2025 年 4 月改訂（第 11 版）

日本標準商品分類番号：87449

# 医 薬 品 イ ン タ ビ ュ ー フ ォ ー ム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

## 持続性選択 $H_1$ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

### ロラタジン錠、ロラタジン口腔内崩壊錠、ロラタジンドライシロップ

# ロラタジン錠 10mg「日医工」
# ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」
# ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」

## Loratadine Tablets, OD Tablets, Dry Syrup

| | | | |
|---|---|---|---|
| **剤形** | 錠 10mg：素錠<br>OD 錠 10mg：素錠（口腔内崩壊錠）<br>ドライシロップ 1%：ドライシロップ | | |
| **製剤の規制区分** | なし | | |
| **規格・含量** | 錠 10mg、OD 錠 10mg：1 錠中ロラタジン 10mg 含有<br>ドライシロップ 1%　：1g 中ロラタジン 10mg 含有 | | |
| **一般名** | 和　名：ロラタジン<br>洋　名：Loratadine | | |
| **製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・販売開始年月日** | | 錠 10mg/OD 錠 10mg | ドライシロップ 1% |
| | 製造販売承認 | 2011 年　7 月 15 日 | 2013 年 2 月 15 日 |
| | 薬価基準収載 | 2011 年 11 月 28 日 | 2013 年 6 月 21 日 |
| | 販 売 開 始 | 2011 年 11 月 28 日 | 2013 年 6 月 21 日 |
| **開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名** | 製造販売元：日医工株式会社 | | |
| **医薬情報担当者の連絡先** | | | |
| **問い合わせ窓口** | 日医工株式会社　お客様サポートセンター<br>TEL：0120-517-215　　FAX：076-442-8948<br>医療関係者向けホームページ　https://www.nichiiko.co.jp/ | | |

**本 IF は 2023 年 12 月改訂（第 1 版）の添付文書の記載に基づき改訂した。**

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要　―日本病院薬剤師会―

（2020 年 4 月改訂）

## １．医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## ２．IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

## ３．IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「Ⅻ. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

## ４．利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目　　次


**Ⅰ．概要に関する項目……1**
1．開発の経緯……1
2．製品の治療学的特性……1
3．製品の製剤学的特性……1
4．適正使用に関して周知すべき特性……1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項……1
6．RMP の概要……1

**Ⅱ．名称に関する項目……2**
1．販売名……2
2．一般名……2
3．構造式又は示性式……2
4．分子式及び分子量……2
5．化学名（命名法）又は本質……2
6．慣用名、別名、略号、記号番号……2

**Ⅲ．有効成分に関する項目……3**
1．物理化学的性質……3
2．有効成分の各種条件下における安定性……3
3．有効成分の確認試験法、定量法……3

**Ⅳ．製剤に関する項目……4**
1．剤形……4
2．製剤の組成……5
3．添付溶解液の組成及び容量……5
4．力価……5
5．混入する可能性のある夾雑物……5
6．製剤の各種条件下における安定性……5
7．調製法及び溶解後の安定性……11
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）……11
9．溶出性……12
10．容器・包装……15
11．別途提供される資材類……15
12．その他……15

**Ⅴ．治療に関する項目……16**
1．効能又は効果……16
2．効能又は効果に関連する注意……16
3．用法及び用量……16
4．用法及び用量に関連する注意……16
5．臨床成績……16

**Ⅵ．薬効薬理に関する項目……21**
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群……21
2．薬理作用……21

**Ⅶ．薬物動態に関する項目……22**
1．血中濃度の推移……22
2．薬物速度論的パラメータ……26
3．母集団（ポピュレーション）解析……27
4．吸収……27
5．分布……27
6．代謝……27
7．排泄……28
8．トランスポーターに関する情報……28
9．透析等による除去率……28
10．特定の背景を有する患者……28
11．その他……30

**Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目……31**
1．警告内容とその理由……31
2．禁忌内容とその理由……31
3．効能又は効果に関連する注意とその理由……31
4．用法及び用量に関連する注意とその理由……31
5．重要な基本的注意とその理由……31
6．特定の背景を有する患者に関する注意……31
7．相互作用……33
8．副作用……34
9．臨床検査結果に及ぼす影響……35
10．過量投与……35
11．適用上の注意……36
12．その他の注意……36

**Ⅸ．非臨床試験に関する項目……37**
1．薬理試験……37
2．毒性試験……37

**Ⅹ．管理的事項に関する項目……38**
1．規制区分……38
2．有効期間……38
3．包装状態での貯法……38
4．取扱い上の注意点……38
5．患者向け資材……38

６．同一成分・同効薬 ..... 38
７．国際誕生年月日 ..... 38
８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 ..... 38
９．効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 ..... 38
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 ..... 39
11．再審査期間 ..... 39
12．投薬期間制限に関する情報 ..... 39
13．各種コード ..... 39
14．保険給付上の注意 ..... 39

**ＸⅠ．文献 ..... 40**

１．引用文献 ..... 40
２．その他の参考文献 ..... 41

**ＸⅡ．参考資料 ..... 42**

１．主な外国での発売状況 ..... 42
２．海外における臨床支援情報 ..... 43

**ＸⅢ．備考 ..... 44**

１．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 ..... 44
２．その他の関連資料 ..... 47

**略 語 表**

| 略語 | 略語内容 |
|---|---|
| AUC | 血中濃度-時間曲線下面積 |
| Cmax | 最高血中濃度 |
| Tmax | 最高血中濃度到達時間 |
| $t_{1/2}$ | 消失半減期 |
| S.D. | 標準偏差 |
| DCL | descarboethoxyloratadine |

# Ⅰ．概要に関する項目

## １．開発の経緯

本剤は、ロラタジンを有効成分とする持続性選択 $H_1$ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

「ロラタジン錠 10mg「日医工」」及び「ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2011 年 7 月 15 日に承認を取得、2011 年 11 月 28 日に販売を開始した。（薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき承認申請）

2012 年 1 月 30 日付で、「ロラタジン錠 10mg「日医工」」及び「ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」」は、「小児における用法及び用量」が追加された。

その後、「ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」」の開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2013 年 2 月 15 日に承認を取得、2013 年 6 月 21 日に販売を開始した。（薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき承認申請）

## ２．製品の治療学的特性

（１）本剤は、ロラタジンを有効成分とする持続性選択 $H_1$ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。
（２）重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、てんかん、痙攣、肝機能障害、黄疸が報告されている。（「Ⅷ．8.（1）重大な副作用と初期症状」の項参照）

## ３．製品の製剤学的特性

（１）OD 錠 10mg は、直径 8.0mm の製剤である。
（２）OD 錠 10mg は、香料としてメントールフレーバーを使用している。
（３）錠 10mg 及び OD 錠 10mg の PTP シートは、ピッチコントロールを行い、1 錠ごとに成分名、含量及び屋号を表示した。
（４）錠 10mg 及び OD 錠 10mg の PTP シートに、「抗アレルギー薬」と表記した。
（５）ドライシロップの分包に、「湿気を避けて保管してください」と表記した。

## ４．適正使用に関して周知すべき特性

| 適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等 | 有無 | タイトル、参照先 |
|---|---|---|
| RMP | 無 | |
| 追加のリスク最小化活動として作成されている資材 | 無 | |
| 最適使用推進ガイドライン | 無 | |
| 保険適用上の留意事項通知 | 無 | |

## ５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

### （１）承認条件

該当しない

### （２）流通・使用上の制限事項

該当しない

## ６．RMP の概要

該当しない

## Ⅱ．名称に関する項目

### １．販売名

#### （１）和名

ロラタジン錠 10mg「日医工」

ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」

ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」

#### （２）洋名

Loratadine Tablets

Loratadine OD Tablets

Loratadine Dry Syrup

#### （３）名称の由来

一般名より

### ２．一般名

#### （１）和名（命名法）

ロラタジン（JAN）

#### （２）洋名（命名法）

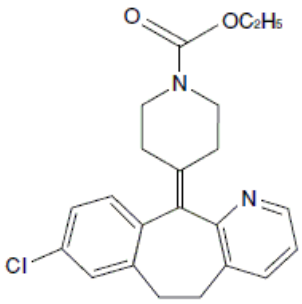
Loratadine（JAN、INN）

#### （３）ステム（stem）

三環系ヒスタミン $H_1$ 受容体拮抗薬：-tadine

### ３．構造式又は示性式

化学構造式：




### ４．分子式及び分子量

分子式：$C_{22}H_{23}ClN_2O_2$

分子量：382.88

### ５．化学名（命名法）又は本質

Ethyl 4-(8-chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo [5,6] cyclohepta [1,2-*b*] pyridin-11-ylidene)-1-piperidinecarboxylate（IUPAC）

### ６．慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

## Ⅲ．有効成分に関する項目

### １．物理化学的性質

#### （１）外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

#### （２）溶解性

メタノール、エタノール（99.5）又は酢酸（100）に溶けやすく、水にほとんど溶けない。

#### （３）吸湿性

該当資料なし

#### （４）融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：133～137℃

#### （５）酸塩基解離定数

該当資料なし

#### （６）分配係数

該当資料なし

#### （７）その他の主な示性値

該当資料なし

### ２．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

### ３．有効成分の確認試験法、定量法

（１）確認試験法

１）紫外可視吸光度測定法

本品のメタノール溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又は定量用ロラタジンのスペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

２）赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又は定量用ロラタジンのスペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

３）炎色反応試験

本品につき、炎色反応試験（2）を行うとき、緑色を呈する。

（２）定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸二水素カリウム、水、リン酸、アセトニトリル、メタノール混液

## Ⅳ．製剤に関する項目

### １．剤形

#### （１）剤形の区別

錠 10mg：素錠

OD 錠 10mg：素錠（口腔内崩壊錠）

ドライシロップ 1%：ドライシロップ

#### （２）製剤の外観及び性状

| 販売名 | | ロラタジン錠<br>10mg「日医工」 | ロラタジン OD 錠<br>10mg「日医工」 |
|---|---|---|---|
| 剤形 | | 割線入りの円形の素錠 | 円形の素錠（口腔内崩壊錠） |
| 色調 | | 白色 | |
| 外形 | 表面 | | |
| | 裏面 | | |
| | 側面 | | |
| 直径（mm） | | 6.5 | 8.0 |
| 厚さ（mm） | | 2.8 | 3.8 |
| 質量（mg） | | 100 | 180 |
| 本体コード | | 176<br>10 | 177<br>10 |
| 包装コード | | 176 | 177 |

| 販売名 | ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」 |
|---|---|
| 剤形・性状 | シロップ用剤（固形）<br>白色の粉末を含む粒子 |

#### （３）識別コード

（「Ⅳ．1．(2) 製剤の外観及び性状」の項参照）

#### （４）製剤の物性

（「Ⅳ．6．製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

#### （５）その他

該当資料なし

## 2．製剤の組成

### （1）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

| 販売名 | ロラタジン錠 10mg「日医工」 | ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」 |
|---|---|---|
| 有効成分 | 1 錠中　ロラタジン 10mg | |
| 添加剤 | 乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ステアリン酸マグネシウム | D-マンニトール、クロスポビドン、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、香料 |

| 販売名 | ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」 |
|---|---|
| 有効成分 | 1g 中　ロラタジン 10mg |
| 添加剤 | 白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素 |

### （2）電解質等の濃度

該当資料なし

### （3）熱量

該当資料なし

## 3．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

## 4．力価

該当しない

## 5．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

## 6．製剤の各種条件下における安定性[1)]

（1）加速試験

試験報告日：2014/10/27

◇ロラタジン錠 10mg「日医工」　加速試験　40℃・75%RH［最終包装形態（PTP 包装）］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット<br>番号 | 保存期間 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 1 ヵ月 | 3 ヵ月 | 6 ヵ月 |
| 性状　n=3<br>＜割線入りの白色の円形の素錠＞ | GK010<br>GK020<br>IK030 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 確認試験　n=3<br>（紫外可視吸光度測定法、定性反応、薄層クロマトグラフィー） | GK010<br>GK020<br>IK030 | 適合 | — | — | 適合 |
| 製剤均一性（%）<br>（含量均一性試験）n=3<br>＜15.0%以下＞ | GK010<br>GK020<br>IK030 | 適合 | — | — | 適合 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜45 分、80%以上＞ | GK010<br>GK020<br>IK030 | 100.2～101.9<br>100.2～101.8<br>99.7～100.8 | 98.6～102.0<br>99.3～104.1<br>98.7～104.3 | 100.3～103.6<br>100.7～102.3<br>99.2～101.5 | 100.2～102.7<br>100.4～103.3<br>100.0～100.8 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | GK010<br>GK020<br>IK030 | 100.6<br>101.3<br>99.8 | 100.9<br>101.5<br>100.2 | 100.4<br>101.1<br>99.6 | 100.5<br>100.7<br>100.2 |

※：表示量に対する含有率（%）　—：未実施

試験実施期間：2009/12/10～2011/3/24

◇ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」　加速試験　40℃・75%RH［最終包装形態（PTP 包装）］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット<br>番号 | 保存期間 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 1 ヵ月 | 3 ヵ月 | 6 ヵ月 |
| 性状　n=3<br>＜白色の円形の素錠＞ | LOR10OD-1<br>LOR10OD-2<br>LOR10OD-3 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 確認試験　n=3<br>（紫外可視吸光度測定法、定性反応、薄層クロマトグラフィー） | LOR10OD-1<br>LOR10OD-2<br>LOR10OD-3 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 製剤均一性（%）<br>（含量均一性試験）n=3<br>＜15.0%以下＞ | LOR10OD-1<br>LOR10OD-2<br>LOR10OD-3 | 3.36～4.32<br>5.04～7.20<br>6.48～7.44 | — | — | 4.08～5.52<br>3.36～6.34<br>3.12～7.54 |
| 崩壊性（秒）　n=18<br>＜60 秒以内＞ | LOR10OD-1<br>LOR10OD-2<br>LOR10OD-3 | 15～19<br>16～20<br>15～20 | 13～19<br>13～18<br>14～19 | 13～18<br>13～16<br>13～18 | 15～20<br>13～18<br>14～18 |
| 溶出性（%）　n=18<br>＜6 分、85%以上＞ | LOR10OD-1<br>LOR10OD-2<br>LOR10OD-3 | 95.9～103.4<br>95.0～103.5<br>97.3～103.7 | 95.3～101.4<br>96.3～104.3<br>96.6～104.6 | 96.2～103.1<br>95.5～104.1<br>95.6～104.3 | 96.3～102.2<br>96.3～104.1<br>96.7～104.7 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | LOR10OD-1<br>LOR10OD-2<br>LOR10OD-3 | 100.5～101.3<br>101.7～103.3<br>98.8～101.0 | 100.2～101.6<br>101.3～101.7<br>101.5～101.8 | 102.5～102.8<br>103.2～104.5<br>101.9～103.3 | 99.8～100.6<br>101.7～102.9<br>101.6～102.6 |

※：表示量に対する含有率（%）　—：未実施

試験報告日：2013/11/21

◇ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」　加速試験　40℃・75%RH［最終包装形態（分包包装）］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット<br>番号 | 保存期間 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 1 ヵ月 | 3 ヵ月 | 6 ヵ月 |
| 性状　n=3<br>＜白色の粉末を含む粒子＞ | JI1001<br>JI1801<br>JI1901 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 確認試験　n=3<br>（紫外可視吸光度測定法） | JI1001<br>JI1801<br>JI1901 | 適合 | — | — | 適合 |
| 製剤均一性（%）<br>（含量均一性試験）n=3<br>＜15.0%以下＞ | JI1001<br>JI1801<br>JI1901 | 1.8<br>4.1<br>2.5 | — | — | 3.2<br>3.0<br>1.3 |
| 溶出性（%）　n=6<br>＜15 分、80%以上＞ | JI1001<br>JI1801<br>JI1901 | 96.3～97.5<br>96.4～97.2<br>95.8～98.1 | 96.1～97.0<br>96.2～97.5<br>95.4～97.7 | 96.2～97.2<br>95.8～97.4<br>96.3～99.0 | 93.9～95.4<br>94.3～94.9<br>93.3～94.6 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | JI1001<br>JI1801<br>JI1901 | 98.4<br>98.8<br>98.8 | 99.2<br>99.4<br>98.2 | 98.3<br>98.4<br>99.0 | 98.5<br>99.0<br>98.4 |

※：表示量に対する含有率（%）　—：未実施

（2）PTP 包装の安定性

試験実施期間：2011/7/8～2011/10/26

◇ロラタジン錠 10mg「日医工」　PTP 包装　40℃　［遮光］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状 n=10<br>＜割線入りの白色の円形の素錠＞ | EN110 | 割線入りの白色の円形の素錠 | 割線入りの白色の円形の素錠 | 割線入りの白色の円形の素錠 | 割線入りの白色の円形の素錠 | 割線入りの白色の円形の素錠 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜45 分、80%以上＞ | EN110 | 100.7～102.7 | 100.2～103.2 | 98.1～103.4 | 98.9～102.6 | 99.9～102.2 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | EN110 | 99.1～100.0 | 97.6～99.8 | 99.1～99.5 | 97.3～98.4 | 99.0～102.3 |
| （参考値）<br>硬度（N）　n=10 | EN110 | 48～60 | 53～63 | 53～60 | 51～61 | 51～59 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン錠 10mg「日医工」　PTP 包装　25℃・75%RH　［遮光］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状 n=10<br>＜白色の円形の素錠＞ | EN110 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜45 分、80%以上＞ | EN110 | 100.7～102.7 | 99.2～102.2 | 97.4～102.0 | 99.9～101.9 | 101.5～103.1 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | EN110 | 99.1～100.0 | 98.3～100.5 | 99.4～100.1 | 98.3～99.3 | 100.5～102.6 |
| （参考値）<br>硬度（N）　n=10 | EN110 | 48～60 | 43～50 | 47～54 | 48～60 | 44～55 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン錠 10mg「日医工」　PTP 包装　室温・曝光［D65 光源（1600Lx）・シャーレをラップで覆う］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 総曝光量 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 40 万 Lx･hr | 80 万 Lx･hr | 120 万 Lx･hr |
| 性状 n=10<br>＜白色の円形の素錠＞ | EN110 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜45 分、80%以上＞ | EN110 | 100.7～102.7 | 100.8～101.5 | 101.8～103.5 | 99.5～102.1 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | EN110 | 99.1～100.0 | 99.4～100.9 | 99.0～99.5 | 100.4～101.6 |
| （参考値）<br>硬度（N）　n=10 | EN110 | 48～60 | 44～57 | 46～58 | 50～56 |

※：表示量に対する含有率（%）

試験実施期間：2011/7/8～2011/10/26

◇ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」　PTP 包装　40℃　［遮光］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状 n=10<br>＜白色の円形の素錠＞ | DN070 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 |
| 崩壊性（秒） n=6<br>＜60 秒以内に崩壊する＞ | DN070 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜6 分、85%以上＞ | DN070 | 100.4～101.7 | 98.5～101.4 | 99.9～103.2 | 99.5～107.2 | 99.3～103.0 |
| 含量（%）※2n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | DN070 | 99.9～101.5 | 99.0～100.4 | 101.1～102.1 | 99.4～100.0 | 100.3～100.9 |
| （参考値）<br>硬度（N） n=10 | DN070 | 45～53 | 54～63 | 53～65 | 58～68 | 60～72 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」　PTP 包装　25℃・75%RH　［遮光・開放］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状 n=10<br>＜白色の円形の素錠＞ | DN070 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 |
| 崩壊性（秒） n=6<br>＜60 秒以内に崩壊する＞ | DN070 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜6 分、85%以上＞ | DN070 | 100.4～101.7 | 97.5～100.8 | 98.6～101.6 | 101.5～103.8 | 98.7～102.0 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | DN070 | 99.9～101.5 | 100.2～101.4 | 101.6～102.0 | 100.8～993.0 | 99.2～101.1 |
| （参考値）<br>硬度（N） n=10 | DN070 | 45～53 | 46～54 | 38～52 | 45～54 | 42～54 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」　PTP 包装　室温・曝光[ポリエチレン製気密袋]

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 総曝光量 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 40 万 Lx･hr | 80 万 Lx･hr | 120 万 Lx･hr |
| 性状 n=10<br>＜白色の円形の素錠＞ | DN070 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 | 白色の円形の素錠 |
| 崩壊性（秒） n=6<br>＜60 秒以内に崩壊する＞ | DN070 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜6 分、85%以上＞ | DN070 | 100.4～101.7 | 97.4～101.5 | 99.1～101.1 | 99.5～103.8 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | DN070 | 99.9～101.5 | 102.1～102.3 | 99.8～103.7 | 100.5～101.7 |
| （参考値）<br>硬度（N） n=10 | DN070 | 45～53 | 43～57 | 50～55 | 48～57 |

※：表示量に対する含有率（%）

（3）無包装状態の安定性

試験実施期間：2011/7/8～2011/10/26

◇ロラタジン錠 10mg「日医工」　無包装　40℃　［遮光･気密容器］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10<br>＜白色の割線入りの素錠＞ | EN110 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜45 分、80%以上＞ | EN110 | 100.7～102.7 | 98.8～102.1 | 102.5～103.9 | 100.1～103.8 | 99.6～102.2 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | EN110 | 99.1～100.0 | 100.2～101.3 | 99.7～100.2 | 100.1～101.2 | 98.7～101.3 |
| （参考値）<br>硬度（N）n=10 | EN110 | 48～60 | 58～67 | 53～63 | 61～65 | 59～66 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン錠 10mg「日医工」　無包装　25℃・75%RH　［遮光・開放］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10<br>＜白色の割線入りの素錠＞ | EN110 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜45 分、80%以上＞ | EN110 | 100.7～102.7 | 100.5～102.5 | 98.7～100.4 | 99.1～102.1 | 99.6～101.6 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | EN110 | 99.1～100.0 | 101.7～101.9 | 99.7～100.1 | 99.8～100.4 | 99.0～100.4 |
| （参考値）<br>硬度（N）n=10 | EN110 | 48～60 | 49～58 | 44～56 | 43～57 | 51～63 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン錠 10mg「日医工」　無包装　室温・曝光［D65 光源（約 1,600Lx）・気密容器］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 総曝光量 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 40 万 Lx･hr | 80 万 Lx･hr | 120 万 Lx･hr |
| 性状　n=10<br>＜白色の割線入りの素錠＞ | EN110 | 割線入りの白色円形の素錠 | 割線入りの白色円形の素錠 | わずかに灰黄色味を帯びる | 灰黄色味を帯びる |
| 溶出性（%）n=6<br>＜45 分、80%以上＞ | EN110 | 100.7～102.7 | 99.8～104.2 | 99.5～102.1 | 100.5～102.8 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | EN110 | 99.1～100.0 | 101.6～102.2 | 99.9～100.7 | 98.6～99.1 |
| （参考値）<br>硬度（N）n=10 | EN110 | 48～60 | 48～60 | 47～55 | 49～58 |

※：表示量に対する含有率（%）

試験実施期間：2011/7/8～2011/10/26

◇ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」　無包装　40℃　［遮光･気密容器］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10<br>＜白色の素錠（口腔内崩壊錠）＞ | DN070 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 |
| 崩壊性　n=6<br>＜60 秒以内＞ | DN070 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜6 分、85%以上＞ | DN070 | 100.4～101.7 | 98.5～100.8 | 98.5～100.8 | 98.9～101.9 | 98.3～101.7 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | DN070 | 99.9～101.5 | 100.1～101.1 | 102.3～104.4 | 101.0～101.6 | 100.6～101.7 |
| （参考値）<br>硬度（N）n=10 | DN070 | 45～53 | 56～64 | 55～61 | 58～66 | 59～70 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」　無包装　25℃・75%RH　［遮光・開放］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10<br>＜白色の素錠（口腔内崩壊錠）＞ | DN070 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 |
| 崩壊性　n=6<br>＜60 秒以内＞ | DN070 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜6 分、85%以上＞ | DN070 | 100.4～101.7 | 97.1～99.1 | 99.5～104.1 | 97.2～101.6 | 98.7～101.7 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | DN070 | 99.9～101.5 | 100.9～101.1 | 102.2～103.6 | 101.6～103.4 | 101.0～101.9 |
| （参考値）<br>硬度（N）n=10 | DN070 | 45～53 | 22～26 | 24～27 | 29～34 | 33～39 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」　無包装　室温・曝光［D65 光源（約 1,600Lx）・気密容器］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 総曝光量 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 40 万 Lx･hr | 80 万 Lx･hr | 120 万 Lx･hr |
| 性状　n=10<br>＜白色の素錠（口腔内崩壊錠）＞ | DN070 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | 白色円形の素錠 | わずかに灰黄色がかる |
| 崩壊性　n=6<br>＜60 秒以内＞ | DN070 | 適合 | 適合 | 適合 | 適合 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜6 分、85%以上＞ | DN070 | 100.4～101.7 | 98.9～101.9 | 97.5～101.6 | 97.5～100.9 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | DN070 | 99.9～101.5 | 102.0～103.4 | 101.6～102.8 | 101.7～101.8 |
| （参考値）<br>硬度（N）n=10 | DN070 | 45～53 | 42～51 | 48～55 | 49～54 |

※：表示量に対する含有率（%）

試験実施期間：2013/2/28～2013/6/19

◇ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」　無包装　40℃　［遮光･気密容器］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10<br>＜白色の粉末を含む粒子＞ | JI100 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜15 分、80%以上＞ | JI100 | 99.1～100.5 | 99.2～99.6 | 98.4～99.3 | 98.0～99.1 | 98.3～99.2 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | JI100 | 99.8～100.0 | 100.1～100.7 | 99.9～100.1 | 99.1～99.6 | 98.6～99.8 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」　無包装　25℃・75%RH　［遮光・開放］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10<br>＜白色の粉末を含む粒子＞ | JI100 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜15 分、80%以上＞ | JI100 | 99.1～100.5 | 98.9～99.6 | 97.5～98.9 | 98.4～100.0 | 96.9～98.4 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | JI100 | 99.8～100.0 | 101.1～101.7 | 100.0～101.1 | 99.1～99.9 | 99.7～101.7 |

※：表示量に対する含有率（%）

◇ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」無包装　室温・曝光［D65 光源（約 1,600Lx）・気密容器］

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 総曝光量 | | | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 40 万 Lx･hr | 80 万 Lx･hr | 120 万 Lx･hr |
| 性状　n=10<br>＜白色の粉末を含む粒子＞ | JI100 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 | 白色の粉末を含む粒子 |
| 溶出性（%）n=6<br>＜15 分、80%以上＞ | JI100 | 99.1～100.5 | 99.9～100.9 | 98.8～100.3 | 98.3～99.5 |
| 含量（%）※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | JI100 | 99.8～100.0 | 98.1～98.6 | 98.3～99.2 | 97.8～99.2 |

※：表示量に対する含有率（%）

## ７．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## ８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

## ９．溶出性[2)]

溶出試験

＜ロラタジン錠 10mg「日医工」＞

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方　溶出試験法　パドル法

回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH3.0、pH6.8、水）、100rpm（pH1.2）

［判定］

・pH1.2（50rpm）の条件では、15 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲になかった。

・pH3.0（50rpm）の条件では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

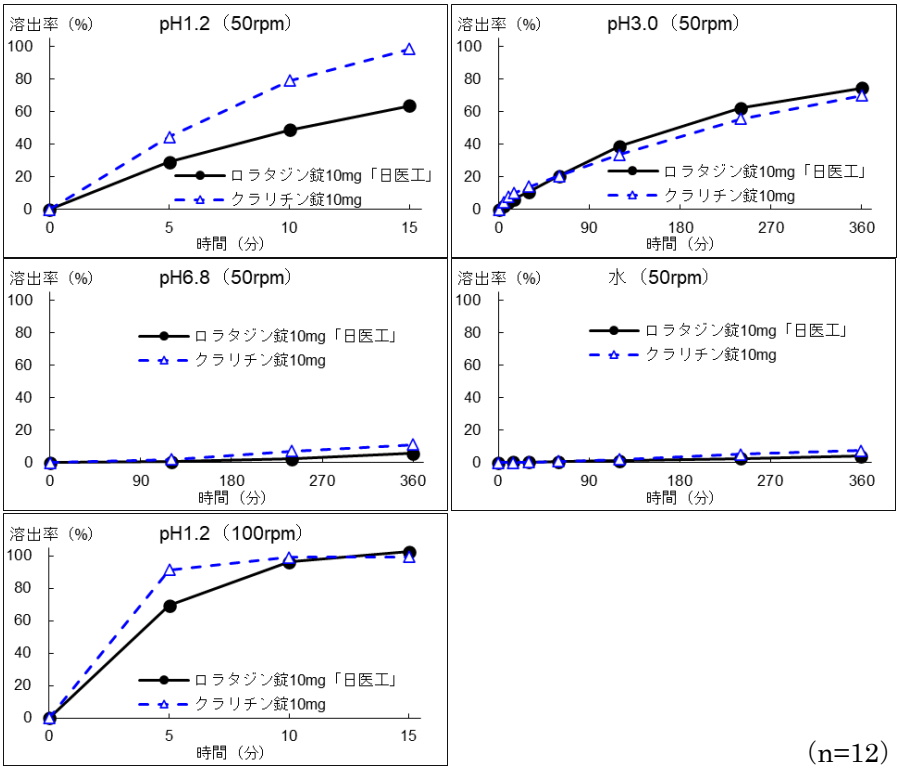
・pH6.8（50rpm）の条件では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

・水（50rpm）の条件では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

・pH1.2（100rpm）の条件では、標準製剤および本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（クラリチン錠 10mg）と比較した結果、pH1.2（50rpm）を除く全ての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

（溶出曲線）




（n=12）

＜ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方　溶出試験法　パドル法

回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、100rpm（pH4.0）

［判定］

・pH1.2（50rpm）の条件では、標準製剤および本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

・pH4.0（50rpm）の条件では、標準製剤および本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

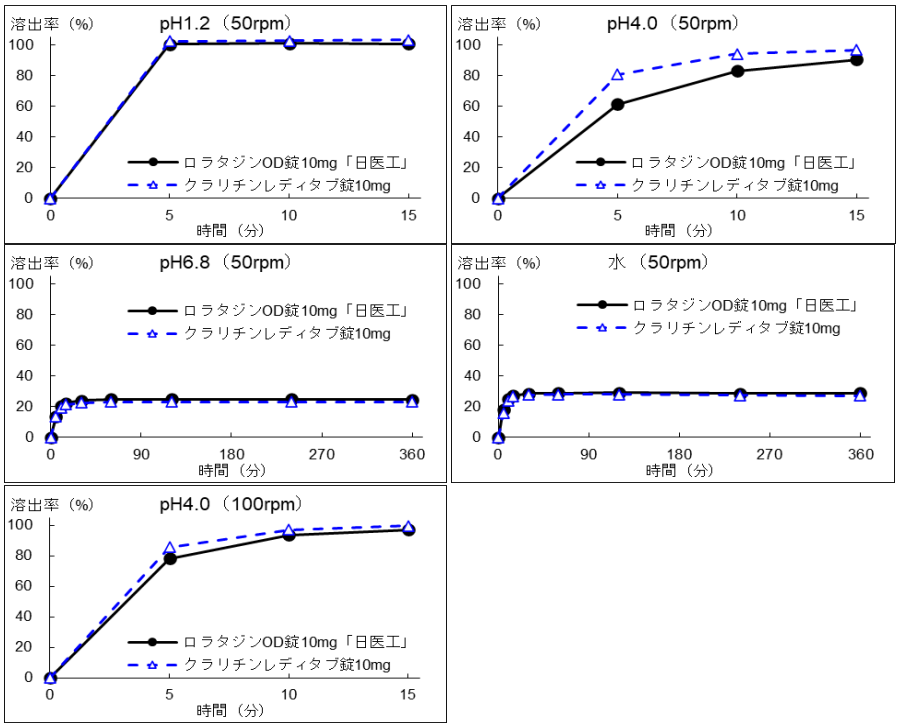
・pH6.8（50rpm）の条件では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

・水（50rpm）の条件では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

・pH4.0（100rpm）の条件では、標準製剤および本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（クラリチンレディタブ錠 10mg）と比較した結果、全ての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

（溶出曲線）




（n=12）

＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日　薬食審発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方　溶出試験法　パドル法

回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、100rpm（pH4.0）

［判定］

・pH1.2（50rpm）の条件では、標準製剤および本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

・pH4.0（50rpm）の条件では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

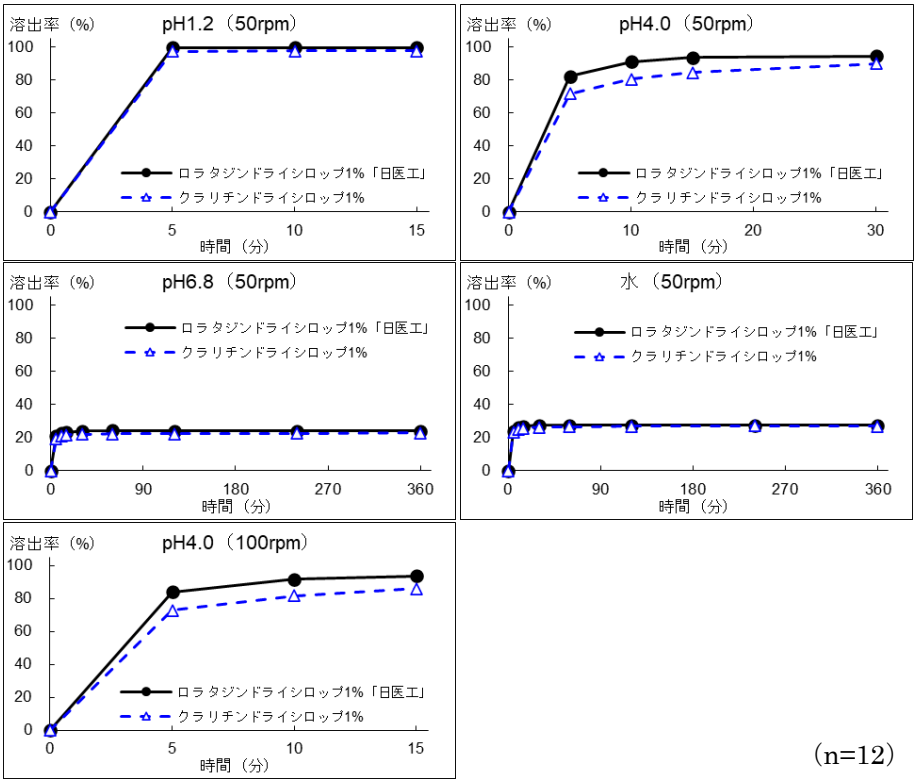
・pH6.8（50rpm）の条件では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

・水（50rpm）の条件では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

・pH4.0（100rpm）の条件では、標準製剤および本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（クラリチンドライシロップ 1%）と比較した結果、全ての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

（溶出曲線）




（n=12）

## 10. 容器・包装

### （1）注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

### （2）包装

**〈ロラタジン錠 10mg「日医工」〉**

100 錠［10 錠×10；PTP］

**〈ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」〉**

100 錠［10 錠×10；PTP］

**〈ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」〉**

0.5g×150 包

### （3）予備容量

該当しない

### （4）容器の材質

| PTP 包装 | 分包包装 |
|---|---|
| ＜錠/OD 錠共通＞<br>PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔<br>＜OD 錠のみ＞<br>ピロー：ポリエチレンテレフタレート・アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム | ＜ドライシロップ＞<br>分包：セロファン・アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム |

## 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

## 12. その他

該当記載事項なし

## Ⅴ．治療に関する項目

### １．効能又は効果

〇アレルギー性鼻炎

〇蕁麻疹

〇皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

### ２．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### ３．用法及び用量

#### （１）用法及び用量の解説

＜ロラタジン錠 10mg「日医工」/ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞

成人：通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。

小児：通常、7 歳以上の小児にはロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。

＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞

成人：通常、ロラタジンとして 1 回 10mg（ドライシロップとして 1g）を 1 日 1 回、食後に用時溶解して経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。

小児：通常、3 歳以上 7 歳未満の小児にはロラタジンとして 1 回 5mg（ドライシロップとして 0.5g）、7 歳以上の小児にはロラタジンとして 1 回 10mg（ドライシロップとして 1g）を 1 日 1 回、食後に用時溶解して経口投与する。

#### （２）用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### ４．用法及び用量に関連する注意

設定されていない

### ５．臨床成績

#### （１）臨床データパッケージ

該当資料なし

#### （２）臨床薬理試験

該当資料なし

#### （３）用量反応探索試験

該当資料なし

#### （４）検証的試験

##### １）有効性検証試験

**〈アレルギー性鼻炎〉**

**17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験（メキタジンを対照とした比較試験）（成人）**

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、ロラタジン錠 10mg（1 日 1 回）あるいはメキタジン 3mg（1 日 2 回）を 1 週間投与したときの最終全般改善率（中等度改善以上）はそれぞれ 49.4%（39/79）と 45.8%（38/83）であった。

副作用は 100 例中 7 例（7.0%）に認められた。副作用は、眠気 4 例（4.0%）、倦怠感 2 例（2.0%）、胃部不快感、嘔気及び発疹が各 1 例（1.0%）であった[3)]。

**17.1.3 国内第Ⅲ相比較試験（プラセボ及びケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験）（成人）**

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、ロラタジン錠（10mg/日）、ケトチフェンフマル酸塩（ケトチフェンとして 2mg/日）あるいはプラセボを 2 週間投与したときの最終全般改善率（中等度改善以上）はロラタジン群 54.9%（56/102）、ケトチフェンフマル酸塩群 55.1%（59/107）、プラセボ群 39.1%（27/69）であった。また、5 鼻症状スコア※1（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感、後鼻漏）の投与前値及び投与 2 週後（又は中止時）の変化量を下表に示した。

| 投与群 | *n* | 投与前<br>（標準誤差） | 変化量 | 比較※2 |
|---|---|---|---|---|
| ロラタジン | 102 | 8.23<br>（0.22） | -2.84 | ロラタジン vs ケトチフェン<br>95%CI：-0.62～0.69 |
| ケトチフェン | 107 | 7.41<br>（0.22） | -2.48 | |
| プラセボ | 69 | 7.90<br>（0.25） | -1.77 | |

※1：各症状の程度を+++：3、++：2、+：1、-：0 にスコア化して合計したスコア。

※2：投与前値を共変量とした共分散分析により、変化量の差（ロラタジンーケトチフェン）の 95%両側信頼区間（95%CI）を算出した。

副作用は 103 例中 26 例（25.2%）に認められた。主な副作用は、眠気 14 例（13.6%）、口渇感 3 例（2.9%）、咽頭痛、鼻の乾燥感及び倦怠感が各 2 例（1.9%）等であった[4)]。

**17.1.4 国内第Ⅲ相比較試験（ケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験）（小児）**

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、ロラタジンシロップ（3～6 歳：ロラタジンとして 5mg/日、7～15 歳：ロラタジンとして 10mg/日、非売品）あるいはケトチフェンフマル酸塩（3～6 歳：ケトチフェンとして 1.2mg/日、7～15 歳：ケトチフェンとして 2mg/日）を 2 週間投与した。4 鼻症状スコア※1（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感）の投与前値及び投与 2 週後（又は中止時）の変化量を下表に示した。

| 投与群 | *n* | 投与前<br>（標準誤差） | 変化量<br>（標準誤差） | 比較※2 |
|---|---|---|---|---|
| ロラタジン | 96 | 7.08<br>（0.19） | -2.53<br>（0.25） | 差の点推定値　-0.39<br>95%CI：-1.04～0.25 |
| ケトチフェン | 91 | 6.36<br>（0.22） | -1.74<br>（0.26） | |

※1：各症状の程度を+++：3、++：2、+：1、-：0 にスコア化して合計したスコア。

※2：投与前値及び年齢層を共変量とした共分散分析により、変化量の差（ロラタジンーケトチフェン）とその 95%両側信頼区間（95%CI）を算出した。

副作用は 96 例中 12 例（12.5%）に認められた。主な副作用は、傾眠 6 例（6.3%）、腹痛 2 例（2.1%）等であった[5)]。

**〈蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒〉**

**17.1.6 国内第Ⅲ相比較試験（メキタジンを対照とした比較試験）（成人）**

慢性じん麻疹を対象とした二重盲検比較試験において、ロラタジン錠 10mg（1 日 1 回）あるいはメキタジン 3mg（1 日 2 回）を 7 日間投与したときの最終全般改善率（中等度改善以上）はそれぞれ 71.3%（82/115）と 66.7%（78/117）であった。

副作用は 119 例中 12 例（10.1%）に認められた。副作用は、眠気 8 例（6.7%）、口渇 2 例（1.7%）、倦怠感、食欲亢進、腹部不快感及び舌のびらん・疼痛が各 1 例（0.8%）であった[6)]。

**17.1.7 国内第Ⅲ相比較試験（シュードプラセボ及びケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験）（成人）**

慢性じん麻疹を対象とした二重盲検比較試験において、ロラタジン錠（10mg/日）、ケトチフェンフマル酸塩（ケトチフェンとして 2mg/日）あるいはシュードプラセボ（ロラタジンとして 1mg/日）を 2 週間投与したところ、投与 2 週後（又は中止時）の全般改善率（中等度改善以上）は、それぞれ 80.5%、62.1%、43.8%であった（ロラタジンとケトチフェンの改善率の差の点推定値 18.4%、95%両側信頼区間 7.4%～29.3%）。また、皮膚症状スコア※の投与前値及び投与 2 週後（又は中止時）の変化量を下表に示した。

そう痒スコア

| 投与群 | *n* | 投与前<br>(標準誤差) | 変化量 |
|---|---|---|---|
| ロラタジン | 128 | 1.98<br>(0.06) | -1.48 |
| ケトチフェン | 124 | 1.97<br>(0.06) | -1.20 |
| シュード<br>プラセボ | 80 | 2.08<br>(0.07) | -0.79 |

発斑スコア

| 投与群 | *n* | 投与前<br>(標準誤差) | 変化量 |
|---|---|---|---|
| ロラタジン | 128 | 1.95<br>(0.06) | -1.40 |
| ケトチフェン | 124 | 1.87<br>(0.06) | -1.11 |
| シュード<br>プラセボ | 80 | 1.91<br>(0.07) | -0.82 |

※：そう痒、発斑の程度をそれぞれ+++：3、++：2、+：1、±：0.5、-：0 にスコア化した。

副作用は 128 例中 27 例（21.1%）に認められた。主な副作用は、眠気 17 例（13.3%）、めまい・立ちくらみ・ふらつき感、口渇感及び胃痛が各 2 例（1.6%）等であった[7)]。

**17.1.8 国内一般臨床試験（成人）**

湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症に対してロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 7 日間投与したときの最終治療効果（有効以上）は 61.0%（161/264）であった。

副作用は 284 例中 22 例（7.7%）に認められた。副作用は、眠気 15 例（5.3%）、倦怠感 4 例（1.4%）、口渇 3 例（1.1%）、頭痛、肩こり、胃部不快感及び食欲不振が各 1 例（0.4%）であった[8)]。

**17.1.9 国内第Ⅲ相比較試験（ケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験）（小児）**

代表的なそう痒性皮膚疾患である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、ロラタジンドライシロップ（3～6 歳：ロラタジンとして 5mg/日、7～15 歳：ロラタジンとして 10mg/日）あるいはケトチフェンフマル酸塩（3～6 歳：ケトチフェンとして 1.2mg/日、7～15 歳：ケトチフェンとして 2mg/日）を 2 週間投与した。主要そう痒スコア※1の投与前値及び投与 2 週後（又は中止時）の変化量を下表に示した。

| 投与群 | *n* | 投与前<br>（標準誤差） | 変化量<br>（標準誤差） | 比較※2 |
|---|---|---|---|---|
| ロラタジン | 101 | 2.50<br>（0.06） | -0.51<br>（0.08） | 差の点推定値　0.03<br>95%CI：-0.18～0.25 |
| ケトチフェン | 100 | 2.56<br>（0.06） | -0.58<br>（0.08） | |

※1：そう痒の程度を++++：4、+++：3、++：2、+：1、-：0 にスコア化し、日中又は夜間の高い方を主要そう痒スコアとした。

※2：投与前値及び年齢層を共変量とした共分散分析により、変化量の差（ロラタジンーケトチフェン）とその 95%両側信頼区間（95%CI）を算出した。

副作用は 101 例中 4 例（4.0%）に認められた。副作用は、ALT 増加及び AST 増加が各 2 例（2.0%）、γ-GTP 増加、肝機能検査値異常及び傾眠が各 1 例（1.0%）であった[9)]。

**２）安全性試験**

**〈アレルギー性鼻炎〉**

**17.1.1 国内長期投与試験（成人）**

通年性アレルギー性鼻炎に対してロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 9 週間投与したときの最終全般改善率（中等度改善以上）は 65.3%（32/49）であった。

副作用は 53 例中 8 例（15.1%）に認められた。副作用は、眠気 6 例（11.3%）、倦怠感、嘔気及び発疹が各 1 例（1.9%）であった[10)]。

**〈蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒〉**

**17.1.5 国内長期投与試験（成人）**

慢性じん麻疹に対してロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 8 週間投与したときの最終治療効果（有効以上）は 87.4%（76/87）であった。

副作用は 92 例中 10 例（10.9%）に認められた。副作用は、眠気 6 例（6.5%）、倦怠感 3 例（3.3%）、心窩部不快感、腹部膨満感、下痢及び生理遅延が各 1 例（1.1%）であった[11)]。

**（５）患者・病態別試験**

該当資料なし

**（６）治療的使用**

**１）使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容**

該当資料なし

**２）承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要**

該当しない

## （7）その他

### 17.3.1 眠気及び運転・機械操作能力に対する影響

ロラタジン服用後の諸動作はプラセボ服用時と類似し、ロラタジンの運転・機械操作能力に対する影響は認められなかった。

**1）**健康成人男女（20 例）を対象にパソコンでの数字入力作業による精神運動機能に及ぼす影響を検討したとき、ロラタジン 10mg 及び 20mg[注)] 投与時の正入力数はプラセボ投与時と有意差がなく、精神運動機能に影響を与えなかった[12)]。

**2）**通年性アレルギー性鼻炎に対する二重盲検比較試験の結果、ロラタジン 10mg（103 例）の眠気の発現頻度は、プラセボ（70 例）と同程度であった[4)]。

**3）**健康成人男女（16 例）を対象に入眠までの時間を比較したとき、ロラタジン 10mg 投与時の平均入眠時間はプラセボ投与時と有意差がなかった[13)]（外国人データ）。

**4）**健康成人男性（20 例）を対象にサーキット上での自動車運転能力に及ぼす影響を検討したとき、ロラタジン 10mg 及び 20mg[注)] 投与時の運転能力はプラセボ投与時と有意差がなく、運転能力に影響を与えなかった[14)、15)]（外国人データ）。

**5）**空軍パイロット及び民間航空会社パイロット（40 例）を対象にフライトシミュレーション試験を実施した結果、ロラタジン 10mg は、プラセボと比較してパイロットの航空機操作能力に影響を与えなかった[16)]（外国人データ）。

### 17.3.2 心血管系に及ぼす影響

健康成人男性（50 例）にロラタジン 40mg[注)] を 1 日 1 回 13 週間投与したとき、プラセボ（20 例）と比較して QTc 間隔を含む心電図及び心拍数への影響は認められなかった[17)]（外国人データ）。

注）ロラタジン錠 10mg「日医工」及びロラタジン OD 錠 10mg「日医工」の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。」である。
また、ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg（ドライシロップとして 1g）を 1 日 1 回、食後に用時溶解して経口投与する。」である。

## Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

### 1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

$H_1$受容体拮抗剤

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2．薬理作用

#### （1）作用部位・作用機序

ロラタジン及びDCLは、ヒスタミン$H_1$受容体拮抗作用を示す。また、ヒスタミン、ロイコトリエン$C_4$の遊離抑制作用を示す。

#### （2）薬効を裏付ける試験成績

**18.2 ヒスタミン$H_1$受容体拮抗作用**

ロラタジン及びDCLは、モルモットの肺$H_1$受容体においてヒスタミンと拮抗し[18)]、モルモット摘出回腸のヒスタミン誘発収縮を抑制した[19)]（*in vitro*）。DCLのヒト$H_1$受容体拮抗作用はロラタジンよりも強かった[20)]。また、ロラタジンは、ラットのヒスタミン誘発皮膚血管透過性亢進[21)]、マウスのヒスタミン誘発足蹠浮腫及びモルモットのヒスタミン誘発致死[22)]を抑制した（*in vivo*）。

**18.3 ヒスタミン及びロイコトリエン$C_4$遊離抑制作用**

ロラタジン又はDCLは、ラット腹腔肥満細胞又はマウス肥満細胞株MC-9細胞からのヒスタミン又はロイコトリエン$C_4$遊離を抑制し[23)、24)]（*in vitro*）、能動感作モルモットに経口投与したときの摘出肺切片からの抗原誘発ヒスタミン遊離を抑制した[24)]（*ex vivo*）。

**18.4 抗原誘発反応に対する作用**

ロラタジンは、ラット及びモルモットの受身皮膚アナフィラキシー反応（PCA反応）並びに能動感作ラット及びモルモットの抗原誘発鼻腔内色素漏出反応を抑制した[25)、26)]。

**18.5 作用の持続性**

ラットのヒスタミン誘発皮膚血管透過性亢進に対するロラタジンの抑制作用は、経口投与後12時間においても認められた[21)]（*in vivo*）。

ヒトにおいて錠10mg単回投与後14時間以上でもヒスタミン誘発皮内反応（膨疹及び紅斑）を抑制した[27)]。

#### （3）作用発現時間・持続時間

（「Ⅵ. 2.（2）薬効を裏付ける試験成績」の項参照）

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### 1．血中濃度の推移

#### （1）治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### （2）臨床試験で確認された血中濃度

**16.1.1 単回投与**

**＜ロラタジン錠 10mg「日医工」／ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞**

健康成人男性にロラタジン錠 10、20[注)]、40mg[注)] を空腹時に単回経口投与したとき、DCL の血漿中濃度について線形性が認められた[28)]。

**＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞**

**ドライシロップ（10mg）と錠 10mg の生物学的同等性**

健康成人男性（20 例）にロラタジンドライシロップ 10mg 又は錠 10mg を空腹時に単回経口投与したとき、DCL の薬物動態パラメータは以下のとおりであった。ロラタジンドライシロップ 10mg と錠 10mg は生物学的に同等であることが確認された[29)]。

| | Cmax<br>（ng/mL） | tmax<br>（hr） | AUC（0-t）<br>（ng・hr/mL） |
|---|---|---|---|
| ドライシロップ<br>（10mg） | 3.29±1.06 | 1.43±0.467 | 33.8±10.0 |
| 錠 10mg | 3.08±1.04 | 1.58±0.568 | 34.5±11.3 |
| 幾何平均比※<br>（90%信頼区間） | 1.06<br>（0.949-1.18） | － | 0.981<br>（0.920-1.05） |

※：ドライシロップ/錠（平均±標準偏差、*n*=20）

**16.1.2 反復投与**

**＜ロラタジン錠 10mg「日医工」／ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞**

**＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞**

健康成人男性（5 例）にロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC（0-24hr）について算出した累積係数は 1.3 であった。

健康成人男性（6 例）にロラタジン錠 20mg[注)] を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC（0-24hr）について算出した累積係数はともに 1.3 であった[30)]。

注）ロラタジン錠 10mg「日医工」及びロラタジン OD 錠 10mg「日医工」の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。」である。
また、ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg（ドライシロップとして 1g）を 1 日 1 回、食後に用時溶解して経口投与する。」である。

**16.1.3 生物学的同等性試験**

**＜ロラタジン錠 10mg「日医工」＞**

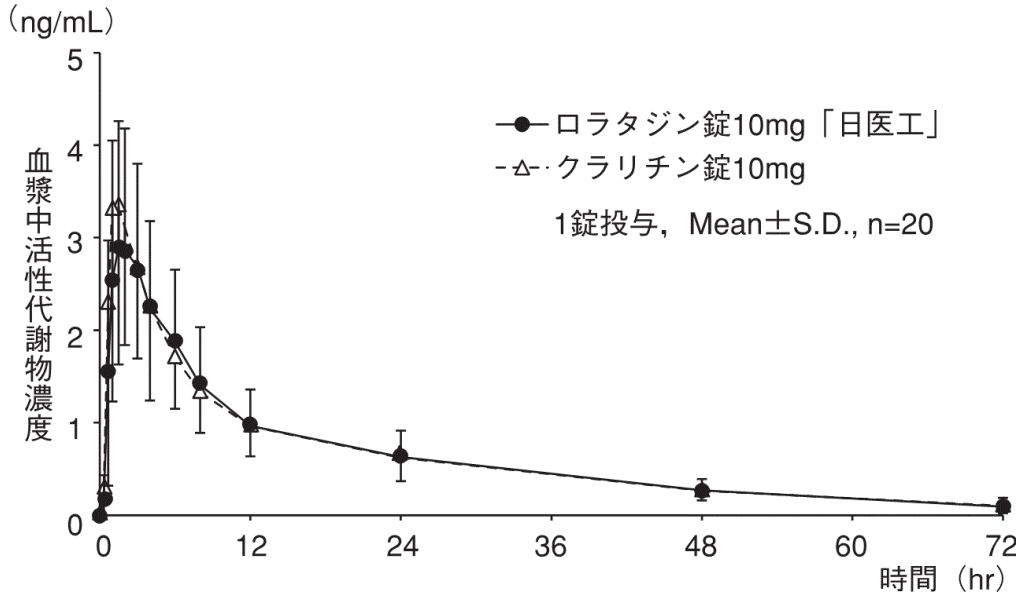
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 号）

ロラタジン錠 10mg「日医工」及びクラリチン錠 10mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ロラタジンとして 10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物（DCL：descarboethoxyloratadine）濃度を測定し、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[31)]。

薬物動態パラメータ

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|---|---|---|---|---|
| | $AUC_{0\rightarrow72}$ (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
| ロラタジン錠 10mg「日医工」 | 45.9±19.0 | 3.44±1.14 | 2.0±1.2 | 20.5±3.5 |
| クラリチン錠 10mg | 46.2±17.0 | 3.67±1.83 | 1.7±0.8 | 20.4±2.3 |

（1 錠投与, Mean±S.D., n=20）




血漿中薬物濃度推移

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。

**＜ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞**

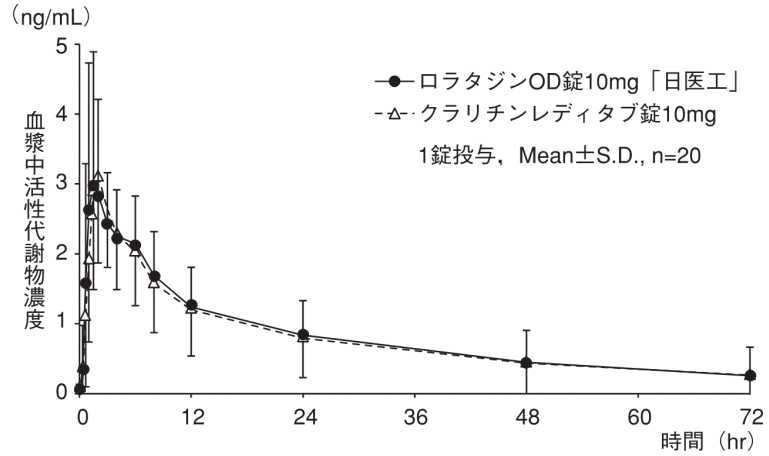
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 号）

ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」及びクラリチンレディタブ錠 10mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ロラタジンとして 10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与（水なしで服用及び水で服用）して血漿中活性代謝物（DCL：descarboethoxyloratadine）濃度を測定し、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[31)]。

薬物動態パラメータ（水なし）

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|---|---|---|---|---|
| | $AUC_{0\rightarrow72}$ (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
| ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」 | 59.4±30.4 | 3.63±1.57 | 2.5±2.0 | 28.5±23.9 |
| クラリチンレディタブ錠 10mg | 57.6±37.1 | 3.67±1.05 | 2.5±2.5 | 30.3±29.6 |

（1 錠投与, Mean±S.D., n=20）

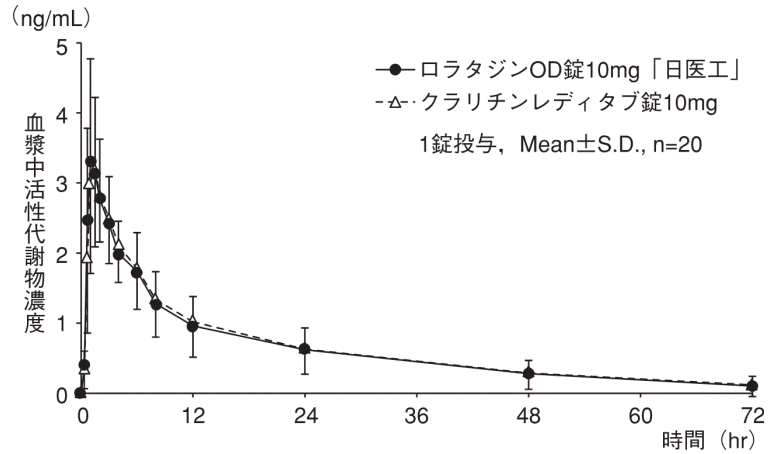



血漿中薬物濃度推移（水なし）

薬物動態パラメータ（水あり）

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|---|---|---|---|---|
| | $AUC_{0\rightarrow72}$ (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
| ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」 | 45.6±19.1 | 3.59±1.26 | 1.5±1.2 | 20.6±4.3 |
| クラリチンレディタブ錠 10mg | 46.8±21.6 | 3.40±1.04 | 1.6±1.1 | 21.0±6.6 |

（1 錠投与, Mean±S.D., n=20）




血漿中薬物濃度推移（水あり）

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。

**＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞**

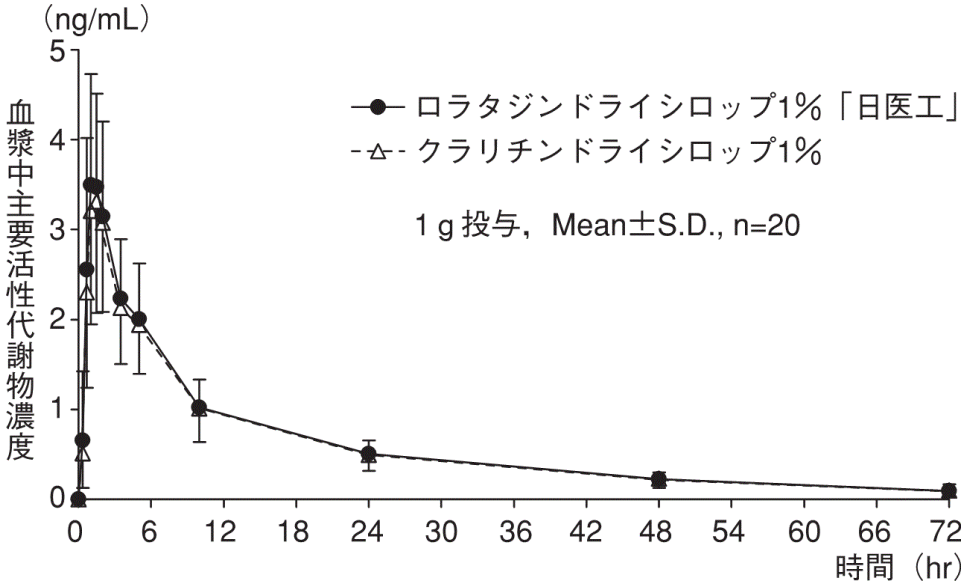
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日　薬食審発第 1124004 号）

ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」及びクラリチンドライシロップ 1%を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1g（ロラタジンとして 10mg）健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中主要活性代謝物（DCL：descarboethoxyloratadine）濃度を測定し、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[32)]。

薬物動態パラメータ

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|---|---|---|---|---|
| | $AUC_{0\rightarrow72}$ (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
| ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」 | 43.1±11.9 | 3.83±1.26 | 1.3±0.4 | 21.8±4.5 |
| クラリチンドライシロップ 1% | 42.3±13.3 | 3.63±1.32 | 1.4±0.4 | 21.1±4.8 |

（1g 投与, Mean±S.D., n=20）




血漿中薬物濃度推移

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。

**（３）中毒域**

該当資料なし

**（４）食事・併用薬の影響**

**＜食事の影響＞**

**１）ロラタジン錠 10mg「日医工」／ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」**

**16.2.1 食事の影響（錠 10mg）**

健康成人男性（12 例）にロラタジン錠 10mg を食後又は空腹時に単回経口投与したときのロラタジン及び DCL の薬物動態パラメータは、以下のとおりであった[33)]※。

※：成人又は小児を対象とした二重盲検比較試験はすべて食後投与の条件で実施されたため、用法・用量では食後投与を規定した。

| | | Cmax<br>(ng/mL) | tmax<br>(hr) | AUC（0-∞）<br>(ng・hr/mL) | $t_{1/2}$<br>(hr) |
|---|---|---|---|---|---|
| ロラタジン | 食後 | 7.73±6.81 | 1.6±0.4 | 31.2±36.3 | 14.3±7.8[a] |
| | 空腹時 | 4.46±4.98 | 1.2±0.3 | 15.4±20.5 | 11.2±8.4[b] |
| DCL | 食後 | 3.52±0.78 | 2.3±0.6 | 41.1±11.8 | 14.5±3.3 |
| | 空腹時 | 3.34±0.70 | 1.7±0.3 | 34.9±6.4 | 12.5±4.7 |

（平均±標準偏差、*n*=12、但しa：*n*=9、b：*n*=7）

**2）ロラタジンドライシロップ1%「日医工」**

**16.2.1 食事の影響（シロップ10mg）**

健康成人男性（12例）にロラタジンシロップ10mg（非売品）を食後又は空腹時に単回経口投与したときのロラタジン及びDCLの薬物動態パラメータは、以下のとおりであった[34)]※。

※：成人又は小児を対象とした二重盲検比較試験はすべて食後投与の条件で実施されたため、用法・用量では食後投与を規定した。

| | | Cmax<br>(ng/mL) | tmax<br>(hr) | AUC（0-∞）<br>(ng・hr/mL) | $t_{1/2}$<br>(hr) |
|---|---|---|---|---|---|
| ロラタジン | 食後 | 5.69 | 1.63 | 34.5 | 31.1 |
| | 空腹時 | 5.63 | 1.00 | 23.2 | 23.5 |
| DCL | 食後 | 2.83±0.80 | 2.33±0.54 | 42.3±13.3 | 19.9±2.69 |
| | 空腹時 | 3.66±1.91 | 1.50±0.48 | 40.6±16.1 | 18.5±2.88 |

（平均±標準偏差、*n*=12）

**＜併用薬の影響＞**

健康成人男性にロラタジン錠10mg及びエリスロマイシン（CYP3A4の阻害剤）又はシメチジン（CYP3A4及びCYP2D6の阻害剤）を空腹時に10日間経口投与したときの血漿中ロラタジン及びDCL濃度の変化率は下表に示すとおりであったが、QTc間隔を含め心電図への影響は認められなかった[35)～37)]。健康成人男性にロラタジン錠10mg及びケトコナゾール（国内では外用剤のみ発売）を空腹時に10日間経口投与したとき、血漿中ロラタジン及びDCL濃度の変化率は下表に示すとおりであったが、QTc間隔を含め心電図への影響は認められなかった[36)]（外国人データ）。[10.2参照]

| 併用薬 | *n* | ロラタジン | | DCL | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | Cmax | AUC | Cmax | AUC |
| エリスロマイシン<br>(500mg1日3回) | 22 | +53% | +40% | +61% | +46% |
| シメチジン<br>(300mg1日4回) | 24 | +121% | +103% | +6% | +6% |
| ケトコナゾール<br>(200mg1日2回) | 24 | +223% | +307% | +67% | +73% |

**2．薬物速度論的パラメータ**

**（1）解析方法**

該当資料なし

**（2）吸収速度定数**

該当資料なし

**（３）消失速度定数**

該当資料なし

**（４）クリアランス**

該当資料なし

**（５）分布容積**

該当資料なし

**（６）その他**

該当資料なし

**３．母集団（ポピュレーション）解析**

**（１）解析方法**

該当資料なし

**（２）パラメータ変動要因**

該当資料なし

**４．吸収**

**５．分布**

**（１）血液-脳関門通過性**

（「Ⅶ．5.（5）その他の組織への移行性」の項参照）

**（２）血液-胎盤関門通過性**

（「Ⅷ．6.（5）妊婦」の項参照）

**（３）乳汁への移行性**

（「Ⅶ．7．排泄」、「Ⅷ．6.（6）授乳婦」の項参照）

**（４）髄液への移行性**

該当資料なし

**（５）その他の組織への移行性**

**16.3.2 組織中放射能濃度（ラット）**

ラット（n=3）に $^{14}$C-ロラタジンを反復経口投与したとき、組織中放射能は大部分の組織で血漿より高く、特に下垂体、甲状腺、副腎、肝臓、涙腺、肺に高濃度の分布が認められた。また、脳内濃度は血漿より低かった。組織中放射能の生物学的半減期は、いずれの組織とも血漿より長かった。甲状腺では 14 日間反復投与でも定常状態に到達せず、蓄積性が示唆された[38)]。

**（６）血漿蛋白結合率**

**16.3.1 血漿タンパク結合**

ヒト血漿に添加したときのタンパク結合率は、ロラタジン 96.8～97.9%、DCL73.3～75.6%であった（測定法：平衡透析法）[39)]（*in vitro*）。

**６．代謝**

**（１）代謝部位及び代謝経路**

ロラタジンは、ヒトに経口投与したとき、消化管から速やかに吸収され、初回通過効果によって DCL へと代謝される[40)]。ヒトの肝ミクロソームを用いた *in vitro* 試験から、ロラタジンから DCL への代謝には CYP3A4 及び CYP2D6 の関与が確認されている[41)]。［10. 参照］

**（２）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率**

ロラタジンから DCL への代謝には CYP3A4 及び CYP2D6 の関与が確認されている。［16.4 参照］

**（３）初回通過効果の有無及びその割合**

該当資料なし

### （4）代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

DCL の効力比は未変化体（ロラタジン）の 7.9 倍であり、ヒトに経口投与したときの主たる薬効に寄与しているのは DCL である[42)]。

## 7．排泄

健康成人男性（6 例）に $^{14}$C-ロラタジン 40mg[注)]（水溶液）を空腹時に単回経口投与したとき、投与 10 日後までに総投与量の約 80%が代謝物として尿及び糞中へ等量ずつ排泄された。尿中にロラタジンは検出されず、DCL は尿中放射能の 2%未満であった[40)]（外国人データ）。

授乳婦（6 例）にロラタジンカプセル 40mg[注)]（非売品）を空腹時に単回経口投与したとき、少量のロラタジン及び DCL が母乳中に検出された。投与後 48 時間までの移行率は 0.03%であった。$AUC_{母乳}/AUC_{血漿}$比は、ロラタジン及び DCL についてそれぞれ 1.2 及び 0.8 であった[43)]（外国人データ）。［9.6 参照］

## 8．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9．透析等による除去率

（「Ⅶ．10．特定の背景を有する患者」、「Ⅷ．10．過量投与」の項参照）

## 10．特定の背景を有する患者

### 16.6.1 腎機能障害患者

#### （1）薬物動態パラメータ

腎機能障害患者（12 例：クレアチニンクリアランス≦29mL/min）にロラタジンカプセル 40mg[注)]（非売品）を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度の Cmax 及び AUC は、健康成人男性（6 例：クレアチニンクリアランス＞80mL/min）との比較において、ロラタジンでは 1.5～1.7 倍、DCL では約 2 倍に上昇した。腎機能障害患者におけるロラタジン及び DCL の $t_{1/2}$ はそれぞれ平均 8 時間及び 20 時間であり、いずれも健康成人と明らかな差は認められなかった[44)]（外国人データ）。［9.2 参照］

#### （2）血液透析患者

重症の腎機能障害患者（6 例：クレアチニンクリアランス＜5mL/min）にロラタジンカプセル 40mg[注)]（非売品）を空腹時に単回経口投与後 4～8 時間（計 4 時間）に血液透析を行ったとき、血液透析を行わない場合と比較して、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度に変動は認められず、ロラタジン及び DCL ともに透析液中へはほとんど排出されなかった[44)]（外国人データ）。［13.2 参照］

### 16.6.2 肝機能障害患者

肝機能障害患者（7 例）にロラタジンカプセル 40mg[注)]（非売品）を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、健康成人男性（24 例）との比較において、ロラタジンでは Cmax が 1.4～1.7 倍、AUC が 2.8～3.8 倍に上昇し、DCL では Cmax、AUC ともに健康成人と明らかな差は認められなかった。肝機能障害患者におけるロラタジン及び DCL の $t_{1/2}$ はそれぞれ平均 24.1 時間及び 37.1 時間であり、健康成人の 2～3 倍に延長していた[45)]（外国人データ）。［9.3 参照］

注）ロラタジン錠 10mg「日医工」及びロラタジン OD 錠 10mg「日医工」の成人における承認用量は「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。」である。

また、ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg（ドライシロップとして 1g）を 1 日 1 回、食後に用時溶解して経口投与する。」である。

### 16.6.3 小児

**＜ロラタジン錠 10mg「日医工」／ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞**

健康小児（13 例、8～12 歳）にロラタジンシロップ 10mg（非売品）を食後に単回経口投与したときのロラタジン及び DCL の薬物動態パラメータは、以下のとおりであった[46)]（外国人データ）。

| | Cmax<br>(ng/mL) | tmax<br>(hr) | AUC（0-t）<br>(ng・hr/mL) | $t_{1/2}$<br>(hr) |
|---|---|---|---|---|
| ロラタジン | 4.38±3.13 | 1.00±0.00 | 8.98±6.21 | － |
| DCL | 3.79±0.98 | 1.69±0.95 | 51.7±25.3 | 13.8±3.1 |

（平均±標準偏差、*n*=13）

小児及び成人の通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした国内製造販売後臨床薬理試験において、小児患者（104 例、7～15 歳）及び成人患者（104 例、16～64 歳）にそれぞれロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 28 日間反復投与したときのロラタジン及び DCL による全身曝露は、互いに類似していた[47)]。

**＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞**

高年齢層（13 例、8～12 歳）及び低年齢層（18 例、2～5 歳）の健康小児にそれぞれロラタジンシロップ 10mg 及び 5mg（非売品）を食後に単回経口投与したときのロラタジン及び DCL の薬物動態パラメータは、以下のとおりであった[48)、49)]（外国人データ）。

| | | Cmax<br>(ng/mL) | tmax<br>(hr) | AUC（0-t）<br>(ng・hr/mL) | $t_{1/2}$<br>(hr) |
|---|---|---|---|---|---|
| 高年齢層<br>（*n*=13）<br>年齢：8～12 歳<br>投与量：10mg | ロラタジン | 4.38±3.13 | 1.00±0.00 | 8.98±6.21 | － |
| | DCL | 3.79±0.98 | 1.69±0.95 | 51.67±25.25 | 13.8±3.1 |
| 低年齢層<br>（*n*=18）<br>年齢：2～5 歳<br>投与量：5mg | ロラタジン | 7.78±7.03 | 1.17±0.38 | 16.7±13.3 | － |
| | DCL | 5.09±1.85 | 2.33±1.75 | 87.3±76.9 | 14.4±2.9<br>（*n*=12） |

（平均±標準偏差）

小児及び成人の通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした国内製造販売後臨床薬理試験において、低年齢層の小児患者（53 例、3～6 歳）にロラタジンドライシロップ 5mg を 1 日 1 回 28 日間反復投与したときのロラタジン及び DCL による全身曝露は、高年齢層の小児患者（104 例、7～15 歳）及び成人患者（104 例、16～64 歳）にそれぞれロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回反復投与したときと類似していた[47)]。

#### 16.6.4 高齢者

高齢者（12 例、66～78 歳）にロラタジンカプセル 40mg[注)]（非売品）を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、非高齢の成人男性（24 例、21～39 歳）との比較において、ロラタジンでは Cmax が 1.6～1.9 倍、AUC が 1.5～2.0 倍に上昇した。DCL では Cmax が約 1.7 倍であったが、AUC に明らかな差は認められなかった。高齢者でのロラタジン及び DCL の $t_{1/2}$ はそれぞれ平均 18.2 時間及び 17.4 時間であった[48)]（外国人データ）。［9.8 参照］

注）ロラタジン錠 10mg「日医工」及びロラタジン OD 錠 10mg「日医工」の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。」である。
また、ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg（ドライシロップとして 1g）を 1 日 1 回、食後に用時溶解して経口投与する。」である。

## 11. その他

該当資料なし

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1．警告内容とその理由

設定されていない

### 2．禁忌内容とその理由

**2.禁忌（次の患者には投与しないこと）**

**2.1** 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

過敏症に対するヒスタミン $H_1$ 受容体拮抗剤に共通の注意事項である。

### 3．効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4．用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5．重要な基本的注意とその理由

**8.重要な基本的注意**

**〈効能共通〉**

**8.1** 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〉**

**8.2** 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。

（解説）

8.2 「鼻アレルギー診療ガイドライン－通年性鼻炎と花粉症－2020 年版（改訂第 9 版）」によると、「第 2 世代抗ヒスタミン薬、抗ロイコトリエン薬、鼻噴霧用ステロイド薬による初期療法では、症状が少しでも出た場合、花粉飛散前でもすぐに内服すべきである。しかし、症状がない場合、花粉飛散開始時（花粉飛散予測日）から初期療法を開始すれば、症状発現は抑制できる。」と記載されている[49]。

### 6．特定の背景を有する患者に関する注意

#### （1）合併症・既往歴等のある患者

**9.1 合併症・既往歴等のある患者**

**9.1.1 てんかんの既往のある患者**

十分な問診を行うこと。発作があらわれたとの報告がある。［11.1.2 参照］

#### （2）腎機能障害患者

**9.2 腎機能障害患者**

ロラタジン及び活性代謝物 descarboethoxyloratadine（DCL）の血漿中濃度が上昇するおそれがある。［16.6.1 参照］

（解説）

外国での臨床試験では、腎障害患者（Ccr：＜29mL/min）にロラタジンカプセル 40mg*を経口投与したときの血漿中濃度の Cmax 及び AUC は、健康成人との比較において、ロラタジンでは 1.5～1.7 倍、活性代謝物 DCL では約 2 倍に上昇した。

また、腎障害患者におけるロラタジン及びDCLの$t_{1/2}$はそれぞれ平均8時間及び20時間であり、いずれも健康成人と明らかな差は認められなかった[44)]。

＊：40mgは承認外用量（「V．3．用法及び用量」の項参照）

**（3）肝機能障害患者**

**9.3 肝機能障害患者**

ロラタジンの血漿中濃度が上昇するおそれがある。［16.6.2 参照］

（解説）

本剤の代謝は消化管から吸収された後、肝臓で活性代謝物であるDCL等に代謝され、更にその水酸化物、グルクロン酸抱合体へと代謝される。このため肝機能障害患者では代謝が遅延し、健康成人と比較し血中濃度が上昇することがある。

外国での臨床試験で、肝障害患者にロラタジンカプセル 40mg*を経口投与したとき、健康成人と比較しロラタジンのCmaxが1.4～1.7倍、AUCが2.8～3.8倍に上昇したとの報告がある。また、このときのロラタジン及びDCLの$t_{1/2}$は健康成人の2～3倍に延長した[45)]。

＊：40mgは承認外用量（「V．3．用法及び用量」の項参照）

**（4）生殖能を有する者**

設定されていない

**（5）妊婦**

**9.5 妊婦**

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、投与しないことが望ましい。動物試験（ラット、ウサギ）で催奇形性は認められていないが、ラットで胎児への移行が報告されている。

（解説）

ラット及びウサギにおける妊娠前・妊娠初期投与試験、器官形成期投与試験及び周産期・授乳期投与試験において催奇形性は認められていないが[50)-52)]、妊娠ラットにおける胎盤・胎児移行性を検討したところ、胎児への移行が認められた[53)]。ヒトの胎児に対する本剤の安全性は確立していない。これらから、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、投与を避けることが望ましい。

**（6）授乳婦**

**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。ヒト母乳中への移行が報告されている。［16.5 参照］

（解説）

外国での臨床試験で、授乳婦にロラタジンカプセル 40mg*を経口投与したとき、少量のロラタジン及び活性代謝物 DCL が母乳中で検出された。投与後 48 時間までの母乳中移行率は投与量の0.03%であった。また、$AUC_{母乳}/AUC_{血漿}$比は、ロラタジン及びDCLについてそれぞれ1.2及び0.8であった[43)]。以上のことから、授乳婦に対しては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が望ましい。

＊：40mgは承認外用量（「V．3．用法及び用量」の項参照）

**（7）小児等**

**＜ロラタジン錠 10mg「日医工」／ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞**

**9.7 小児等**

**9.7.1** 3 歳以上 7 歳未満の小児に対しては、ロラタジンドライシロップ 1%を投与すること。

**9.7.2** 低出生体重児、新生児、乳児又は 3 歳未満の幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

（解説）

9.7.2 国内臨床試験では、3 歳未満の幼児等（低出生体重児、新生児、乳児又は 3 歳未満の幼児）を対象とした試験は実施されていない。したがって、3 歳未満の幼児等に対する使用経験がなく、3 歳未満の幼児等に対する安全性は確立していないことから記載した。

**＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞**

**9.7 小児等**

低出生体重児、新生児、乳児又は 3 歳未満の幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

（解説）

国内臨床試験では、3 歳未満の幼児等（低出生体重児、新生児、乳児又は 3 歳未満の幼児）を対象とした試験は実施されていない。したがって、3 歳未満の幼児等に対する使用経験がなく、3 歳未満の幼児等に対する安全性は確立していないことから記載した。

**（8）高齢者**

**9.8 高齢者**

高い血中濃度が持続するおそれがある。一般に生理機能（肝、腎等）が低下している。［16.6.4 参照］

（解説）

高齢者では肝・腎等の臓器機能が加齢により低下していることがあること、また、様々な慢性疾患に罹患していることが多いことから、これらを要因として薬物動態の遅延が起きることがある。

**7．相互作用**

**10.相互作用**

ロラタジンから DCL への代謝には CYP3A4 及び CYP2D6 の関与が確認されている。［16.4 参照］

**（1）併用禁忌とその理由**

設定されていない

**（2）併用注意とその理由**

**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 |
|---|---|---|
| エリスロマイシン、シメチジン<br>［16.7 参照］ | ロラタジン及び DCL の血漿中濃度の上昇が認められるので、患者の状態を十分に観察するなど注意すること。 | 薬物代謝酵素（CYP3A4、CYP2D6）阻害作用を有する医薬品との併用により、ロラタジンから DCL への代謝が阻害され、ロラタジンの血漿中濃度が上昇する。［DCL の血漿中濃度が上昇する機序は不明］ |

（解説）

$^{3}$H-ロラタジンをヒト肝ミクロソームとインキュベートすることにより、その代謝に関与する CYP 分子種について検討した結果、ロラタジンから活性代謝物 DCL への代謝には主に CYP3A4 が関与することが確認された。また、エリスロマイシンのような CYP3A4 阻害作用を有する薬剤の存在下では、CYP2D6 が関与することが確認された[35)]。

健康成人男性（外国人）において、ロラタジン錠（10mg、1 日 1 回）とエリスロマイシン（500mg、1 日 3 回；CYP3A4 の阻害剤）を 10 日間併用投与したとき、ロラタジン及び DCL の血漿中濃度に上昇が認められた[35)]。また、シメチジン（300mg、1 日 4 回；CYP3A4 及び CYP2D6 の阻害剤）を 10 日間併用投与したとき、ロラタジンの血漿中濃度に上昇が認められた[36)]。

〔参考〕

健康成人男性 23 例にロラタジン錠 10mg 1 日 1 回及びケトコナゾール[注1)] 1 回 200mg 1 日 2 回を空腹時に 10 日間併用経口投与したとき、血漿中ロラタジン濃度の Cmax 及び AUC はロラタジン錠単独投与時に比べてそれぞれ 223%及び 307%上昇し、また、血漿中 DCL 濃度の Cmax 及び AUC はそれぞれ 67%及び 73%上昇した[36)]。（参考：外国人データ）

注１）国内では外用剤のみ発売

## ８．副作用

**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。

### （１）重大な副作用と初期症状

**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）

チアノーゼ、呼吸困難、血圧低下、血管浮腫等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

**11.1.2 てんかん**（頻度不明）

［9.1.1 参照］

**11.1.3 痙攣**（頻度不明）

**11.1.4 肝機能障害、黄疸**（いずれも頻度不明）

AST、ALT、γ-GTP、Al-P、LDH、ビリルビン等の著しい上昇を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

### （２）その他の副作用

**11.2 その他の副作用**

| | 1%以上 | 0.1～1%未満 | 0.1%未満 | 頻度不明 |
|---|---|---|---|---|
| 精神神経系 | 眠気、倦怠感 | めまい、頭痛 | | |
| 呼吸器 | | 鼻の乾燥感、咽頭痛 | | |
| 消化器 | | 腹痛、口渇、嘔気・嘔吐、下痢、便秘、口内炎 | 口唇乾燥 | 胃炎 |
| 過敏症 | | 発疹 | じん麻疹 | 発赤、紅斑、そう痒 |
| 皮膚 | | | | 脱毛 |
| 肝臓 | | ALT 上昇、AST 上昇、ビリルビン値上昇、γ-GTP 上昇、Al-P 上昇 | | |
| 腎臓 | | BUN 上昇、タンパク尿 | | 尿閉 |
| 循環器 | | 動悸 | 頻脈 | |
| 血液 | | 好酸球増多、白血球減少、好中球減少、単球増多、リンパ球減少、白血球増多、リンパ球増多、ヘマトクリット減少、ヘモグロビン減少、好塩基球増多、血小板減少、好中球増多 | | |
| その他 | | 尿糖、眼球乾燥、耳鳴、ほてり | 味覚障害、月経不順、胸部不快感 | 不正子宮出血、胸痛、難聴、浮腫（顔面・四肢） |

## ９．臨床検査結果に及ぼす影響

**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。

（解説）

本剤服用中にはヒスタミン $H_1$ 受容体拮抗作用及びヒスタミン、ロイコトリエン等のケミカルメディエーターの遊離抑制作用により、アレルゲン皮内反応が抑制されるため、検査結果が誤って陰性となる可能性がある。アレルゲン皮内反応検査を実施する際には、3～5 日前より本剤投与を一時中断し、検査を実施すること。

## 10．過量投与

**13.過量投与**

**13.1 症状**

海外において、過量投与（40mg から 180mg）により眠気、頻脈、頭痛が報告されている。

**13.2 処置**

本剤は血液透析によって除去できない。［16.6.1 参照］

（解説）

13.2 本剤の過量投与に対する特別な治療方法はないため、通常行われている処置、胃洗浄、活性炭投与等により薬剤が吸収されるのを阻止すること。なお、本剤は血液透析では除去できない。

## 11. 適用上の注意

**＜ロラタジン錠 10mg「日医工」／ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」＞**

**14.適用上の注意**

**14.1 薬剤交付時の注意**

**〈製剤共通〉**

**14.1.1** 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、更には穿孔をお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。

**〈OD 錠〉**

**14.1.2** 本剤は口腔内で速やかに崩壊することから唾液のみ（水なし）でも服用可能であるが、口腔粘膜から吸収されることはないため、水なしで服用した場合は唾液で飲み込むこと。

**14.1.3** 本剤は寝たままの状態では水なしで服用しないこと。

（解説）

14.1.3 本剤を寝たままの状態で水なしで服用した場合、食道に付着して炎症を起こす可能性が考えられるため、注意する必要がある。

**＜ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」＞**

**14.適用上の注意**

**14.1 薬剤調製時の注意**

用時調製して用いる製剤であるため、調製後は速やかに使用すること。

## 12. その他の注意

**（１）臨床使用に基づく情報**

設定されていない

**（２）非臨床試験に基づく情報**

設定されていない

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### １．薬理試験

#### （１）薬効薬理試験

（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照）

#### （２）安全性薬理試験

該当資料なし

#### （３）その他の薬理試験

該当資料なし

### ２．毒性試験

#### （１）単回投与毒性試験

該当資料なし

#### （２）反復投与毒性試験

該当資料なし

#### （３）遺伝毒性試験

該当資料なし

#### （４）がん原性試験

該当資料なし

#### （５）生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### （６）局所刺激性試験

該当資料なし

#### （７）その他の特殊毒性

該当資料なし

## Ⅹ．管理的事項に関する項目

### １．規制区分

| | | |
|---|---|---|
| 製　剤 | ロラタジン錠 10mg「日医工」<br>ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」<br>ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」 | なし |
| 有効成分 | ロラタジン | なし |

### ２．有効期間

3 年

### ３．包装状態での貯法

室温保存

### ４．取扱い上の注意点

設定されていない

### ５．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

### ６．同一成分・同効薬

同一成分：クラリチン錠 10mg、クラリチンレディタブ錠 10mg、クラリチンドライシロップ 1%

### ７．国際誕生年月日

不明

### ８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

| 販売名 | 製造販売承認<br>年月日 | 承認番号 | 薬価基準収載<br>年月日 | 販売開始<br>年月日 |
|---|---|---|---|---|
| ロラタジン錠 10mg<br>「日医工」 | 2011 年<br>7 月 15 日 | 22300AMX00921000 | 2011 年<br>11 月 28 日 | 2011 年<br>11 月 28 日 |
| ロラタジン OD 錠<br>10mg「日医工」 | 2011 年<br>7 月 15 日 | 22300AMX00922000 | 2011 年<br>11 月 28 日 | 2011 年<br>11 月 28 日 |
| ロラタジンドライシ<br>ロップ 1%「日医工」 | 2013 年<br>2 月 15 日 | 22500AMX00182000 | 2013 年<br>6 月 21 日 | 2013 年<br>6 月 21 日 |

## ９．効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

＜用法及び用量の追加＞

用法及び用量追加年月日：2012 年 1 月 30 日

製品名：ロラタジン錠 10mg「日医工」、ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」

内　容：

| | 用法及び用量　変更後 | 用法及び用量　変更前 |
|---|---|---|
| 効能又は効果 | 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 | 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 |
| 用法及び用量 | 成人：通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。<br><br>小児：通常、7 歳以上の小児にはロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。 | 成人：通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。 |

（__：用法及び用量追加に伴う変更箇所）

## 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

## 11. 再審査期間

該当しない

## 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

## 13. 各種コード

| 販売名 | 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード | 個別医薬品コード（YJ コード） | HOT（9 桁）番号 | レセプト電算処理システム用コード |
|---|---|---|---|---|
| ロラタジン錠 10mg「日医工」 | 4490027F1014 | 4490027F1162 | 121304101 | 622130401 |
| ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」 | 4490027F2010 | 4490027F2177 | 121303401 | 622130301 |
| ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」 | 4490027R1010 | 4490027R1070 | 122294401 | 622229401 |

## 14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品である。

## ＸＩ．文献

### １．引用文献


1) 社内資料：安定性試験
2) 社内資料：溶出試験
3) 奥田稔　他：耳展. 1992；35（補 4）：327-345
4) プラセボ及びケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ト.1.1.3.3）
5) 石川哮　他：臨床医薬. 2007；23（11）：965-990
6) 久木田淳　他：臨床医薬. 1990；6（12）：2689-2705
7) シュードプラセボ及びケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ト.1.1.2.3）
8) 久木田淳　他：臨床医薬. 1990；6（11）：2443-2456
9) 川島眞　他：臨床医薬. 2007；23（11）：991-1016
10) 奥田稔　他：耳展. 1992；35（補 1）：13-26
11) 久木田淳　他：臨床医薬. 1990；6（11）：2457-2468
12) Nakano S., et al.：臨床薬理. 2007；38（6）：401-407
13) Roth T., et al.：J. Allergy Clin. Immunol. 1987；80（1）：94-98（PMID: 2885356）
14) Riedel W. J., et al.：Management of Allergy in the 1990's. 1990；38-49
15) 運転操作に対する影響（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ト.1.2.3）
16) Neves-Pinto R. M., et al.：American J. Rhinology. 1992；6（1）：23-27
17) 心電図に及ぼす影響の検討（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ト.1.2.4）
18) モルモットの $H_1$ 受容体親和性（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.4.1）
19) モルモットのヒスタミン誘発収縮に対する作用（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.4.1）
20) Anthes J. C., et al.：Eur. J. Pharmacol. 2002；449（3）：229-237（PMID: 12167464）
21) ラットのヒスタミン誘発皮膚血管透過性亢進に対する作用（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.2.1）
22) Barnett A., et al.：Agents Actions. 1984；14（5-6）：590-597（PMID: 6236679）
23) Kreutner W., et al.：Allergy. 1987；42（1）：57-63（PMID: 2436504）
24) 亀井千晃　他：薬理と治療. 1996；24：49-52
25) アレルギー性皮膚炎モデルにおける作用（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.1.1）
26) アレルギー性鼻炎モデルにおける作用（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.1.2）
27) 中島光好　他：臨床医薬. 1990；6（8）：1537-1549
28) 第 I 相臨床試験（単回投与）（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ヘ.4.2.1）
29) 健康成人におけるドライシロップ剤と錠剤の生物学的同等性試験（クラリチン錠・レディタブ錠・ドライシロップ：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.2.4）
30) 第 I 相臨床試験（反復投与）（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ヘ.4.2.2）
31) 信岡史将　他：診療と新薬. 2011；48（10）：1033-1044
32) 信岡史将　他：診療と新薬. 2013；50（3）：241-247
33) 食事の影響（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ヘ.4.3）
34) シロップ剤における食事の影響（クラリチン錠・レディタブ錠・ドライシロップ：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.1.2.4、2.7.6.2）

35) Brannan M. D., et al. : Clin. Pharmacol. Ther. 1995 ; 58（3）: 269-278（PMID: 7554700）
36) Kosoglou T., et al. : Br. J. Clin. Pharmacol. 2000 ; 50（6）: 581-589（PMID: 11136297）
37) シメチジンとの薬物相互作用（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ.4.8.3）
38) ラットの組織中濃度（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ.3.2.1）
39) 血漿タンパク結合（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ.3.2.4）
40) ヒトにおける薬物動態試験（代謝、排泄）（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ.3.3.1、へ.4.1）
41) Yumibe N., et al. : Biochem. Pharmacol. 1996 ; 51（2）: 165-172（PMID: 8615885）
42) ロラタジン及びその代謝物の作用（クラリチン錠 : 2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.5.3）
43) Hilbert J., et al. : J. Clin. Pharmacol. 1988 ; 28（3）: 234-239（PMID: 2966185）
44) 腎機能障害患者における薬物動態（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ.4.6）
45) 肝機能障害患者における薬物動態（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ.4.5）
46) 小児における薬物動態（クラリチン錠・レディタブ錠・ドライシロップ：2007 年 10 月 19 日承認、申請資料概要 2.7.6.4.1.5）
47) 小児及び成人患者における国内製造販売後臨床薬理試験（クラリチン錠・レディタブ錠・ドライシロップ：2015 年 9 月 17 日、再審査報告書）
48) 高齢者における薬物動態（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ.4.4）
49) 日本耳鼻咽喉科免疫アレルギー学会・鼻アレルギー診療ガイドライン作成委員会 編（ライフ・サイエンス）「鼻アレルギー診療ガイドライン－通年性鼻炎と花粉症－2020 年版（改訂第 9 版）」
50) ラット妊娠前及び妊娠初期経口投与試験（クラリチン錠 2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ニ 3.1）
51) ラット胎児器官形成期経口投与試験（クラリチン錠 2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ニ 3.2）
52) ウサギ胎児器官形成期経口投与試験（クラリチン錠 2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ニ 3.3）
53) ラットの胎盤・胎児移行性（クラリチン錠 2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要へ 3.2.3）

**２．その他の参考文献**

該当資料なし

## ＸⅡ．参考資料

### １．主な外国での発売状況

ロラタジンの米国における発売状況は下記のとおりである。なお、スイッチ OTC 薬として承認され、現在は OTC 薬として販売されている。

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

| 効能又は効果 | 用法及び用量 |
|---|---|
| ○アレルギー性鼻炎<br>○蕁麻疹<br>○皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒 | ＜ロラタジン錠10mg「日医工」／ロラタジンOD錠10mg「日医工」＞<br>成人：通常、ロラタジンとして1回10mgを1日1回、食後に経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。<br>小児：通常、7歳以上の小児にはロラタジンとして1回10mgを1日1回、食後に経口投与する<br><br>＜ロラタジンドライシロップ1%「日医工」＞※<br>成人：通常、ロラタジンとして1回10mg（ドライシロップとして1g）を1日1回、食後に用時溶解して経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。<br>小児：通常、3歳以上7歳未満の小児にはロラタジンとして1回5mg（ドライシロップとして0.5g）、7歳以上の小児にはロラタジンとして1回10mg（ドライシロップとして1g）を1日1回、食後に用時溶解して経口投与する。 |

＜DailyMed（USA）、2023 年 12 月検索＞

| 国　名 | 米国 |
|---|---|
| 会社名 | Bayer HealthCare LLC. |
| 販売名 | CLARITIN/ CLARITIN REDITABS |
| 剤形・規格 | CLARITIN：tablet：10 mg<br>CLARITIN REDITABS：　tablet、orally disintegrating：5 mg、10 mg |

**INDICATIONS AND USAGE**

Temporarily relieves these symptoms due to hay fever or other upper respiratory allergies:

- ■ runny nose
- ■ itchy, watery eyes
- ■ sneezing
- ■ itching of the nose or throat

**DOSAGE AND ADMINISTRATION**

CLARITIN-/ CLARITIN REDITABS　10 mg

| | |
|---|---|
| adults and children 6 years and over | 1 tablet daily; not more than 1 tablet in 24 hours |
| children under 6 years of age | ask a doctor |
| consumers with liver or kidney disease | ask a doctor |

CLARITIN REDITABS　5 mg
place 1 tablet on tongue; tablet disintegrates, with or without water

| | |
|---|---|
| adults and children 6 years and over | 1 tablet every 12 hours; not more than 2 tablets in 24 hours |
| children under 6 years of age | ask a doctor |
| consumers with liver or kidney disease | ask a doctor |

※ドライシロップ該当資料なし

## ２．海外における臨床支援情報

### 妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。
（「Ⅷ．6．特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

| | Drug Name | Category |
|---|---|---|
| オーストラリアの分類 | loratadine | B1 |

（2021 年 4 月検索）

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category B1：

Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have not shown evidence of an increased occurrence of fetal damage.

## ＸⅢ．備考

### 1．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

**本項の情報に関する注意**

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。
試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。
医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### （1）粉砕

**粉砕物の安定性試験**

**ロラタジン錠 10mg「日医工」**

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉砕した。
試験実施期間：2011/7/8～2011/10/26

● 粉砕物　25℃・75%RH［遮光・開放］　（最小値～最大値）

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10 | EN110 | 白色の粉末 | 白色の粉末 | 白色の粉末 | 白色の粉末 | 白色の粉末 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | EN110 | 99.1～100.0 | 98.1～100.8 | 98.8～99.4 | 101.0～103.7 | 95.5～103.3 |
| （参考値）重量変化（%） | EN110 | ― | ＋0.4 | ＋0.3 | ＋0.4 | ＋0.4 |

※：表示量に対する含有率（%）

**ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」**

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉砕した。
試験実施期間：2011/7/8～2011/10/26

● 粉砕物　25℃・75%RH［遮光・開放］　（最小値～最大値）

| 試験項目<br>＜規格＞ | ロット番号 | 保存期間 | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | 開始時 | 2 週 | 1 ヵ月 | 2 ヵ月 | 3 ヵ月 |
| 性状　n=10 | DN070 | 白色の粉末 | 白色の粉末 | 白色の粉末 | 白色の粉末 | 白色の粉末 |
| 含量（%）※　n=3<br>＜95.0～105.0%＞ | DN070 | 99.9～101.5 | 99.4～102.2 | 101.6～102.1 | 101.3～101.9 | 100.7～102.2 |
| （参考値）重量変化（%） | DN070 | ― | +1.1 | +1.1 | +1.1 | +1.1 |

※：表示量に対する含有率（%）

**（２）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験**

**ロラタジン錠 10mg「日医工」**

**１）試験方法**

［崩壊懸濁試験］

検体 1 個を容器にとり、約 55℃の温湯 20mL を加え、軽く撹拌し、ディスペンサー内に入れ、ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。充分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で充分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

［通過性試験］

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施日：2011/10/4

ロット番号：EN110

**２）試験結果**

| | 崩壊懸濁試験 | 通過性試験 |
|---|---|---|
| ロラタジン錠 10mg「日医工」 | 破壊した検体を用いて試験したとき 10 分以内に崩壊・懸濁しなかった。 | 実施しなかった。 |

備考：破壊した検体においても良好な懸濁液が得られず、通過性試験はできなかった。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（(株) じほう)」に準じて実施しました。

**ロラタジン OD 錠 10mg「日医工」**

**1）試験方法**

［崩壊懸濁試験］

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。充分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で充分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

［通過性試験］

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施日：2011/10/4

ロット番号：DN070

**2）試験結果**

| | 崩壊懸濁試験 | 通過性試験 |
|---|---|---|
| ロラタジン OD 錠 10mg<br>「日医工」 | 5 分以内に崩壊・懸濁した。 | 8Fr.チューブを通過した。 |

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（(株) じほう)」に準じて実施しました。

**ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」**

**1）試験方法**

［崩壊懸濁試験］

検体 1 個を容器にとり、約 55℃の温湯 20mL を加え、軽く撹拌し、ディスペンサー内に入れ、ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。充分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で充分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

［通過性試験］

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施日：2013/3/26

ロット番号：JI100

**2）試験結果**

| | 崩壊懸濁試験 | 通過性試験 |
|---|---|---|
| ロラタジンドライシロップ 1%「日医工」 | 5 分以内に溶解・懸濁した。 | 8Fr.チューブを通過した。 |

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（(株) じほう)」に準じて実施しました。

**2．その他の関連資料**

該当資料なし