0.97±0.90、投与12週時：1.03±0.90であり、効果は投与終了時まで減弱することなく、安定していた[13]。
副作用発現頻度は1.4%（1/73例）であり、傾眠1例であった。

17.1.2 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、鼻のそう痒及び眼のそう痒）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。

表3　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。

表4　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[14]。

表5　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[15]。

表6　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%（15/81例）であり、主な副作用は疲労9.9%（8/81例）、頭痛6.2%（5/81例）であった。

17.3 その他

17.3.1 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[6),12),13),16)]。小児通年性アレルギー性鼻炎に対するプラセボを対照とした二重盲検比較試験の結果、セチリジン塩酸塩の眠気の発現率は1.0%未満（1/122例）であり、プラセボ（0/117例）と同程度であった[5]。

18．薬効薬理

18.1 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。

18.2 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）[17]。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[18]。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）[19]。

18.3 好酸球に対する作用

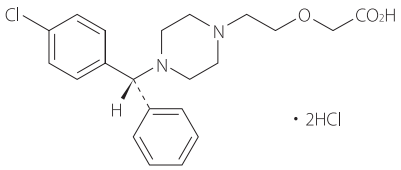
*In vitro*において、エオタキシン刺激による好酸球の血管内皮細胞間隙遊走を抑制した（ヒト）[20]。

18.4 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）。

19．有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：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：$C_{21}H_{25}ClN_2O_3$・2HCl
分　子　量：461.81
化学構造式：



性　　状：白色の粉末である。
分配係数（logP）：1.32（pH7.4、1-オクタノール／水系）

22．包装

100錠［10錠（PTP）×10］
500錠［10錠（PTP）×50］

23．主要文献

1）井野比呂子ほか：臨床薬理．2010；41：309-315
2）Benedetti MS，et al.：Eur J Clin Pharmacol．2001；57：571-582
3）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望．1994；37：754-779
4）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望．1995；38：116-136
5）斎藤博久：臨床医薬．2010；26：141-154
6）斎藤博久ほか：臨床医薬．2010；26：127-139
7）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床．1994；28：2107-2129
8）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床．1994；28：2131-2145
9）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床．1994；28：2163-2173
10）社内資料：セチリジン円形錠（5mg錠）の慢性蕁麻疹に対する臨床試験
11）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床．1994；28：2147-2162
12）中川秀己ほか：臨床医薬．2010；26：155-167
13）中川秀己ほか：臨床医薬．2010；26：169-181
14）Potter PC，et al.：Allergy．2003；58：893-899
15）Kapp A，et al.：Int J Dermatol．2006；45：469-474
16）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2009年4月22日承認、セチリジン塩酸塩CTD 2.7.6.3）
17）Gillard M，et al.：Mol Pharmacol．2002；61：391-399
18）Christophe B，et al.：Eur J Pharmacol．2003；470：87-94
19）Devalia JL，et al.：Allergy．2001；56：50-57
20）Thomson L，et al.：Clin Exp Allergy．2002；32：1187-1192

24．文献請求先及び問い合わせ先

グラクソ・スミスクライン株式会社
東京都港区赤坂1-8-1
カスタマー・ケア・センター
TEL：0120-561-007（9：00～17：45/土日祝日及び当社休業日を除く）
FAX：0120-561-047（24時間受付）

26．製造販売業者等

26.1 製造販売元

グラクソ・スミスクライン株式会社
東京都港区赤坂 1－8－1
http://jp.gsk.com

®登録商標

＊2021年8月改訂（第1版）

貯法：室温保存
有効期間：3年

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

ザイザル®シロップ0.05%

Xyzal® Syrup

日本標準商品分類番号
87449

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

承認番号	22600AMX00030
販売開始	2014年4月

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．組成・性状
3.1 組成

販売名	ザイザルシロップ0.05%
有効成分	1mL中 レボセチリジン塩酸塩0.5mg
添加剤	酢酸ナトリウム水和物、氷酢酸、マルチトール液、グリセリン、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、香料、精製水

3.2 製剤の性状

販売名	ザイザルシロップ0.05%
剤形・性状	無色澄明のシロップ剤
pH	4.7～5.3

4．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

6．用法及び用量
［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。

7．用法及び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］

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。

9．特定の背景を有する患者に関する注意
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］
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］
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］
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。
9.7 小児等
6ヵ月未満の乳児等を対象とした臨床試験は実施していない。
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］

10．相互作用
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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。

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。

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）

11.2 その他の副作用

	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、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。

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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

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

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男性20例にレボセチリジン塩酸塩5mg（シロップ）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0.75時間には最高血漿中濃度203.3ng/mLに到達した。血漿中濃度の消失半減期は約7.9時間であった。セチリジン塩酸塩10mg（ドライシロップ）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196.5ng/mLに到達し、血漿中濃度の消失半減期は約7.9時間であった[1)]。レボセチリジン塩酸塩（シロップ）はセチリジン塩酸塩（ドライシロップ）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Cmax及びAUC_{0-48}は同等であった。

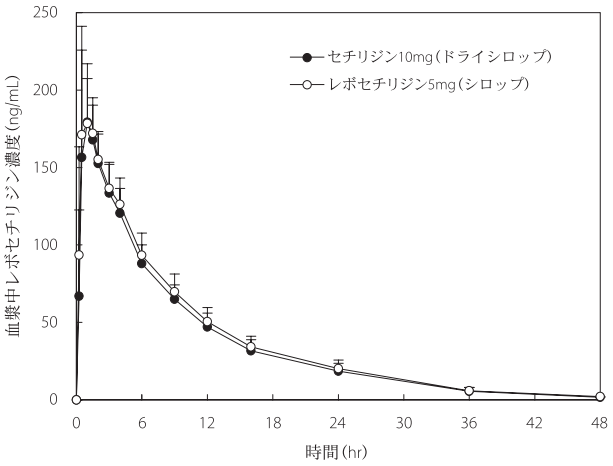


図1　血漿中レボセチリジン濃度推移（20例、平均値＋標準偏差）

表1　レボセチリジンの薬物動態パラメータ

投与薬剤	投与量	tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)
レボセチリジン（シロップ）	5mg	0.75 (0.50-1.50)	203.3±42.49	7.91±1.00	1844.7±317.56
セチリジン（ドライシロップ）	10mg	1.00 (0.50-1.50)	196.5±31.31	7.85±1.00	1737.1±278.99

20例、平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

健康成人男性20例にレボセチリジン塩酸塩5mg（錠剤）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Cmaxの上昇及びAUCの増加が認められた。セチリジン塩酸塩10mg（錠剤）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に到達し、血漿中濃度の消失半減期は約7.3時間であった[2)]。レボセチリジン塩酸塩（錠剤）はセチリジン塩酸塩（錠剤）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Cmax及びAUC_{0-48}は同等であった。

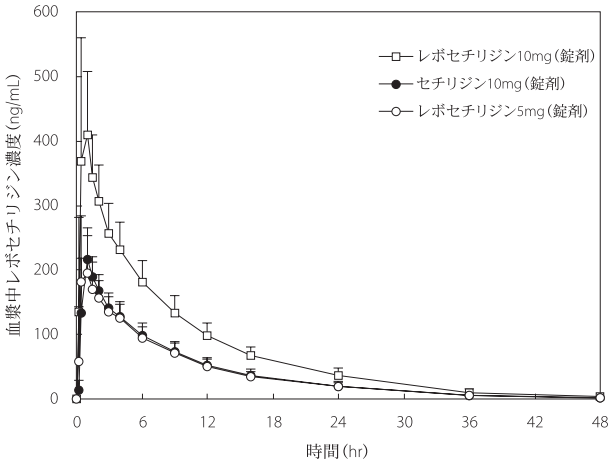


図2　血漿中レボセチリジン濃度推移（20例、平均値＋標準偏差）

表2　レボセチリジンの薬物動態パラメータ

投与薬剤	投与量	tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)
レボセチリジン（錠剤）	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（錠剤）	10mg	1.00 (0.50-2.00)	228.30±40.67	7.32±0.78	1875.37±377.94

20例、平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

16.1.2 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（外国人データ）。

16.2 吸収

16.2.1 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tmaxは約1.3時間遅延し、Cmaxが約35%低下したが、AUCに顕著な差はみられなかった（外国人データ）。

16.3 分布

16.3.1 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。

16.3.2 血漿蛋白結合率

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

16.4 代謝

16.4.1 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。

16.4.2 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Cmax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。

16.5 排泄

16.5.1 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±0.567L/hr及び2.482±0.582L/hrであった。

16.5.2 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（外国人データ）。

16.5.3 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[3]。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 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$AUC_{0-\infty}$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（外国人データ）。［2.2、7.1、9.2.1、9.2.2参照］

表3　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 (6例)	軽度低下 (6例)	中等度低下 (6例)	重度低下 (5例)
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
$AUC_{0-\infty}$ (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

平均値±標準偏差
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

16.6.2 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（外国人データ）。［9.3.1参照］

表4　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 (14例)	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 (6例)	1.0±0.4	498±118	13.8±1.8	6.4±1.6

平均値±標準偏差

16.6.3 高齢者

高齢者（年齢：平均68歳）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（年齢：平均40歳）と比較して約25%低かった（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、最高投与量は1日20mL（レボセチリジン塩酸塩として10mg）である。

表5　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)	$AUC_{0-\infty}$ (ng.hr/mL)
健康成人 (27例)	0.58 (0.58-2.08)	1635±268	6.92±1.10	13855±2340
高齢者 (9例)	1.08 (0.58-2.08)	1596±287	8.92±1.71	20382±6025

平均値±標準偏差、tmax：中央値（範囲）

16.6.4 小児等

アレルギー性鼻炎もしくは皮膚疾患に伴うそう痒を有する小児（生後6ヵ月以上2歳未満）に、レボセチリジン塩酸塩1.25mgを生後6ヵ月以上1歳未満の小児には1日1回、1歳以上2歳未満の小児には1日2回投与した時、血漿中レボセチリジン濃度は下記の通りであった。

表6　小児におけるレボセチリジン濃度

被験者	Cmax(ng/mL)	Cmin(ng/mL)
生後6ヵ月以上1歳未満	216.1±81.7 (29)	21.6±19.2 (30)
1歳以上2歳未満	203.4±69.1 (29)	53.8±25.8 (29)

平均値±標準偏差（例数）

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 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[4]。

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[5]。

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1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[6]。

表1　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（平均値±標準偏差、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[7]。

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週後及び投与2週後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[8]。

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週後及び投与2週後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[9]。

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週後及び投与2週後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[10]。

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。

(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回投与した時、投与3日後、投与1週後及び投与2週後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、66.7%（24/36例）、70.8%（34/48例）及び80.0%（32/40例）であった[11]。

副作用発現頻度は7.8%（4/51例）であり、主な副作用は眠気3.9%（2/51例）であった。

〈湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症〉

(9)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[12]。

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〉

(10)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フマル酸塩ドライシロップ［3歳以上7歳未満：1回0.6g（ケトチフェンとして0.6mg）を1日2回、7歳以上15歳未満：1回1g（ケトチフェンとして1mg）を1日2回］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2に示した。その結果から、ケトチフェンフマル酸塩に対する本薬の非劣性が検証された[13]。

表2　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。

(11)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（平均値±標準偏差）は、投与4週時：0.83±0.79、投与8週時：0.97±0.90、投与12週時：1.03±0.90であり、効果は投与終了時まで減弱することなく、安定していた[14]。

副作用発現頻度は1.4%（1/73例）であり、傾眠1例であった。

17.1.2 レボセチリジン塩酸塩の臨床試験

〈アレルギー性鼻炎、皮膚疾患に伴うそう痒〉

(1)国内第Ⅲ相試験（非対照非盲検試験、小児）

生後6ヵ月以上2歳未満のアレルギー性鼻炎もしくは皮膚疾患に伴うそう痒を有する小児を対象として、レボセチリジン塩酸塩シロップ1.25mgを6ヵ月以上1歳未満の小児では1日1回、1歳以上2歳未満の小児では1日2回、2週間投与した。

アレルギー性鼻炎の症状について医師が評価した全般改善度において、改善を示した被験者の割合（「中等度改善」以上の症例/総症例）は、75%（15/20例）であった。

皮膚疾患に伴うそう痒の症状について医師が評価した全般改善度において、改善を示した被験者の割合（「中等度改善」以上の症例/総症例）は、73%（29/40例）であった。また、そう痒の重症度の治療期開始日からの変化量（平均値±標準偏差）は、投与1週時：0.7±0.85、投与2週時：1.0±1.01であった。

副作用の発現は認められなかった（解析対象60例）。

〈アレルギー性鼻炎〉

(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、鼻のそう痒及び眼のそう痒）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。

表3　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。

(3)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、季節性アレルギー性鼻炎患者に対し、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。

表4　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。

(4)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[15)]。

表5　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〉

(5)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[16)]。

表6　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%（15/81例）であり、主な副作用は疲労9.9%（8/81例）、頭痛6.2%（5/81例）であった。

17.3 その他

17.3.1 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[7),13),14),17)]。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[6)]。

18．薬効薬理

18.1 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。

18.2 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）[18)]。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[19)]。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）[20)]。

18.3 好酸球に対する作用

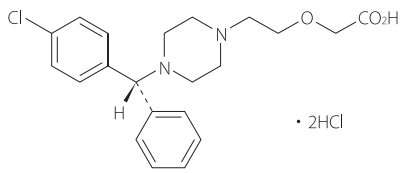
*In vitro*において、エオタキシン刺激による好酸球の血管内皮細胞間隙遊走を抑制した（ヒト）[21)]。

18.4 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）。

19．有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：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：$C_{21}H_{25}ClN_2O_3$・2HCl
分　子　量：461.81
化学構造式：



性　　状：白色の粉末である。
分配係数（logP）：1.32（pH7.4、1-オクタノール／水系）

20．取扱い上の注意

ガラス容器開栓後は、遮光して保存すること。

22．包装

200mL［瓶］、500mL［瓶］

23．主要文献

1）Ino H, et al.：J Drug Assess. 2014；3：38-42
2）井野比呂子ほか：臨床薬理. 2010；41：309-315
3）Benedetti MS, et al.：Eur J Clin Pharmacol. 2001；57：571-582
4）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1994；37：754-779
5）奥田　稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1995；38：116-136
6）斎藤博久：臨床医薬. 2010；26：141-154
7）斎藤博久ほか：臨床医薬. 2010；26：127-139
8）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2107-2129
9）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2131-2145
10）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2163-2173
11）社内資料：セチリジン円形錠（5mg錠）の慢性蕁麻疹に対する臨床試験
12）吉田彦太郎ほか：基礎と臨床. 1994；28：2147-2162
13）中川秀己ほか：臨床医薬. 2010；26：155-167
14）中川秀己ほか：臨床医薬. 2010；26：169-181
15）Potter PC, et al.：Allergy. 2003；58：893-899
16）Kapp A, et al.：Int J Dermatol. 2006；45：469-474
17）社内資料：小児アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（2009年4月22日承認、セチリジン塩酸塩CTD 2.7.6.3）
18）Gillard M, et al.：Mol Pharmacol. 2002；61：391-399
19）Christophe B, et al.：Eur J Pharmacol. 2003；470：87-94
20）Devalia JL, et al.：Allergy. 2001；56：50-57
21）Thomson L, et al.：Clin Exp Allergy. 2002；32：1187-1192

24．文献請求先及び問い合わせ先

グラクソ・スミスクライン株式会社
東京都港区赤坂1-8-1
カスタマー・ケア・センター
TEL：0120-561-007（9：00～17：45/土日祝日及び当社休業日を除く）
FAX：0120-561-047（24時間受付）

26．製造販売業者等

26.1 製造販売元

グラクソ・スミスクライン株式会社
東京都港区赤坂１－８－１
http://jp.gsk.com

®登録商標

資料5-2

＜日本耳鼻咽喉科頭頸部外科学会　見解＞
＜日本臨床耳鼻咽喉科医会　見解＞

スイッチＯＴＣ医薬品の候補成分に関する見解

１．候補成分に関連する事項

候補成分の情報	成分名 （一般名）	レボセチリジン塩 5mg 錠、0.5mg/mL（シロップ）
	効能・効果	花粉、ハウスダスト（室内塵）などによる次のような症状の緩和：鼻づまり、鼻みず、くしゃみ、

２．スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の妥当性	１．OTC とすることの妥当性について 【薬剤特性の観点から】 医療用の効能・効果は「アレルギー性鼻炎」となっているが、これは耳鼻咽喉科医が鼻内所見等を総合して判断している。一般の方はアレルギー性鼻炎、副鼻腔炎等と自己判断されると混乱するため上記効能・効果とした。 [成人] 〈錠剤〉既承認のセチリジンの半量で効果が得られるため、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。10mg は OTC としては過剰なため削除していただきたい。 〈シロップ剤〉 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。 [小児] 小児に関しては 7 歳以上が適当である（フェキソフェナジンは使用者が自身の症状を説明できる範囲となっている） 〈錠剤〉 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。 〈シロップ剤〉 通常、7 歳以上 15 歳未満の小児はレボセチリジン塩酸塩として 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。 【対象疾患の観点から】 花粉、ハウスダスト（室内塵）などによる次のような鼻症状の緩和：鼻づまり、鼻みず、くしゃみ、として副鼻腔炎は除外していただきたい。 【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 〔上記と判断した根拠〕 既承認されているセチリジン、フェキソフェナジン、アレグラ FX

	ジュニアを参照 ２．OTC とする際の留意事項、課題点について 小児に販売する場合は、小児及び保護者の両方が薬局に行く必要がある。 〔上記と判断した根拠〕 耳鼻咽喉科医は鼻内所見等を参考に総合的に判断しており、OTC 化には若干の制限が必要である。 ３．その他 内服を１週間継続しても症状の改善がみられない場合には服用を中止し、医師又は薬剤師に相談すること。
備考	

＜日本皮膚科学会　見解＞

スイッチＯＴＣ医薬品の候補成分に関する見解

１．候補成分に関連する事項

候補成分の情報	成分名 （一般名）	レボセチリジン
	効能・効果	鼻炎、皮膚炎

２．スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の妥当性	１．OTC とすることの妥当性について 条件付可 【薬剤特性の観点から】 　医療用レボセチリジンの効能・効果は、成人ではアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症に、小児ではアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒に認められている。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、血小板減少が記載されているが、その頻度は極めて低く、発売され 10 年以上経過する中、臨床現場では大きな問題なく使用されている。 【対象疾患の観点から】 　以前レボセチリジンと同様の作用を有する抗ヒスタミン薬（エピナスチン、フェキソフェナジンなど）が OTC 化されるにあたり、皮膚疾患は効能効果から除外された。その理由として以下の 2 点が挙げられた。まず、蕁麻疹は初期には薬疹との鑑別が困難であり、発症早期の不適切な一般用医薬品の使用により適切な治療開始が遅れ症状を重篤化させる懸念がある。また、湿疹皮膚炎群の治療の主体はステロイド外用薬を中心とした外用療法であり、一般用医薬品の抗ヒスタミン薬で湿疹皮膚炎群を効能効果に入れることには大きな問題がある。 　欧米では非鎮静性抗ヒスタミン薬のアトピー性皮膚炎に対する有用性を認めておらず、本剤をスイッチ OTC 化する場合、湿疹・皮膚炎を対象とすることは適切な治療を遅らせる可能性があり、好ましくないと考える。 【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 　レボセチリジンをスイッチ化することに問題は無いと考えるが、前述した理由により皮膚炎を効能効果に入れることは不可と考える。 〔上記と判断した根拠〕 上述した通り

	２．OTC とする際の留意事項、課題点について 　適応の遵守と受診勧奨を対面販売でしっかり行っていただきたい。 〔上記と判断した根拠〕 ３．その他
備考	

＜日本臨床皮膚科医会　見解＞

スイッチＯＴＣ医薬品の候補成分に関する見解

１．候補成分に関連する事項

候補成分の情報	成分名 （一般名）	レボセチリジン
	効能・効果	鼻炎、皮膚炎

２．スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の妥当性	１．OTC とすることの妥当性について 【薬剤特性の観点から】 　医療用レボセチリジンの皮膚疾患関連の適応は、成人においては蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚掻痒症、小児においては蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒である。重大な副作用にショック・アナフィラキシー、痙攣、肝機能障害・黄疸、血小板減少が記載されているものの、その頻度は極めて少なく、眠気、倦怠感が 0.1～5%未満、頭重感、ふらふら感、めまいは 0.1%未満とかなり安全に使用できる薬剤である。 【対象疾患の観点から】 　皮膚炎（湿疹を含む）に関しては多くの場合、薬局薬剤師又は患者本人による判断は難しく、皮膚科専門医の診断が必須である。さらに皮膚科専門医の診察・診断によらない自己判断は、症状を遷延化又は重症化させる原因ともなる。もとより皮膚炎（湿疹を含む）にはステロイド外用剤を中心に、抗アレルギー剤の内服を併用することが治療の原則となるため、本剤をスイッチ OTC 化した場合、「皮膚炎に対し本剤の内服により治癒する」との安易な考えを助長することにもつながり、適切な治療に至らないことを危惧する。 【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 　レボセチリジンを OTC 化することに問題は無いと考えるが、前述した理由により効能・効果から皮膚炎の削除を強く要望する。 〔上記と判断した根拠〕 　前述参照 ２．OTC とする際の留意事項、課題点について

	〔上記と判断した根拠〕 ３．その他
備考	

＜日本小児科学会　見解＞

スイッチＯＴＣ医薬品の候補成分に関する見解

１．候補成分に関連する事項

候補成分の情報	成分名 （一般名）	レボセチリジン塩酸塩
	効能・効果	鼻炎、皮膚炎

２．スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の妥当性	１．OTC とすることの妥当性について 【薬剤特性の観点から】 問題なし。 【対象疾患の観点から】 問題なし。 【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 問題なし。 〔上記と判断した根拠〕 ２．OTC とする際の留意事項、課題点について 添付文章の事項を留意するような注意喚起があれば良いと思われる。 〔上記と判断した根拠〕 ３．その他
備考	