

# 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 2013 に準拠して作成

持続性選択 H<sub>1</sub> 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

## ロラタジン錠10mg「JG」

## ロラタジンOD錠10mg「JG」

Loratadine Tablets

Loratadine OD Tablets

|                               |  |
|-------------------------------|--|
| 剤形                            | 錠10mg : 錠剤（素錠）<br>OD錠10mg : 錠剤（口腔内崩壊錠）   |
| 製剤の規制区分                       | 該当しない  |
| 規格・含量                         | 錠10mg : 1錠中 ロラタジン10mg 含有<br>OD錠10mg : 1錠中 ロラタジン10mg 含有   |
| 一般名                           | 和名：ロラタジン（JAN）<br>洋名：Loratadine（JAN、INN）  |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・<br>発売年月日 | 製造販売承認年月日：2011年7月15日<br>薬価基準収載年月日：2011年11月28日<br>発売年月日：2011年11月28日   |
| 開発・製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名      | 製造販売元：日本ジェネリック株式会社   |
| 医薬情報担当者の連絡先                   |  |
| 問い合わせ窓口                       | 日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室<br>受付時間：9時～18時（土、日、祝日を除く）<br>TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172<br>医療関係者向けホームページ：<br><a href="http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html">http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html</a> |

本 IF は 2017 年 4 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、(独)医薬品医療機器総合機構(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 ー日本病院薬剤師会ー

## 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。この変更に合わせて、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(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>) 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 PMDA 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 A4 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。
- ②IF 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。

#### [IF の作成]

- ①IF 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。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF 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、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF 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（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IF の発行]

- ①「IF 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、「IF 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 IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF 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 IF については、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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、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薬剤師等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、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、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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

IF 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。IF 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、IF 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)

# 目次

|                                |    |  |    |
|--------------------------------|----|--|----|
| I. 概要に関する項目                    | 1  | 11. 力価                                     | 13 |
| 1. 開発の経緯                       | 1  | 12. 混入する可能性のある夾雑物                          | 14 |
| 2. 製品の治療学的・製剤学的特性              | 1  | 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報                | 14 |
| II. 名称に関する項目                   | 2  | 14. その他                                    | 14 |
| 1. 販売名                         | 2  | V. 治療に関する項目                                | 15 |
| (1)和名                          | 2  | 1. 効能又は効果                                  | 15 |
| (2)洋名                          | 2  | 2. 用法及び用量                                  | 15 |
| (3)名称の由来                       | 2  | 3. 臨床成績                                    | 15 |
| 2. 一般名                         | 2  | (1)臨床データパッケージ                              | 15 |
| (1)和名(命名法)                     | 2  | (2)臨床効果                                    | 15 |
| (2)洋名(命名法)                     | 2  | (3)臨床薬理試験                                  | 15 |
| (3)ステム                         | 2  | (4)探索的試験                                   | 15 |
| 3. 構造式又は示性式                    | 2  | (5)検証的試験                                   | 15 |
| 4. 分子式及び分子量                    | 2  | 1)無作為化並行用量反応試験                             | 15 |
| 5. 化学名(命名法)                    | 2  | 2)比較試験                                     | 15 |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号              | 2  | 3)安全性試験                                    | 15 |
| 7. CAS登録番号                     | 3  | 4)患者・病態別試験                                 | 15 |
| III. 有効成分に関する項目                | 4  | (6)治療の使用                                   | 15 |
| 1. 物理化学的性質                     | 4  | 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) | 15 |
| (1)外観・性状                       | 4  | 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                | 15 |
| (2)溶解性                         | 4  | VI. 薬効薬理に関する項目                             | 16 |
| (3)吸湿性                         | 4  | 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群                       | 16 |
| (4)融点(分解点)、沸点、凝固点              | 4  | 2. 薬理作用                                    | 16 |
| (5)酸塩基解離定数                     | 4  | (1)作用部位・作用機序                               | 16 |
| (6)分配係数                        | 4  | (2)薬効を裏付ける試験成績                             | 16 |
| (7)その他の主な示性値                   | 4  | (3)作用発現時間・持続時間                             | 16 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性           | 4  | VII. 薬物動態に関する項目                            | 17 |
| 3. 有効成分の確認試験法                  | 4  | 1. 血中濃度の推移・測定法                             | 17 |
| 4. 有効成分の定量法                    | 4  | (1)治療上有効な血中濃度                              | 17 |
| IV. 製剤に関する項目                   | 5  | (2)最高血中濃度到達時間                              | 17 |
| 1. 剤形                          | 5  | (3)臨床試験で確認された血中濃度                          | 17 |
| (1)剤形の区別、外観及び性状                | 5  | (4)中毒域                                     | 20 |
| (2)製剤の物性                       | 5  | (5)食事・併用薬の影響                               | 20 |
| (3)識別コード                       | 5  | (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        | 20 |
| (4)pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等 | 5  | 2. 薬物速度論的パラメータ                             | 20 |
| 2. 製剤の組成                       | 5  | (1)解析方法                                    | 20 |
| (1)有効成分(活性成分)の含量               | 5  | (2)吸収速度定数                                  | 20 |
| (2)添加物                         | 5  | (3)バイオアベイラビリティ                             | 20 |
| (3)その他                         | 5  | (4)消失速度定数                                  | 20 |
| 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意            | 5  | (5)クリアランス                                  | 20 |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性             | 6  | (6)分布容積                                    | 20 |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性                | 8  | (7)血漿蛋白結合率                                 | 20 |
| 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)           | 8  | 3. 吸収                                      | 20 |
| 7. 溶出性                         | 9  |  |    |
| 8. 生物学的試験法                     | 13 |  |    |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法              | 13 |  |    |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法               | 13 |  |    |

|                                    |    |                                    |    |
|------------------------------------|----|------------------------------------|----|
| 4. 分布                              | 20 | IX. 非臨床試験に関する項目                    | 26 |
| (1)血液-脳関門通過性                       | 20 | 1. 薬理試験                            | 26 |
| (2)血液-胎盤関門通過性                      | 20 | (1)薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)      | 26 |
| (3)乳汁への移行性                         | 20 | (2)副次的薬理試験                         | 26 |
| (4)髄液への移行性                         | 20 | (3)安全性薬理試験                         | 26 |
| (5)その他の組織への移行性                     | 21 | (4)その他の薬理試験                        | 26 |
| 5. 代謝                              | 21 | 2. 毒性試験                            | 26 |
| (1)代謝部位及び代謝経路                      | 21 | (1)単回投与毒性試験                        | 26 |
| (2)代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種          | 21 | (2)反復投与毒性試験                        | 26 |
| (3)初回通過効果の有無及びその割合                 | 21 | (3)生殖発生毒性試験                        | 26 |
| (4)代謝物の活性の有無及び比率                   | 21 | (4)その他の特殊毒性                        | 26 |
| (5)活性代謝物の速度論的パラメータ                 | 21 | X. 管理的事項に関する項目                     | 27 |
| 6. 排泄                              | 21 | 1. 規制区分                            | 27 |
| (1)排泄部位及び経路                        | 21 | 2. 有効期間又は使用期限                      | 27 |
| (2)排泄率                             | 21 | 3. 貯法・保存条件                         | 27 |
| (3)排泄速度                            | 21 | 4. 薬剤取扱い上の注意点                      | 27 |
| 7. トランスポーターに関する情報                  | 21 | (1)薬局での取扱い上の留意点について                | 27 |
| 8. 透析等による除去率                       | 21 | (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)   | 27 |
| VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目           | 22 | (3)調剤時の留意点について                     | 27 |
| 1. 警告内容とその理由                       | 22 | 5. 承認条件等                           | 27 |
| 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)              | 22 | 6. 包装                              | 27 |
| 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由          | 22 | 7. 容器の材質                           | 28 |
| 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由          | 22 | 8. 同一成分・同効薬                        | 28 |
| 5. 慎重投与内容とその理由                     | 22 | 9. 国際誕生年月日                         | 28 |
| 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法             | 22 | 10. 製造販売承認年月日及び承認番号                | 28 |
| 7. 相互作用                            | 22 | 11. 薬価基準収載年月日                      | 28 |
| (1)併用禁忌とその理由                       | 22 | 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 | 28 |
| (2)併用注意とその理由                       | 23 | 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容         | 28 |
| 8. 副作用                             | 23 | 14. 再審査期間                          | 28 |
| (1)副作用の概要                          | 23 | 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報                | 28 |
| (2)重大な副作用と初期症状                     | 23 | 16. 各種コード                          | 29 |
| (3)その他の副作用                         | 24 | 17. 保険給付上の注意                       | 29 |
| (4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧           | 24 | XI. 文献                             | 30 |
| (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 | 24 | 1. 引用文献                            | 30 |
| (6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法              | 24 | 2. その他の参考文献                        | 30 |
| 9. 高齢者への投与                         | 24 | XII. 参考資料                          | 31 |
| 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与                 | 24 | 1. 主な外国での発売状況                      | 31 |
| 11. 小児等への投与                        | 25 | 2. 海外における臨床支援情報                    | 31 |
| 12. 臨床検査結果に及ぼす影響                   | 25 | XIII. 備考                           | 32 |
| 13. 過量投与                           | 25 | その他の関連資料                           | 32 |
| 14. 適用上の注意                         | 25 |                                    |    |
| 15. その他の注意                         | 25 |                                    |    |
| 16. その他                            | 25 |                                    |    |

# I. 概要に関する項目

---

## 1. 開発の経緯

ロラタジン錠 10mg「JG」及びロラタジン OD 錠 10mg「JG」は、ロラタジンを含む持続性選択 H<sub>1</sub> 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療薬である。

本邦ではロラタジン錠は 2002 年、ロラタジン口腔内速溶錠は 2004 年に販売されている。

本剤は、日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成 17 年 3 月 31 日 薬食発第 0331015 号）」に基づき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行い、2011 年 7 月に製造販売承認を得て、2011 年 11 月に販売開始した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 1 日 1 回投与で効果が得られる。
- (2) 血液-脳関門をほとんど通過しないので、治療量を与えても脳に移行せず、睡眠導入までの時間、脳波および行動テストのような鎮静作用の指標となる効果は、プラセボを与えた場合と同様である。<sup>1)</sup>
- (3) OD 錠は、口腔内で崩壊することから水なしでも服用可能である。
- (4) 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 「JG」
- ・ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」

#### (2) 洋名

- ・Loratadine Tablets 10mg “JG”
- ・Loratadine OD Tablets 10mg “JG”

#### (3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」 より命名

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

ロラタジン（JAN）

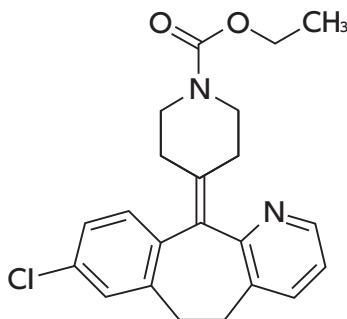
#### (2) 洋名（命名法）

Loratadine（JAN、INN）

#### (3) ステム

三環系ヒスタミン H<sub>1</sub> 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<sub>22</sub>H<sub>23</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>

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 (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

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：波長 245～249nm に吸収の極大を認める。

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

(3) 炎色反応試験法（2）：緑色を呈する。







#### 4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

## 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 「JG」  | ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」  |
|----------|---|---|
| 色・剤形     | 割線の入った白色の円形の素錠  | 白色の素錠   |
| 外形       |    |    |
| 大きさ (mm) | 直径：6.5 厚さ：2.3   | 直径：7.0 厚さ：3.5   |
| 重量 (mg)  | 100   | 140   |

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

- ・ロラタジン錠 10mg 「JG」  
錠剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG 23
- ・ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」  
錠剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG 24

#### (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

- ・ロラタジン錠 10mg 「JG」  
1 錠中 ロラタジン 10mg 含有
- ・ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」  
1 錠中 ロラタジン 10mg 含有

#### (2) 添加物

- ・ロラタジン錠 10mg 「JG」  
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
- ・ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」  
D-マンニトール、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、アスパルテーム (L-フェニルアラニン化合物)、クロスボビドン、ステアリン酸マグネシウム

#### (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

##### ロラタジン錠 10mg 「JG」

###### ◎ 加速試験<sup>2)</sup>

包装形態：PTP 包装

保存条件：40±1°C/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性、溶出試験、定量試験、純度試験

| 試験項目  | 性状  | 確認試験 |     |     | 製剤均一性<br>試験 | 溶出試験<br>(%) | 定量試験<br>(%) | 純度試験  |
|-------|-----|------|-----|-----|-------------|-------------|-------------|-------|
|       |     | (2)  | (3) | (4) |             |             |             |       |
| 規格    | (1) | (2)  | (3) | (4) | (5)         | (6)         | (7)         | (8)   |
| 試験開始時 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合  | 適合          | 101         | 100.7       | N.D.* |
| 1 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合  | —           | 適合          | 100.8       | N.D.* |
| 3 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合  | —           | 適合          | 101.1       | N.D.* |
| 6 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合  | 適合          | 適合          | 99.8        | N.D.* |

(1) 割線の入った白色の円形の素錠

(2) 紫外可視吸光度測定法：波長 245～249nm に吸収の極大を示す。

(3) 薄層クロマトグラフィー：試料溶液から得た主スポット及び標準溶液から得られたスポットの色は青紫色を呈し、それらの  $R_f$  値は等しい。

(4) 塩化物の定性反応を呈する。

(5) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。

(6) 15 分間、80%以上（日局 溶出試験第 1 液 900mL、パドル法、50rpm）

(7) 表示量の 95.0～105.0%

(8) 類縁物質（参考値）

※ 検出せず

最終包装製品を用いた加速試験（40°C、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

◎無包装状態での安定性試験<sup>3)</sup>

試験条件：

- ①温度に対する安定性試験：40℃、3 ヶ月（遮光・気密容器）
- ②湿度に対する安定性試験：25℃/75%RH、3 ヶ月（遮光・開放）
- ③光に対する安定性試験：総照度 60 万 lux・hr、25 日（シャーレ）

試験項目：性状、溶出試験、定量試験、硬度

| 試験項目  |             | 性状   | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) | 硬度    |
|-------|-------------|------|----------|----------|-------|
| 規格    |             | (1)  | (2)      | (3)      | (4)   |
| 試験開始時 |             | 適合   | 101      | 101.4    | 2.9kg |
| ①温度   | 3 ヶ月後       | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     | 変化なし  |
| ②湿度   | 3 ヶ月後       | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     | 変化なし  |
| ③光    | 60 万 lux・hr | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     | 変化なし  |

- (1) 割線の入った白色の円形の素錠
- (2) 15 分間、80%以上（日局 溶出試験第 1 液 900mL、パドル法、50rpm）
- (3) 表示量の 95.0～105.0%
- (4) 参考値

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」

◎加速試験<sup>4)</sup>

包装形態：PTP/アルミピロー包装

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性、崩壊試験、溶出試験、定量試験、純度試験

PTP 包装

| 試験項目  | 性状  | 確認試験 | 製剤均一性試験 | 崩壊試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) | 純度試験  |
|-------|-----|------|---------|------|----------|----------|-------|
| 規格    | (1) | (2)  | (3)     | (4)  | (5)      | (6)      | (7)   |
| 試験開始時 | 適合  | 適合   | 適合      | 適合   | 102      | 100.3    | N.D.* |
| 1 ヶ月後 | 適合  | 適合   | —       | 適合   | 適合       | 100.1    | N.D.* |
| 3 ヶ月後 | 適合  | 適合   | —       | 適合   | 適合       | 100.8    | N.D.* |
| 6 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合      | 適合   | 適合       | 99.8     | N.D.* |

- (1) 白色の素錠
- (2) 紫外可視吸光度測定法（臭化カリウム錠剤法）
- (3) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。
- (4) 90 秒以内に崩壊する。
- (5) 15 分間、80%以上（日局 溶出試験第 1 液 900mL、パドル法、50rpm）
- (6) 表示量の 95.0～105.0%

(7) 類縁物質 (参考値)

※ 検出せず

最終包装製品を用いた加速試験 (40°C、相対湿度 75%、6 ヶ月) の結果、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。

◎ 無包装状態での安定性試験<sup>5)</sup>

試験条件：

- ① 温度に対する安定性試験：40°C、3 ヶ月 (遮光・気密容器)
- ② 湿度に対する安定性試験：25°C/75%RH、3 ヶ月 (遮光・開放)
- ③ 光に対する安定性試験：総照度 60 万 lux・hr、25 日 (シャーレ)

試験項目：性状、崩壊試験、溶出試験、定量試験、硬度

| 試験項目  |             | 性状   | 崩壊試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) | 硬度           |
|-------|-------------|------|------|----------|----------|--------------|
| 規格    |             | (1)  | (2)  | (3)      | (4)      | (5)          |
| 試験開始時 |             | 適合   | 適合   | 101      | 100.2    | 3.9kg        |
| ① 温度  | 3 ヶ月後       | 変化なし | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     | 変化なし         |
| ② 湿度  | 3 ヶ月後       | 変化なし | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     | 変化あり (1.4kg) |
| ③ 光   | 60 万 lux・hr | 変化なし | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     | 変化なし         |

- (1) 割線の入った白色の円形の素錠
- (2) 90 秒以内に崩壊する。
- (3) 15 分間、80%以上 (日局 溶出試験第 1 液 900mL、パドル法、50rpm)
- (4) 表示量の 95.0~105.0%
- (5) 参考値：下記答申では、硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重 (19.6N) 未満の場合、変化あり (規格外) とされている。

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について (答申) 平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

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

【溶出挙動の類似性】

ロラタジン錠 10mg「JG」<sup>6)</sup>

「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1124004号）」に従う。

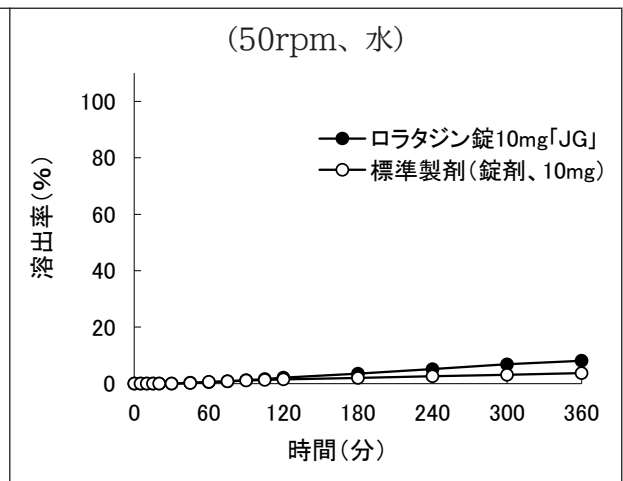
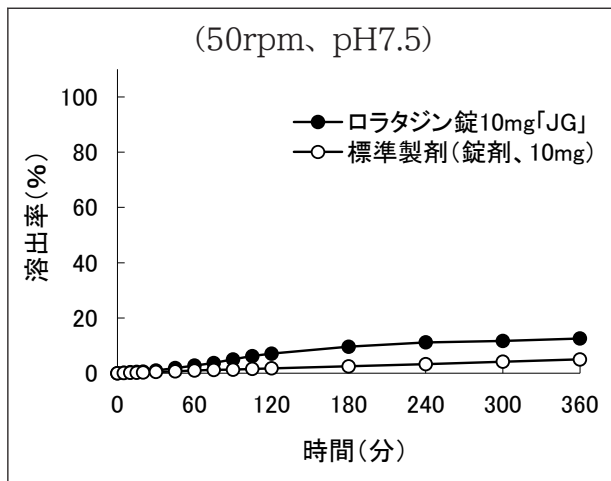
|                         |                        |       |               |                    |
|-------------------------|------------------------|-------|---------------|--------------------|
| 試験方法                    | 日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法） |       |               |                    |
| 試験条件                    | 回転数/試験液                | 50rpm | pH1.2         | 日本薬局方 溶出試験第1液      |
|                         |                        |       | pH6.5         | 薄めた McIlvaine の緩衝液 |
|                         |                        |       | pH7.5         | 薄めた McIlvaine の緩衝液 |
|                         |                        |       | 水             | 日本薬局方 精製水          |
|                         | 100rpm                 | pH1.2 | 日本薬局方 溶出試験第1液 |                    |
| 試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル |                        |       |               |                    |
| 分析法                     | 紫外可視吸光度測定法             |       |               |                    |

### ・判定基準

| 回転数 (rpm) | 試験液   | 判定基準  |
|-----------|-------|---|
| 50        | pH1.2 | 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%の範囲にある。   |
|           | pH6.5 | 標準製剤が規定された試験時間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、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又はf2関数の値が53以上である。 |
|           | pH7.5 |   |
|           | 水     |   |
| 100       | pH1.2 | 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%の範囲にある。   |

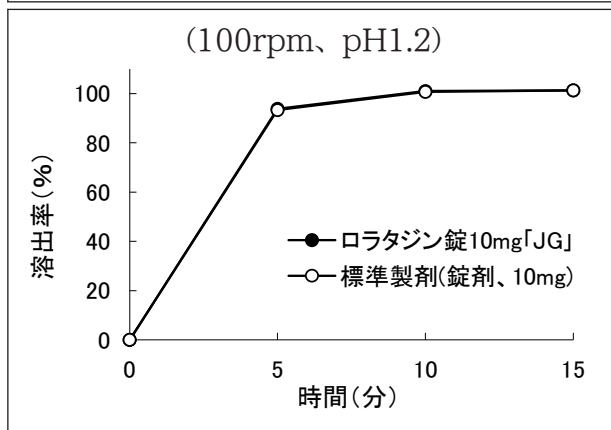
### ・試験結果

|  |  |
|--|--|
| <p>(50rpm、pH1.2)</p> <p>● ロラタジン錠10mg「JG」<br/>○ 標準製剤(錠剤、10mg)</p> | <p>(50rpm、pH6.5)</p> <p>● ロラタジン錠10mg「JG」<br/>○ 標準製剤(錠剤、10mg)</p>             |
| <p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>       | <p>判定時点である154分、360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> |



判定時点である180分、360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。

判定時点である168分、360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。

溶出挙動の類似性の判定 (平均溶出率)

| 回転数 (rpm) | 試験液   | 判定時点 (min) | 平均溶出率 (%)      |                         | 判定 |
|-----------|-------|------------|----------------|-------------------------|----|
|           |       |            | 標準製剤 (錠剤、10mg) | 試験製剤 (ロラタジン錠 10mg 「JG」) |    |
| 50        | pH1.2 | 15         | 96.3           | 101.0                   | 適合 |
|           | pH6.5 | 154        | 3.5            | 8.9                     | 適合 |
|           |       | 360        | 6.9            | 13.5                    |    |
|           | pH7.5 | 180        | 2.5            | 9.6                     | 適合 |
|           |       | 360        | 5.0            | 12.6                    |    |
|           | 水     | 168        | 1.9            | 3.2                     | 適合 |
| 360       |       | 3.7        | 8.1            |                         |    |
| 100       | pH1.2 | 15         | 101.3          | 101.3                   | 適合 |

・ 結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「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ていた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

ロラタジン OD錠 10mg 「JG」<sup>7)</sup>

「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 1124004 号）」に従う。

|                         |                        |       |                 |                    |
|-------------------------|------------------------|-------|-----------------|--------------------|
| 試験方法                    | 日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法） |       |                 |                    |
| 試験条件                    | 回転数/試験液                | 50rpm | pH1.2           | 日本薬局方 溶出試験第 1 液    |
|                         |                        |       | pH5.5           | 薄めた McIlvaine の緩衝液 |
|                         |                        |       | pH6.8           | 日本薬局方 溶出試験第 2 液    |
|                         |                        |       | 水               | 日本薬局方 精製水          |
|                         | 100rpm                 | pH1.2 | 日本薬局方 溶出試験第 1 液 |                    |
| 試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル |                        |       |                 |                    |
| 分析法                     | 紫外可視吸光度測定法             |       |                 |                    |

・ 判定基準

| 回転数 (rpm) | 試験液   | 判定基準   |
|-----------|-------|--|
| 50        | pH1.2 | 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%の範囲にある。   |
|           | pH5.5 | 標準製剤が規定された試験時間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、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である |
|           | pH6.8 |  |
|           | 水     |  |
| 100       | pH1.2 | 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%の範囲にある。   |



・試験結果

|   |   |
|---|---|
| <p>(50rpm、pH1.2)</p> <p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>                 | <p>(50rpm、pH5.5)</p> <p>判定時点である3分、360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> |
| <p>(50rpm、pH6.8)</p> <p>判定時点である3分、360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> | <p>(50rpm、水)</p> <p>判定時点である3分、360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>     |
| <p>(100rpm、pH1.2)</p> <p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>                |   |

溶出挙動の類似性の判定（平均溶出率）

| 回転数<br>(rpm) | 試験液   | 判定<br>時点<br>(min) | 平均溶出率 (%)     |                               | 判定 |
|--------------|-------|-------------------|---------------|-------------------------------|----|
|              |       |                   | 標準製剤（錠剤、10mg） | 試験製剤（ロラタジン OD<br>錠 10mg 「JG」） |    |
| 50           | pH1.2 | 15                | 100.4         | 101.5                         | 適合 |
|              | pH5.5 | 3                 | 9.8           | 15.6                          | 適合 |
|              |       | 360               | 27.6          | 31.5                          |    |
|              | pH6.8 | 3                 | 7.4           | 8.5                           | 適合 |
|              |       | 360               | 17.5          | 17.8                          |    |
|              | 水     | 3                 | 9.4           | 10.3                          | 適合 |
| 360          |       | 22.4              | 23.2          |                               |    |
| 100          | pH1.2 | 15                | 101.1         | 100.2                         | 適合 |

・ 結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「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ていた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

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

・ ロラタジン錠 10mg 「JG」

(1) 紫外可視吸光度測定法：波長 245～249nm に吸収の極大を認める。

(2) 薄層クロマトグラフィー：試料溶液から得た主スポット及び標準溶液から得られたスポットの色は青紫色を呈し、それらの  $R_f$  値は等しい。

(3) 塩化物の定性反応

・ ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

10. 製剤中の有効成分の定量法

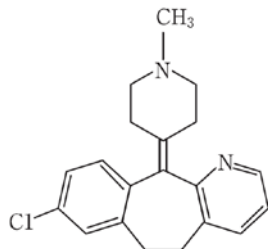
液体クロマトグラフィー

11. 力価

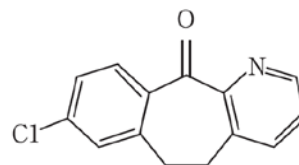
該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

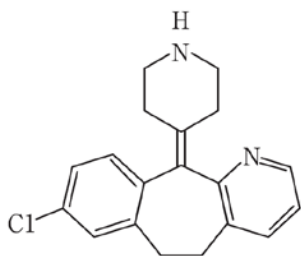
- 合成工程混入物（合成中間体）  
4-(8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-*b*]pyridin-11-ylidene)-1-methylpiperidine



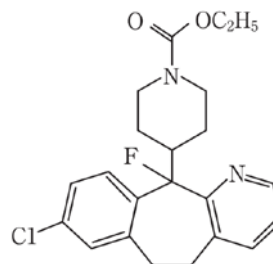
- 分解物  
8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-*b*]pyridin-11-one



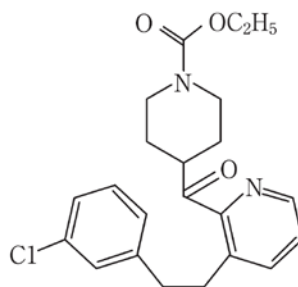
- 分解物  
4-(8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-*b*]pyridin-11-ylidene)piperidine



- 合成工程混入物（副生成物）  
Ethyl 4-(8-chloro-11-fluoro-6,11-dihydro-5*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-*b*]pyridin-11-yl)-1-piperidinecarboxylate



- 合成工程混入物（副生成物）  
Ethyl 4-[[3-[2-(3-chlorophenyl)ethyl]-2-pyridinyl]carbonyl]-1-piperidinecarboxylate



## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

## 14. その他

該当しない

## 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、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

### 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「JG」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 H<sub>1</sub> 受容体拮抗剤（フェキソフェナジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、ベポタスチンベシル酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エメダスチンフマル酸塩 等）

### 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

健康成人男子

| 薬剤名                  | 投与量                      | 投与方法   | Tmax (hr) |
|----------------------|--------------------------|--------|-----------|
| ロラタジン錠<br>10mg「JG」   | 1錠<br>(ロラタジンとして<br>10mg) | —      | 2.3±1.4   |
| ロラタジンOD錠<br>10mg「JG」 |                          | 水で服用   | 1.5±1.0   |
|                      |                          | 水なしで服用 | 2.0±1.0   |

(Mean±S.D.,n=16)

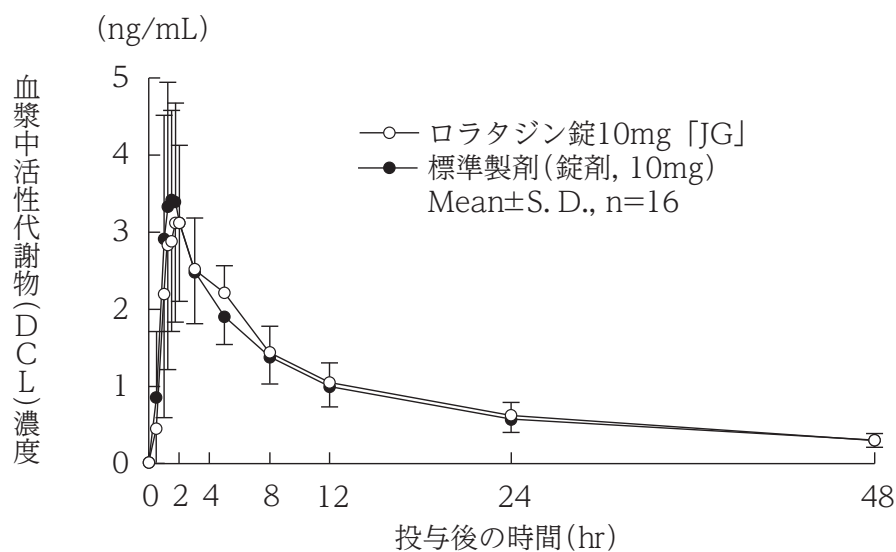
#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 【生物学的同等性試験】

「医薬品の臨床試験の実施の基準に関する省令（平成9年3月27日 厚生省令第28号）」、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン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）」に従う。

#### ロラタジン錠10mg「JG」<sup>8)</sup>

ロラタジン錠10mg「JG」と標準製剤を、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descarboethoxyloratadine（DCL）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。



<薬物動態パラメータ>

|                   | 判定パラメータ                           |                 | 参考パラメータ      |                          |
|-------------------|-----------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
|                   | AUC <sub>0-48</sub><br>(ng·hr/mL) | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| ロラタジン錠 10mg 「JG」  | 42.6±8.7                          | 3.7±1.3         | 2.3±1.4      | 20.5±3.5                 |
| 標準製剤<br>(錠剤、10mg) | 40.8±9.6                          | 3.8±1.4         | 1.6±0.5      | 21.6±3.8                 |

(Mean±S.D.,n=16)

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。

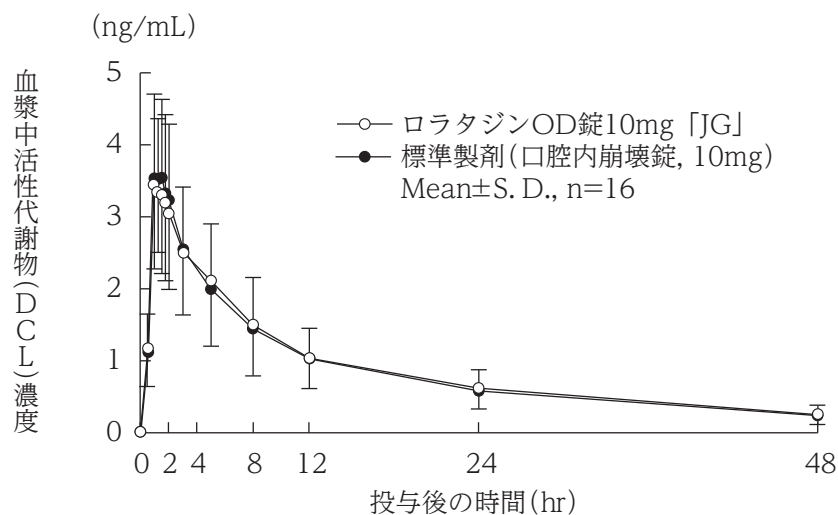
<同等性の判定結果>

|         | AUC <sub>0-48</sub>          | Cmax                           |
|---------|------------------------------|--------------------------------|
| 90%信頼区間 | log (0.999436) ~log (1.1001) | log (0.865814) ~log (1.107173) |

ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」<sup>9)</sup>

1) 水で服用

ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」と標準製剤を、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）健康成人男子に水 150mL と共に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物（DCL）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。



<薬物動態パラメータ>

|                         | 判定パラメータ                           |                 | 参考パラメータ      |                          |
|-------------------------|-----------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
|                         | AUC <sub>0-48</sub><br>(ng·hr/mL) | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| ロラタジン OD 錠<br>10mg 「JG」 | 42.7±17.4                         | 3.9±1.2         | 1.5±1.0      | 17.2±2.5                 |
| 標準製剤<br>(口腔内崩壊錠、10mg)   | 41.8±16.0                         | 3.9±1.1         | 1.4±0.4      | 17.0±2.1                 |

(Mean±S.D.,n=16)

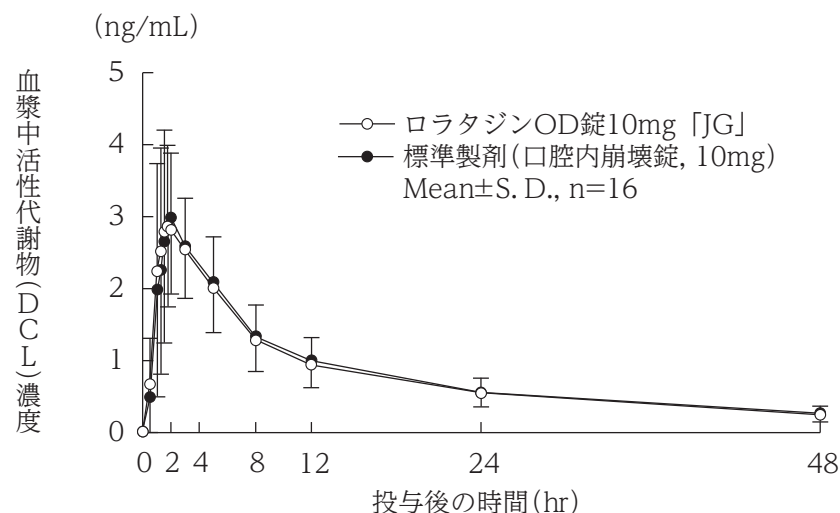
血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<同等性の判定結果>

|         | AUC <sub>0-48</sub>               | Cmax                               |
|---------|-----------------------------------|------------------------------------|
| 90%信頼区間 | log (0.926701) ~<br>log (1.08988) | log (0.937638) ~<br>log (1.081535) |

## 2) 水なしで服用

ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」と標準製剤を、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）健康成人男子に水なしで絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物（DCL）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。



<薬物動態パラメータ>

|                         | 判定パラメータ                           |                 | 参考パラメータ      |                          |
|-------------------------|-----------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
|                         | AUC <sub>0-48</sub><br>(ng·hr/mL) | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| ロラタジン OD 錠<br>10mg 「JG」 | 38.4±9.3                          | 3.4±0.9         | 2.0±1.0      | 18.7±3.0                 |
| 標準製剤<br>(口腔内崩壊錠、10mg)   | 39.6±11.2                         | 3.5±1.0         | 2.1±1.3      | 18.9±2.7                 |

(Mean±S.D.,n=16)

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。

<同等性の判定結果>

|         | AUC <sub>0-48</sub>                | Cmax                               |
|---------|------------------------------------|------------------------------------|
| 90%信頼区間 | log (0.920098) ~<br>log (1.036217) | log (0.941216) ~<br>log (1.061096) |



#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 7. 相互作用」の項参照

#### (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

健康成人男子

| 薬剤名                  | 投与量                      | 投与方法         |        | kel (hr <sup>-1</sup> ) |
|----------------------|--------------------------|--------------|--------|-------------------------|
| ロラタジン錠<br>10mg「JG」   | 1錠<br>(ロラタジンと<br>して10mg) | 絶食単回<br>経口投与 | —      | 0.03473±0.00603         |
| ロラタジンOD錠<br>10mg「JG」 |                          |              | 水で服用   | 0.04104±0.00565         |
|                      |                          |              | 水なしで服用 | 0.03789±0.00587         |

(Mean±S.D.,n=16)

#### (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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

#### (3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 13. 過量投与」の項参照

## 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 - 2. 用法及び用量」の項参照

### 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（「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

**重要な基本的注意**

(1) 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。

(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）   |   |  |
|-------------------|---|--|
| 薬剤名等              | 臨床症状・措置方法   | 機序・危険因子  |
| エリスロマイシン<br>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（頻度不明）

##### 1) ショック、アナフィラキシー

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

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

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

AST (GOT)、ALT (GPT)、 $\gamma$ -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  | 胃炎、腹痛、口渇、嘔気・嘔吐、下痢、便秘、口唇乾燥、口内炎  |
| 過敏症  | 発赤、発疹、蕁麻疹、紅斑、瘙痒  |
| 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、 $\gamma$ -GTP 上昇                      |
| 腎臓   | 尿閉、蛋白尿、BUN 上昇  |
| 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  | 不正子宮出血、胸痛、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                            |

#### (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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 -2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）、-8. 副作用（2）重大な副作用と初期症状、-（3）その他の副作用「過敏症」の項参照

### 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婦人には、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、動物試験（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) 授乳中の婦人には、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) ロラタジン錠 10mg 「JG」

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、更には穿孔をお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) ロラタジンOD錠 10mg 「JG」

1) 薬剤交付時：

①PTP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よう指導すること。

2) 服用時：

本剤は舌の上のにせ唾液を湿潤させ、唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

## 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     | ロラタジン錠 10mg「JG」<br>ロラタジン OD 錠 10mg「JG」 | 該当しない<br>(処方箋医薬品以外の医薬品である) |
| 有 効 成 分 | ロラタジン                                  | 該当しない                      |

※注意－医師等の処方箋により使用すること

### 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

室温保存、気密容器

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

#### (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）

「V. 治療に関する項目 -2. 用法及び用量、VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目-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

##### 【取扱い上の注意】

##### 1. 保存方法

ロラタジン OD 錠 10mg「JG」

(1) 使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。

(2) アルミピロー開封後は湿気を避けて保存すること。

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

・ロラタジン錠 10mg「JG」

PTP：100錠（10錠×10）、500錠（10錠×50）

・ロラタジン OD 錠 10mg「JG」

PTP：100錠（10錠×10）



## 7. 容器の材質

- ・ ロラタジン錠 10mg 「JG」  
PTP 包装：ポリ塩化ビニルフィルム・アルミニウム箔 (PTP)、紙箱
- ・ ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」  
PTP 包装：ポリ塩化ビニルフィルム・アルミニウム箔 (PTP)、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム (ピロー)、紙箱

## 8. 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 (バイエル薬品=塩野義)  
同効薬：エバスチン、ケトチフェンフマル塩酸、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩 等

## 9. 国際誕生年月日

該当しない

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

| 販売名                  | 製造販売承認年月日       | 承認番号             |
|----------------------|-----------------|------------------|
| ロラタジン錠 10mg 「JG」     | 2011 年 7 月 15 日 | 22300AMX00996000 |
| ロラタジン OD 錠 10mg 「JG」 | 2011 年 7 月 15 日 | 22300AMX00995000 |

## 11. 薬価基準収載年月日

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

承認年月日：2012 年 2 月 2 日

効能・効果の内容：小児に対する用法及び用量を追加した。

## 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、投薬（あるいは投与）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                 | HOT (9桁) 番号 | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | レセプト電算<br>コード |
|---------------------|-------------|-----------------------|---------------|
| ロラタジン錠 10mg「JG」     | 121095801   | 4490027F1065          | 622109501     |
| ロラタジン OD 錠 10mg「JG」 | 121096501   | 4490027F2070          | 622109601     |

## 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) 高折修二 他監訳：グッドマン・ギルマン薬理書（上）第10版、830（2003）、廣川書店
- 2) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン錠 10mg「JG」の加速試験（2011）
- 3) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン錠 10mg「JG」の無包装状態での安定性試験（2011）
- 4) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン OD 錠 10mg「JG」の加速試験（2011）
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン OD 錠 10mg「JG」の無包装状態での安定性試験（2011）
- 6) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン錠 10mg「JG」の溶出試験（2011）
- 7) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン OD 錠 10mg「JG」の溶出試験（2011）
- 8) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン錠 10mg「JG」の生物学的同等性試験（2011）
- 9) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
ロラタジン OD 錠 10mg「JG」の生物学的同等性試験（2011）

## 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

妊婦に関する海外情報 (FDA、オーストラリア分類)

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA、オーストラリア分類とは異なる。

#### 【使用上の注意】「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、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、動物試験 (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) 授乳中の婦人には、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。]

|   | 分類           |
|---|--------------|
| FDA : Pregnancy Category  | B (2010年3月)  |
| ADEC :<br>(An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy) | B1 (2011年5月) |

参考：分類の概要

FDA : Pregnancy Category

B : Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus, but there are no adequate and well controlled studies of pregnant women. Or animal studies demonstrate a risk, and adequate and well-controlled studies in pregnant women have not been done during the first trimester.

ADEC : (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

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

---

その他の関連資料

該当資料なし

*Memo*

*Memo*



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目9番1号