



GlaxoSmithKline

生きる喜びを、もっと
Do more, feel better, live longer

2010年12月

持続性選択H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

ザイザル[®]錠5mg

新発売のお知らせ

謹啓

時下、ますますご清栄のこととお慶び申し上げます。

平素は弊社製品につきまして、格別のご高配を賜り厚く御礼申し上げます。

さて、この度、持続性選択H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤「ザイザル[®]錠 5mg」
(一般名:レボセチリジン塩酸塩)を発売させていただき運びとなりました。

「ザイザル[®]錠 5mg」は、ベルギーのUCB社(本社:ベルギーブリュッセル)が開発し、EUや米国など世界93カ国で承認されているアレルギー性疾患治療薬です。

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症のアレルギー症状でお悩みの患者さんの治療に「ザイザル[®]錠 5mg」を幅広くお役立ていただき、ご愛顧賜りますよう何卒宜しく
お願い申し上げます。

謹白



製造販売元(輸入)

グラクソ・スミスクライン 株式会社
〒151-8566 東京都渋谷区千駄ヶ谷 4-6-15

グラクソ・スミスクラインの製品に関するお問い合わせ・資料請求
TEL:0120-561-007(9:00~18:00/土日祝日及び当社休業日を除く)
FAX:0120-561-047(24時間受付)

ザイザル錠5mg

Xyzal Tablets 5mg レボセチリジン塩酸塩錠

貯法：室温保存 / 使用期限：包装に表示

【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

成分・含量	1錠中にレボセチリジン塩酸塩 5mg
添加物	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

2. 性状 本剤は、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り、識別コード及び形状は下記のとおりである。

販売名	識別コード	表	裏	側面	質量
ザイザル錠5mg	XX	 長径：8mm 短径：4.5mm		 厚さ：3.2mm	103mg

【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、血中濃度が增大するため、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(「薬物動態」の項参照)。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】

- 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)及び「薬物動態」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」及び「薬物動態」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。]
- 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、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。 (3)本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。
- 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) 塩酸塩との併用により、テオフィリンの薬物動態には変化はないが、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。
ビルシカイニド 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、ビ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。

日本標準商品分類番号	87449
承認番号	22200AMX00949
薬価収載	2010年12月
販売開始	2010年12月
国際誕生	2001年1月

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。国内において、レボセチリジン塩酸塩の有効性、安全性を検証する臨床試験は行われていない。

(レボセチリジン塩酸塩の海外における試験)

(成人)アレルギー性鼻炎及び慢性蕁麻疹を対象とした9つの海外臨床試験において、レボセチリジン塩酸塩5mgを投与した総調査症例1292例中207例(16.0%)に副作用が報告された。その主なものは、傾眠67例(5.2%)、頭痛42例(3.3%)、疲労39例(3.0%)であった。(承認時)

(セチリジン塩酸塩の国内における試験及び調査)

(成人)セチリジン塩酸塩の承認時までの成人を対象とした調査1396例中189例(13.5%)に副作用又は臨床検査値の異常変動が認められた。副作用は1396例中140例(10.0%)にみられ、主なものは眠気84例(6.0%)、倦怠感12例(0.9%)、口渇9例(0.6%)、嘔気7例(0.5%)であった。また、主な臨床検査値の異常変動はAST(GOT)上昇1.4%(17/1182例)、ALT(GPT)上昇1.5%(18/1181例)、好酸球増多0.8%(9/1114例)、総ビリルビン上昇0.5%(6/1133例)であった。成人を対象とした市販後の使用成績調査57599例(小児163例を含む)中207例(3.6%)に臨床検査値異常を含む副作用が認められた。主な副作用は眠気149件(2.6%)、倦怠感9件(0.2%)、口渇9件(0.2%)、浮動性めまい8件(0.1%)、頭痛6件(0.1%)等であった。(セチリジン塩酸塩の再審査終了時) (小児)セチリジン塩酸塩ドライシロップの承認時までの小児を対象とした臨床試験602例中25例(4.2%)に臨床検査値異常変動を含む副作用が認められた。主なものはALT(GPT)上昇8例(1.3%)、眠気6例(1.0%)であった。

(1)重大な副作用 1)ショック、アナフィラキシー様症状(頻度不明^(注2)):ショック、アナフィラキシー様症状(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、観察を十分にを行い、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^(注2)):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(0.6%)、黄疸(頻度不明^(注2)):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、観察を十分にを行い、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^(注2)):血小板減少があらわれることがあるので、観察を十分にを行い、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。

注2)海外でのレボセチリジン塩酸塩の自発報告のみで認められている副作用については頻度不明とした。(2)その他の副作用 セチリジン塩酸塩で認められている副作用を以下に示す。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。

	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 ^(注3) 、疲労 ^(注3) 、無力症 ^(注3) 、睡眠障害 ^(注3) 、錯覚 ^(注3) 、幻覚 ^(注3)
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
循環器		動悸、血圧上昇、不整脈(房室ブロック、期外収縮、頻脈、発作性上室性頻拍、心房細動)	
血液	好酸球増多	好中球減少、リンパ球増多、白血球増多、白血球減少、単球増多、血小板増加、血小板減少	
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 ^(注3)
眼		結膜充血、霧視	視覚障害 ^(注3)
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、BUN上昇、尿酸、ウロビリノーゲンの異常、頻尿、血尿	排尿困難
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 ^(注3) 、筋肉痛 ^(注3) 、呼吸困難 ^(注3)

注3)海外のレボセチリジン塩酸塩で認められている副作用を記載した。

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ため、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(「薬物動態」の項参照)。 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。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。 10. 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。]

【包装】

ザイザル錠5mg:100錠(10錠×10)PTP

● その他の詳細につきましては、添付文書をご参照ください。添付文書の改訂に十分ご注意ください。

2010年10月作成(第1版)

製造販売元(輸入)

グラクソ・スミスクライン株式会社
〒115-18566 東京都渋谷区千駄ヶ谷4-6-15

グラクソ・スミスクラインの製品に関するお問い合わせ・資料請求
TEL:0120-561-007(9:00~18:00/土日祝日及び当社休業日を除く)
FAX:0120-561-047(24時間受付)

XYXT0006-D1012D
作成年月2010年12月