

持続性選択H₁受容体拮抗・
アレルギー性疾患治療剤

	錠5	錠10
承認番号	21000AMY00144000	21000AMY00145000
薬価収載	1998年8月	
販売開始	1998年9月	
国際誕生	1986年11月	

指定医薬品
要指示医薬品^{注)}

ジルテック錠5
ジルテック錠10

Zyrtec®

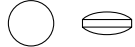
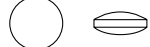
塩酸セチリジン錠

貯 法：室温保存
使用期限：3年(組箱，ラベルに記載)

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 (1錠中)	塩酸セチリジン 5mg	塩酸セチリジン 10mg
添 加 物	乳糖，結晶セルロース，軽質無水ケイ酸，ステアリン酸マグネシウム，ヒドロキシプロピルメチルセルロース2910，酸化チタン，マクロゴール400	乳糖，結晶セルロース，軽質無水ケイ酸，ステアリン酸マグネシウム，ヒドロキシプロピルメチルセルロース2910，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	622 	623 
直 径	約6mm	約7mm
厚 さ	約3mm	約3mm
重 量	約88mg	約119mg
識別コード	622	623

効能・効果

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹，湿疹・皮膚炎，痒疹，皮膚痒症

用法・用量

通常，成人には塩酸セチリジンとして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。

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）〕

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. 副作用

承認時までの調査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%(17/1,182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。
市販後の使用成績調査4,850例中164例(3.4%)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117件(2.4%)，倦怠感8件(0.2%)，頭痛感5件(0.1%)，口渇5件(0.1%)等であった。（2002年7月安全性定期報告時）

(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※）

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※）

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，減量，投与中止等の適切な処置を行うこと。

	副作用発現頻度		
	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	不眠，振戦，抑うつ
※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，痒痒感，血管浮腫	多形紅斑

注）注意—医師等の処方せん・指示により使用すること。



	副作用発現頻度		
	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明※
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	ALP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、ぼてり、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

※市販後の自発報告等又は外国での報告のため頻度不明。

4. 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。

5. 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。〕

6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

7. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、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。

8. 適用上の注意

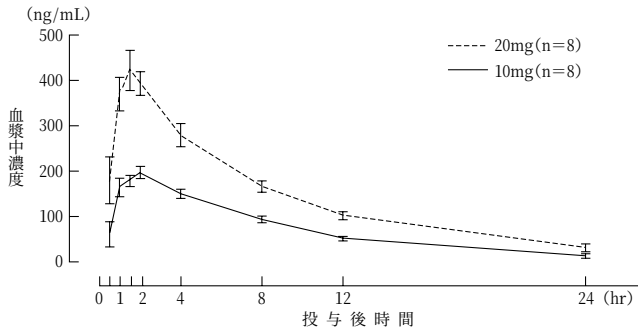
薬剤交付時
PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。
(PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。)

薬物動態

1. 血中濃度

- (1)血漿中濃度の推移
健康成人に塩酸セチリジン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(Cmax)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 Cmax 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¹⁾。

塩酸セチリジン単回投与時の血漿中濃度の推移



塩酸セチリジン単回投与時の薬物動態パラメーター

投与量	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (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)

(2)血漿蛋白結合率

¹⁴C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)²⁾。

2. 代謝・排泄

健康成人に塩酸セチリジン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、血漿中に酸化的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50%、7日目は約70%であった¹⁾。

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(クレアチニンクリアランス：7-60mL/min)に塩酸セチリジン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³⁾。

腎障害患者における塩酸セチリジンの薬物動態パラメーター

クレアチニンクリアランス (mL/min)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (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(クレアチニンクリアランス：≤7mL/min, n=5)に塩酸セチリジン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⁴⁾。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5mg)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塩酸セチリジン10mgを単回経口投与した場合、肝機能正常成人³⁾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⁵⁾。これらの成績から、高度の肝障害患者では、低用量(例えば5mg)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塩酸セチリジンの薬物動態パラメーター

投 与 量 (被験者, 例数)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (mg・hr/L)
10mg (肝機能正常成人, n=14)	1.0±0.5	384±103	7.4±1.6	3.3±0.9
10mg (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、クレアチニンクリアランス：平均53mL/min)に塩酸セチリジン10mgを単回経口投与した場合、成人(年齢：平均53歳、クレアチニンクリアランス：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ーの変化は、腎機能の低下によるものと考えられた³⁾。

高齢者における塩酸セチリジンの薬物動態パラメーター

投 与 量 (被験者, 例数)	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T _{1/2} (hr)	AUC (mg・hr/L)
10mg (成 人, n=14)	1.0±0.5	384±103	7.4±1.6	3.3±0.9
10mg (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

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、皮膚掻痒症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⁶⁻⁹⁾。

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)
皮膚掻痒症	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. 使用成績調査

市販後の使用成績調査4,850例における臨床検査値異常を含む副作用発現頻度は、成人(15歳～64歳)で3.7%(131/3,505例)、高齢者(65歳以上)で2.6%(31/1,206例)、小児等(3歳～14歳)で1.4%(2/139例)であった(2002年7月安全性定期報告時)。

薬効薬理

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H₂、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)¹⁰⁾、中枢神経系におけるヒスタミンH₁受容体への影響が少ない(ラット)¹¹⁾。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¹²⁾。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)¹³⁾¹⁴⁾。

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)¹⁵⁾¹⁶⁾。

3. メディエーター遊離抑制作用

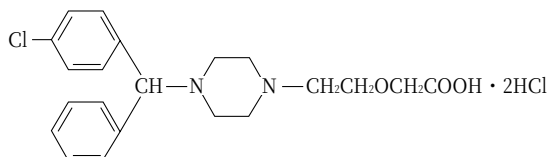
ヒト肺切片からのロイコトリエン及びプロスタグランジンD₂遊離を抑制した¹⁷⁾。

有効成分に関する理化学的知見

一般名：塩酸セチリジン(cetirizine hydrochloride)

化学名：(±)-2-[4-[(4-chlorophenyl)phenylmethyl]-1-piperazinyl]ethoxyacetic acid dihydrochloride

構造式



分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃・2HCl

分子量：461.82

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、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくく、アセトニトリル又はアセトンに極めて溶けにくく、エーテルにほとんど溶けない。水溶液(1→10)は旋光性を示さない。

分配係数：24.3(pH 7、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

主要文献

- 1) 笹 征史ほか：臨床薬理 **26**, 509(1995)
- 2) 水野佳子ほか：基礎と臨床 **28**, 1951(1994)
- 3) Matzke, G. R., *et al.* : *Ann. Allergy* **59**, 25(1987)
- 4) Awni, W. M., *et al.* : *Eur. J. Clin. Pharmacol.* **38**, 67(1990)
- 5) Simons, F. E. R., *et al.* : *J. Clin. Pharmacol.* **33**, 949(1993)
- 6) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望 **37**, 754(1994)
- 7) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 **28**, 2107(1994)
- 8) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 **28**, 2147(1994)
- 9) 吉田彦太郎ほか：基礎と臨床 **28**, 2163(1994)
- 10) 内田昌子ほか：基礎と臨床 **28**, 1795(1994)
- 11) Snyder, S. H., *et al.* : *Ann. Allergy* **59**, 4(1987)
- 12) Advenier, C., *et al.* : *J. Allergy Clin. Immunol.* **88**, 104(1991)
- 13) Simons, F. E. R., *et al.* : *J. Allergy Clin. Immunol.* **86**, 540(1990)
- 14) Braunstein, G., *et al.* : *Br. J. Clin. Pharmacol.* **33**, 445(1992)
- 15) Okada, C., *et al.* : *Int. Arch. Allergy Immunol.* **103**, 384(1994)
- 16) Fadel, R., *et al.* : *Clin. Allergy* **17**, 373(1987)
- 17) Fabre, J. M., *et al.* : *Allergy* **50**, 362(1995)

製品に関するお問い合わせ先

住友製薬株式会社 くすり情報センター

TEL 0120-03-4389

文献請求先

住友製薬株式会社 医薬情報部

大阪市中央区道修町2丁目2番8号 (〒541-8510)

発売元

住友製薬株式会社
大阪市中央区道修町2丁目2番8号

製造元

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

