

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2013 に準拠して作成

持続性選択H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

ロラタジン錠10mg「AA」

ロラタジンOD錠10mg「AA」

LORATADINE TABLETS, OD TABLETS

ロラタジン錠、ロラタジン口腔内崩壊錠

剤形	錠10mg：素錠 OD錠10mg：素錠（口腔内崩壊錠）
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中 ロラタジン 10mg
一般名	和名：ロラタジン（JAN） 洋名：Loratadine（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2011年7月15日 薬価基準収載年月日：2011年11月28日 発売年月日：2011年11月28日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：あすか製薬株式会社 販売：武田薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	あすか製薬株式会社 くすり相談室 TEL 0120-848-339 FAX 03-5484-8358 医療関係者向けホームページ http://www.aska-pharma.co.jp/medical/index.html

本 IF は 2017 年 6 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要 — 日本病院薬剤師会 —

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」（<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品医療機器総合機構ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式】

- ①規格は A 4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

【 I F の作成】

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「 I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（ P D F ）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【 I F の発行】

- ① 「 I F 記載要領 2013」 は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「 I F 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「 I F 記載要領 2013」においては、 P D F ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構ホーム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」に従って作成・提供するが、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の M R 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、 I F 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、 I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、 I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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

I F を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。 I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、 I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂・一部変更)

目 次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目.....	13
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性.....	1	2. 薬理作用	13
II. 名称に関する項目	2	VII. 薬物動態に関する項目.....	14
1. 販売名	2	1. 血中濃度の推移・測定法	14
2. 一般名	2	2. 薬物速度論的パラメータ	16
3. 構造式又は示性式.....	2	3. 吸収	17
4. 分子式及び分子量.....	3	4. 分布	17
5. 化学名（命名法）	3	5. 代謝	18
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	6. 排泄	18
7. CAS登録番号	3	7. トランスポーターに関する情報	18
III. 有効成分に関する項目	4	8. 透析等による除去率.....	18
1. 物理化学的性質	4	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目..	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性....	4	1. 警告内容とその理由.....	19
3. 有効成分の確認試験法	4	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	19
4. 有効成分の定量法.....	4	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	19
IV. 製剤に関する項目	5	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	19
1. 剤形.....	5	5. 慎重投与内容とその理由	19
2. 製剤の組成.....	5	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	19
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意.....	6	7. 相互作用	20
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	8. 副作用.....	20
5. 調製法及び溶解後の安定性	6	9. 高齢者への投与.....	21
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	6	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	22
7. 溶出性.....	6	11. 小児等への投与.....	22
8. 生物学的試験法	10	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
9. 製剤中の有効成分の確認試験法.....	10	13. 過量投与.....	22
10. 製剤中の有効成分の定量法.....	10	14. 適用上の注意	22
11. 力価	10	15. その他の注意	23
12. 混入する可能性のある夾雑物	10	16. その他	23
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報.....	10	IX. 非臨床試験に関する項目	24
14. その他.....	10	1. 薬理試験.....	24
V. 治療に関する項目	11	2. 毒性試験.....	24
1. 効能又は効果.....	11		
2. 用法及び用量.....	11		
3. 臨床成績	11		

X. 管理的事項に関する項目	25
1. 規制区分	25
2. 有効期間又は使用期限	25
3. 貯法・保存条件	25
4. 薬剤取扱い上の注意点	25
5. 承認条件等.....	25
6. 包装.....	25
7. 容器の材質.....	26
8. 同一成分・同効薬.....	26
9. 国際誕生年月日	26
10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	26
11. 薬価基準収載年月日	26
12. 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	26
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ の内容	26
14. 再審査期間	27
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	27
16. 各種コード	27
17. 保険給付上の注意	27
X I . 文献.....	28
1. 引用文献	28
2. その他の参考文献.....	28
X II . 参考資料.....	29
1. 主な外国での発売状況	29
2. 海外における臨床支援情報	29
X III . 備考	30

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロラタジンは抗アレルギー作用を有し、本邦ではアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚瘙癢症）に伴う瘙癢の適応で 2002 年 7 月に承認されている。

ロラタジン錠 10mg「AA」及びロラタジン OD 錠 10mg「AA」は、あすか製薬が後発医薬品として開発し、2011 年 7 月に承認を取得し、同年 11 月から販売している。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 持続性選択 H₁拮抗剤で、1 日 1 回の服用で効果を示す。
- (2) ロラタジン OD 錠 10mg「AA」は、水なしでも服用できる口腔内崩壊錠である。
- (3) 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。（頻度不明）

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロラタジン錠 10mg 「AA」

ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」

(2) 洋名

LORATADINE TABLETS

LORATADINE OD TABLETS

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格含量＋屋号

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ロラタジン（JAN）

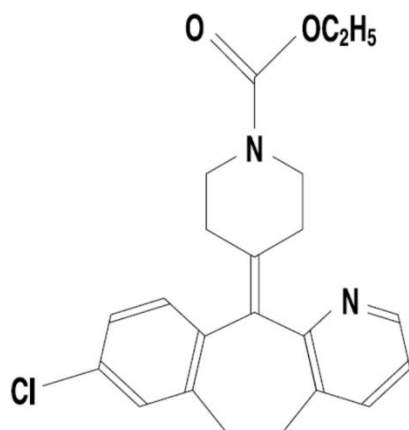
(2) 洋名（命名法）

Loratadine（JAN）

(3) ステム

三環系ヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬：-tadine

3. 構造式又は示性式



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)

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当なし

7. CAS登録番号

79794-75-5

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

酢酸（100）に極めて溶けやすく、メタノール又はエタノール（99.5）に溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けやすく、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

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
- (3) 炎色反応試験







4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	ロラタジン錠 10mg 「AA」			ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」		
成分・含量	1錠中 ロラタジン 10mg			1錠中 ロラタジン 10mg		
剤形	白色の円形の素錠（割線入り）			白色の円形の素錠		
外形	表	側面	裏	表	側面	裏
						
	直径 6.5mm 厚さ 2.3mm 重量 100mg			直径 7.0mm 厚さ 3.3mm 重量 150mg		

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

販売名	ロラタジン錠 10mg 「AA」	ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」
識別コード (表示箇所)	AK521 (PTP 表面、錠剤 表)	AK531 (PTP 表面、錠剤 表、アルミピロー)

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

販売名	ロラタジン錠 10mg 「AA」	ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」
成分・含量	1錠中 ロラタジンを 10mg 含有	1錠中 ロラタジンを 10mg 含有

(2) 添加物

販売名	ロラタジン錠 10mg 「AA」	ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」
添加物	アルファー化デンプン、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物	エリスリトール、クロスポビドン、結晶セルロース、スクラロース、ステアリン酸マグネシウム、ラウリル硫酸ナトリウム

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 カ月）の結果、本剤は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。¹⁾

<ロラタジン錠 10mg 「AA」 >

保存条件	保存期間	保存形態	結果
40℃、75%RH	6 カ月	PTP 包装（最終包装形態）	変化なし

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性（含量均一性試験）、溶出性、定量

<ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」 >

保存条件	保存期間	保存形態	結果
40℃、75%RH	6 カ月	PTP 包装（最終包装形態）	変化なし

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性（含量均一性試験）、崩壊性、溶出性、定量

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性

<ロラタジン錠 10mg 「AA」 >

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日改正）に従い、ロラタジン錠 10mg 「AA」を試験製剤として標準製剤との溶出試験を行った。なお、ロラタジンは酸性での溶解度が高いため、「中性又は塩基性薬物を含む製剤、コーティング製剤」に従い、溶出挙動の類似性について確認した。²⁾

<試験条件>

パドル法、900mL、37±0.5℃

試験液と回転数

- ① pH1.2－日本薬局方溶出試験 第 1 液、50rpm
- ② pH3.0－薄めた McIlvaine 緩衝液、50rpm
- ③ pH6.8－日本薬局方溶出試験 第 2 液、50rpm
- ④ 水、50rpm
- ⑤ pH1.2－日本薬局方溶出試験 第 1 液、100rpm

<判定基準>

1) ①、⑤

標準製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出したことから、試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ 以内の範囲にあることとした。

2) ②

規定された試験時間 (360 分) 内に標準製剤の平均溶出率は 50%以上かつ 85%に達しなかったことから、規定された試験時間における標準製剤の平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点である 120 分及び 360 分の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 46 以上であることとした。

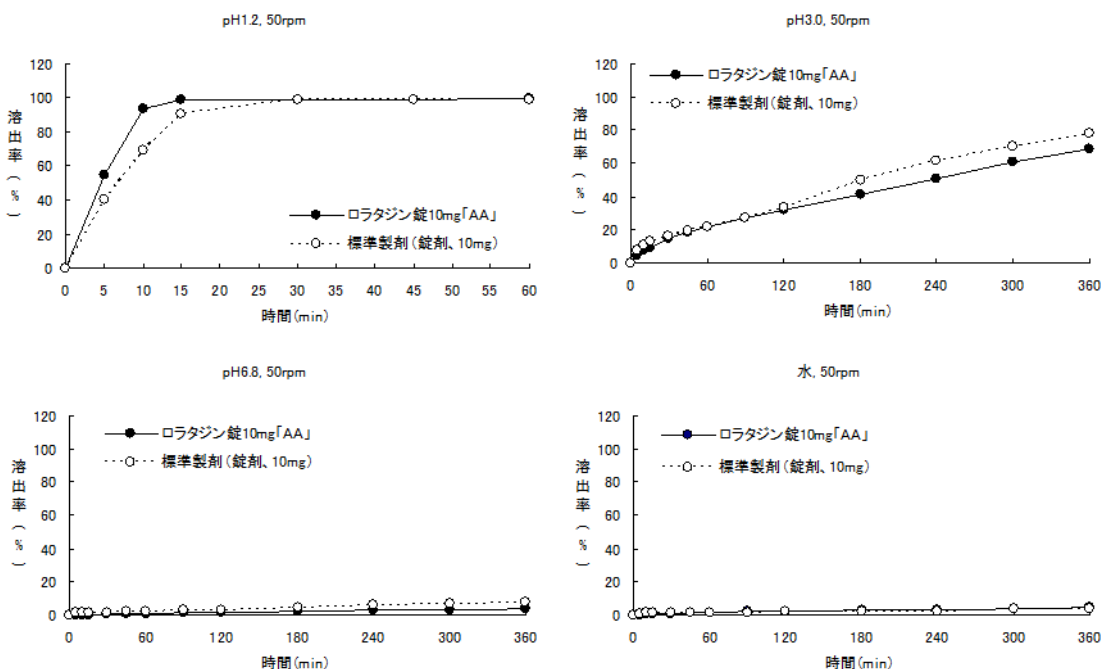
3) ③

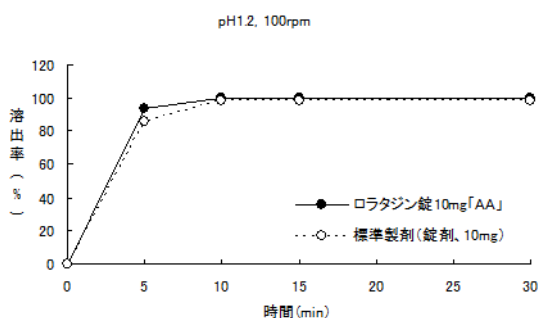
規定された試験時間 (360 分) 内に標準製剤の平均溶出率は 50%に達しなかったことから、規定された試験時間における標準製剤の平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点である 120 分及び 360 分の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 53 以上であることとした。

4) ④

規定された試験時間 (360 分) 内に標準製剤の平均溶出率は 50%に達しなかったことから、規定された試験時間における標準製剤の平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点である 180 分及び 360 分の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 53 以上であることとした。

<溶出曲線>





<結果>

回転数 (rpm)	試験液	判定時間 (分)	平均溶出率 (%)			判定基準	判定
			標準製剤	試験製剤	差		
50	pH1.2	15	90.2	98.8	8.6	試験製剤の平均溶出率が85%以上	適合
	pH3.0	120	33.8	32.0	-1.8	試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の±12%以内	適合
		360	78.0	68.9	-9.1		
	pH6.8	120	3.5	1.8	-1.7	試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の±9%以内	適合
		360	7.6	4.0	-3.6		
	水	180	2.1	3.2	1.1	試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の±9%以内	適合
360		4.2	4.4	0.2			
100	pH1.2	15	98.4	99.9	1.5	試験製剤の平均溶出率が85%以上	適合

<ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」 >

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日改正）に従い、ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」を試験製剤として標準製剤との溶出試験を行った。なお、ロラタジンは酸性での溶解度が高いため、「中性又は塩基性薬物を含む製剤、コーティング製剤」に従い、溶出挙動の類似性について確認した。²⁾

<試験条件>

パドル法、900mL、37±0.5℃

試験液と回転数

- ① pH1.2－日本薬局方溶出試験 第 1 液、50rpm
- ② pH4.0－薄めた McIlvaine 緩衝液、50rpm
- ③ pH6.8－日本薬局方溶出試験 第 2 液、50rpm
- ④ 水、50rpm
- ⑤ pH4.0－薄めた McIlvaine 緩衝液、100rpm

<判定基準>

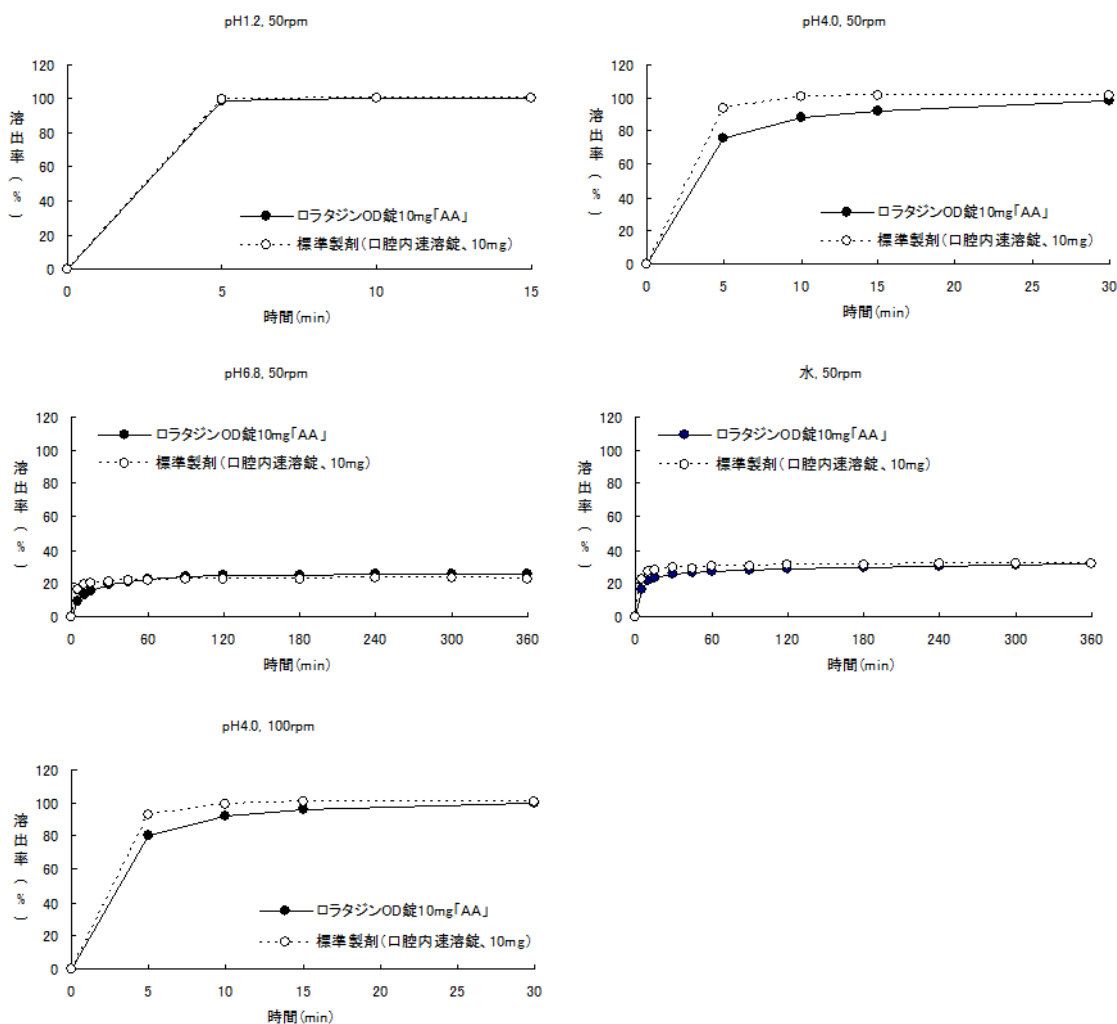
- 1) ①、②、⑤

標準製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出したことから、試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%以内の範囲にあることとした。

2) ③、④

規定された試験時間（360分）内に標準剤の平均溶出率は50%に達しなかったことから、規定された試験時間における標準剤の平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点である5分及び360分の2時点において、試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又はf2関数の値が53以上であることとした。

<溶出曲線>



<結果>

回転数 (rpm)	試験液	判定時間 (分)	平均溶出率 (%)			判定基準	判定
			標準剤	試験剤	差		
50	pH1.2	15	100.4	100.5	0.1	試験剤の平均溶出率が85%以上	適合
	pH4.0	15	101.2	92.3	-8.9	試験剤の平均溶出率が85%以上	適合
	pH6.8	5	16.0	9.5	-6.5	試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率の±9%以内	適合
		360	22.9	25.9	3.0		
	水	5	22.4	16.1	-6.3	試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率の±9%以内	適合
360		32.3	31.7	-0.6			
100	pH4.0	15	100.2	96.1	-4.1	試験剤の平均溶出率が85%以上	適合

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

次の成分が混入する可能性があるが、いずれも 0.1%以下である。

DCL (活性代謝物) : 4-(8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine-11-ylidene)piperidine-11-one (descarboethoxyloratadine)

HEP (ヘプタノン体) : 8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 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、皮膚掻痒症）に伴う瘙痒

2. 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。

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。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

OD錠10mgは口腔内で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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

第2世代 H₁ 受容体拮抗剤（アゼラスチン塩酸塩、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、オロパタジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩）

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

該当資料なし

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

「(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

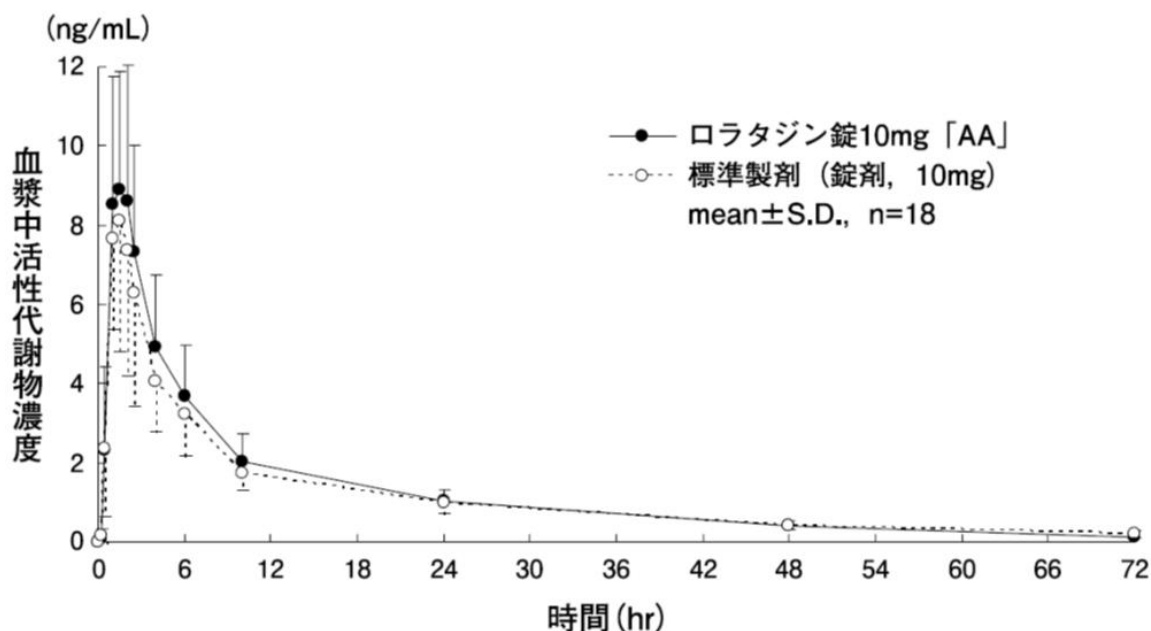
(3) 臨床試験で確認された血中濃度

<ロラタジン錠 10mg「AA」>³⁾

健康成人男性にロラタジン錠 10mg「AA」と標準製剤それぞれ1錠(ロラタジンとして 10mg)をクロスオーバー法により絶食単回経口投与して血漿中ロラタジン活性代謝物 (DCL, descarboethoxyloratadine) 濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	投与量	AUC ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ロラタジン錠 10mg 「AA」	10mg	89.48 ±27.76	10.166 ±3.419	1.50 ±0.45	18.77 ±4.00
標準製剤 (錠剤、10mg)	10mg	83.16 ±23.21	9.037 ±3.337	1.31 ±0.42	22.97 ±3.62

(mean±S.D., n=18)



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。

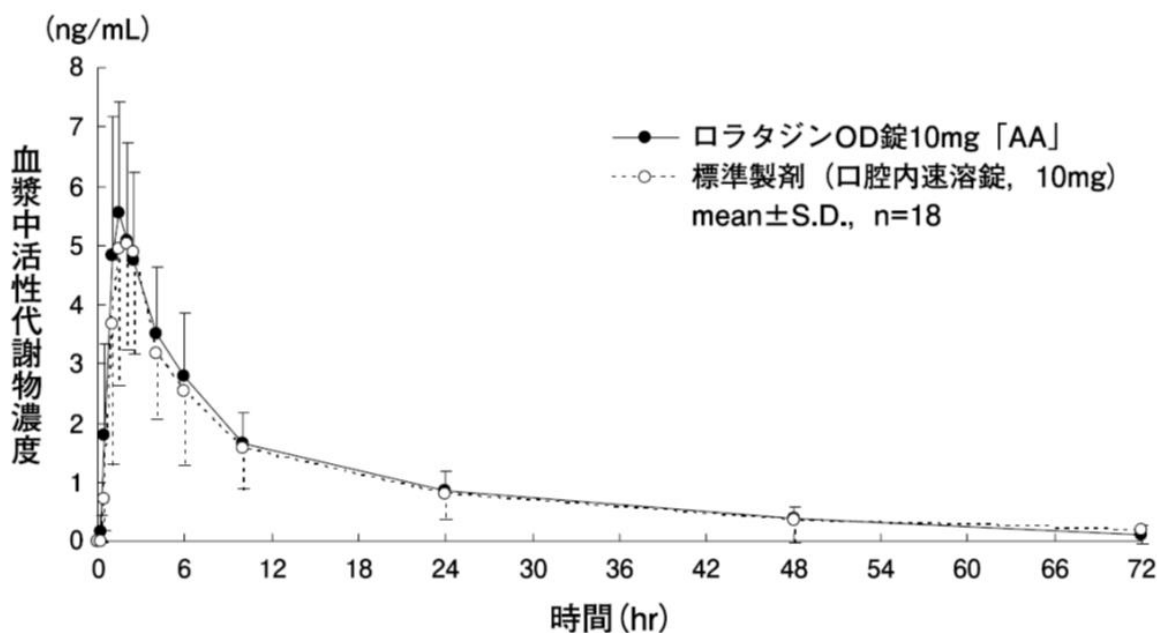
<ロラタジン OD錠 10mg「AA」>⁴⁾

健康成人男性にロラタジン OD錠 10mg「AA」と標準製剤（口腔内速溶錠）それぞれ1錠（ロラタジンとして 10mg）をクロスオーバー法により絶食単回経口投与して血漿中ロラタジン活性代謝物（DCL、descarboethoxyloratadine）濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

<水なしで服用>

	投与量	AUC ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ロラタジン OD錠 10mg「AA」	10mg	68.82 ±25.44	6.131 ±1.949	1.53 ±0.53	19.67 ±7.09
標準製剤 (口腔内速溶錠、10mg)	10mg	65.30 ±35.39	5.534 ±2.111	1.94 ±0.51	22.37 ±10.26

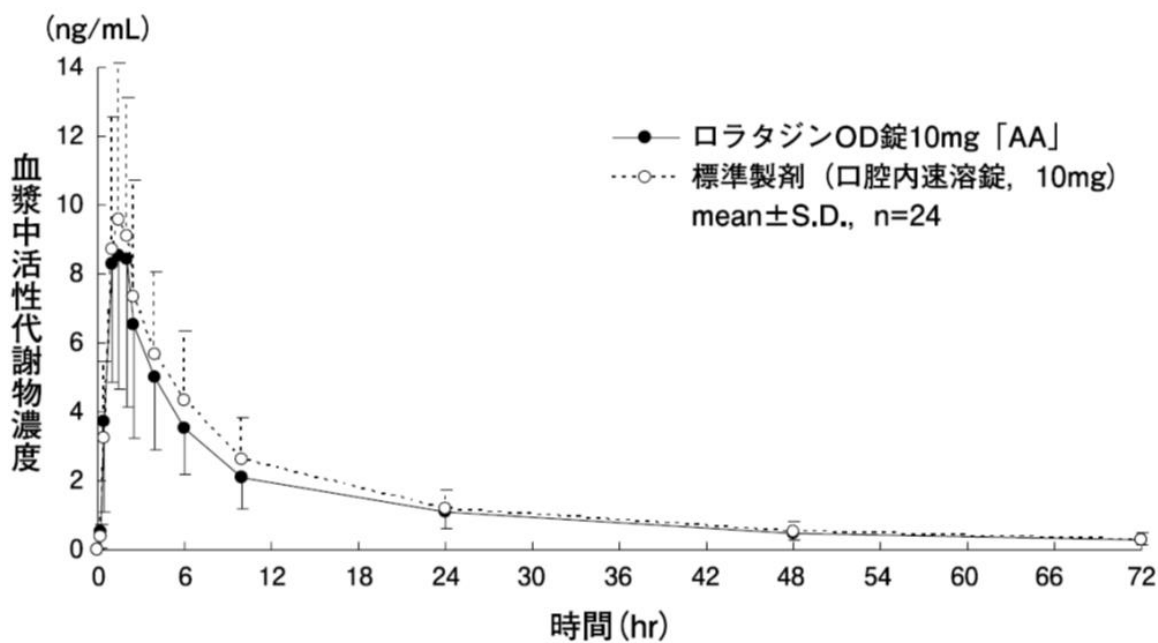
(mean±S.D., n=18)



<水ありで服用>

	投与量	AUC ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」	10mg	94.22 ±36.53	9.678 ±4.367	1.48 ±0.45	23.78 ±5.82
標準製剤 (口腔内速溶錠、10mg)	10mg	108.07 ±44.61	10.775 ±4.510	1.46 ±0.39	22.74 ±6.68

(mean±S.D., n=24)



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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

<ロラタジン錠 10mg 「AA」 >³⁾

$k_{el}=0.039\pm 0.011$ (/hr)

<ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」 >⁴⁾

$k_{el}=0.039\pm 0.012$ (/hr) [水なし服用]

$k_{el}=0.031\pm 0.007$ (/hr) [水あり服用]

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考> 「Ⅷ. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」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

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

<参考>「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

(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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)

【禁忌】 (次の患者には投与しないこと)
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照すること。

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)

(1) 肝障害のある患者

[ロラタジンの血漿中濃度が上昇するおそれがある。]

(2) 腎障害のある患者

[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。]

(3) 高齢者 (「9. 高齢者への投与」の項参照)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

(1) 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。

(2) 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。

7. 相互作用

ロラタジンから活性代謝物（DCL）への代謝には CYP3A4 及び CYP2D6 の関与が確認されている。

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

【併用注意】（併用に注意すること）		
薬剤名	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	ロラタジン及び活性代謝物（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、ロラタジンから活性代謝物（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。〔活性代謝物（DCL）の血漿中濃度が上昇する機序は不明〕

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用

- 1) **ショック、アナフィラキシー**（頻度不明）：ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、チアノーゼ、呼吸困難、血圧低下、血管浮腫等の症状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。
- 2) **てんかん**（頻度不明）：てんかんの既往のある患者で本剤投与後に発作があらわれたとの報告があるので使用に際しては十分な問診を行うこと。
- 3) **痙攣**（頻度不明）：痙攣があらわれることがあるので、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) **肝機能障害、黄疸**（頻度不明）：AST（GOT）、ALT（GPT）、 γ -GTP、ALP、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。

(3) 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、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
精神神経系	眠気、倦怠感、めまい、頭痛
呼吸器	咽頭痛、鼻の乾燥感
消化器	腹痛、口渇、嘔気・嘔吐、下痢、便秘、口唇乾燥、口内炎、胃炎
過敏症	発疹、蕁麻疹、紅斑、そう痒、発赤
皮膚	脱毛
肝臓	AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、ビリルビン値上昇、ALP 上昇、 γ -GTP 上昇
腎臓	蛋白尿、BUN 上昇、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、難聴、ほてり、浮腫（顔面・四肢）、味覚障害、月経不順、胸部不快感、不正子宮出血、胸痛

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、チアノーゼ、呼吸困難、血圧低下、血管浮腫等の症状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。
- 3) 発疹、蕁麻疹、紅斑、癢痒、発赤などの過敏症が認められた場合には、必要に応じ、投与中止等の適切な処置を行うこと。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能（肝、腎等）が低下しており、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、慎重に投与すること。

10. 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女性には、投与を避けることが望ましい。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、動物実験（ラット、ウサギ）で催奇形性は認められないが、ラットで胎児への移行が報告されている。]

(2) 授乳中の女性には、投与を避けることが望ましい。やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。

[ヒト母乳中への移行が報告されている。]

11. 小児等への投与

(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。

(2) 低出生体重児、新生児、乳児又は3歳未満の幼児に対する安全性は確立していない（使用経験がない）。

12. 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。

13. 過量投与

徴候、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。

処置：一般的な薬物除去法（胃洗浄、活性炭投与等）により、本剤を除去する。また、必要に応じて対症療法を行う。なお、本剤は血液透析によって除去できない。

14. 適用上の注意

(1) 錠 10mg

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）。

(2) OD錠 10mg

1) 薬剤交付時：以下の点について指導すること。

①PTP シートから取り出して服用すること（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）。

②吸湿性を有するため、使用直前に PTP シートから取り出すこと。

2) 服用時

舌の上で崩壊するので、唾液のみ（水なし）で服用可能である。ただし、寝たままの状態では水なしで服用しないこと。

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

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」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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：該当しない

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ. 14. 適用上の注意」の項参照

くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

ロラタジン錠 10mg 「AA」： 100錠（10錠×10）

500錠（10錠×50）

ロラタジン OD錠 10mg 「AA」： 50錠（10錠×5）

300錠（10錠×30）

7. 容器の材質

<ロラタジン錠 10mg「AA」>

PTP 包装	PTP シート	ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔
--------	---------	---------------------

<ロラタジン OD 錠 10mg「AA」>

PTP 包装	PTP シート	ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔
	ピロー	アルミニウムポリエチレンラミネートフィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分：該当なし

同 効 薬：アゼラスチン塩酸塩、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、オロパタジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
ロラタジン錠 10mg「AA」	2011年 7月 15日	22300AMX00985000
ロラタジン OD 錠 10mg「AA」	2011年 7月 15日	22300AMX01000000

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
ロラタジン錠 10mg「AA」	2011年 11月 28日
ロラタジン OD 錠 10mg「AA」	2011年 11月 28日

12. 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

用法及び用量追加

承認年月日：2012年 2月 23日

変更内容：小児の用法・用量追加

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	HOT (9桁) コード	レセプト電算 コード
ロラタジン錠 10mg 「AA」	4490027F1030	120909901	622090901
ロラタジン OD 錠 10mg 「AA」	4490027F2037	120910501	622091001

17. 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。

X I . 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) 社内資料 (ロラタジン錠 生物学的同等性試験)
- 4) 社内資料 (ロラタジン OD 錠 生物学的同等性試験)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

X Ⅲ . 備考

その他の関連資料

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（薬食審査発第 1124004 号、平成 18 年 11 月 24 日）