

日本薬局方  
セチリジン塩酸塩錠  
**ジルテック錠5**  
**ジルテック錠10**

Zyrtec®

規制区分：

処方せん医薬品

(注意 - 医師等の処方せん  
により使用すること)

貯 法：室温保存

使用期限：包装に表示

|         | 錠5            | 錠10           |
|---------|---------------|---------------|
| 承認番号    | 21000AMY00144 | 21000AMY00145 |
| 薬価収載    | 1998年8月       | 1998年8月       |
| 販売開始    | 1998年9月       | 1998年9月       |
| 再審査結果   | 2008年10月      | 2008年10月      |
| 用法・用量追加 | 2009年4月       | -             |
| 国際誕生    | 1986年11月      | 1986年11月      |

**【禁忌】** 次の患者には投与しないこと)

本剤の成分又はヒドロキシジンに対し過敏症の既往歴のある患者

**【組成・性状】**

| 販売名           | ジルテック錠5  | ジルテック錠10   |
|---------------|--|--|
| 有効成分<br>(1錠中) | 日局セチリジン塩酸塩<br>5mg  | 日局セチリジン塩酸塩<br>10mg   |
| 添 加 物         | 乳糖水和物、結晶セルロース、<br>軽質無水ケイ酸、ステアリン酸<br>マグネシウム、ヒプロメロース、<br>酸化チタン、マクロゴール400 | 乳糖水和物、結晶セルロース、<br>軽質無水ケイ酸、ステアリン酸<br>マグネシウム、ヒプロメロース、<br>酸化チタン、マクロゴール400 |
| 剤 形           | 白色のフィルムコート錠  | 白色のフィルムコート錠  |
| 外 形           |  |  |
| 直 径           | 約6mm   | 約7mm   |
| 厚 さ           | 約3mm   | 約3mm   |
| 質 量           | 約88mg  | 約119mg   |
| 識別コード         | 622  | 623  |

**【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】**

〔10mg錠〕

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として1回10mg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  
20mgとする。

〔5mg錠〕

〔成人〕

通常、成人にはセチリジン塩酸塩として1回10mg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  
20mgとする。

〔小児〕

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

**【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。  
(「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。  
(「薬物動態」の項参照))
- (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。)

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に十分  
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         |
|-------------------|---|-----------------|
| ピルシカイニド<br>塩酸塩水和物 | 併用により両剤の血中濃度が<br>上昇し、ピルシカイニド塩酸<br>塩水和物の副作用が発現した<br>との報告がある。 | 機序は明らかで<br>はない。 |

4 副作用

〔成人〕

承認時までの成人を対象とした調査1,396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  
1,396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%)、口渴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%(17/1,182例)、ALT(GPT)上昇1.5%(18/  
1,181例)、好酸球増多0.8%(9/1,114例)、総ビリルビン上昇  
0.5%(6/1,133例)であった。

成人を対象とした市販後の使用成績調査5,759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%)、口渴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。(再審査終了時)

〔小児〕

ジルテック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))

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 (0.1%未満)

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 (頻度不明注)

AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP、LDH、AI-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 (頻度不明注)

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、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  | 頻度不明注)                     |
|--------|--------------------------------|---|----------------------------|
| 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           |
| 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                       |
| 眼      |                                | 結膜充血、霧視   |                            |
| 肝臓     | ALT(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、総ビリルビン上昇 | AI-P上昇  |                            |
| 腎臓・泌尿器 |                                | 尿蛋白、BUN上昇、尿糖、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 |

注) 市販後の自発報告等又は外国での報告のため頻度不明。

5. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄される(「薬物動態」の項参照)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5mg)から投与を開始するなど慎重に投与し、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。

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。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

(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。〔動物実験(ラット、イヌ)で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の幼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が少ない)。

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. 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。)

【薬物動態】

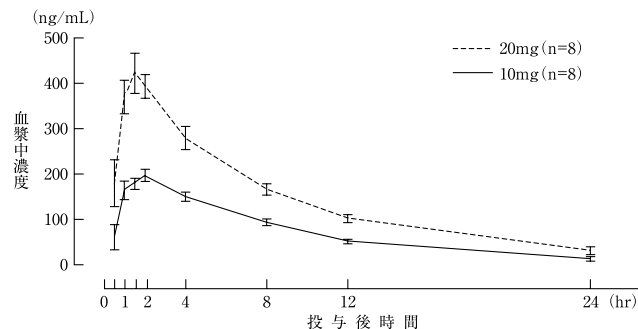
1 血中濃度

(1) 血漿中濃度の推移

〔成人〕

健康成人にセチリジン塩酸塩錠10mgを単回経口投与した場合、速やかに吸収され、投与約1.4時間後に最高血漿中濃度(C<sub>max</sub>) 214.5ng/mLに達し、血漿中濃度消失半減期は約7時間であった。また、20mgを単回経口投与した場合、投与量の増加に伴ってC<sub>max</sub>の上昇、AUCの増大が認められた。健康成人に1日1回20mgを7日間連続経口投与した場合、蓄積性は認められなかった<sup>1)</sup>。

成人におけるセチリジン塩酸塩錠単回投与時の血漿中濃度の推移



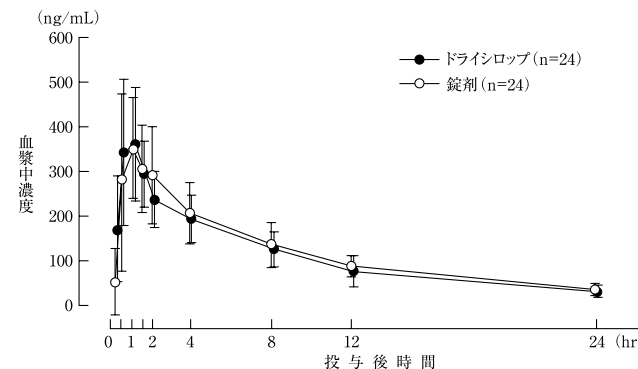
成人におけるセチリジン塩酸塩錠単回投与時の薬物動態パラメータ

| 投与量  | T <sub>max</sub> (hr) | C <sub>max</sub> (ng/mL) | T <sub>1/2</sub> (hr) | AUC (mg·hr/L) |
|------|-----------------------|--------------------------|-----------------------|---------------|
| 10mg | 1.44 ± 0.50           | 214.5 ± 35.3             | 6.73 ± 2.30           | 2.0 ± 0.3     |
| 20mg | 1.50 ± 0.38           | 438.1 ± 111.8            | 6.79 ± 1.85           | 3.9 ± 0.9     |

(平均値 ± 標準偏差, n = 8)

また、健康成人にセチリジン塩酸塩ドライシロップ0.8gを単回経口投与した場合、速やかに吸収され、投与約0.82時間後に最高血漿中濃度(C<sub>max</sub>) 413.6ng/mLに達し、血漿中濃度消失半減期は約8時間であった<sup>2)</sup>。

成人におけるセチリジン塩酸塩錠・ドライシロップ単回投与時の血漿中濃度の推移



成人におけるセチリジン塩酸塩錠・ドライシロップ単回投与時の薬物動態パラメータ

| 投与量          | T <sub>max</sub> (hr) | C <sub>max</sub> (ng/mL) | T <sub>1/2</sub> (hr) | AUC (mg·hr/L) |
|--------------|-----------------------|--------------------------|-----------------------|---------------|
| 10mg錠        | 1.13 ± 0.52           | 440.9 ± 144.7            | 8.36 ± 1.63           | 3.0 ± 0.8     |
| ドライシロップ 0.8g | 0.82 ± 0.39           | 413.6 ± 130.5            | 8.03 ± 1.45           | 2.8 ± 0.8     |

(平均値 ± 標準偏差, n = 24)

〔小児〕

日本人の通年性アレルギー性鼻炎患児又は皮膚疾患患児を対象とした臨床試験5試験、570例から得られた血清中濃度値994点を用い、母集団薬物動態解析(非線形混合効果モデル法、NONMEM)を行った。その結果、体重が共変量として認められ、2~6歳の小児(本年齢層における体重の中央値: 18.0kg)の全身クリアランス(CL/F)は1.64L/h、分布容積(V/F)は11.9L、7~14歳の小児(同: 31.0kg)のCL/Fは2.11L/h、V/Fは17.7Lと推定された。また、2.5mg 1日2回投与時の定常状態時最低血清中濃度(C<sub>ss min</sub>)及び最高血清中濃度(C<sub>ss max</sub>)は、それぞれ58 ± 25ng/mL及び214 ± 50ng/mL(平均 ± 標準偏差\*、以下同様)と推定さ

れ、5 mg 1日2回投与時のC<sub>ss</sub> min及びC<sub>ss</sub> maxは、それぞれ100 ± 40ng/mL及び308 ± 74ng/mLと推定された<sup>3)</sup>。

\* ) 1000例の血清中濃度推移をシミュレーションしたときの推定値

## (2) 血漿蛋白結合率

<sup>14</sup>C標識セチリジン0.1、1及び10 µg/mL濃度の*in vitro*におけるヒト血漿蛋白との結合率は、平均92% (90.7 ~ 92.5%)であった(平衡透析法)<sup>3)</sup>。

## 2. 代謝・排泄

健康成人にセチリジン塩酸塩10mg又は20mgを単回経口投与した場合、24時間後までに投与量の約50%が未変化体として尿中に排泄された。健康成人に1日1回20mgを7日間連続経口投与した場合、血漿中に酸化脱アルキル体がわずかに認められた。また、未変化体の1日投与量に対する尿中排泄率は、1日目は24時間後までに約58%、7日目は約70%であった<sup>1)</sup>。

## 3. 腎障害患者での体内動態 (参考：外国人データ)

腎障害患者(クレアチンクリアランス：7-60mL/min)にセチリジン塩酸塩10mgを単回経口投与した場合、腎機能正常者に比べ血清中濃度は持続し、血清中濃度消失半減期の延長が認められた<sup>5)</sup>。

腎障害患者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

| クレアチンクリアランス<br>(mL/min) | Tmax<br>(hr) | Cmax<br>(ng/mL) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC<br>(mg·hr/L) |
|-------------------------|--------------|-----------------|--------------------------|------------------|
| > 90 (n=5)              | 0.9 ± 0.2    | 313 ± 45        | 7.4 ± 3.0                | 2.7 ± 0.4        |
| 31-60 (n=5)             | 1.1 ± 0.2    | 356 ± 64        | 19.2 ± 3.3               | 6.9 ± 1.8        |
| 7-30 (n=5)              | 2.2 ± 1.1    | 357 ± 172       | 20.9 ± 4.4               | 10.7 ± 2.4       |

(平均値 ± 標準偏差)

また、血液透析患者(クレアチンクリアランス：7 mL/min, n=5)にセチリジン塩酸塩10mgを透析開始3時間前に経口投与した場合、血清中濃度消失半減期は平均19.3時間で延長が認められた<sup>6)</sup>。これらの成績から、中等度及び高度の腎障害患者では、低用量(例えば通常量の半量)から投与を開始するなど慎重に投与すること。

## 4. 肝障害患者での体内動態 (参考：外国人データ)

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、肝機能正常成人<sup>5)</sup>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<sup>7)</sup>。これらの成績から、高度の肝障害患者では、低用量(例えば通常量の半量)から投与を開始するなど慎重に投与すること。

肝障害患者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

| 投与量<br>(被験者、例数)            | Tmax<br>(hr) | Cmax<br>(ng/mL) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC<br>(mg·hr/L) |
|----------------------------|--------------|-----------------|--------------------------|------------------|
| 10mg<br>(肝機能正常成人, n=14)    | 1.0 ± 0.5    | 384 ± 103       | 7.4 ± 1.6                | 3.3 ± 0.9        |
| 10mg<br>(原発性胆汁性肝硬変患者, n=6) | 1.0 ± 0.4    | 498 ± 118       | 13.8 ± 1.8               | 6.4 ± 1.6        |

(平均値 ± 標準偏差)

## 5. 高齢者での体内動態 (参考：外国人データ)

高齢者(年齢：平均77歳、クレアチンクリアランス：平均53mL/min)にセチリジン塩酸塩10mgを単回経口投与した場合、成人(年齢：平均53歳、クレアチンクリアランス：平均87mL/min)に比べ、血清中濃度消失半減期の延長とCmaxの上昇が認められ、これらの薬物動態パラメータの変化は、腎機能の低下によるものと考えられた<sup>5)</sup>。

高齢者におけるセチリジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

| 投与量<br>(被験者、例数)     | Tmax<br>(hr) | Cmax<br>(ng/mL) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC<br>(mg·hr/L) |
|---------------------|--------------|-----------------|--------------------------|------------------|
| 10mg<br>(成人, n=14)  | 1.0 ± 0.5    | 384 ± 103       | 7.4 ± 1.6                | 3.3 ± 0.9        |
| 10mg<br>(高齢者, n=16) | 0.9 ± 0.3    | 460 ± 59        | 11.8 ± 5.4               | 5.6 ± 1.8        |

(平均値 ± 標準偏差)

## 【臨床成績】

### 1. 臨床効果

#### (1) 成人

国内延べ178施設で実施されたアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症636例における一般臨床試験及び二重盲検比較試験の概要は次のとおりであった<sup>8)-11)</sup>。

| 疾患名      | 改善率(「中等度改善」以上の症例/総症例) |
|----------|-----------------------|
| アレルギー性鼻炎 | 49.6% (66/133)        |
| 蕁麻疹      | 77.3% (211/273)       |
| 湿疹・皮膚炎   | 65.9% (81/123)        |
| 痒疹       | 57.7% (30/52)         |
| 皮膚そう痒症   | 74.5% (41/55)         |

(10mg 1日1回投与例について集計)

また、アレルギー性鼻炎及び蕁麻疹を対象とした二重盲検比較試験において本剤の有用性が確認されている。

#### (2) 小児

##### 1) アレルギー性鼻炎

i) 二重盲検比較試験(投与期間2週間、解析対象122例)<sup>2)</sup>

国内28施設で通年性アレルギー性鼻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[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)の変化量を下表に示した。その結果から、プラセボに対する本薬の優越性が検証された。なお、小児の通年性アレルギー性鼻炎に対するケトチフェンマル酸塩を対照とする二重盲検比較試験では、有効性について非劣性は示されなかった。

全治療評価期間における総合鼻症状スコア<sup>a)</sup>の変化量

| 群            | 例数  | ベースライン<br>評価期間 | 全治療<br>評価期間    | 変化量 <sup>b)</sup> |                                 |
|--------------|-----|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|
|              |     | 平均値<br>(標準偏差)  | 平均値<br>(標準偏差)  | 平均値<br>(標準偏差)     | 調整済み平均値 <sup>c)</sup><br>(標準誤差) |
| セチリジン<br>塩酸塩 | 122 | 6.66<br>(1.26) | 4.79<br>(1.96) | 1.87<br>(1.79)    | 1.85<br>(0.18)                  |
| プラセボ         | 117 | 6.84<br>(1.52) | 5.51<br>(2.04) | 1.33<br>(1.79)    | 1.25<br>(0.18)                  |

| セチリジン塩酸塩<br>vs プラセボ | 点推定値 <sup>a)</sup> | 95%信頼区間 <sup>a)</sup> | p値         |
|---------------------|--------------------|-----------------------|------------|
|                     | 0.60               | [0.15 ~ 1.05]         | p = 0.0087 |

a) 総合鼻症状スコアが10を超える患児は組入れから除外

b) 変化量 = (ベースライン評価期間 - 治療投与開始日の前3日間) - 全治療評価期間

c) 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

##### ii) 一般臨床試験(投与期間12週間、解析対象36例)<sup>3)</sup>

国内19施設で通年性アレルギー性鼻炎を対象に実施され、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)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。

#### 2) 蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒

i) 二重盲検比較試験(投与期間2週間、解析対象134例)<sup>4)</sup>

国内29施設でアトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験において、セチリジン塩酸塩ドライシロップ[3歳以上7歳未満：1回0.2g セチリジン塩酸塩として2.5mg)を1日2回、7歳以上15歳未満：1回0.4g セチリジン塩酸塩として5mg)を1日2回]あるいはケトチフェンマル酸塩ドライシロップ[3歳以上7歳未満：1回0.6g ケトチフェンとして0.6mg)を1日2回、7歳以上15歳未満：1回1g ケトチフェンとして1mg)を1日2回]2週間投与した。そう痒の重症度の変化量を下表に示した。その結果から、ケトチフェンマル酸塩に対する本薬の非劣性が検証された。

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 <sup>a)</sup> | ベースライン<br>評価期間     | 全治療<br>評価期間           | 変化量 <sup>b)</sup> |                                 |
|--------------------------------|------------------|--------------------|-----------------------|-------------------|---------------------------------|
|                                |                  | 平均値<br>(標準偏差)      | 平均値<br>(標準偏差)         | 平均値<br>(標準偏差)     | 調整済み平均値 <sup>c)</sup><br>(標準誤差) |
| セチリジン<br>塩酸塩                   | 134              | 2.41<br>(0.52)     | 1.96<br>(0.64)        | 0.45<br>(0.67)    | 0.43<br>(0.05)                  |
| ケトチフェン<br>フマル酸塩                | 126              | 2.40<br>(0.52)     | 1.88<br>(0.63)        | 0.52<br>(0.62)    | 0.51<br>(0.05)                  |
| セチリジン塩酸塩<br>vs ケトチフェン<br>フマル酸塩 |                  | 点推定値 <sup>c)</sup> | 95%信頼区間 <sup>c)</sup> |                   |                                 |
|                                |                  | -0.08              | [-0.22 ~ 0.06]        |                   |                                 |

a) 変化量が算出可能な被験者数  
b) 変化量 = (ベースライン評価期間 治療投与開始日の前3日間) - 全治療評価期間  
c) 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

ii) 一般臨床試験 (投与期間12週間、解析対象73例)<sup>9)</sup>  
国内25施設で蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症を対象に実施され、そう痒の重症度の治療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。

2. 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<sup>13-16)</sup>。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<sup>12)</sup>。

【薬効薬理】

1. ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗作用

ヒスタミンH<sub>1</sub>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<sub>2</sub>、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く(ラット、モルモット)<sup>7)</sup>、中枢神経系におけるヒスタミンH<sub>1</sub>受容体への影響が少ない(ラット)<sup>8)</sup>。摘出臓器(ヒト気管支平滑筋)のヒスタミン反応を濃度依存的に抑制した<sup>19)</sup>。また、ヒスタミン誘発皮膚反応及びヒスタミン誘発鼻症状を抑制し、その作用は速効的かつ持続的であった(ヒト)<sup>20)21)</sup>。

2. 好酸球に対する作用

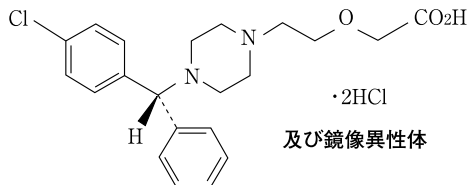
好酸球に対し *in vitro* 及び *in vivo* において遊走抑制を示し、好酸球活性化の指標であるスーパーオキシド産生を抑制した(ヒト)<sup>22)23)</sup>。

3. メディエーター遊離抑制作用

ヒト肺切片からのロイコトリエン及びプロスタグランジンD<sub>2</sub>遊離を抑制した<sup>24)</sup>。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: セチリジン塩酸塩 (Cetirizine Hydrochloride)  
化学名: 2-(2-{4-[(RS)-(4-Chlorophenyl)phenylmethyl]piperazin-1-yl}ethoxy)acetic acid dihydrochloride  
構造式:



分子式: C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>3</sub> · 2HCl  
分子量: 461.81  
融点: 204 ~ 210 (分解)  
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。0.1mol/L塩酸試液に溶ける。水溶液(1/10)は旋光性を示さない。  
分配係数: 24.3 (pH7、水-オクタノール系)

【包装】

ジルテック錠5: PTP100錠(10錠×10)、PTP500錠(10錠×50)  
ジルテック錠10: PTP100錠(10錠×10)、PTP280錠(14錠×20)、PTP500錠(10錠×50)、PTP1000錠(10錠×100)、500錠(瓶)

【主要文献】

- 1) 笹 征史ほか: 臨床薬理 26, 50(1995)
- 2) 社内資料: ドライシロップ剤及び錠剤の生物学的同等性試験
- 3) 社内資料: Retrospective population pharmacokinetic analysis of cetirizine in Japanese children
- 4) 水野佳子ほか: 基礎と臨床 28, 195(1994)
- 5) Matzke, G. R., et al.: *Ann. Allergy* 59, 25(1987)
- 6) Awini, W. M., et al.: *Eur. J. Clin. Pharmacol.* 38, 67(1990)
- 7) Simons, F. E. R., et al.: *J. Clin. Pharmacol.* 33, 94(1993)
- 8) 奥田 稔ほか: 耳鼻咽喉科展望 37, 75(1994)
- 9) 吉田彦太郎ほか: 基礎と臨床 28, 210(1994)
- 10) 吉田彦太郎ほか: 基礎と臨床 28, 214(1994)
- 11) 吉田彦太郎ほか: 基礎と臨床 28, 216(1994)
- 12) 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(2007)
- 13) 社内資料: 小児アレルギー性鼻炎を対象とした長期投与試験
- 14) 社内資料: 小児アトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験
- 15) 社内資料: 小児各種皮膚疾患を対象とした長期投与試験
- 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(2005)
- 17) 内田昌子ほか: 基礎と臨床 28, 179(1994)
- 18) Snyder, S. H., et al.: *Ann. Allergy* 59, 4(1987)
- 19) Advenier, C., et al.: *J. Allergy Clin. Immunol.* 88, 104(1991)
- 20) Simons, F. E. R., et al.: *J. Allergy Clin. Immunol.* 86, 540(1990)
- 21) Braunstein, G., et al.: *Br. J. Clin. Pharmacol.* 33, 445(1992)
- 22) Okada, C., et al.: *Int. Arch. Allergy Immunol.* 103, 384(1994)
- 23) Fadel, R., et al.: *Clin. Allergy* 17, 373(1987)
- 24) Fabre, J. M., et al.: *Allergy* 50, 362(1995)

【資料請求先】

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。  
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  
カスタマー・ケア・センター  
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)

製造販売元  ユーシービー・ジャパン株式会社  
東京都千代田区神田駿河台2丁目2番地

 GlaxoSmithKline

販売元 **グラクソ・スミスクライン株式会社**  
東京都渋谷区千駄ヶ谷4-6-15  
<http://www.glaxosmithkline.co.jp>