

# 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「NP」

## ロラタジンOD錠10mg「NP」

LORATADINE TABLETS, OD TABLETS

剤形	ロラタジン錠 10mg「NP」 錠剤（素錠） ロラタジン OD 錠 10mg「NP」 錠剤（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：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL:0120-226-898 FAX:06-6375-0177 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.nipro.co.jp/">http://www.nipro.co.jp/</a>

本 I F は 2017 年 1 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。

## I F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、I Fと略す）の位置付け並びにI F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I F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I F記載要領2008が策定された。

I F記載要領2008では、I F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-I F）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-I Fが提供されることとなった。

最新版のe-I F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.info.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-I F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-I Fの情報を検討する組織を設置して、個々のI F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、I F記載要領の一部改訂を行いI F記載要領2013として公表する運びとなった。

### 2. I Fとは

I F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I F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I F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。

#### 【I F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。
- ②I F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「I F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]

- ①I 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。
- ②I 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（PDF）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，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I F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，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，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

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)

# 目 次

## I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯 ..... 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 ..... 1

## II. 名称に関する項目

1. 販売名 ..... 2
2. 一般名 ..... 2
3. 構造式又は示性式 ..... 2
4. 分子式及び分子量 ..... 2
5. 化学名（命名法） ..... 2
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 ..... 2
7. CAS 登録番号 ..... 3

## III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 ..... 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 ..... 4
3. 有効成分の確認試験法 ..... 4
4. 有効成分の定量法 ..... 4

## IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 ..... 5
2. 製剤の組成 ..... 5
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 ..... 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 ..... 6
5. 調製法及び溶解後の安定性 ..... 7
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） ..... 7
7. 溶出性 ..... 7
8. 生物学的試験法 ..... 12
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 ..... 12
10. 製剤中の有効成分の定量法 ..... 12
11. 力価 ..... 12
12. 混入する可能性のある夾雑物 ..... 12
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 ..... 12
14. その他 ..... 12

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 ..... 13
2. 用法及び用量 ..... 13
3. 臨床成績 ..... 13

## VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ..... 15
2. 薬理作用 ..... 15

## VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法 ..... 16
2. 薬物速度論的パラメータ ..... 20
3. 吸収 ..... 21
4. 分布 ..... 21
5. 代謝 ..... 21
6. 排泄 ..... 22
7. トランスポーターに関する情報 ..... 22
8. 透析等による除去率 ..... 22

## 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 ..... 23
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ..... 23
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 ..... 23
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 ..... 23
5. 慎重投与内容とその理由 ..... 23
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 ..... 23
7. 相互作用 ..... 23
8. 副作用 ..... 24
9. 高齢者への投与 ..... 25
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 ..... 25
11. 小児等への投与 ..... 26
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 ..... 26
13. 過量投与 ..... 26
14. 適用上の注意 ..... 26
15. その他の注意 ..... 26
16. その他 ..... 26

## IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 ..... 27
2. 毒性試験 ..... 27

<b>X. 管理的事項に関する項目</b>			
1. 規制区分	28	14. 再審査期間	29
2. 有効期間又は使用期限	28	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	30
3. 貯法・保存条件	28	16. 各種コード	30
4. 薬剤取扱い上の注意点	28	17. 保険給付上の注意	30
5. 承認条件等	28	<b>XI. 文献</b>	
6. 包装	28	1. 引用文献	31
7. 容器の材質	29	2. その他の参考文献	31
8. 同一成分・同効薬	29	<b>XII. 参考資料</b>	
9. 国際誕生年月日	29	1. 主な外国での発売状況	32
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	29	2. 海外における臨床支援情報	32
11. 薬価基準収載年月日	29	<b>XIII. 備考</b>	
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	29	その他の関連資料	33
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	29		

---

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

ロラタジンは持続性選択  $H_1$  受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。本邦では 2002 年に上市されている。

1錠中にロラタジンを 10mg 含有するロラタジン錠 10mg「NP」及びロラタジン OD 錠 10mg「NP」は、ニプロファーマ(株)が初の後発医薬品として開発を企画し、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 月に承認を取得、2011 年 11 月に販売を開始した。2012 年 2 月には、小児に対する「用法・用量」が追加承認された。その後、2013 年 12 月には、製造販売承認をニプロ(株)が承継した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 本剤は抗コリン性の副作用がなく、血液-脳関門を通過しにくいため鎮静作用がないといわれている<sup>1)</sup>。
- 臨床的には、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）に伴うそう痒に有用性が認められている。
- 錠剤の裏面に含量刻印を入れることにより、識別性の向上をはかった。
- ロラタジン OD 錠 10mg「NP」は、水なしでの服用も可能な口溶けのよい口腔内崩壊錠であり、味も「無味～やや甘い」ので、服用しやすい。
- 重大な副作用としては、ショック、アナフィラキシー、てんかん、痙攣、肝機能障害、黄疸があらわれることがある（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 「NP」

ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」

(2) 洋 名 : LORATADINE TABLETS

LORATADINE OD TABLETS

(3) 名称の由来 : 有効成分であるロラタジンに剤形及び含量を記載し、NIPRO から「NP」を付した。

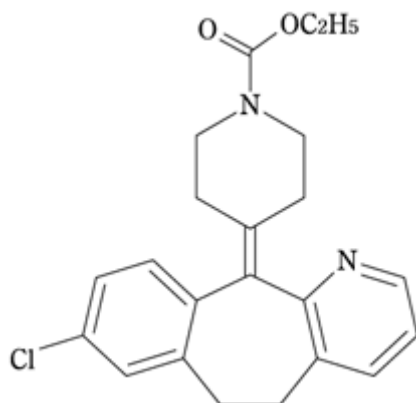
### 2. 一般名

(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 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

該当資料なし

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の臭化カリウム錠剤法
- (3) 炎色反応試験法

#### 4. 有効成分の定量法






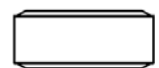
液体クロマトグラフィー

#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

- 1) 区別：ロラタジン錠 10mg「NP」                      錠剤（素錠）  
             ロラタジン OD 錠 10mg「NP」          錠剤（素錠：口腔内崩壊錠）
- 2) 外観及び性状：下記表に記載

販売名		ロラタジン錠 10mg「NP」	ロラタジン OD 錠 10mg「NP」
外形			
			
			
形状		白色の割線入りの素錠	白色の素錠 (口腔内崩壊錠)
大きさ	直径 (mm)	6.5	7.0
	厚さ (mm)	2.6	2.9
	重量 (mg)	100	140
識別コード		NP-721	NP-722

- (2) 製剤の物性：該当資料なし
- (3) 識別コード：上記表に記載
- (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等：該当資料なし

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1 錠中   ロラタジン   10mg

###### (2) 添加物

ロラタジン錠 10mg「NP」

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、デキストリン、ステアリン酸マグネシウム

ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」

D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルスターチ、結晶セルロース、クロスポビドン、フマル酸ステアリルナトリウム

(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

加速試験

試験条件：40±1℃、75±5%RH

①ロラタジン錠 10mg 「NP」<sup>2)</sup>

PTP 包装：包装形態（ポリ塩化ビニル・アルミ箔）

項目及び規格	試験開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状（白色の割線入りの素錠である）	適 合	適 合	適 合	適 合
確認試験	適 合	適 合	適 合	適 合
製剤均一性試験（15.0%を超えない）	適 合	—	—	適 合
溶出試験（30 分間の溶出率：85%以上）	適 合	適 合	適 合	適 合
含量（95.0～105.0%）	99.52～ 100.64	99.47～ 100.95	100.05～ 100.85	100.35～ 101.27

(n=3)

バラ包装：包装形態（ポリエチレン製瓶）

項目及び規格	試験開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状（白色の割線入りの素錠である）	適 合	適 合	適 合	適 合
確認試験	適 合	適 合	適 合	適 合
製剤均一性試験（15.0%を超えない）	適 合	—	—	適 合
溶出試験（30 分間の溶出率：85%以上）	適 合	適 合	適 合	適 合
含量（95.0～105.0%）	99.52～ 100.64	99.53～ 100.53	99.79～ 100.80	99.72～ 100.91

(n=3)

②ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」<sup>3)</sup>

PTP 包装：包装形態（ポリプロピレン・アルミ箔）

項目及び規格	試験開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状（白色の素錠である）	適 合	適 合	適 合	適 合
確認試験	適 合	適 合	適 合	適 合
製剤均一性試験（15.0%を超えない）	適 合	—	—	適 合
崩壊性試験	適 合	適 合	適 合	適 合
溶出試験（30 分間の溶出率：85%以上）	適 合	適 合	適 合	適 合
含量（95.0～105.0%）	99.69～ 100.99	99.82～ 101.01	100.62～ 101.61	100.24～ 101.52

(n=3)

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、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。

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

溶出挙動における類似性<sup>4,5)</sup>

（「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成 9 年 12 月 22 日 医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日一部改正 医薬審発第 786 号及び平成 18 年 11 月 24 日一部改正 薬食審査発第 1124004 号」）

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

試験液の温度：37±0.5℃

試験液の量：900mL

試験液：①ロラタジン錠 10mg 「NP」

pH1.2＝日本薬局方溶出試験第 1 液

pH3.0＝薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8＝日本薬局方溶出試験第 2 液

水

② ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」

pH1.2 = 日本薬局方溶出試験第1液

pH4.5 = 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液

水

試験液の種類：① ロラタジン錠 10mg 「NP」

回転数 50rpm の場合 pH1.2、3.0、6.8 及び水

回転数 100rpm の場合 pH1.2

② ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」

回転数 50rpm の場合 pH1.2、4.5、6.8 及び水

回転数 100rpm の場合 pH4.5

判定基準：すべての溶出試験条件において、以下の基準に適合するとき、溶出挙動が類似しているとする。ただし、少なくとも1つの溶出試験条件において規定する試験時間内に標準製剤の平均溶出率が85%以上に達しなければならない。また、標準製剤の溶出にラグ時間があるときには、試験製剤と標準製剤の平均溶出ラグ時間の差は10分以内でなければならない。

① 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 $\pm$ 15%の範囲にある。

② 標準製剤が15～30分に平均85%以上溶出する場合：標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる適当な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 $\pm$ 15%の範囲にあるか、又は $f_2$ 関数の値が42以上である。

③ 標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合：以下のいずれかの基準に適合する。

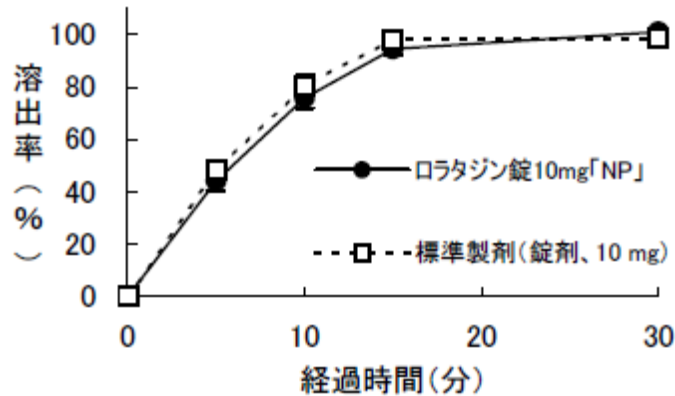
a. 規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上となるとき、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm$ 15%の範囲にあるか、又は $f_2$ 関数の値は42以上である。

- b. 規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%以上85%に達しないとき、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 $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又はf2関数の値が46以上である。
- c. 規定された試験時間において、標準製剤の平均溶出率が50%に達しないとき、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 $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又はf2関数の値が53以上である。

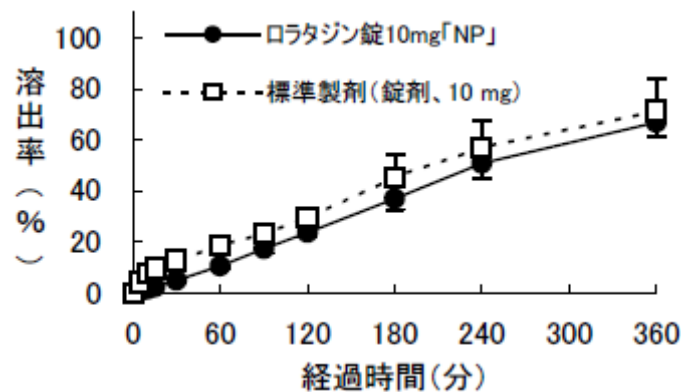
試験結果 : 各試験条件においてロラタジン錠10mg「NP」及びロラタジンOD錠10mg「NP」と標準製剤の溶出試験を実施した結果、両製剤の溶出挙動は類似であると判断された。

①ロラタジン錠10mg「NP」

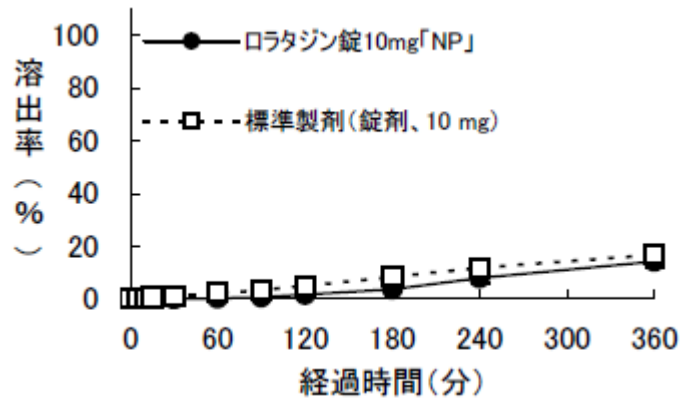
試験液 pH1.2 における平均溶出曲線 (mean $\pm$ S. D.、n=12)



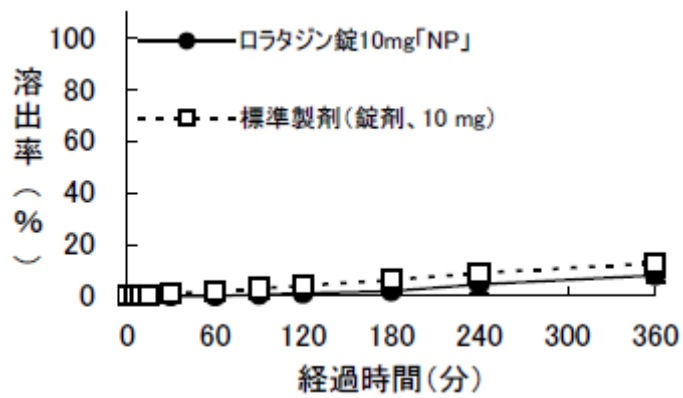
試験液 pH3.0 における平均溶出曲線 (mean $\pm$ S. D.、n=12)



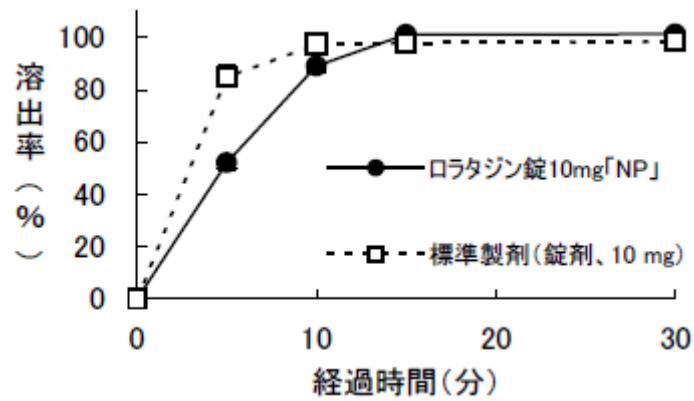
試験液 pH6.8 における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



試験液 水における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)

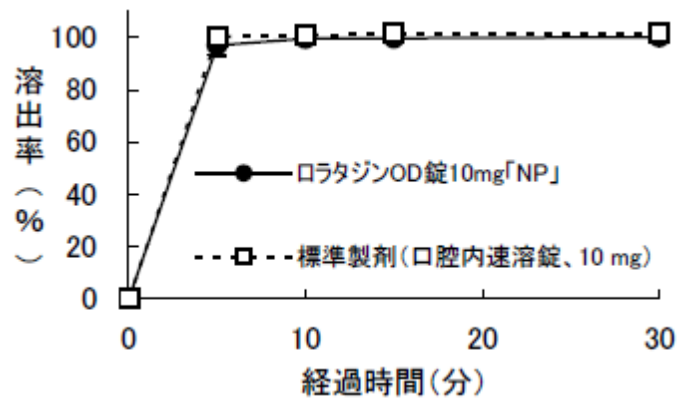


試験液 pH1.2(毎分 100 回転)における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)

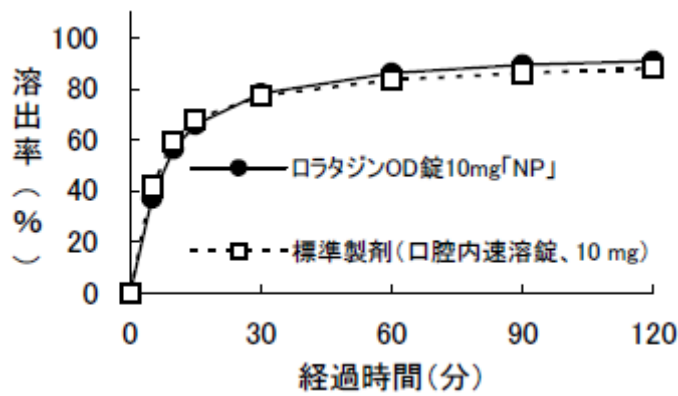


②ロラタジン OD錠 10mg 「NP」

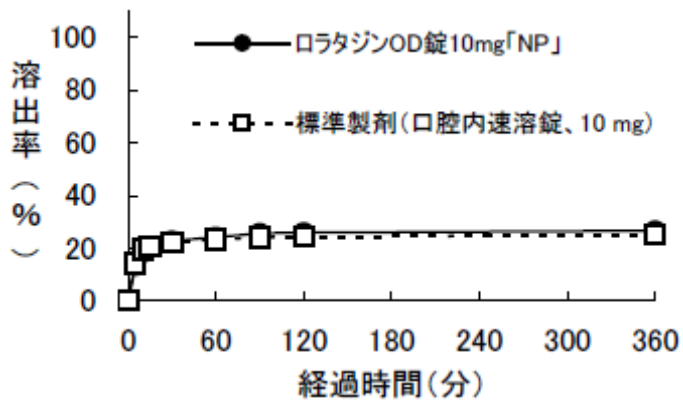
試験液 pH1.2 における平均溶出曲線 (mean±S.D.、n=12)



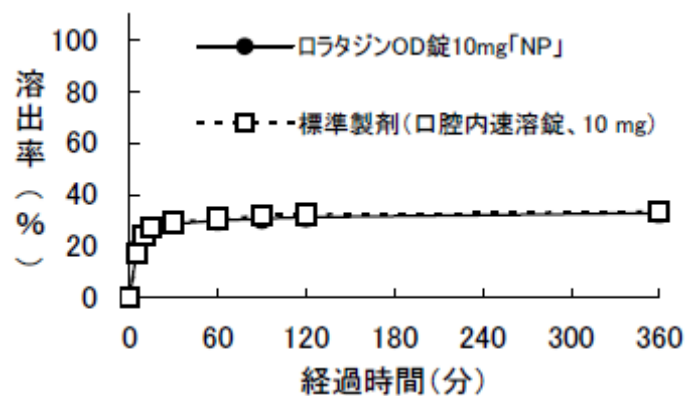
試験液 pH4.5 における平均溶出曲線 (mean±S.D.、n=12)



試験液 pH6.8 における平均溶出曲線 (mean±S.D.、n=12)

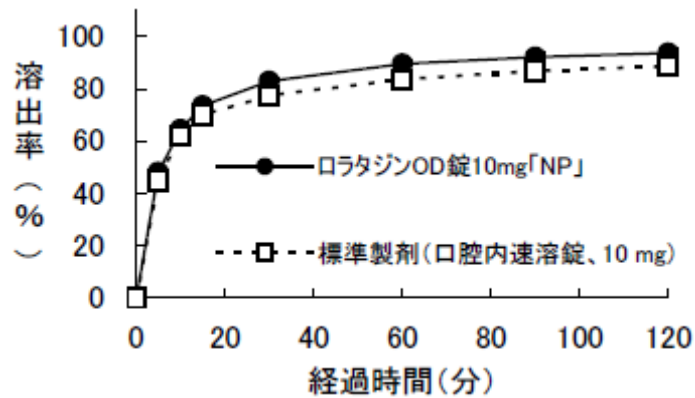


試験液 水における平均溶出曲線 (mean±S.D.、n=12)





試験液 pH4.5(毎分 100 回転)における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



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. カ価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

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〉**

ロラタジン OD錠 10mg「NP」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

該当資料なし

---

## 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  $H_1$  受容体拮抗薬（セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩 他）

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>1)</sup>

ヒトの皮膚のマスト細胞に発現した  $H_1$  受容体においてヒスタミンと拮抗することにより、痒みを抑制する。

#### (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

健康成人男子に、ロラタジン錠 10mg「NP」を 1 錠（ロラタジンとして 10mg、n=30）絶食時に経口投与した時の未変化体及び活性代謝物（DCL）の T<sub>max</sub> はそれぞれ約 1.5 時間及び約 1.9 時間であった<sup>4)</sup>。

健康成人男子に、ロラタジン OD 錠 10mg「NP」を 1 錠（ロラタジンとして 10mg、n=20）絶食時に水ありで経口投与した時の未変化体及び活性代謝物（DCL）の T<sub>max</sub> はそれぞれ約 1.3 時間及び約 1.7 時間であった。また、水なしで経口投与した時の未変化体及び活性代謝物（DCL）の T<sub>max</sub> はそれぞれ約 1.4 時間及び約 1.8 時間であった<sup>5)</sup>。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

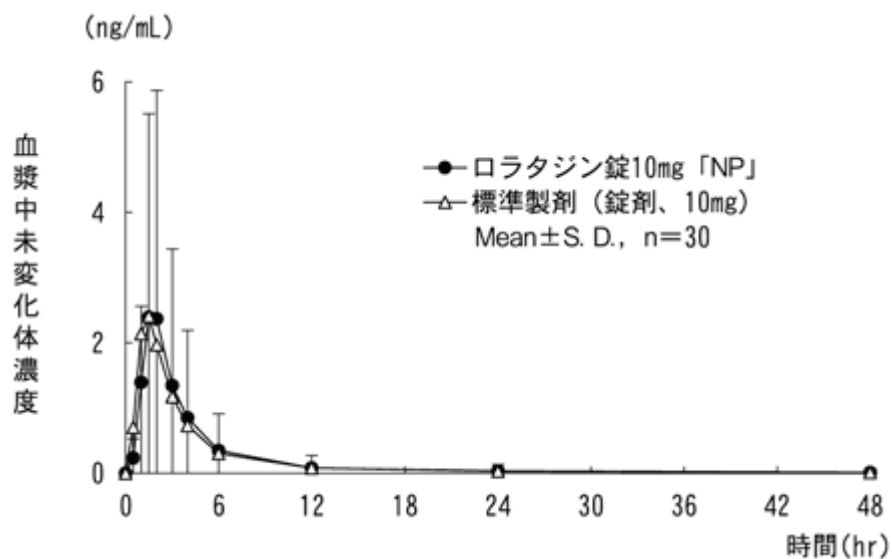
生物学的同等性試験ガイドライン

（「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成 9 年 12 月 22 日 医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日一部改正 医薬審発第 786 号及び平成 18 年 11 月 24 日一部改正 薬食審査発第 1124004 号」、「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、平成 15 年 6 月 12 日一部改正 厚生労働省令第 106 号、平成 16 年 12 月 21 日一部改正 厚生労働省令第 172 号、平成 18 年 3 月 31 日一部改正 厚生労働省令第 72 号及び平成 20 年 2 月 29 日一部改正 厚生労働省令第 24 号」）

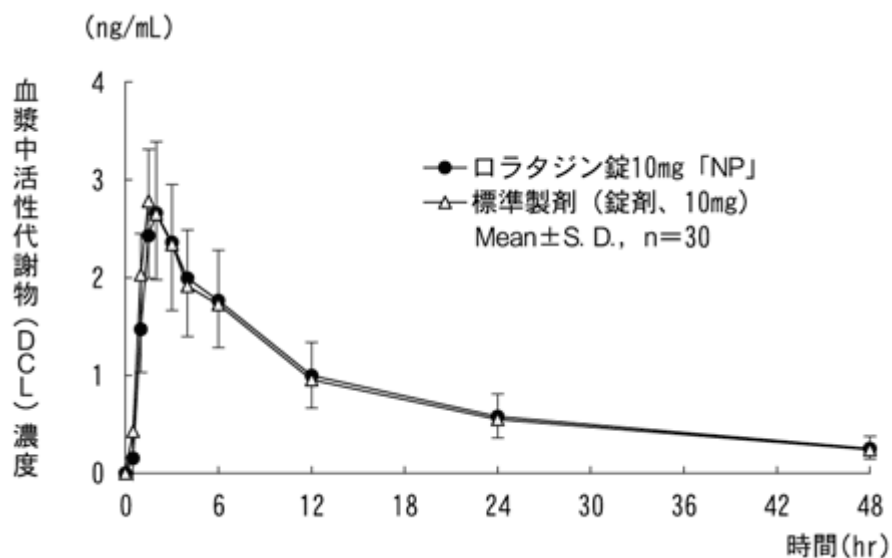
##### ① ロラタジン錠 10mg「NP」<sup>4)</sup>

ロラタジン錠 10mg「NP」1 錠と標準製剤 1 錠（ロラタジンとして 10mg）を、2 剤 2 期のクロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に経口投与して LC-MS/MS 法にて血漿中未変化体濃度及び活性代謝物（DCL）濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC<sub>0→48hr</sub>、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)～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) 未変化体濃度



(2) 活性代謝物 (DCL) 濃度



		判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC <sub>0→48hr</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
未変化体	ロラタジン錠 10mg「NP」	9.3 ± 14.7	2.79 ± 3.72	1.5 ± 0.4	3.9 ± 4.6
	標準製剤 (錠剤、10mg)	9.0 ± 13.0	2.81 ± 3.12	1.3 ± 0.5	3.3 ± 4.8
(DCL) 活性代謝物	ロラタジン錠 10mg「NP」	38.9 ± 12.0	2.88 ± 0.72	1.9 ± 0.5	18.3 ± 3.0
	標準製剤 (錠剤、10mg)	38.1 ± 10.1	3.00 ± 0.76	1.7 ± 0.5	18.4 ± 2.6

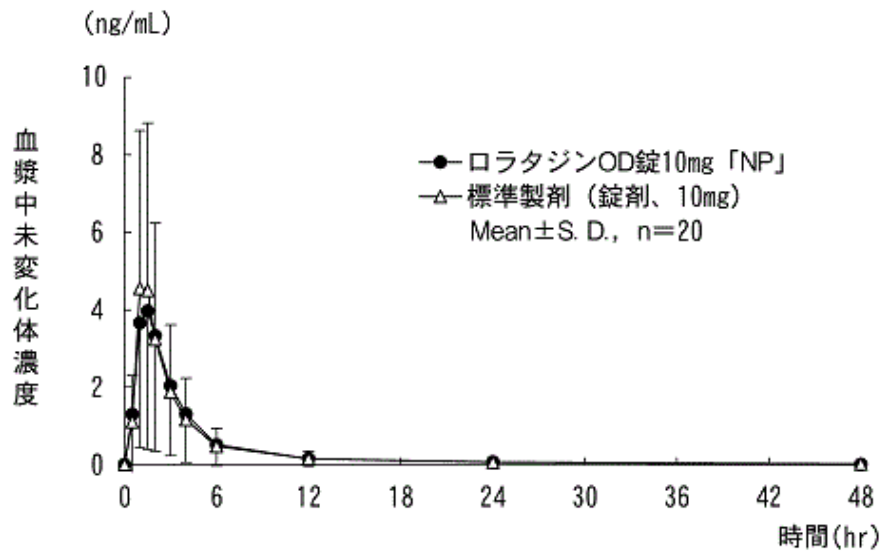
(Mean ± S. D., n=30)

生物学的同等性試験によって得られた血漿中濃度並びに 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。

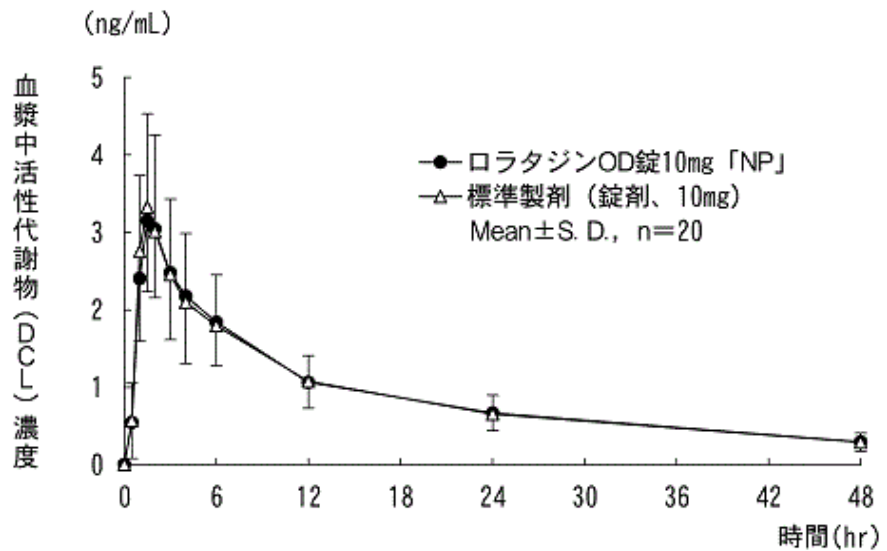
② ロラタジン OD錠 10mg 「NP」<sup>5)</sup>

ロラタジン OD錠 10mg 「NP」1錠と標準製剤1錠(ロラタジンとして10mg)を、2剤2期のクロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に経口投与してLC-MS/MS法にて血漿中未変化体濃度及び活性代謝物(DCL)濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ( $AUC_{0\rightarrow 48hr}$ 、 $C_{max}$ )について90%信頼区間法に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。

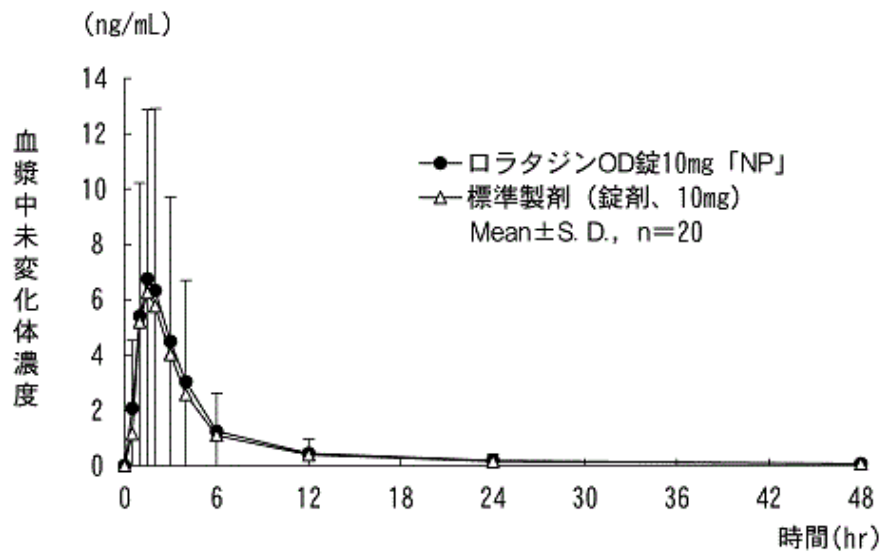
(1) 水あり投与 未変化体濃度



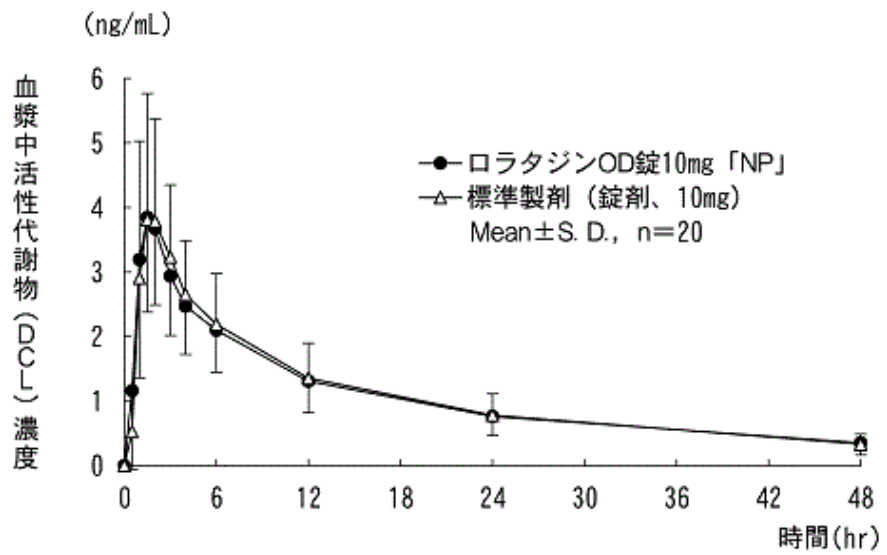
(2) 水あり投与 活性代謝物 (DCL) 濃度



(3) 水なし投与 未変化体濃度



(4) 水なし投与 活性代謝物 (DCL) 濃度





			判定パラメータ		参考パラメータ	
			AUC <sub>0→48hr</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
水あり投与	未変化体	ロラタジン OD錠 10mg 「NP」	15.8±14.8	4.50±3.85	1.3±0.3	5.0±5.0
		標準製剤 (錠剤、10mg)	15.8±15.6	4.92±4.49	1.2±0.3	5.8±7.1
	(D C L) 活性代謝物	ロラタジン OD錠 10mg 「NP」	43.5±14.0	3.38±1.31	1.7±0.7	19.5±2.8
		標準製剤 (錠剤、10mg)	43.3±12.6	3.44±1.04	1.6±0.3	19.2±2.9
水なし投与	未変化体	ロラタジン OD錠 10mg 「NP」	34.0±35.7	7.48±6.44	1.4±0.4	8.6±6.1
		標準製剤 (錠剤、10mg)	30.1±35.7	7.10±7.36	1.4±0.6	8.2±7.2
	(D C L) 活性代謝物	ロラタジン OD錠 10mg 「NP」	51.7±17.2	4.10±1.35	1.8±1.1	19.5±3.8
		標準製剤 (錠剤、10mg)	52.7±18.7	4.45±1.68	2.0±1.1	18.2±3.1

(Mean±S. D., n=20)

生物学的同等性試験によって得られた血漿中濃度並びに 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

該当資料なし

(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

〈参考〉

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。

(3) 乳汁への移行性

ヒト母乳中への移行が報告されている。

(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

本剤は血液透析によって除去できない。

---

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

種類\頻度	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、Al-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

「2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」の項

「8. 副作用」の項 を参照。

## 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

- 1) 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。
- 2) 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) 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（ロラタジン OD錠 10mg「NP」）  
本剤は舌の上への唾液を湿潤させ、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。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  
〈参考〉  
動物試験 (ラット、ウサギ) で催奇形性は認められない。
- (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 「NP」	該当しない
ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」	該当しない
有効成分：ロラタジン	該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後 3 年（安定性試験結果に基づく）

（「IV. 製剤に関する項目」の「4. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照。）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

開封後は湿気を避けて保存すること

### 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）

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「14. 適用上の注意」の項を参照。

#### （3）調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

ロラタジン錠 10mg 「NP」	: 100 錠 (PTP)
	300 錠 (バラ)
	420 錠 (PTP)
	500 錠 (PTP)
ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」	: 50 錠 (PTP)
	300 錠 (PTP)

## 7. 容器の材質

ロラタジン錠 10mg 「NP」

PTP 包装 : ポリ塩化ビニル、アルミ箔

バラ包装 : ポリエチレン製瓶

ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」

PTP 包装 : ポリプロピレン、アルミ箔

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬 : クラリチン錠 10mg、同レディタブ錠 10mg、同ドライシロップ 1% (MSD=塩野義) 他

同効薬 : セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩 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

製造販売承認年月日 : 2011 年 7 月 15 日

承認番号 : ロラタジン錠 10mg 「NP」 : 22300AMX01068000

ロラタジン OD 錠 10mg 「NP」 : 22300AMX01069000

[注]2013 年 12 月 2 日に製造販売承認をニプロ㈱に承継。

## 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

○小児に対する「用法・用量」の追加

一部変更承認年月日 : 2012 年 2 月 2 日

〈用法・用量〉「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。」を追記する。

## 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 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
ロラタジン錠 10mg「NP」	121245701	4490027F1081	622124501
ロラタジン OD 錠 10mg「NP」	121246401	4490027F2088	622124601

17. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。

---

## XI. 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(下)第11版：P. 2162、2007、  
廣川書店
- 2) ニプロ(株)社内資料：安定性（加速）試験
- 3) ニプロ(株)社内資料：安定性（加速）試験
- 4) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性（溶出、血漿中濃度測定）試験
- 5) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性（溶出、血漿中濃度測定）試験

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

---

## XII. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

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 (2011年)
オーストラリアの分類 (Australian categorisation system for prescribing medicines in pregnancy)	B1 (2017年)

参考：分類の概要

FDA：

B: Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus and there are no adequate and well-controlled studies in humans, AND the benefits from the use of the drug in pregnant women may be acceptable despite its potential risks. OR animal studies have not been conducted and there are no adequate and well-controlled studies in humans.

オーストラリアの分類：

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】

**ニフ。ロ株式会社**  
大阪市北区本庄西3丁目9番3号