

## 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 OD 錠 10mg「トーフ」

LORATADINE OD TABLETS 10 mg “TOWA”

《ロラタジン口腔内崩壊錠》

### ロラタジン DS1%「トーフ」

LORATADINE DS1% “TOWA”

《ロラタジンドライシロップ》

製 品 名	ロラタジン OD 錠 10mg「トーフ」	ロラタジン DS1%「トーフ」
剤 形	口腔内崩壊錠	シロップ用剤(ドライシロップ)
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 含有	1g 中 ロラタジン 10mg 含有
一 般 名	和 名：ロラタジン (JAN) 洋 名：Loratadine (JAN)	
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：東和薬品株式会社	
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	電話番号： FAX：	
問 い 合 わ せ 窓 口	東和薬品株式会社 学術部 DI センター(24時間受付対応)  0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797 <a href="http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff">http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff</a>	

本 IF は 2017 年 1 月改訂[第 6 版(OD 錠)、処方箋医薬品の指定解除に伴う改訂] 及び 2017 年 1 月改訂[第 6 版(DS)、処方箋医薬品の指定解除に伴う改訂]の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は医薬品医療機器情報提供ホームページ

<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の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.pmda.go.jp/>)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 を掲載する医薬品情報提供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 が添付文書を保管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、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供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、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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供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

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、今後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)

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	27
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	27
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	27
II. 名称に関する項目	3	3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	27
1. 販売名	3	4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	27
2. 一般名	3	5. 慎重投与内容とその理由	27
3. 構造式又は示性式	3	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	27
4. 分子式及び分子量	3	7. 相互作用	27
5. 化学名(命名法)	4	8. 副作用	28
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	9. 高齢者への投与	29
7. CAS登録番号	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	29
III. 有効成分に関する項目	5	11. 小児等への投与	30
1. 物理化学的性質	5	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	30
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6	13. 過量投与	30
3. 有効成分の確認試験法	6	14. 適用上の注意	30
4. 有効成分の定量法	6	15. その他の注意	30
IV. 製剤に関する項目	7	16. その他	30
1. 剤形	7	IX. 非臨床試験に関する項目	31
2. 製剤の組成	7	1. 薬理試験	31
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	8	2. 毒性試験	31
4. 製剤の各種条件下における安定性	8	X. 管理的事項に関する項目	32
5. 調製法及び溶解後の安定性	11	1. 規制区分	32
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	2. 有効期間又は使用期限	32
7. 溶出性	12	3. 貯法・保存条件	32
8. 生物学的試験法	16	4. 薬剤取扱い上の注意点	32
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	17	5. 承認条件等	32
10. 製剤中の有効成分の定量法	17	6. 包装	32
11. 力価	17	7. 容器の材質	33
12. 混入する可能性のある夾雑物	17	8. 同一成分・同効薬	33
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	17	9. 国際誕生年月日	33
14. その他	17	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	33
V. 治療に関する項目	18	11. 薬価基準収載年月日	33
1. 効能・効果	18	12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	34
2. 用法・用量	18	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	34
3. 臨床成績	18	14. 再審査期間	34
VI. 薬効薬理に関する項目	20	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	34
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	20	16. 各種コード	35
2. 薬理作用	20	17. 保険給付上の注意	35
VII. 薬物動態に関する項目	21	XI. 文 献	36
1. 血中濃度の推移・測定法	21	1. 引用文献	36
2. 薬物速度論的パラメータ	24	2. その他の参考文献	36
3. 吸収	25	XII. 参考資料	36
4. 分布	25	1. 主な外国での発売状況	36
5. 代謝	25	2. 海外における臨床支援情報	36
6. 排泄	26	XIII. 備 考	36
7. トランスポーターに関する情報	26	その他の関連資料	36
8. 透析等による除去率	26		

---

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ロラタジン口腔内崩壊錠及びロラタジンドライシロップは持続性選択H<sub>1</sub>受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では2004年(口腔内崩壊錠)及び2008年(ドライシロップ)にそれぞれ上市されている。東和薬品株式会社が後発医薬品として、ロラタジンOD錠10mg「トーワ」及びロラタジンDS1%「トーワ」の開発を企画し、薬食発第0331015号(平成17年3月31日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2011年7月にそれぞれ承認を取得、2011年11月に発売した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

#### 臨床的特性

**有用性：**ロラタジンOD錠10mg「トーワ」は、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)に伴うそう痒に対して、通常、成人にロラタジンとして1回10mgを1日1回、食後に経口投与、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ことにより、有用性が認められている。

ロラタジンDS1%「トーワ」は、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)に伴うそう痒に対して、通常、成人にロラタジンとして1回10mg(ドライシロップとして1g)を1日1回、食後に用時懸濁して経口投与、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、食後に用時懸濁して経口投与することにより、有用性が認められている。

**安全性：**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。

副作用として、眠気等が報告されている。〔Ⅷ. 8. (3) その他の副作用の項を参照〕

重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーを起こすことがある。てんかん、痙攣、肝機能障害、黄疸があらわれることがある。〔Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状の項を参照〕

---

## 製剤的特性

### ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」

- ・ 東和薬品独自の口腔内崩壊錠製剤技術である RACTAB 技術を採用。錠剤硬度が高く、自動分包機による一包化も可能。普通錠同様に取り扱いやすく、水なしでも飲める服用利便性を有する OD 錠。
- ・ 製品名・含量を PTP シートへ 1 錠ごとに表示するとともに、独自のデザインで他製品との識別性を向上させるなど、包装デザインを工夫。患者が一目で薬効を認識できるよう「アレルギー性疾患の薬」と表示。さらに、「口腔内崩壊錠」及び「GS1-RSS コード」を表示。
- ・ プラスチックボトル入りのバラ包装のラベルに、必要時に切り取ってキャップに貼付できる“キャップ貼付ラベル”を採用。

### ロラタジン DS1% 「トーワ」

- ・ 甘味を有し、水に速やかに分散。
- ・ 患者が一目で薬効を認識できるよう、分包シートに「アレルギー性疾患の薬」と表示。また、QR コードを表示し、携帯電話でアクセスすることで医薬品情報の入手が可能。さらに、「GS1-RSS コード」を表示。
- ・ プラスチックボトル入りのバラ包装のラベルに、必要時に切り取ってキャップに貼付できる“キャップ貼付ラベル”を採用。

---

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ロラタジン OD 錠 10 mg 「トーワ」

ロラタジン DS1% 「トーワ」

#### (2) 洋名

LORATADINE OD TABLETS 10 mg “TOWA”

LORATADINE DS1% “TOWA”

#### (3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格(含量)＋「トーワ」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

### 2. 一般名

#### (1) 和名(命名法)

ロラタジン(JAN)

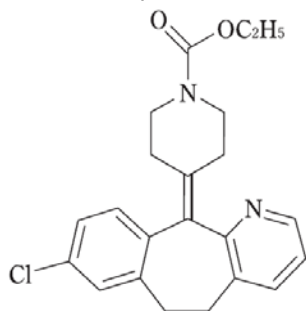
#### (2) 洋名(命名法)

Loratadine (JAN、INN)

#### (3) ステム

-tadine : 三環系ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗薬

### 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

該当しない

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

溶 媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	溶 解 性
メタノール	1mL 以上    10mL 未満	溶けやすい
エタノール(99.5)	1mL 以上    10mL 未満	溶けやすい
酢酸(100)	1mL 以上    10mL 未満	溶けやすい
水	10000mL 以上	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(2)




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

製品名	ロラタジン OD 錠 10mg「トーワ」		
剤形の区別	口腔内崩壊錠		
性状	白色の割線入りの口腔内崩壊錠		
識別コード	本体	Tw337	
	包装		
外形	表	裏	側面
			
錠径(mm)	6.5		
厚さ(mm)	2.9		
質量(mg)	100		

製品名	ロラタジン DS1%「トーワ」
剤形の区別	シロップ用剤(ドライシロップ)
性状	白色の粉末を含む粒子。分包品もある。

#### (2) 製剤の物性

製品名	ロラタジン OD 錠 10mg「トーワ」
硬度	60.1N(6.1kg 重)
摩損度	0.07%

#### (3) 識別コード

(1) 剤形の区別、外観及び性状の項を参照

#### (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 OD 錠 10mg「トーワ」

1 錠中 ロラタジン 10mg を含有する。

ロラタジン DS1%「トーワ」

1g 中 ロラタジン 10mg を含有する。

(2) 添加物

ロラタジン OD錠 10mg 「トーワ」

使用目的	添加物
賦形剤	D-マンニトール
結合剤	ヒドロキシプロピルセルロース
香料	香料
滑沢剤	軽質無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg

その他 3成分

ロラタジン DS1% 「トーワ」

使用目的	添加物
賦形剤	白糖
結合剤	ヒドロキシプロピルセルロース
滑沢剤	含水二酸化ケイ素

(3) その他

該当資料なし

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

(1) 加速試験

ロラタジン OD錠 10mg 「トーワ」<sup>1)</sup>

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6箇月
性状	白色の割線入りの 口腔内崩壊錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
崩壊時間(秒)	22～32	21～34
溶出率(%)	79.3～104.8	95.9～105.8
含量(%)	99.75～102.48	98.68～101.86

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6箇月
性状	白色の割線入りの 口腔内崩壊錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
崩壊時間(秒)	22~32	20~37
溶出率(%)	79.3~104.8	85.8~107.1
含量(%)	99.75~102.48	97.84~101.39

ロラタジン DS1%「トーワ」<sup>2)</sup>

包装形態：分包包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6箇月
性状	白色の粉末を含む粒子	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	95.6~99.1	95.1~100.6
含量(%)	100.1~101.1	98.8~99.3

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品(乾燥剤入り)

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6箇月
性状	白色の粉末を含む粒子	同左
確認試験	適合	同左
溶出率(%)	95.6~99.1	95.1~99.7
含量(%)	100.1~101.1	99.0~99.9

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 箇月)の結果、ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」及びロラタジン DS1%「トーワ」は通常の市場流通下においてそれぞれ 3 年間安定であることが推測された。

## (2) 無包装状態における安定性

### ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」<sup>3)</sup>

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
硬度	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：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)」に準じて試験を実施した。

### ロラタジン DS1% 「トーワ」<sup>4)</sup>

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：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)」に準じて試験を実施した。

## (3) 自動分包機落下試験

### ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」<sup>5)</sup>

分包機名：湯山製作所製 全自動錠剤分包機(YS-TR-260FDS II)

試験方法：ローターカセット位置を構造上最も負荷がかかると考えられる最上段(6 段目)及び負荷のかかりにくいと考えられる最下段(1 段目)に設定し分包を行った。判定は目視にて割れ欠けの有無を確認した。

結 果：

ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」	1 包中に 5 錠包装		1 包中に 1 錠包装	
	1 段目	6 段目	1 段目	6 段目
開始時	0/50 包	0/50 包	0/50 包	0/50 包
25℃75%RH・5 日間	0/50 包	0/50 包	0/50 包	0/50 包

(1 包中割れ欠けが目視で認められた錠剤数 / 分包数)

ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」は吸湿条件の有無に関わらず全ての条件で割れ欠けを認める錠剤はなかった。

ただし、ローターカセット内部には目視で確認できる程度の粉の付着が認められた。

まとめ：ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」について自動分包機落下試験を行った結果、目視で分かるレベルの錠剤の割れ欠けは認められなかった。

ただし、口腔内崩壊錠についてはわずかではあるが粉立ちが避けられないので、定期的なローターカセット内の清掃が必要と考えられ、落下の衝撃を少なくするためにもローターカセット位置はなるべく下段にすることが望ましい。

## 5. 調製法及び溶解後の安定性

### 懸濁後の安定性<sup>6)</sup>

#### ロラタジン DS1% 「トーワ」

調製方法：本品 1g をとり、水 10mL を加えて懸濁させたものを気密容器(耐圧瓶)に入れ、検体とした。

試験条件：25°C、60%RH、1ロット(n=3)

試験項目	開始時	1日	3日	7日
性状	白濁した懸濁液	同左	同左	同左
pH	5.795～5.871	5.805～5.898	5.902～5.925	5.909～6.064
含量(%)	100.2～100.7	101.0～103.9	99.3～100.7	99.2～99.4

調製方法：本品 1g をとり、水 10mL を加えて懸濁させたものを気密容器(耐圧瓶)に入れ、検体とした。

試験条件：5°C、1ロット(n=3)

試験項目	開始時	1日	3日	7日
性状	白濁した懸濁液	同左	同左	同左
pH	5.795～5.871	5.848～5.887	5.866～5.905	5.788～5.962
含量(%)	100.2～100.7	98.6～101.9	99.1～100.3	98.6～101.5

ロラタジン DS1% 「トーワ」の 0.1g/mL 懸濁液について、25°C、相対湿度 60%及び 5°Cにおいて 7日間保存したとき、性状、pH 及び含量に著明な変化は認められなかった。

## 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

---

## 7. 溶出性

### (1) 規格及び試験方法

#### ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」<sup>7)</sup>

ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：溶出試験第 1 液 900mL

回転数：50rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：15 分間の溶出率が 85%以上のときは適合とする。

#### ロラタジン DS1% 「トーワ」<sup>8)</sup>

ロラタジン DS1% 「トーワ」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：pH4.0 の薄めた McIlvaine 緩衝液 900mL

回転数：50rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：15 分間の溶出率が 85%以上のときは適合とする。



(2) 生物学的同等性試験

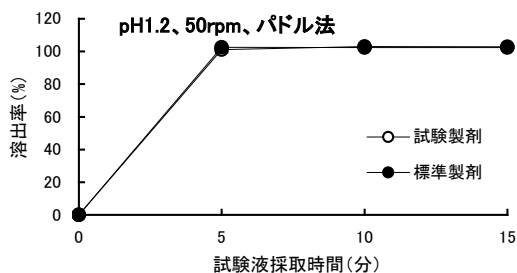
ロラタジン OD錠 10mg「トーワ」<sup>9)</sup>

「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 薬食審査発第 1124004 号)(以下、ガイドライン)に従い、溶出試験を行った。

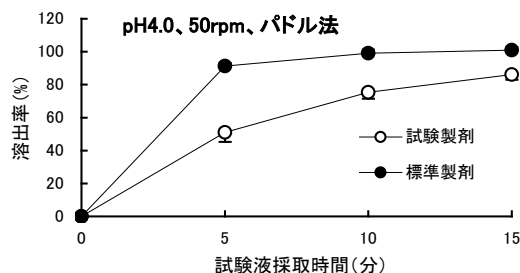
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH4.0、pH6.8、水  
 回転数 : 50rpm、100rpm  
 試験製剤 : ロラタジンOD錠10mg「トーワ」

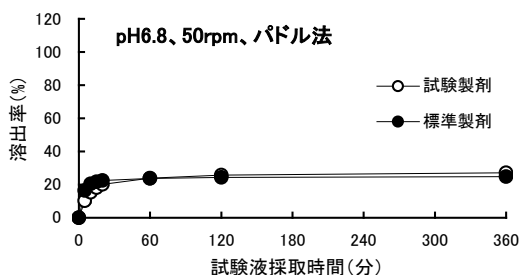
検体数 : n=12  
 試験法 : パドル法  
 標準製剤 : OD錠、10mg



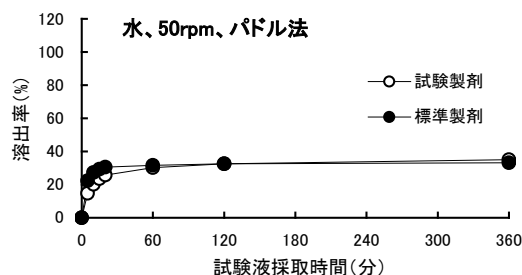
時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	101.1	103.0	102.9
標準偏差	0	1.7	1.1	1.1
標準製剤	0	102.5	102.4	102.4
標準偏差	0	1.0	1.0	1.0



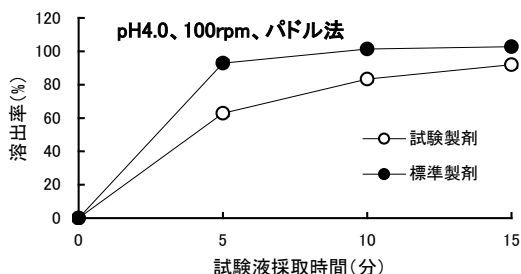
時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	51.1	75.4	86.2
標準偏差	0	5.8	4.0	3.2
標準製剤	0	91.3	99.1	101.0
標準偏差	0	1.8	2.1	1.7



時間(分)	0	5	10	15	20	60	120	360
試験製剤	0	10.2	15.3	18.2	20.1	23.9	25.7	27.1
標準偏差	0	1.2	0.8	0.6	0.5	0.2	0.2	0.4
標準製剤	0	16.5	20.4	21.7	22.5	23.7	24.4	24.8
標準偏差	0	0.6	0.4	0.4	0.3	0.3	0.3	0.3



時間(分)	0	5	10	15	20	60	120	360
試験製剤	0	14.7	20.2	23.6	25.7	30.2	32.6	35.1
標準偏差	0	1.0	0.7	0.6	1.4	0.8	0.8	0.9
標準製剤	0	22.3	27.3	29.3	30.5	31.7	32.6	33.2
標準偏差	0	0.5	0.5	0.5	0.4	0.3	0.3	0.6



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	62.8	83.4	92.0
標準偏差	0	1.7	1.6	1.9
標準製剤	0	92.9	101.3	102.7
標準偏差	0	2.0	1.2	1.0

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率 (%)		平均溶出率の差(%)	f <sub>2</sub> 値	判定
回転数	試験液	採取時間	標準製剤 (OD錠、10mg)	ロラタジンOD錠 10mg「トーワ」			
50rpm	pH1.2	15分	102.4	102.9	0.5	/	適
	pH4.0	15分	101.0	86.2	-14.8		適
	pH6.8	5分	16.5	10.2	/	66.5	適
		10分	20.4	15.3			
		15分	21.7	18.2			
		20分	22.5	20.1			
	水	5分	22.3	14.7	/	59.4	適
		10分	27.3	20.2			
		15分	29.3	23.6			
		20分	30.5	25.7			
100rpm	pH4.0	15分	102.7	92.0	-10.7	/	適

(n=12)

判定基準

[pH1.2、pH4.0(各 50rpm)、pH4.0(100rpm)]

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：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。

[pH6.8、水(各 50rpm)]

標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間(360分)において 50%に達しない場合：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 f<sub>2</sub>関数の値は 53 以上である。

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

従って、ロラタジン OD 錠 10mg「トーワ」と、標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

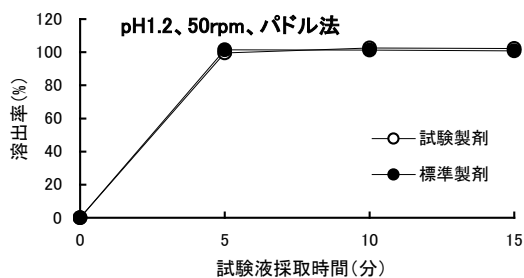
ロラタジン DS1% 「トーワ」<sup>10)</sup>

「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 薬食審査発第 1124004 号)(以下、ガイドライン)に従い、溶出試験を行った。

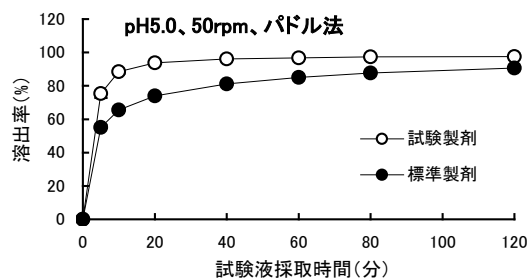
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水  
 回転数 : 50rpm、100rpm  
 試験製剤 : ロラタジンDS1%「トーワ」

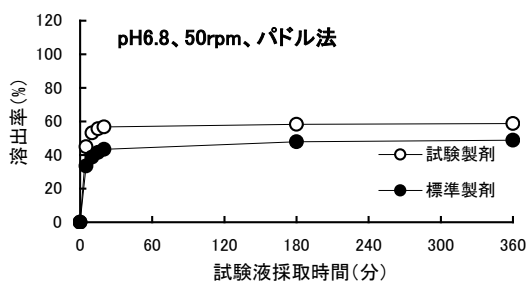
検体数 : n=12  
 試験法 : パドル法  
 標準製剤 : シロップ用剤、10mg/g



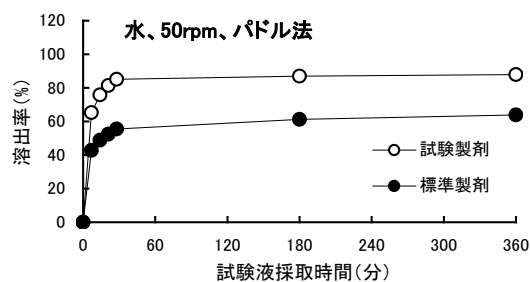
時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	99.6	102.6	102.3
標準偏差	0	1.1	0.5	0.5
標準製剤	0	101.5	101.3	100.8
標準偏差	0	0.6	0.6	0.8



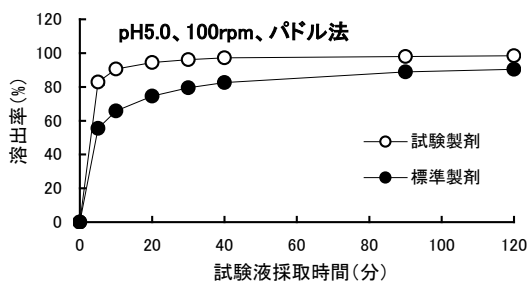
時間(分)	0	5	10	20	40	60	80	120
試験製剤	0	75.3	88.5	93.8	96.2	96.8	97.4	97.6
標準偏差	0	2.6	1.2	0.5	0.6	0.7	0.8	1.2
標準製剤	0	55.1	65.6	73.9	81.1	85.0	87.7	90.6
標準偏差	0	1.5	0.8	0.7	0.5	0.4	0.5	0.8



時間(分)	0	5	10	15	20	180	360
試験製剤	0	45.0	53.2	55.6	56.8	58.3	58.8
標準偏差	0	1.3	1.1	1.0	0.6	0.4	0.3
標準製剤	0	33.5	38.8	41.5	43.4	47.9	48.9
標準偏差	0	0.5	0.4	0.4	0.4	0.3	0.4



時間(分)	0	7	14	21	28	180	360
試験製剤	0	65.2	75.8	81.4	85.1	87.0	87.9
標準偏差	0	0.5	1.0	0.9	1.2	0.8	1.6
標準製剤	0	42.8	48.8	52.4	55.5	61.2	63.8
標準偏差	0	0.8	0.5	0.6	0.7	0.7	0.6



時間(分)	0	5	10	20	30	40	90	120
試験製剤	0	82.8	90.6	94.4	96.1	97.2	98.0	98.5
標準偏差	0	1.5	0.9	1.0	0.7	0.8	1.0	1.0
標準製剤	0	55.5	65.7	74.5	79.5	82.6	88.9	90.4
標準偏差	0	1.2	1.0	1.2	1.1	1.1	0.7	0.9

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率 (%)		平均溶出率の差(%)	f <sub>2</sub> 値	判定
回転数	試験液	採取時間	標準製剤 (シロップ用剤、10mg/g)	ロラタジンDS1% 「トーワ」			
50rpm	pH1.2	15分	100.8	102.3	1.5	41.7	不適
		20分	73.9	93.8			
	pH5.0	40分	81.1	96.2			
		60分	85.0	96.8			
		80分	87.7	97.4			
		5分	33.5	45.0			
	pH6.8	10分	38.8	53.2			
		15分	41.5	55.6			
		20分	43.4	56.8			
		水	7分	42.8		65.2	
	14分		48.8	75.8			
	21分		52.4	81.4			
28分	55.5		85.1				
100rpm	pH5.0	10分	65.7	90.6	35.6	不適	
		20分	74.5	94.4			
		30分	79.5	96.1			
		40分	82.6	97.2			

(n=12)

判定基準

〔pH1.2(50rpm)〕

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：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。

〔pH5.0(50rpm 及び 100rpm)〕

標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間(360分)において 85%以上となる場合：標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 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±15%の範囲にあるか、又は f<sub>2</sub> 関数の値は 42 以上である。

〔pH6.8(50rpm)〕

標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間(360分)において 50%に達しない場合：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 f<sub>2</sub> 関数の値は 53 以上である。

---

[水(50rpm)]

標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間(360分)において50%以上85%に達しない場合：  
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±12%の範囲にあるか、又は $f_2$ 関数の値が46以上である。

上記の結果より、一部の試験条件について、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合しなかったため、ロラタジン DS1%「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していない。

なお、ヒトにおける生物学的同等性試験の結果、ロラタジン DS1%「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認されている。

#### 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 OD 錠 10mg 「トーワ」

赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

ロラタジン DS1% 「トーワ」

紫外可視吸光度測定法

#### 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. カ価

該当しない

#### 12. 混入する可能性のある夾雑物

SCH13095、LOR05、EP Impurity A、 EP Impurity C、SCH34117

#### 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・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・用量

#### ロラタジン OD錠 10mg 「トーフ」

成人：通常、ロラタジンとして1回 10 mg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 10 mg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 10 mg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。

#### ロラタジン DS1% 「トーフ」

成人：通常、ロラタジンとして1回 10 mg（ドライシロップとして1 g）を1日1回、食後に用時懸濁して経口投与する。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 5 mg（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 10 mg（ドライシロップとして1 g）を1日1回、食後に用時懸濁して経口投与する。

### 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)

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

ロラタジン及び活性代謝物(DCL)がヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体に可逆的かつ競合的に結合し、ヒスタミンの作用を阻害する。血液-脳関門をほとんど通過しないことから、中枢神経系への影響が少ない。

#### (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を参照

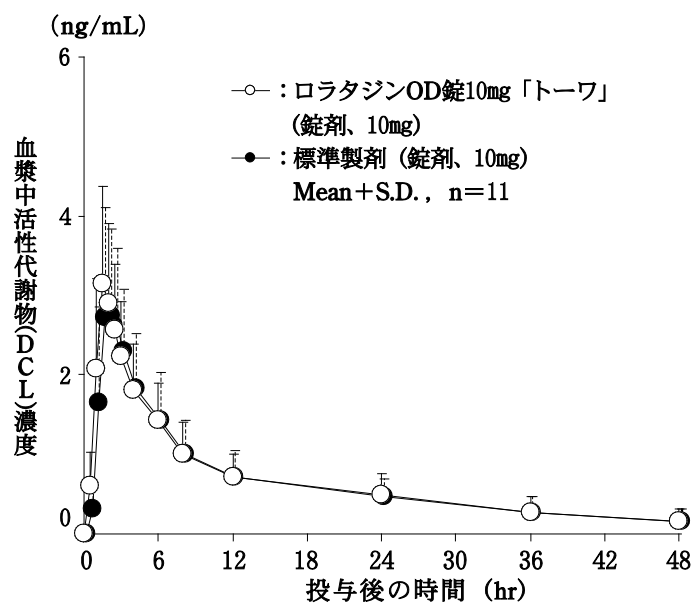
#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験

ロラタジン OD錠 10mg「トーワ」<sup>11)</sup>

ロラタジン OD錠 10mg「トーワ」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〔水なしで服用(n=11)及び水で服用(n=12)〕して活性代謝物 descarboethoxyloratadine(DCL)の血漿中濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C<sub>max</sub>)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

#### 1) 水なしで服用



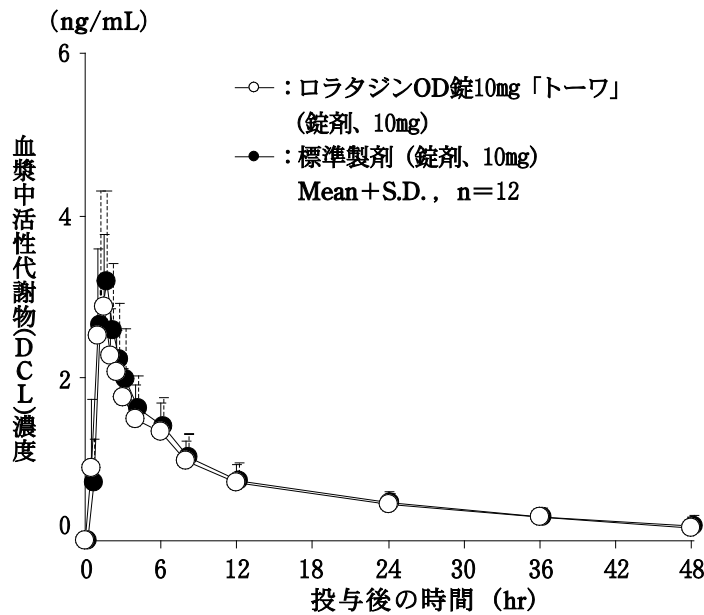
薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>48</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロラタジンOD錠10mg 「トーワ」 (錠剤、10mg)	31.50±13.57	3.297±1.073	1.68±0.34	17.40±2.82
標準製剤 (錠剤、10mg)	30.61±14.05	3.188±1.031	1.91±0.54	17.14±3.87

(Mean±SD.,n=11)

血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 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。

2) 水で服用



薬物動態パラメータ

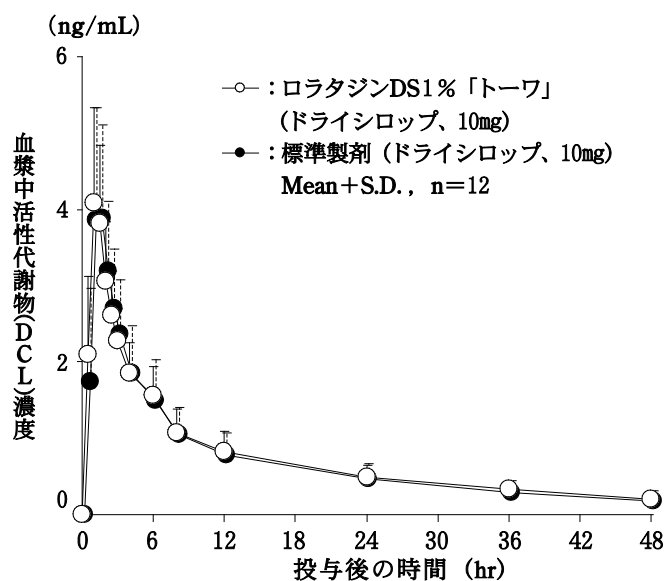
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>48</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロラタジンOD錠10mg 「トーワ」 (錠剤、10mg)	30.00±8.40	2.921±0.871	1.46±0.40	18.92±2.76
標準製剤 (錠剤、10mg)	31.54±8.78	3.291±1.328	1.38±0.23	20.44±4.08

(Mean±SD.,n=12)

血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 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 DS1% 「トーワ」<sup>12)</sup>

ロラタジン DS1% 「トーワ」と標準製剤を、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)健康成人男子(n=12)に絶食単回経口投与して活性代謝物 descarboethoxyloratadine(DCL)の血漿中濃度を測定し、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>48</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロラタジンDS1% 「トーワ」 (ドライシロップ、10mg)	36.35±9.57	4.226±1.134	1.21±0.33	18.53±1.73
標準製剤 (ドライシロップ、10mg)	34.95±12.94	4.153±1.444	1.25±0.34	18.97±4.31

(Mean±SD.,n=12)

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 OD 錠 10mg 「トーワ」<sup>11)</sup>

1) 水なしで服用

kel :  $0.04100 \pm 0.00808 \text{hr}^{-1}$  (健康成人男子、絶食経口投与)

2) 水で服用

kel :  $0.03736 \pm 0.00544 \text{hr}^{-1}$  (健康成人男子、絶食経口投与)

ロラタジン DS1% 「トーワ」<sup>12)</sup>

kel :  $0.03770 \pm 0.00355 \text{hr}^{-1}$  (健康成人男子、絶食経口投与)

(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. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 1)を参照

#### (3) 乳汁への移行性

VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 2)を参照

#### (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

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。

#### (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. 13. 過量投与の項を参照

## 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・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・用量に関連する使用上の注意とその理由

ロラタジン OD錠 10mg 「トーワ」のみ

#### 【用法・用量に関連する使用上の注意】

OD錠 10 mg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。

### 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	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ロラタジン製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、A1-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

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、けん怠感、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、A1-P上昇、 $\gamma$ -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

添付文書より抜粋

**【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

**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。

**その他の副作用**

	頻 度 不 明
過敏症	発疹、蕁麻疹、紅斑、そう痒、発赤

9. 高齢者への投与

**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

**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

##### 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

##### 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤は、アレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン皮内反応検査を実施する3～5日前より本剤の投与を中止すること。

#### 13. 過量投与

##### 過量投与

徴候、症状：海外において、過量投与(40 mgから180 mg)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

##### ロラタジン OD錠 10mg 「トーワ」

##### 適用上の注意

- 1) 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) 服用時：本剤は舌の上への唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後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。ただし、寝たままの状態では水なしで服用しないこと。

##### ロラタジン DS1% 「トーワ」

##### 適用上の注意

調製時：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。

#### 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

該当資料なし

#### (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(外箱、ラベルに記載)

### 3. 貯法・保存条件

貯法：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

患者向け医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：有

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

#### (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

製品名	包装形態	内容量(重量、容量又は個数等)
ロラタジン OD錠 10mg 「トーワ」	PTP包装	100錠、500錠 140錠(14錠×10)
	バラ包装	100錠
ロラタジン DS1% 「トーワ」	分包包装	0.5g×150包
	バラ包装	100g

7. 容器の材質

製品名	包装形態	材質
ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリプロピレン、アルミ箔
		ピロー : アルミ・ポリエチレンラミネート
	バラ包装	瓶、蓋 : ポリエチレン
ロラタジン DS1% 「トーワ」	分包包装	分包 : セロファン・ポリエチレン・アルミラミネート
	バラ包装	瓶、蓋(乾燥剤入り) : ポリエチレン

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、クラリチンドライシロップ 1%  
 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

9. 国際誕生年月日

1987 年 9 月 15 日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号	備考
ロラタジン OD 錠 10mg「トーワ」	2011 年 7 月 15 日	22300AMX00809000	
ロラタジン DS1%「トーワ」	2011 年 7 月 15 日	22300AMX00810000	

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日	備考
ロラタジン OD 錠 10mg「トーワ」	2011 年 11 月 28 日	
ロラタジン DS1%「トーワ」	2011 年 11 月 28 日	

12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」

用法・用量追加年月日：2012年1月30日

内容：以下の下線部分を追加した。

	旧	新
用法・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。	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。 <u>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。</u>

ロラタジン DS1% 「トーワ」

用法・用量追加年月日：2012年1月30日

内容：以下の下線部分を追加した。

	旧	新
用法・用量	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、食後に用時懸濁して経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。	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、食後に用時懸濁して経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。 <u>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、食後に用時懸濁して経口投与する。</u>

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。

ただし、Ⅷ. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法の項2)に注意喚起の記載がある。

16. 各種コード

製品名	包装単位	HOT 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
ロラタジン OD 錠 10mg 「トーワ」	100 錠 (PTP)	1211092010201	4490027F2169	622110901
	140 錠 (PTP)	1211092010301		
	500 錠 (PTP)	1211092010202		
	100 錠 (バラ)	1211092010101		
ロラタジン DS1% 「トーワ」	0.5g×150 包	1211108010101	4490027R1053	622111001
	100g(バラ)	1211108010201		

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) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(OD錠 10mg)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(DS1%)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(OD錠 10mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(DS1%)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：自動分包機落下試験(OD錠 10mg)
- 6) 東和薬品株式会社 社内資料：懸濁後の安定性試験(DS1%)
- 7) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(OD錠 10mg)
- 8) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(DS1%)
- 9) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(OD錠 10mg)
- 10) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(DS1%)
- 11) 塚本 雅俊ほか：医学と薬学, 66(2), 309, 2011
- 12) 塚本 雅俊ほか：新薬と臨床, 60(8), 160, 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

該当資料なし

### 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

東和薬品株式会社 製品情報ホームページ

<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/product/index.php>



## ロラタジン DS1% 「トーワ」 配合変化試験成績

### 配合変化試験

試験方法：本剤0.5gに配合薬又は配合物を加えて混合した。

混合後の検体は、固体製剤及び液体製剤については、室内散光下・室温保管  
もしくは25℃・75%RH・遮光保管とし、飲食物については、室内散光下・室温もしくは  
遮光・5℃で保管とした。

検 体：ロラタジンDS1% 「トーワ」

試 験 日：2011年6月

測定項目	測定方法	測定時期
外観	室内散光下、目視	固体製剤・液体製剤： 配合直後及び7日後 飲食物：配合直後及び 1日後
再分散性	試料を入れた試験管を5秒間倒立させ、次いで5秒間正立させる。 この操作を1回として、懸濁液が均一に分散するまでの回数を計測した。	
pH	pH測定法	
残存率	液体クロマトグラフィー	

### 1. 固体製剤との配合

分類	配 合 薬			配 合 結 果				
	品 名 (メーカー)	成分名	配合量		配合前* (配合薬)	配合直後	7日後 (室内散光下 ・室温保管)	7日後(25℃・ 75%RH・遮光)
その他のアレ ル ギ ー 用 薬	ロラタジンDS1% 「トーワ」 (東和薬品)	ロラタジン	/	外観	白色の粉末を 含む粒子	白色の粉末を 含む粒子	同左	同左
				残存率 (%)	/	100.0	99.9	100.0
去 痰 剤	メチスタDS33.3% (東和薬品)	L-カルボシステ イン	0.45g	外観	微赤白色～淡 赤白色の粉末 及び微粒物	淡赤白色の 粉末と白色の 粒子が混在	同左	同左
				残存率 (%)	/	100.0	100.0	100.0
気 管 支 拮 抗 剤	テオフルマート ドライシロップ20% (東和薬品)	テオフィリン	0.3g	外観	白色の粉末状 又は粒状	白色の粒子を 含む粉末	同左	同左
				残存率 (%)	/	100.0	100.1	100.3
その 他 の アレ ル ギ ー 用 薬	برانلカストDS10% 「トーワ」 (東和薬品)	برانلカス ト水和物	0.5g	外観	白色～微黄色 の顆粒	白色の粉末を 含む粒子	同左	同左
				残存率 (%)	/	100.0	101.1	100.8
セ フ エ ム 系 抗 生 物 質	セフジトレンピボキシ ル細粒小児用10% 「トーワ」 (東和薬品)	セフジトレ ンピボキシ ル	0.45g	外観	だいだい色の 細粒	橙色の粉末と 白色の粒子が 混在	同左	同左
				残存率 (%)	/	100.0	99.0	99.2

\*：製品の添付文書情報より記載

## 2. 液体製剤との配合

分類	配合薬			配合結果				
	品名 (メーカー)	成分名	配合量		配合前 <sup>*1</sup> (配合薬)	配合直後	7日後 (室内散光下 ・室温保管)	7日後(25℃・ 75%RH・遮光)
去痰剤	メチスタシロップ 小児用5% (東和薬品)	L-カルボシステ イン	3mL <sup>*2</sup>	外観	褐色の液	淡黄白色 の懸濁液	淡黄白色の懸濁 液であり、白色 の沈殿を生じた	同左
				pH	5.5～7.5	6.3	6.3	6.2
				再分散性 (回数)			良(3回)	良(3回)
				残存率 (%)		100.0	99.5	100.5
鎮咳去痰剤	アスベリンシロップ 0.5% (田辺三菱)	チペピジンヒ ベンズ酸塩	1mL <sup>*2</sup>	外観	白色～淡黄灰 白色の懸濁液	白色の 懸濁液	白色の懸濁液 であり、白色 の沈殿を生じた	同左
				pH	4.3～5.5	4.9	4.8	4.5
				再分散性 (回数)			不良(10回 以上)	不良(10回 以上)
				残存率 (%)		100.0	100.0	100.4
解熱鎮痛剤	ポントールシロップ 3.25% (第一三共)	メフェナム酸	3mL <sup>*2</sup>	外観	白色の水 性懸濁液	白色の 懸濁液	白色の懸濁液 であり、白色 の沈殿を生じた	同左
				pH	3.5～5.5	4.5	4.5	4.5
				再分散性 (回数)			不良(10回 以上)	不良(10回 以上)
				残存率 (%)		100.0	99.5	99.7

\*1：製品の添付文書情報より記載

\*2：配合薬を加えた後、精製水を加えて全量を10mLとした

### 3. 飲食物との配合

分類	配合物		配合結果			
	品名 (メーカー)	配合量		配合直後	1日後 (室温)	1日後 (5℃)
飲料	天然水 (サントリーフーズ)	小さじ 1杯(5cc)	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液であり、白色の沈殿を生じた	同左
			残存率 (%)	100.0	99.5	99.8
	烏龍茶 (サントリーフーズ)		外観	淡褐色の懸濁液	淡褐色の懸濁液であり、帯褐白色の沈殿を生じた	同左
			残存率 (%)	100.0	99.8	100.3
	天然ミネラル麦茶 (伊藤園)		外観	淡褐色の懸濁液	淡褐色の懸濁液であり、白色の沈殿を生じた	同左
			残存率 (%)	100.0	99.6	100.2
	なっちゃん オレンジ (サントリーフーズ)		外観	黄白色の懸濁液	黄白色の懸濁液であり、黄白色の沈殿を生じた	同左
			残存率 (%)	100.0	100.1	100.3
	なっちゃん りんご (サントリーフーズ)		外観	微黄白色の懸濁液	微黄白色の懸濁液であり、白色の沈殿を生じた	同左
			残存率 (%)	100.0	99.8	100.9
	ポカリスエット (大塚製薬)		外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液であり、白色の沈殿を生じた	同左
			残存率 (%)	100.0	99.7	100.0
	明治おいしい牛乳 (明治乳業)		外観	白色の懸濁液	同左	同左
			残存率 (%)	100.0	100.4	100.6
	VAN HOUTEN COCOA (明治乳業)		外観	帯白赤褐色の懸濁液	帯白赤褐色の懸濁液であり、暗褐色の沈殿を生じた	同左
			残存率 (%)	100.0	100.2	100.4
	ヤクルト (ヤクルト乳業)		外観	帯赤黄白色の懸濁液	帯赤黄白色の懸濁液であり、微黄白色の沈殿を生じた	帯赤黄白色の懸濁液であり、白色の沈殿を生じた
			残存率 (%)	100.0	100.7	100.4
食品	十勝ヨーグルト (明治乳業)	外観	白色の粘稠な懸濁液	同左	同左	
		残存率 (%)	100.0	100.1	100.1	
	ハーゲンダッツ バニラ (ハーゲンダッツジャパン)	外観	微黄白色の懸濁液であり、白色の顆粒状物質の沈殿を認めた	—	微黄白色の懸濁液	
		残存率 (%)	100.0	—	100.2	
	Bigブッチンプリン (grico)	外観	黄白色の粘稠な懸濁液	同左	同左	
		残存率 (%)	100.0	99.6	97.6	



製造販売元

**東和薬品株式会社**

大阪府門真市新橋町2番11号