

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018(2019年更新版)に準拠して作成

持続性選択H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

ロラタジン錠、ロラタジン口腔内崩壊錠

ロラタジン錠10mg「サワイ」

ロラタジンOD錠10mg「サワイ」

ロラタジンドライシロップ

ロラタジンDS1%「サワイ」

LORATADINE Tablets, OD Tablets, DS [SAWAI]

剤形	錠10mg : 割線入り素錠 OD錠10mg : 割線入り素錠(口腔内崩壊錠) DS1% : ドライシロップ
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠10mg/OD錠10mg : 1錠中ロラタジン10mg含有 DS1% : 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 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日 : 2011年7月15日(錠10mg、OD錠10mg) 2013年2月15日(DS1%) 薬価基準収載年月日 : 2011年11月28日(錠10mg、OD錠10mg) 2013年6月21日(DS1%) 販売開始年月日 : 2011年11月28日(錠10mg、OD錠10mg) 2013年6月21日(DS1%)
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元 : 沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL : 0120-381-999、FAX : 06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト : https://med.sawai.co.jp/

本IFは2023年9月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

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

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

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

2. IFとは

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

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

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

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

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

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

4. 利用に際しての留意点

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

(2020年4月改訂)

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	39
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	39
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	39
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	39
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	39
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	39
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	39
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	40
1. 販売名	3	8. 副作用	41
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	42
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	42
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	42
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	42
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	43
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	43
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	43
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	44
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6	1. 規制区分	44
IV. 製剤に関する項目	7	2. 有効期間	44
1. 剤形	7	3. 包装状態での貯法	44
2. 製剤の組成	8	4. 取扱い上の注意	44
3. 添付溶解液の組成及び容量	8	5. 患者向け資材	44
4. 力価	9	6. 同一成分・同効薬	44
5. 混入する可能性のある夾雑物	9	7. 国際誕生年月日	44
6. 製剤の各種条件下における安定性	9	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	45
7. 調製法及び溶解後の安定性	12	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等 の年月日及びその内容	45
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	12	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	45
9. 溶出性	12	11. 再審査期間	45
10. 容器・包装	16	12. 投薬期間制限に関する情報	45
11. 別途提供される資材類	17	13. 各種コード	45
12. その他	17	14. 保険給付上の注意	45
V. 治療に関する項目	20	XI. 文献	46
1. 効能又は効果	20	1. 引用文献	46
2. 効能又は効果に関連する注意	20	2. その他の参考文献	48
3. 用法及び用量	20	XII. 参考資料	49
4. 用法及び用量に関連する注意	20	1. 主な外国での発売状況	49
5. 臨床成績	20	2. 海外における臨床支援情報	49
VI. 薬効薬理に関する項目	25	XIII. 備考	50
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	25	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	50
2. 薬理作用	25	2. その他の関連資料	52
VII. 薬物動態に関する項目	26		
1. 血中濃度の推移	26		
2. 薬物速度論的パラメータ	33		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	34		
4. 吸収	34		
5. 分布	34		
6. 代謝	35		
7. 排泄	35		
8. トランスポーターに関する情報	35		
9. 透析等による除去率	35		
10. 特定の背景を有する患者	36		
11. その他	38		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロラタジン錠10mg/OD錠10mg/DS 1%「サワイ」は、ロラタジンを含有する持続性選択H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

品名	ロラタジン錠10mg/OD錠10mg 「サワイ」	ロラタジンDS 1%「サワイ」
承認申請に際し 準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号 (平成21年3月4日 薬食発第0304004号により一部改正)	
承認	2011年7月	2013年2月
上市	2011年11月	2013年6月

2012年2月に小児に対する用法及び用量が追加承認された。[錠10mg/OD錠10mg] (X. -9. 参照)

2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤は、「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」の効能又は効果を有する。(V. -1. 参照)
- 2) 本剤の用法は、「1日1回投与」である。(V. -3. 参照)
- 3) ロラタジン及び活性代謝物descarboethoxyloratadine (DCL)は、ヒスタミンH₁受容体拮抗作用を示す。また、ヒスタミン、ロイコトリエンC₄の遊離抑制作用を示す。(VI. -2. 参照)
- 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。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

「IV. 製剤に関する項目」及び沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」
<https://med.sawai.co.jp/> 参照

4. 適正使用に関して周知すべき特性

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

(2025年10月1日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

1) 承認条件

該当しない

I. 概要に関する項目

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

ロラタジン錠10mg「サワイ」
 ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
 ロラタジンDS 1 %「サワイ」

2) 洋名

LORATADINE Tablets, OD Tablets, DS [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

ロラタジン(JAN)

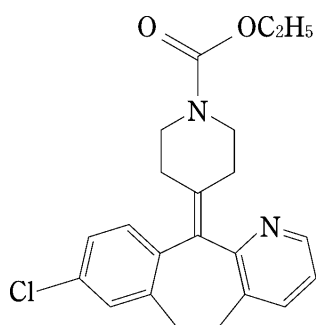
2) 洋名(命名法)

Loratadine(JAN、INN)

3) ステム(stem)

-tadine : histamine- H_1 receptor antagonists, tricyclic compounds

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{22}H_{23}ClN_2O_2$

分子量 : 382.88

5. 化学名(命名法)又は本質

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

II. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号
特になし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

2) 溶解性

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

3) 吸湿性

該当資料なし

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：133～137℃

5) 酸塩基解離定数

pKa：5.2〔紫外可視吸光度測定法〕¹⁾

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

原薬の安定性¹⁾

水：該当資料なし

液性(pH)：該当資料なし

光：

試験項目：形状(外観、におい、味)、確認試験、融点、溶状、乾燥減量、含量、分解物の検索

試験区分		保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
苛酷試験	曝光	25℃、 D65ランプ	シャーレ、開放	120万lx・hr (総近紫外放射エネルギーは 200W・hr/m ² 以上)	変化を認めず安定

Ⅲ. 有効成分に関する項目

その他：

試験項目：形状(外観、におい、味)、確認試験、融点、溶状、乾燥減量、含量、分解物の検索

試験区分	保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
苛酷試験	加温	60℃	ビーカー、開放	変化を認めず安定
	加湿	25℃、90%RH	ビーカー、開放	
	加温・加湿	40℃、85%RH	ビーカー、開放	
長期保存試験	25℃、60%RH	ポリエチレン袋 +紙箱	36ヵ月	変化を認めず安定
加速試験	40℃、75%RH	ポリエチレン袋 +紙箱	6ヵ月	変化を認めず安定

3. 有効成分の確認試験法、定量法

<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
- 3) 炎色反応試験(2)

<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

- ロラタジン錠10mg「サワイ」：割線入り素錠
 ロラタジンOD錠10mg「サワイ」：割線入り素錠(口腔内崩壊錠)
 ロラタジンDS 1%「サワイ」：ドライシロップ

2) 製剤の外観及び性状

品名	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
ロラタジン錠10mg 「サワイ」	 6.5	 約100	 2.6	白色
ロラタジンOD錠10mg 「サワイ」	 8.0	 約190	 4.3	白色
ロラタジンDS 1% 「サワイ」	_____			白色の粉末を含む粒子で、ストロベリー様の芳香があり、味は甘い

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」

添加剤由来の甘み及び酸味を有する。

●ロラタジンDS 1%「サワイ」

ストロベリー様芳香、添加剤由来の甘みを有する。

3) 識別コード

●ロラタジン錠10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW L21

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW L11

4) 製剤の物性

●ロラタジン錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

IV. 製剤に関する項目

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

摩損度：日本薬局方 参考情報 錠剤の摩損度試験法により試験を行う。(25rpm、4分間)
0.13%

●ロラタジンDS1%「サワイ」

製剤均一性(分包品)：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

品名	ロラタジン錠10mg「サワイ」	ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	ロラタジン 10mg	
添加剤	ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、乳糖	アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、クエン酸、クロスポビドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルセルロース、フマル酸ステアリルNa、D-マンニトール

●ロラタジンDS1%「サワイ」

有効成分 [1g中]	ロラタジン 10mg
添加剤	二酸化ケイ素、白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、香料

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価……………該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物……………該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性……………

●ロラタジン錠10mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)²⁾

ロラタジン錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.8	101.5

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験³⁾

ロラタジン錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	3.9	4.2	3.9	3.9	3.9
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.8	99.3	98.5	99.3

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁴⁾

ロラタジンOD錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り素錠であった	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.1	100.4

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁵⁾

ロラタジンOD錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度、光及び室温の条件下で硬度低下が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度(25°C75%RH)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.0	5.0	3.2	3.2
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	—	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.9	100.1	100.2

保存条件	イニシャル	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温(25°C60%RH)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.0	3.3	3.4	3.4
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	—	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.2	100.2	100.0

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁶⁾

ロラタジンOD錠10mg「サワイ」のPTP包装(ピロー包装なし)について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温・湿度 (40°C75%RH 6ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.0	4.0	4.4
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	—
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.3	99.4

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ロラタジンDS1%「サワイ」

1) 分包装品の安定性(加速試験)⁷⁾

ロラタジンDS1%「サワイ」を分包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。
その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の粉末を含む粒子で、ストロベリー様の芳香があり、味は甘かった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.9	100.2

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)⁷⁾

ロラタジンDS1%「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の粉末を含む粒子で、ストロベリー様の芳香があり、味は甘かった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.9	98.4

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性試験⁸⁾

ロラタジンDS1%「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3 ヶ月)
性 状	白色の粉末を 含む粒子	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.4	98.8	98.8	98.6

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

7. 調製法及び溶解後の安定性

●ロラタジンDS1%「サワイ」

<溶解後の安定性試験>⁹⁾

ロラタジンDS1%「サワイ」を水に溶解(本剤0.5gを水に加え10mLとして溶解)したのについて、各種条件下で7日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

試験項目	イニシャル	5°C遮光 7日後	室温遮光 7日後	室温散光 7日後
性 状	液は白濁し、分散 していた	変化なし	変化なし	変化なし
pH	5.9	5.7	5.7	5.7
定量試験※	100.0	100.4	100.7	100.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

VIII. -11. 参照

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

<pH変動試験>

●ロラタジンDS1%「サワイ」¹⁰⁾

含量/容量	試料pH	外 観	(A)0.1mol/L HCl (B)0.1mol/L NaOH	最終pH 又は変化点pH	移動指数	変化所見
25mg/ 2.5g	3.94 (2.5g/精製水5mL)	白色の 懸濁液	(A)1.6mL	1.72	2.22	薄い白色の 懸濁液
	3.90 (2.5g/精製水5mL)	白色の 懸濁液	(B)5.0mL	11.21	7.31	変化なし

<配合変化試験>

●ロラタジンDS1%「サワイ」

XIII. -2. 参照

9. 溶出性

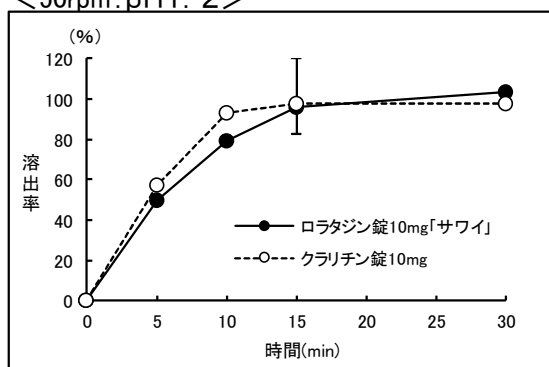
<溶出挙動における同等性及び類似性>

●ロラタジン錠10mg「サワイ」^{11,12)}

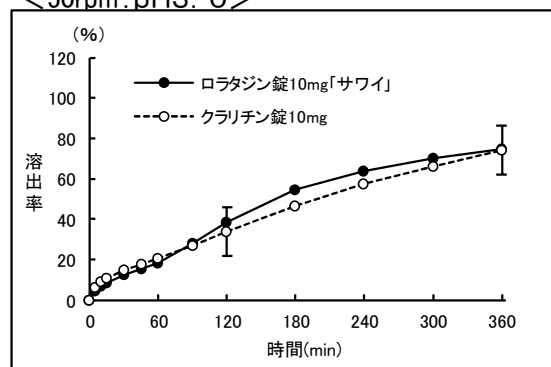
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食 審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、3.0、6.8、水)、100rpm(pH1.2)
試験回数	12ベッセル	

試験製剤	ロラタジン錠10mg「サワイ」
標準製剤	クラリチン錠10mg
結果及び考察	<p><50rpm : pH1. 2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm : pH3. 0> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(120分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。</p> <p><50rpm : pH6. 8> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(180分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm : 水> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(180分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><100rpm : pH1. 2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>

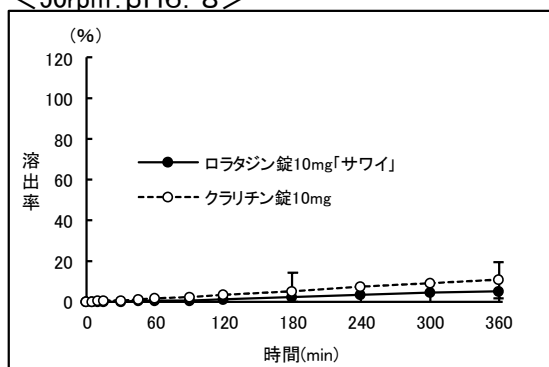
<50rpm : pH1. 2>



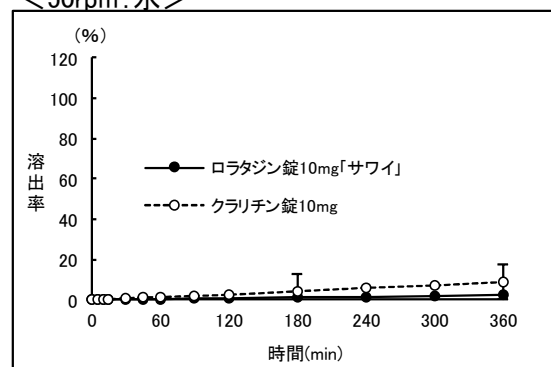
<50rpm : pH3. 0>



<50rpm : pH6. 8>

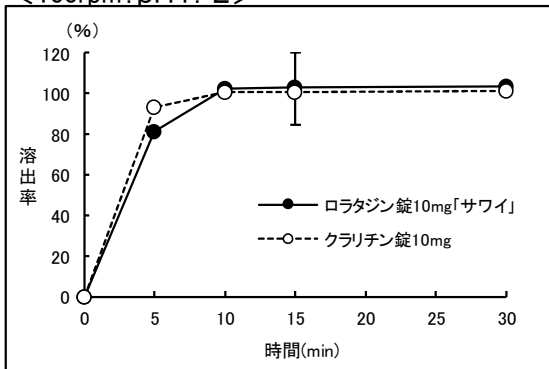


<50rpm : 水>



IV. 製剤に関する項目

<100rpm: pH1. 2>

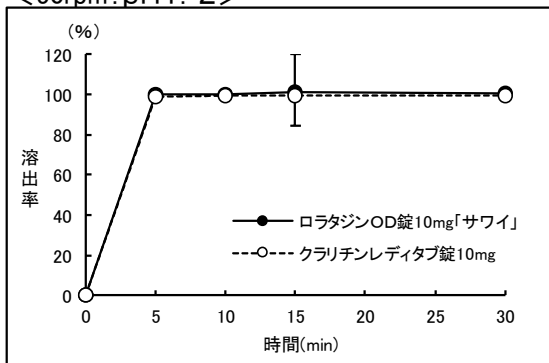


(I : 判定基準の適合範囲)

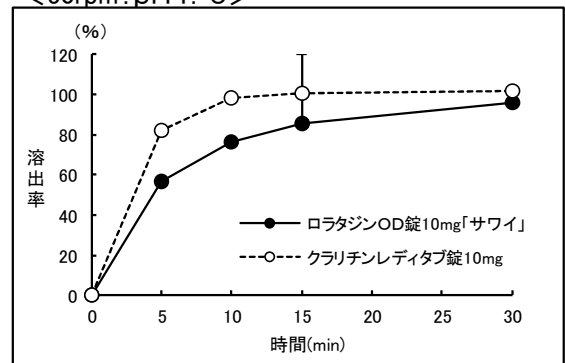
●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」^{13, 14)}

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、4. 0、6. 8、水)、100rpm (pH4. 0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ロラタジンOD錠10mg「サワイ」	
標準製剤	クラリチンレディタブ錠10mg	
結果及び考察	<p><50rpm : pH1. 2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm : pH4. 0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm : pH6. 8> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm : 水> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><100rpm : pH4. 0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>	

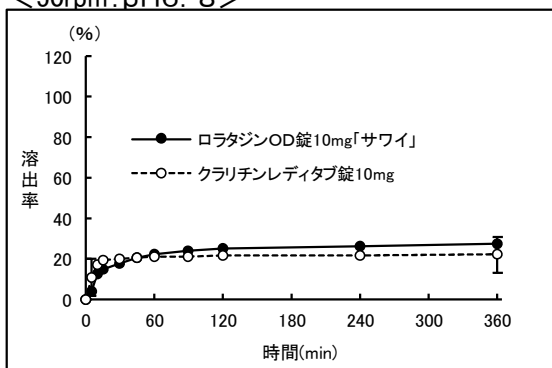
<50rpm: pH1. 2>



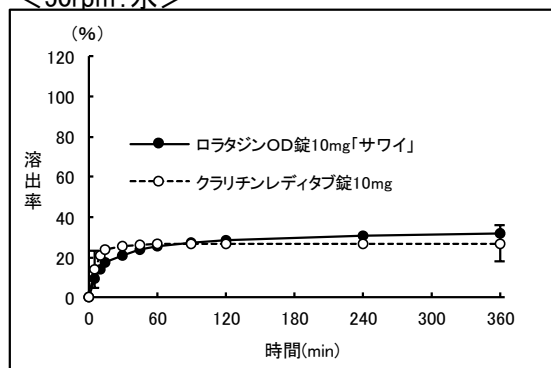
<50rpm: pH4. 0>



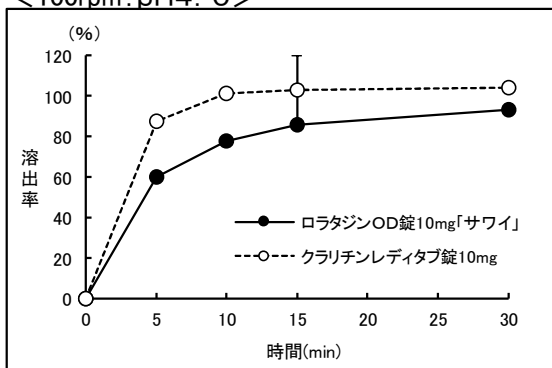
<50rpm: pH6.8>



<50rpm: 水>



<100rpm: pH4.0>

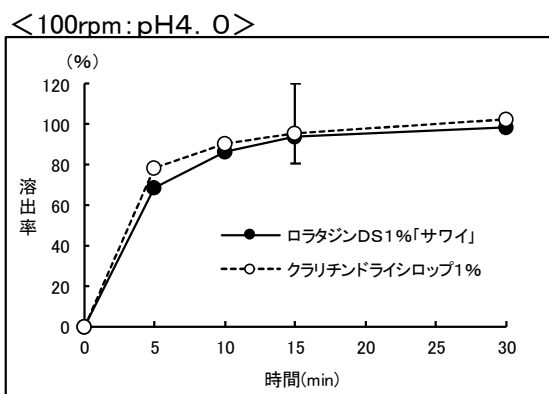
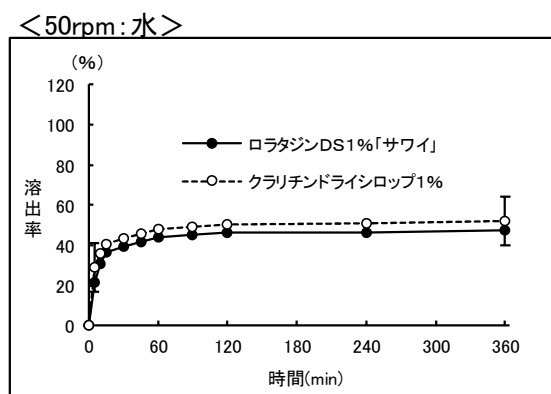
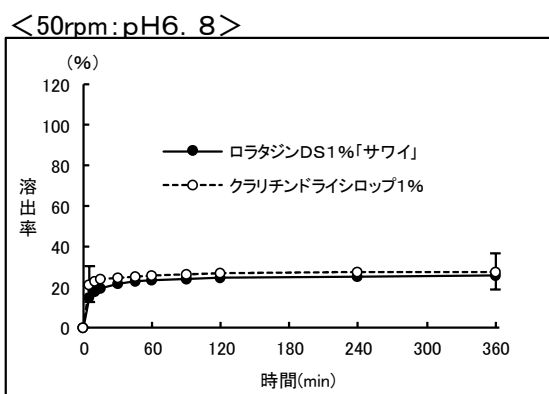
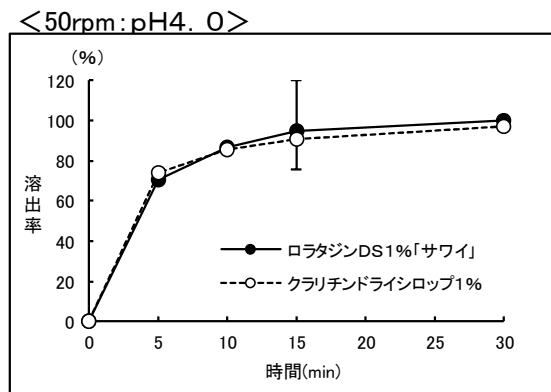
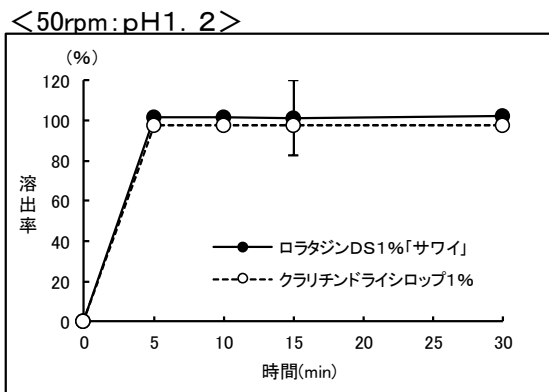


([] : 判定基準の適合範囲)

●ロラタジンDS 1%「サワイ」^{15, 16)}

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm(pH4.0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ロラタジンDS 1%「サワイ」	
標準製剤	クラリチンドライシロップ 1%	
結果及び考察	<p><50rpm: pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm: pH4.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm: pH6.8> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm: 水> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。</p> <p><100rpm: pH4.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>	

IV. 製剤に関する項目



([] : 判定基準の適合範囲)

10. 容器・包装

1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

2) 包装

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

<p>22. 包装</p> <p><ロラタジン錠10mg「サワイ」></p> <p>PTP : 100錠 (10錠×10)</p> <p><ロラタジンOD錠10mg「サワイ」></p> <p>PTP [乾燥剤入り] : 100錠 (10錠×10)</p>

●ロラタジンDS1%「サワイ」

22. 包装

分包：0.5g×150包

バラ〔乾燥剤入り〕：100g

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

●ロラタジン錠10mg「サワイ」

PTP：〔PTPシート〕ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

〔ピロー〕ポリエチレンフィルム

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」

PTP：〔PTPシート〕ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

〔ピロー〕アルミラミネートフィルム

●ロラタジンDS1%「サワイ」

分包：セロニウム

バラ：〔本体〕ポリエチレン瓶、〔中蓋〕ポリエチレン、〔キャップ〕ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

<自動分包機錠剤落下試験>

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」¹⁷⁾

湯山製作所製自動分包機による試験

試験機器：YS-TR-330/260FDS II (ユヤマ)

試験方法：本剤の無包装品について、最上段のカセットからそれぞれ30錠落下させ分包した。

試験結果

	イニシャル	25°C75%RH 1週間保存品
イニシャル用カセット (イニシャルの錠剤をもとに作成したカセット)	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	カセットの中で詰まりが発生し、分包できなくなった。
加湿品用カセット (加湿後の膨潤した錠剤をもとに作成したカセット)	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	カセットの中で詰まりは発生しなかったが、割線部分が割れた錠剤が一部認められた。

IV. 製剤に関する項目

<参考：加湿による錠剤サイズの変化>

イニシャル		→	25°C75%RH 1 週間保存品	
直径 (mm)	厚み (mm)		直径 (mm)	厚み (mm)
8.06	4.25		8.23	4.49

<分散性試験>

●ロラタジンDS 1%「サワイ」¹⁸⁾

目的

本製剤の水に対する分散性について確認するため試験を実施する。

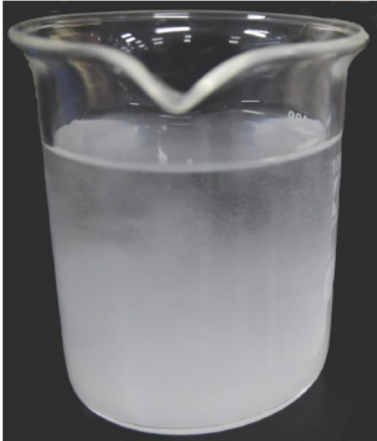



方法

水100mLの入ったビーカーに、ロラタジンDS 1%「サワイ」0.5gをゆっくりと添加し、10分後攪拌する。①製剤を添加した直後、②添加10分後、③攪拌直後、④攪拌10分後の製剤の状態を確認する。

ロット番号及び試験回数

ロット番号	12X03
試験回数	1 回

結果

①添加直後	②添加10分後
全体に分散する傾向が認められた。	一部に堆積傾向が認められた。
	
③攪拌直後	④攪拌10分後
均一に分散した。	ほぼ均一な分散状態が保たれていた。
	

<付着性試験>

●ロラタジンDS1%「サワイ」¹⁹⁾

目的

本製剤の包材に対する付着性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤0.5gをポリエチレン袋[ユニパックB-4]に入れて1分間(150回)振とうさせた後、袋への付着量を測定し、付着率を算出する。

ロット番号及び試験回数

ロット番号	12X03
試験回数	3回

結果

平均付着率(%)	1.71
----------	------

※室温21.0℃、湿度56.2%

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 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. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

1) 用法及び用量の解説

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

6. 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。

●ロラタジンDS1%「サワイ」

6. 用法及び用量

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

2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

2) 臨床薬理試験

該当資料なし

3) 用量反応探索試験

該当資料なし

4) 検証的試験

(1) 有効性検証試験

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験(メキタジンを対照とした比較試験)(成人)

通年性アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験において、ロラタジン錠10mg(1日1回)あるいはメキタジン3mg(1日2回)を1週間投与したときの最終全般改善率(中等度改善以上)はそれぞれ49.4%(39/79)と45.8%(38/83)であった。

副作用は100例中7例(7.0%)に認められた。副作用は、眠気4例(4.0%)、倦怠感2例(2.0%)、胃部不快感、嘔気及び発疹が各1例(1.0%)であった²⁰⁾。

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

通年性アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験において、ロラタジン錠(10mg/日)、ケトチフェンフマル酸塩(ケトチフェンとして2mg/日)あるいはプラセボを2週間投与したときの最終全般改善率(中等度改善以上)はロラタジン群54.9%(56/102)、ケトチフェンフマル酸塩群55.1%(59/107)、プラセボ群39.1%(27/69)であった。また、5鼻症状スコア^{*1}(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感、後鼻漏)の投与前値及び投与2週後(又は中止時)の変化量を下表に示した。

投与群	n	投与前 (標準誤差)	変化量	比較 ^{*2}
ロラタジン	102	8.23 (0.22)	-2.83	ロラタジンvsケトチフェン 95%CI: -0.62~0.69
ケトチフェン	107	7.41 (0.22)	-2.48	
プラセボ	69	7.90 (0.25)	-1.77	

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

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

副作用は103例中26例(25.2%)に認められた。主な副作用は、眠気14例(13.6%)、口渇感3例(2.9%)、咽頭痛、鼻の乾燥感及び倦怠感が各2例(1.9%)等であった²¹⁾。

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

通年性アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験において、ロラタジンシロップ(3~6歳:ロラタジンとして5mg/日、7~15歳:ロラタジンとして10mg/日、非売品)あるいはケトチフェンフマル酸塩(3~6歳:ケトチフェンとして1.2mg/日、7~15歳:ケトチフェンとして2mg/日)を2週間投与した。4鼻症状スコア^{*1}(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感)の投与前値及び投与2週後(又は中止時)の変化量を下表に示した。

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

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

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

副作用は96例中12例(12.5%)に認められた。主な副作用は、傾眠6例(6.3%)、腹痛2例(2.1%)等であった²²⁾。

V. 治療に関する項目

〈蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒〉

17.1.6 国内第Ⅲ相比較試験(メキタジンを対照とした比較試験)(成人)

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

副作用は119例中12例(10.1%)に認められた。副作用は、眠気8例(6.7%)、口渇2例(1.7%)、倦怠感、食欲亢進、腹部不快感及び舌のびらん・疼痛が各1例(0.8%)であった²³⁾。

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

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

そう痒スコア

投与群	n	投与前 (標準誤差)	変化量
ロラタジン	128	1.98 (0.06)	-1.48
ケトチフェン	124	1.97 (0.06)	-1.20
シュードプラセボ	80	2.08 (0.07)	-0.78

発斑スコア

投与群	n	投与前 (標準誤差)	変化量
ロラタジン	128	1.95 (0.06)	-1.41
ケトチフェン	124	1.87 (0.06)	-1.11
シュードプラセボ	80	1.91 (0.07)	-0.82

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

副作用は128例中27例(21.1%)に認められた。主な副作用は、眠気17例(13.3%)、めまい・立ちくらみ・ふらつき感、口渇感及び胃痛が各2例(1.6%)等であった²⁴⁾。

17.1.8 国内一般臨床試験(成人)

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

副作用は284例中22例(7.7%)に認められた。副作用は、眠気15例(5.3%)、倦怠感4例(1.4%)、口渇3例(1.1%)、頭痛、肩こり、胃部不快感及び食欲不振が各1例(0.4%)であった²⁵⁾。

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

代表的なそう痒性皮膚疾患であるアトピー性皮膚炎を対象とした二重盲検比較試験において、ロラタジンドライシロップ(3～6歳：ロラタジンとして5mg/日、7～15歳：ロラタジンとして10mg/日)あるいはケトチフェンフマル酸塩(3～6歳：ケトチフェンとして1.2mg/日、7～15歳：ケトチフェンとして2mg/日)を2週間投与した。主要そう痒スコア^{※1}の投与前値及び投与2週間後(又は中止時)の変化量を下表に示した。

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

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

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

副作用は101例中4例(4.0%)に認められた。副作用は、ALT増加及びAST増加が各2例(2.0%)、 γ -GTP増加、肝機能検査値異常及び傾眠が各1例(1.0%)であった²⁶⁾。

(2) 安全性試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.1 国内長期投与試験(成人)

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

副作用は53例中8例(15.1%)に認められた。副作用は、眠気6例(11.3%)、倦怠感、嘔気及び発疹が各1例(1.9%)であった²⁷⁾。

〈蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒〉

17.1.5 国内長期投与試験(成人)

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

副作用は92例中10例(10.9%)に認められた。副作用は、眠気6例(6.5%)、倦怠感3例(3.3%)、心窩部不快感、腹部膨満感、下痢及び生理遅延が各1例(1.1%)であった²⁸⁾。

5) 患者・病態別試験

該当資料なし

6) 治療的使用

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

該当資料なし

(2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

V. 治療に関する項目

7) その他

17.3 その他

17.3.1 眠気及び運転・機械操作能力に対する影響

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

- (1) 健康成人男女(20例)を対象にパソコンでの数字入力作業による精神運動機能に及ぼす影響を検討したとき、ロラタジン10mg及び20mg^{註)}投与時の正入力数はプラセボ投与時と有意差がなく、精神運動機能に影響を与えなかった²⁹⁾。
- (2) 通年性アレルギー性鼻炎に対する二重盲検比較試験の結果、ロラタジン10mg(103例)の眠気の発現頻度は、プラセボ(70例)と同程度であった²¹⁾。
- (3) 健康成人男女(16例)を対象に入眠までの時間を比較したとき、ロラタジン10mg投与時の平均入眠時間はプラセボ投与時と有意差がなかった³⁰⁾(外国人データ)。
- (4) 健康成人男性(20例)を対象にサーキット上での自動車運転能力に及ぼす影響を検討したとき、ロラタジン10mg及び20mg^{註)}投与時の運転能力はプラセボ投与時と有意差がなく、運転能力に影響を与えなかった³¹⁾(外国人データ)。
- (5) 空軍パイロット及び民間航空会社パイロット(40例)を対象にフライトシミュレーション試験を実施した結果、ロラタジン10mgは、プラセボと比較してパイロットの航空機操作能力に影響を与えなかった³²⁾(外国人データ)。

17.3.2 心血管系に及ぼす影響

健康成人男性(50例)にロラタジン40mg^{註)}を1日1回13週間投与したとき、プラセボ(20例)と比較してQTc間隔を含む心電図及び心拍数への影響は認められなかった³³⁾(外国人データ)。

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

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

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

抗ヒスタミン作用：

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ホモクロルシクリジン塩酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメタジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩³⁴⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

ロラタジン及びDCLは、ヒスタミンH₁受容体拮抗作用を示す。また、ヒスタミン、ロイコトリエンC₄の遊離抑制作用を示す。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミンH₁受容体拮抗作用

ロラタジン及びDCLは、モルモットの肺H₁受容体においてヒスタミンと拮抗し³⁵⁾、モルモット摘出回腸のヒスタミン誘発収縮を抑制した³⁶⁾ (*in vitro*)。DCLのヒトH₁受容体拮抗作用はロラタジンよりも強かった³⁷⁾。また、ロラタジンは、ラットのヒスタミン誘発皮膚血管透過性亢進³⁸⁾、マウスのヒスタミン誘発足蹠浮腫及びモルモットのヒスタミン誘発致死³⁹⁾を抑制した (*in vivo*)。

18.3 ヒスタミン及びロイコトリエンC₄遊離抑制作用

ロラタジン又はDCLは、ラット腹腔肥満細胞又はマウス肥満細胞株MC-9細胞からのヒスタミン又はロイコトリエンC₄遊離を抑制し^{40, 41)} (*in vitro*)、能動感作モルモットに経口投与したときの摘出肺切片からの抗原誘発ヒスタミン遊離を抑制した⁴¹⁾ (*ex vivo*)。

18.4 抗原誘発反応に対する作用

ロラタジンは、ラット及びモルモットの受身皮膚アナフィラキシー反応(PCA反応)並びに能動感作ラット及びモルモットの抗原誘発鼻腔内色素漏出反応を抑制した^{42, 43)}。

18.5 作用の持続性

ラットのヒスタミン誘発皮膚血管透過性亢進に対するロラタジンの抑制作用は、経口投与後12時間においても認められた³⁸⁾ (*in vivo*)。

ヒトにおいて錠10mg単回投与後14時間以上でもヒスタミン誘発皮内反応(膨疹及び紅斑)を抑制した⁴⁴⁾。

3) 作用発現時間・持続時間

VI. -2. -2) 参照

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2) 臨床試験で確認された血中濃度

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男性(6例)にロラタジン錠10、20^{注)}、40mg^{注)}を空腹時に単回経口投与したとき、DCLの血漿中濃度について線形性が認められた⁴⁵⁾。

16.1.2 反復投与

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

健康成人男性(6例)にロラタジン錠20mg^{注)}を1日1回5日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン及びDCL濃度は連投開始後4日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数はともに1.3であった⁴⁶⁾。

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

●ロラタジンDS1%「サワイ」

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

(1) ドライシロップ(10mg)と錠10mgの生物学的同等性

健康成人男性(20例)にロラタジンドライシロップ10mg又は錠10mgを空腹時に単回経口投与したとき、DCLの薬物動態パラメータは以下のとおりであった。ロラタジンドライシロップ10mgと錠10mgは生物学的に同等であることが確認された⁴⁷⁾。

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

※：ドライシロップ/錠(平均±標準偏差、n=20)

16.1.2 反復投与

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

健康成人男性(6例)にロラタジン錠20mg^{注)}を1日1回5日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン及びDCL濃度は連投開始後4日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数はともに1.3であった⁴⁶⁾。

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

<生物学的同等性試験>

●ロラタジン錠10mg「サワイ」^{11, 48)}

通知等	「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
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、2.5、3、4、6、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ロラタジン錠10mg「サワイ」
標準製剤	クラリチン錠10mg

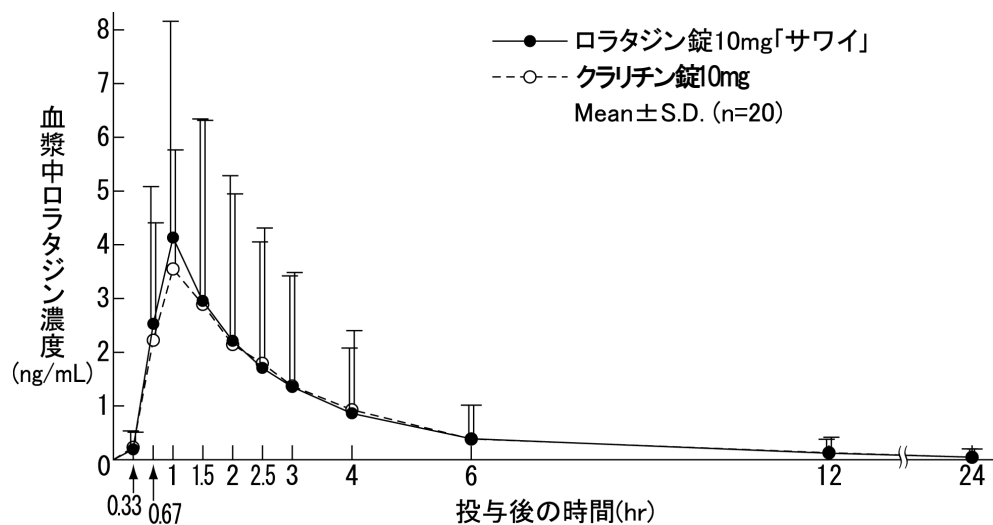
ロラタジン錠10mg「サワイ」とクラリチン錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ロラタジンとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロラタジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。またロラタジンの代謝物であるDCL(descarboethoxyloratadine)についても、血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について、生物学的同等性試験ガイドラインに準じて統計解析を行った結果、対数値の平均値の差の90%信頼区間の判定基準を満たすことが確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUCt (ng・hr/mL)
未変化体	ロラタジン錠10mg 「サワイ」	4.43±4.02	1.1±0.5	2.9±2.4	11.34±15.56
	クラリチン錠10mg	4.35±3.54	1.1±0.7	2.9±2.4	11.17±14.64
代謝物	ロラタジン錠10mg 「サワイ」	2.79±0.96	1.6±0.5	12.9±3.3	23.97± 8.38
	クラリチン錠10mg	2.80±1.05	1.6±0.8	12.8±2.4	23.82± 9.03

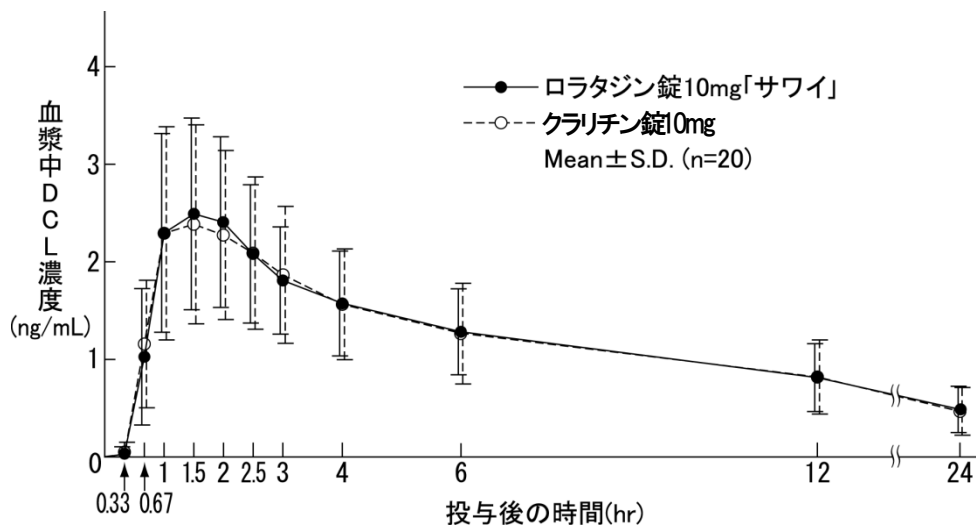
(Mean±S.D.)

【未変化体】



VII. 薬物動態に関する項目

【代謝物】



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUCt	log(0.98)	log(0.93) ~ log(1.04)
Cmax	log(0.97)	log(0.88) ~ log(1.07)

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

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」^{13,49)}

通知等	「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
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、2.5、3、4、6、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
標準製剤	クラリチンレディタブ錠10mg

ロラタジンOD錠10mg「サワイ」とクラリチンレディタブ錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ロラタジンとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロラタジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、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。

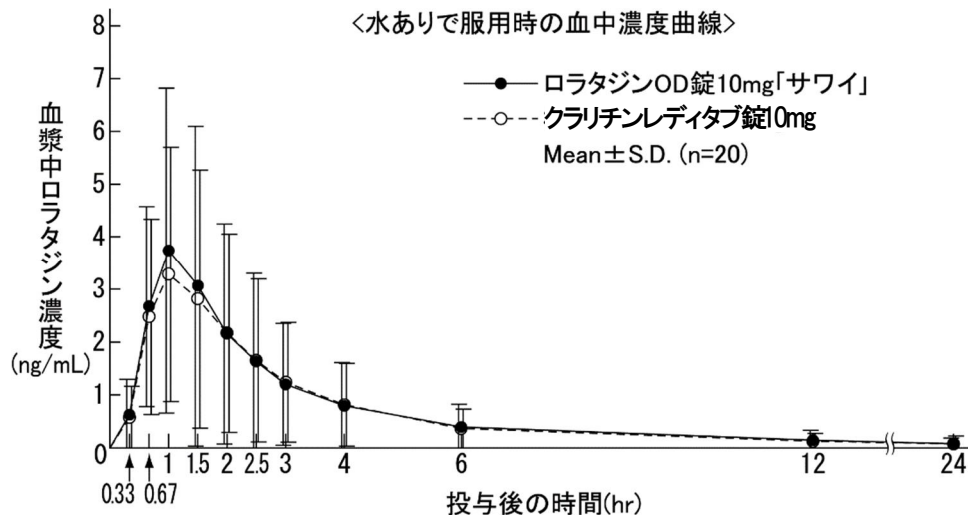
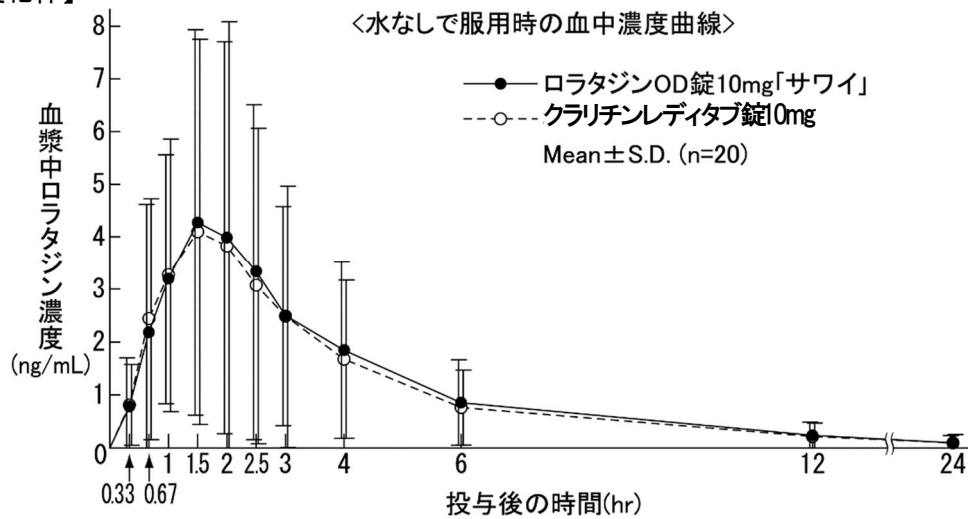
またロラタジンの代謝物であるDCL(descarboethoxyloratadine)についても、血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について、生物学的同等性試験ガイドラインに準じて統計解析を行った結果、対数値の平均値の差の90%信頼区間の判定基準を満たすことが確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

			Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUCt (ng·hr/mL)
未変化体	水なし	ロラタジンOD錠 10mg「サワイ」	5.02±3.88	1.5±0.5	4.2±2.5	18.91±15.95
		クラリチン レディタブ錠10mg	4.98±4.37	1.5±0.6	4.4±3.0	17.93±15.98
	水あり	ロラタジンOD錠 10mg「サワイ」	3.86±3.05	0.9±0.2	6.3±5.2	11.64±10.82
		クラリチン レディタブ錠10mg	3.58±2.46	1.0±0.3	4.7±4.5	11.02± 9.64
代謝物	水なし	ロラタジンOD錠 10mg「サワイ」	2.95±1.32	1.9±0.7	12.1±3.0	26.80± 9.39
		クラリチン レディタブ錠10mg	3.08±1.27	1.7±0.6	12.0±2.7	27.71± 9.29
	水あり	ロラタジンOD錠 10mg「サワイ」	3.35±1.29	1.3±0.3	14.0±5.6	27.45± 7.81
		クラリチン レディタブ錠10mg	3.36±1.00	1.3±0.5	13.8±4.8	29.56±10.36

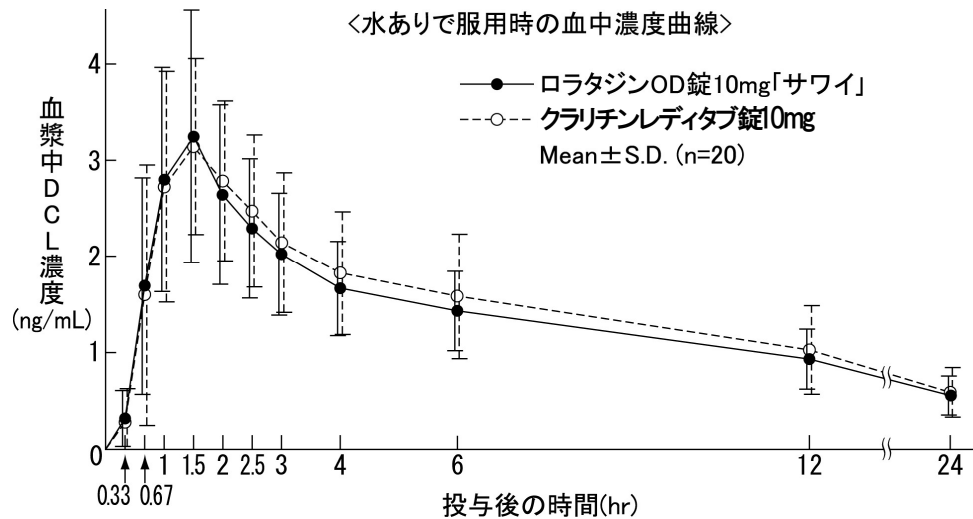
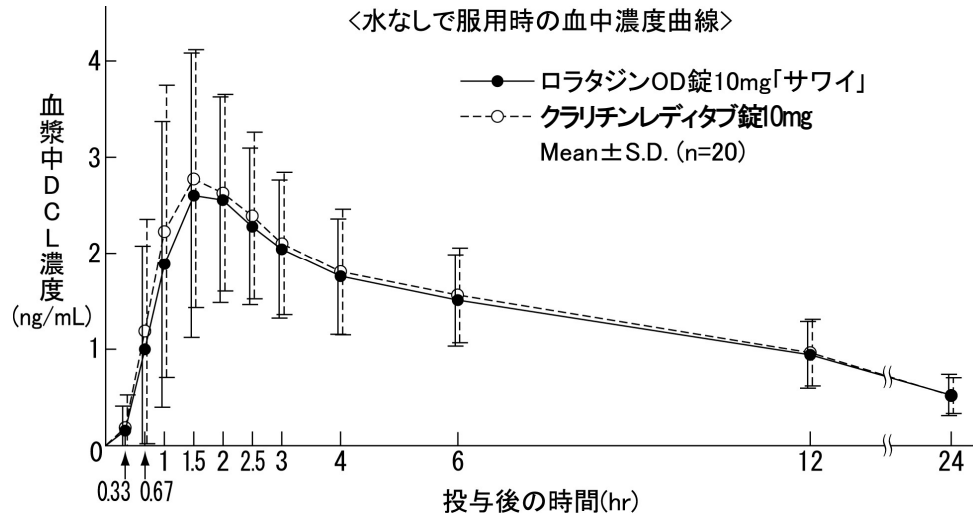
(Mean±S.D.)

【未変化体】



VII. 薬物動態に関する項目

【代謝物】



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUCt	log (1.09)	log (1.00) ~ log (1.20)
	Cmax	log (1.06)	log (0.99) ~ log (1.13)
水あり	AUCt	log (1.03)	log (0.91) ~ log (1.16)
	Cmax	log (1.02)	log (0.91) ~ log (1.15)

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

●ロラタジンDS1%「サワイ」^{15,50)}

通知等	「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
採血時点	0、0.25、0.5、0.75、1、1.5、2、3、4、6、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ロラタジンDS1%「サワイ」
標準製剤	クラリチンドライシロップ1%

VII. 薬物動態に関する項目

ロラタジンDS 1%「サワイ」とクラリチンドライシロップ 1%を健康成人男子にそれぞれ 1g(ロラタジンとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロラタジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

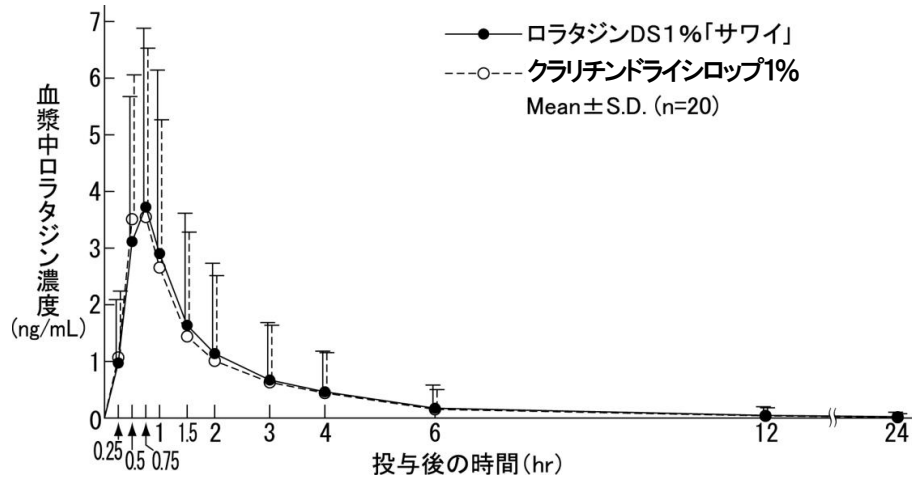
またロラタジンの代謝物であるDCL(descarboethoxyloratadine)についても、血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について、生物学的同等性試験ガイドラインに準じて統計解析を行った結果、対数値の平均値の差の90%信頼区間の判定基準を満たすことが確認された。

各製剤 1g投与時の薬物動態パラメータ

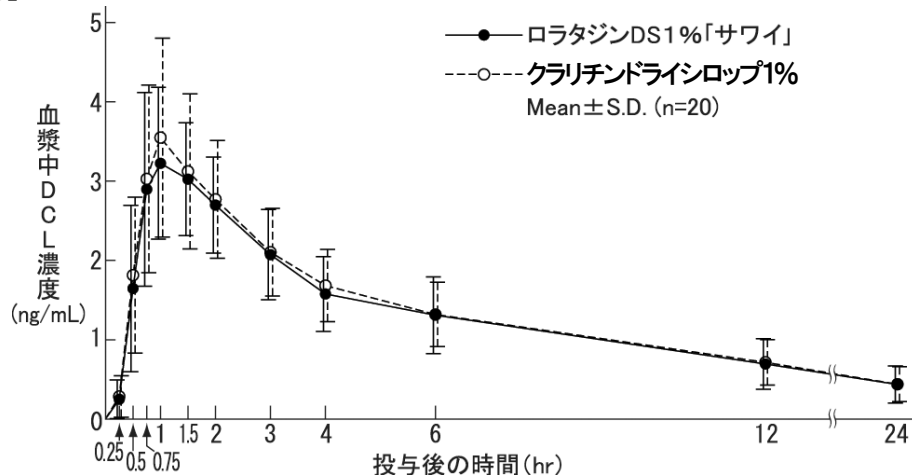
		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUCt (ng・hr/mL)
未変化体	ロラタジンDS 1% 「サワイ」	4.37±3.50	0.7±0.2	2.2±1.8	7.34±9.57
	クラリチン ドライシロップ 1%	4.09±3.12	0.6±0.1	1.9±1.4	6.84±9.09
代謝物	ロラタジンDS 1% 「サワイ」	3.46±0.92	1.2±0.4	10.8±2.0	24.53±8.17
	クラリチン ドライシロップ 1%	3.63±1.20	1.1±0.3	11.1±2.4	25.25±7.91

(Mean±S.D.)

【未変化体】



【代謝物】



Ⅶ. 薬物動態に関する項目

	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUCt	log(0.99)	log(0.89)～log(1.11)
Cmax	log(1.04)	log(0.91)～log(1.18)

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

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

● ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

16.2.1 食事の影響(錠10mg)

健康成人男性(12例)にロラタジン錠10mgを食後又は空腹時に単回経口投与したときのロラタジン及びDCLの薬物動態パラメータは、以下のとおりであった⁵¹⁾※。

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

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

(平均±標準偏差、n=12)

● ロラタジンDS1%「サワイ」

16.2.1 食事の影響(シロップ10mg)

健康成人男性(12例)にロラタジンシロップ10mg(非売品)を食後又は空腹時に単回経口投与したときのロラタジン及びDCLの薬物動態パラメータは、以下のとおりであった⁵²⁾※。

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

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

(平均±標準偏差、n=12)

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg/DS 1%「サワイ」

16.7 薬物相互作用

健康成人男性にロラタジン錠10mg及びエリスロマイシン(CYP3A4の阻害剤)又はシメチジン(CYP3A4及びCYP2D6の阻害剤)を空腹時に10日間経口投与したときの血漿中ロラタジン及びDCL濃度の変化率は下表に示すとおりであったが、QTc間隔を含め心電図への影響は認められなかった^{53,54)}。健康成人男性にロラタジン錠10mg及びケトコナゾール(国内では外用剤のみ発売)を空腹時に10日間経口投与したとき、血漿中ロラタジン及びDCL濃度の変化率は下表に示すとおりであったが、QTc間隔を含め心電図への影響は認められなかった⁵⁴⁾(外国人データ)。^[10.2参照]

併用薬	n	ロラタジン		DCL	
		Cmax	AUC	Cmax	AUC
エリスロマイシン (500mg 1日3回)	22	+53%	+40%	+61%	+46%
シメチジン (300mg 1日4回)	24	+121%	+103%	+6%	+6%
ケトコナゾール (200mg 1日2回)	24	+223%	+307%	+67%	+73%

VIII. -7. 参照

2. 薬物速度論的パラメータ.....

1) 解析方法

該当資料なし

2) 吸収速度定数

該当資料なし

3) 消失速度定数

●ロラタジン錠10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ロラタジンとして10mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{11,48)}

ロラタジン：0.348±0.170hr⁻¹、DCL：0.056±0.011hr⁻¹

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ロラタジンとして10mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{13,49)}

ロラタジン：[水なし]0.235±0.136hr⁻¹、[水あり]0.206±0.150hr⁻¹

DCL：[水なし]0.060±0.014hr⁻¹、[水あり]0.054±0.013hr⁻¹

●ロラタジンDS 1%「サワイ」を健康成人男子に1g(ロラタジンとして10mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{15,50)}

ロラタジン：0.440±0.207hr⁻¹、DCL：0.066±0.010hr⁻¹

4) クリアランス

該当資料なし

5) 分布容積

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

1) 解析方法

該当資料なし

2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

VII. -1. -4) 参照

5. 分布

16.3.2 組織中放射能濃度(ラット)

ラット(n=3)に¹⁴C-ロラタジンを反復経口投与したとき、組織中放射能は大部分の組織で血漿より高く、特に下垂体、甲状腺、副腎、肝臓、涙腺、肺に高濃度の分布が認められた。また、脳内濃度は血漿より低かった。組織中放射能の生物学的半減期は、いずれの組織とも血漿より長かった。甲状腺では14日間反復投与でも定常状態に到達せず、蓄積性が示唆された⁵⁵⁾。

1) 血液-脳関門通過性

VII. -5. 参照

2) 血液-胎盤関門通過性

VIII. -6. -5) 参照

3) 乳汁への移行性

VII. -7. 及びVIII. -6. -6) 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

VII. -5. 参照

6) 血漿蛋白結合率

16.3.1 血漿タンパク結合

ヒト血漿に添加したときのタンパク結合率は、ロラタジン96.8~97.9%、DCL73.3~75.6%であった(測定法:平衡透析法)⁵⁶⁾ (*in vitro*)。

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

ロラタジンは、ヒトに経口投与したとき、消化管から速やかに吸収され、初回通過効果によってDCLへと代謝される⁵⁷⁾。ヒトの肝ミクロソームを用いた*in vitro*試験から、ロラタジンからDCLへの代謝にはCYP3A4及びCYP2D6の関与が確認されている⁵⁸⁾。[10. 参照]

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

VII. -6. -1) 参照

3) 初回通過効果の有無及びその割合

VII. -6. -1) 参照

4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

16.8 その他

DCLの効力比は未変化体(ロラタジン)の7.9倍であり、ヒトに経口投与したときの主たる薬効に寄与しているのはDCLである⁵⁹⁾。

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人男性(6例)に¹⁴C-ロラタジン40mg^{注)}(水溶液)を空腹時に単回経口投与したとき、投与10日後までに総投与量の約80%が代謝物として尿及び糞中へ等量ずつ排泄された。尿中にロラタジンは検出されず、DCLは尿中放射能の2%未満であった⁵⁷⁾(外国人データ)。

授乳婦(6例)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与したとき、少量のロラタジン及びDCLが母乳中に検出された。投与後48時間までの移行率は0.03%であった。AUC_{母乳}/AUC_{血漿}比は、ロラタジン及びDCLについてそれぞれ1.2及び0.8であった⁶⁰⁾(外国人データ)。[9.6参照]

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

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

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

VII. -10. 及びVIII. -10. 参照

VII. 薬物動態に関する項目

10. 特定の背景を有する患者

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

(1) 薬物動態パラメータ

腎機能障害患者(12例:クレアチニンクリアランス \leq 29mL/min)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度のCmax及びAUCは、健康成人男性(6例:クレアチニンクリアランス $>$ 80mL/min)との比較において、ロラタジンでは1.5~1.7倍、DCLでは約2倍に上昇した。腎機能障害患者におけるロラタジン及びDCLの $t_{1/2}$ はそれぞれ平均8時間及び20時間であり、いずれも健康成人と明らかな差は認められなかった⁶¹⁾(外国人データ)。^[9.2参照]

(2) 血液透析患者

重症の腎機能障害患者(6例:クレアチニンクリアランス $<$ 5 mL/min)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与後4~8時間(計4時間)に血液透析を行ったとき、血液透析を行わない場合と比較して、血漿中ロラタジン及びDCL濃度に変動は認められず、ロラタジン及びDCLともに透析液中へはほとんど排出されなかった⁶¹⁾(外国人データ)。^[13.2参照]

16.6.2 肝機能障害患者

肝機能障害患者(7例)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、健康成人男性(24例)との比較において、ロラタジンではCmaxが1.4~1.7倍、AUCが2.8~3.8倍に上昇し、DCLではCmax、AUCともに健康成人と明らかな差は認められなかった。肝機能障害患者におけるロラタジン及びDCLの $t_{1/2}$ はそれぞれ平均24.1時間及び37.1時間であり、健康成人の2~3倍に延長していた⁶²⁾(外国人データ)。^[9.3参照]

16.6.3 小児

健康小児(13例、8~12歳)にロラタジンシロップ10mg(非売品)を食後に単回経口投与したときのロラタジン及びDCLの薬物動態パラメータは、以下のとおりであった⁶³⁾(外国人データ)。

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

(平均±標準偏差、n=13)

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

16.6.4 高齢者

高齢者(12例、66~78歳)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、非高齢の成人男性(24例、21~39歳)との比較において、ロラタジンではCmaxが1.6~1.9倍、AUCが1.5~2.0倍に上昇した。DCLではCmaxが約1.7倍であったが、AUCに明らかな差は認められなかった。高齢者でのロラタジン及びDCLの $t_{1/2}$ はそれぞれ平均18.2時間及び17.4時間であった⁶⁵⁾(外国人データ)。^[9.8参照]

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

●ロラタジンDS1%「サワイ」

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

(1) 薬物動態パラメータ

腎機能障害患者(12例：クレアチニンクリアランス \leq 29mL/min)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度のCmax及びAUCは、健康成人男性(6例：クレアチニンクリアランス $>$ 80mL/min)との比較において、ロラタジンでは1.5~1.7倍、DCLでは約2倍に上昇した。腎機能障害患者におけるロラタジン及びDCLの $t_{1/2}$ はそれぞれ平均8時間及び20時間であり、いずれも健康成人と明らかな差は認められなかった⁶¹⁾(外国人データ)。^[9.2参照]

(2) 血液透析患者

重症の腎機能障害患者(6例：クレアチニンクリアランス $<$ 5 mL/min)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与後4~8時間(計4時間)に血液透析を行ったとき、血液透析を行わない場合と比較して、血漿中ロラタジン及びDCL濃度に変動は認められず、ロラタジン及びDCLともに透析液中へはほとんど排出されなかった⁶¹⁾(外国人データ)。^[13.2参照]

16.6.2 肝機能障害患者

肝機能障害患者(7例)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、健康成人男性(24例)との比較において、ロラタジンではCmaxが1.4~1.7倍、AUCが2.8~3.8倍に上昇し、DCLではCmax、AUCともに健康成人と明らかな差は認められなかった。肝機能障害患者におけるロラタジン及びDCLの $t_{1/2}$ はそれぞれ平均24.1時間及び37.1時間であり、健康成人の2~3倍に延長していた⁶²⁾(外国人データ)。^[9.3参照]

16.6.3 小児

高年齢層(13例、8~12歳)及び低年齢層(18例、2~5歳)の健康小児にそれぞれロラタジンシロップ10mg及び5mg(非売品)を食後に単回経口投与したときのロラタジン及びDCLの薬物動態パラメータは、以下のとおりであった^{66,67)}(外国人データ)。

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

(平均 \pm 標準偏差)

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

16.6.4 高齢者

高齢者(12例、66~78歳)にロラタジンカプセル40mg^{注)}(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、非高齢の成人男性(24例、21~39歳)との比較において、ロラタジンではCmaxが1.6~1.9倍、AUCが1.5~2.0倍に上昇した。DCLではCmaxが約1.7倍であったが、AUCに明らかな差は認められなかった。高齢者でのロラタジン及びDCLの $t_{1/2}$ はそれぞれ平均18.2時間及び17.4時間であった⁶⁵⁾(外国人データ)。^[9.8参照]

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

VII. 薬物動態に関する項目

11. その他.....

該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1. 警告内容とその理由……………
設定されていない
2. 禁忌内容とその理由……………
2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)
2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………
設定されていない
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………
設定されていない
5. 重要な基本的注意とその理由……………
8. 重要な基本的注意
〈効能共通〉
8.1 効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。
〈アレルギー性鼻炎〉
8.2 季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………
1) 合併症・既往歴等のある患者
9.1 合併症・既往歴等のある患者
9.1.1 てんかんの既往のある患者
十分な問診を行うこと。発作があらわれたとの報告がある。[11. 1. 2参照]
- 2) 腎機能障害患者
9.2 腎機能障害患者
ロラタジン及び活性代謝物descarboethoxyloratadine (DCL) の血漿中濃度が上昇するおそれがある。[16. 6. 1参照]
- 3) 肝機能障害患者
9.3 肝機能障害患者
ロラタジンの血漿中濃度が上昇するおそれがある。[16. 6. 2参照]
- 4) 生殖能を有する者
設定されていない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

5) 妊婦

9.5 妊婦

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

6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト母乳中への移行が報告されている。[16.5参照]

7) 小児等

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

9.7 小児等

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

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

●ロラタジンDS1%「サワイ」

9.7 小児等

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

8) 高齢者

9.8 高齢者

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

7. 相互作用

10. 相互作用

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

1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

2) 併用注意とその理由

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

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

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

11.1.2 てんかん(頻度不明)

[9.1.1参照]

11.1.3 痙攣(頻度不明)

11.1.4 肝機能障害、黄疸(いずれも頻度不明)

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

2) その他の副作用

11.2 その他の副作用				
	1%以上	0.1~1%未満	0.1%未満	頻度不明
精神神経系	眠気、倦怠感	めまい、頭痛		
呼吸器		鼻の乾燥感、咽頭痛		
消化器		腹痛、口渇、嘔気・嘔吐、下痢、便秘、口内炎	口唇乾燥	胃炎
過敏症		発疹	じん麻疹	発赤、紅斑、そう痒
皮膚				脱毛
肝臓		ALT上昇、AST上昇、ビリルビン値上昇、 γ -GTP上昇、Al-P上昇		
腎臓		BUN上昇、タンパク尿		尿閉
循環器		動悸	頻脈	
血液		好酸球増多、白血球減少、好中球減少、単球増多、リンパ球減少、白血球増多、リンパ球増多、ヘマトクリット減少、ヘモグロビン減少、好塩基球増多、血小板減少、好中球増多		

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	1%以上	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
その他		尿糖、眼球乾燥、耳鳴、ほてり	味覚障害、月経不順、胸部不快感	不正子宮出血、胸痛、難聴、浮腫(顔面・四肢)

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

アレル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。

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

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

13.2 処置

本剤は血液透析によって除去できない。[16.6.1参照]

11. 適用上の注意

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

〈製剤共通〉

14.1.1 PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

〈OD錠〉

14.1.2 本剤は舌の上に乗せて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

14.1.3 本剤は寝たままの状態では水なしで服用しないこと。

●ロラタジンDS1%「サワイ」

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

用時調製して用いる製剤であるため、調製後は速やかに使用すること。

12. その他の注意

1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験
 - 1) 薬効薬理試験
「VI. 薬効薬理に関する項目」参照
 - 2) 安全性薬理試験
該当資料なし
 - 3) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験
 - 1) 単回投与毒性試験
該当資料なし
 - 2) 反復投与毒性試験
該当資料なし
 - 3) 遺伝毒性試験
該当資料なし
 - 4) がん原性試験
該当資料なし
 - 5) 生殖発生毒性試験
VIII. -6. -5) 参照
 - 6) 局所刺激性試験
該当資料なし
 - 7) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

	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

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

20. 取扱い上の注意 〈OD錠〉 アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。
--

●ロラタジンDS1%「サワイ」

VIII. -11. 参照

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分：クラリチン錠10mg/レディタブ錠10mg/ドライシロップ1%

同効薬：抗ヒスタミン作用

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ホモクロルシクリジン塩酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンプモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩³⁴⁾

7. 国際誕生年月日

該当しない

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

製品名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
ロラタジン錠10mg 「サワイ」	2011年7月15日	22300AMX00811000	2011年11月28日	2011年11月28日
ロラタジンOD錠10mg 「サワイ」	2011年7月15日	22300AMX00812000	2011年11月28日	2011年11月28日
ロラタジンDS 1 % 「サワイ」	2013年2月15日	22500AMX00070000	2013年6月21日	2013年6月21日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容……………

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg「サワイ」

承認年月日：2012年2月16日

用法及び用量内容：小児に対する用法及び用量を追加した。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容……………

該当しない

11. 再審査期間……………

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報……………

本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード……………

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
ロラタジン錠10mg 「サワイ」	4490027F1014	4490027F1146	121007101	622100701
ロラタジンOD錠10mg 「サワイ」	4490027F2010	4490027F2142	121008801	622100801
ロラタジンDS 1 % 「サワイ」	4490027R1010	4490027R1061	122566201	622256601

14. 保険給付上の注意……………

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 医療用医薬品最新品質情報集(ブルーブック) <<https://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>> (2025/10/1 アクセス)
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品の安定性(加速試験)] ロラタジン錠10mg「サワイ」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロラタジン錠10mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品の安定性(加速試験)] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶解後の安定性試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[配合変化試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」
- 11) 竹内譲他, 新薬と臨床, 60(9), 1837(2011)
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロラタジン錠10mg「サワイ」
- 13) 佐竹一夫他, 新薬と臨床, 60(9), 1823(2011)
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 15) 田中孝典他, 新薬と臨床, 62(3), 540(2013)
- 16) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」
- 17) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包機錠剤落下試験] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 18) 沢井製薬(株) 社内資料[分散性試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」
- 19) 沢井製薬(株) 社内資料[付着性試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」
- 20) 奥田稔他: 耳展, 1992; 35(補4): 327-345
- 21) プラセボ及びケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験(クラリチン錠: 2002年7月5日承認、申請資料概要ト.1.1.3.3)
- 22) 石川哮他: 臨床医薬, 2007; 23: 965-990
- 23) 久木田淳他: 臨床医薬, 1990; 6: 2689-2705
- 24) シュードプラセボ及びケトチフェンフマル酸塩を対照とした比較試験(クラリチン錠: 2002年7月5日承認、申請資料概要ト.1.1.2.3)
- 25) 久木田淳他: 臨床医薬, 1990; 6: 2443-2456
- 26) 川島眞他: 臨床医薬, 2007; 23: 991-1016
- 27) 奥田稔他: 耳展, 1992; 35(補1): 13-26
- 28) 久木田淳他: 臨床医薬, 1990; 6: 2457-2468
- 29) Nakano, S. et al.: 臨床薬理, 2007; 38: 401-407
- 30) Roth, T. et al.: J. Allergy Clin. Immunol., 1987; 80: 94-98
- 31) 運転操作に対する影響(クラリチン錠: 2002年7月5日承認、申請資料概要ト.1.2.3)
- 32) Neves-Pinto, R. M. et al.: American J. Rhinology, 1992; 6: 23-27
- 33) 心電図に及ぼす影響の検討(クラリチン錠: 2002年7月5日承認、申請資料概要ト.1.2.4)
- 34) 薬剤分類情報閲覧システム <<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2025/10/1 アクセス)

- 35) モルモットのH₁受容体親和性(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要ホ.1.4.1)
- 36) モルモットのヒスタミン誘発収縮に対する作用(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要ホ.1.4.1)
- 37) Anthes, J. C. et al. : Eur. J. Pharmacol., 2002 ; 449 : 229-237
- 38) ラットのヒスタミン誘発皮膚血管透過性亢進に対する作用(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要ホ.1.2.1)
- 39) Barnett, A. et al. : Agents Actions, 1984 ; 14 : 590-597
- 40) Kreutner, W. et al. : Allergy, 1987 ; 42 : 57-63
- 41) 亀井千晃他：薬理と治療, 1996 ; 24 : 49-52
- 42) アレルギー性皮膚炎モデルにおける作用(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要ホ.1.1.1)
- 43) アレルギー性鼻炎モデルにおける作用(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要ホ.1.1.2)
- 44) 中島光好他：臨床医薬, 1990 ; 6 : 1537-1549
- 45) 第I相臨床試験(単回投与)(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.4.2.1)
- 46) 第I相臨床試験(反復投与)(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.4.2.2)
- 47) 健康成人におけるドライシロップ剤と錠剤の生物学的同等性試験(クラリチン錠/レディタブ錠/ドライシロップ：2007年10月19日承認、申請資料概要2.7.6.2.4)
- 48) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロラタジン錠10mg「サワイ」
- 49) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 50) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロラタジンDS1%「サワイ」
- 51) 食事の影響(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.4.3)
- 52) シロップ剤における食事の影響(クラリチン錠/レディタブ錠/ドライシロップ：2007年10月19日承認、申請資料概要2.7.1.2.4, 2.7.6.2)
- 53) Brannan, M. D. et al. : Clin. Pharmacol. Ther., 1995 ; 58 : 269-278
- 54) Kosoglou, T. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol., 2000 ; 50 : 581-589
- 55) ラットの組織中濃度(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.3.2.1)
- 56) 血漿タンパク結合(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.3.2.4)
- 57) ヒトにおける薬物動態試験(代謝、排泄)(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.3.3.1, へ.4.1)
- 58) Yumibe, N. et al. : Biochem. Pharmacol., 1996 ; 51 : 165-172
- 59) ロラタジン及びその代謝物の作用(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要ホ.1.5.3)
- 60) Hilbert, J. et al. : J. Clin. Pharmacol., 1988 ; 28 : 234-239
- 61) 腎機能障害患者における薬物動態(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.4.6)
- 62) 肝機能障害患者における薬物動態(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.4.5)
- 63) 小児における薬物動態(クラリチン錠/レディタブ錠/ドライシロップ：2007年10月19日承認、申請資料概要2.7.6.4.1.5)
- 64) 小児及び成人患者における国内製造販売後臨床薬理試験(クラリチン錠/レディタブ錠/ドライシロップ：2015年9月17日再審査報告書)
- 65) 高齢者における薬物動態(クラリチン錠：2002年7月5日承認、申請資料概要へ.4.4)
- 66) 小児における薬物動態(クラリチン錠/レディタブ錠/ドライシロップ：2007年10月19日承認、申請資料概要2.7.6.4.1)
- 67) 小児における薬物動態(クラリチン錠/レディタブ錠/ドライシロップ：2007年10月19日承認、申請資料概要2.7.6.4.2)

X I. 文献

- 68) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ロラタジン錠10mg「サワイ」
- 69) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 70) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロラタジン錠10mg「サワイ」
- 71) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロラタジンOD錠10mg「サワイ」
- 72) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロラタジンDS 1%「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報.....
 該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

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

1) 粉砕

<粉砕後の安定性試験>

●ロラタジン錠10mg「サワイ」⁶⁸⁾

ロラタジン錠10mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験※	100.0	101.0	101.1	100.7

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」⁶⁹⁾

ロラタジンOD錠10mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験※	100.0	97.8	97.7	97.8

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

<崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>

●ロラタジン錠10mg「サワイ」⁷⁰⁾

試験方法

1. ロラタジン錠10mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr. (外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

備考

上記の状態から更に10分間(合計20分間)放置したところ、錠剤は完全には崩壊していなかったが、その状態で8Fr. チューブに注入すると水圧で崩壊し、通過した。

●ロラタジンOD錠10mg「サワイ」⁷¹⁾

試験方法

1. ロラタジンOD錠10mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr. (外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	錠剤は30秒後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

●ロラタジンDS1%「サワイ」⁷²⁾

試験方法

1. ロラタジンDS1%「サワイ」を1包(0.5g)、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、製剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr. (外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	温湯採取直後に懸濁状態となり、転倒混和したところほぼ均一に溶解した
チューブ通過性	通過した

2. その他の関連資料

患者向け資料

●ロラタジン錠10mg/OD錠10mg/DS1%「サワイ」

- ・気になる皮膚のかゆみ じんましん
- ・花粉症のセルフケアと治療法

●ロラタジンDS1%「サワイ」

- ・ロラタジンDS1%「サワイ」の飲ませ方

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

<配合変化試験成績>

●ロラタジンDS1%「サワイ」¹⁰⁾

<配合方法>

ロラタジンDS1%「サワイ」(以下、当社製剤)と他剤を配合し、配合剤の性状(外観、におい、湿潤性、流動性、再分散性、pH)を観察し、含量を測定した。

含量は配合直後のロラタジン量を100%とし、()に表示量に対する含有率を%で示した。

A：当社製剤を配合薬剤(粉末製剤)と混合した。

B：当社製剤を配合薬剤(シロップ剤)と混合した。

C：当社製剤を食品・飲料と混合した。

(保存条件)温度：1～30℃(室温) 期間：7日間(A, B)又は24時間(C)

貯法：シャーレ内保存・散光下[A, C(食品の場合)]

プラスチック容器・密栓・散光下[B, C(飲料の場合)]

流動性：「良好」、「少し悪化」、「悪化」、「固化」の4段階で評価した。

再分散性：試験液を入れた試験管を5秒間倒立させ、次いで5秒間正立する。この操作を1回として、懸濁液が均質に分散するまでの回数が9回までは良好、10回以上は不良とした。

※2013年6月作成の配合変化試験成績を掲載した。

ロラタジンDS 1%「サワイ」 配合変化試験成績

【粉末製剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前の外観、におい)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
去 た ん 剤	ムコダインDS50% 外観：白色 におい：なし	L-カルボシ ステイン	0.3g	0.5g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(96.8)	-	-	101.6					
	ムコサールドライシロップ 1.5% 外観：白色 におい：ヨーグルト様のにおい	アムプロキシ ール塩酸塩	0.3g	0.5g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
流動性						良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(99.3)	-	-	100.7						
気 管 支 拡 張 剤	メプチンドライシロップ 0.005% 外観：白色 におい：なし	プロカテロー ル塩酸塩水和 物	0.38g	0.5g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
含量(%)	100.0(99.6)	-	-	100.7						
ア レ ル ギ ー 用 剤	オノンドライシロップ10% 外観：微黄色 におい：なし	برانلکاست ト水和物	0.5g	0.5g	A	外観	白色と微黄色の混合物	白色と微黄色の混合物	白色と微黄色の混合物	白色と微黄色の混合物
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(101.0)	-	-	99.6					
	برانلکاستDS10% 「サワイ」 外観：白色 におい：なし	برانلکاست ト水和物	0.5g	0.5g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(101.4)	-	-	99.5					
	シングレア細粒4mg 外観：白色 におい：なし	モンテルカス トナトリウム	1包	0.5g	A	外観	白色	白色	白色	白色
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
湿潤性						なし	なし	なし	なし	
流動性						良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(102.1)	-	-	99.8						
抗 生 物 質 製 剤	フロモックス小児用細粒 100mg 外観：赤白色 におい：芳香あり	セフカペン ビ ボキシル塩酸 塩水和物	0.45g	0.5g	A	外観	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(100.0)	-	-	100.9					
	セフカペンビボキシル塩酸塩 小児用細粒10%「サワイ」 外観：赤白色 におい：芳香あり	セフカペン ビ ボキシル塩酸 塩水和物	0.45g	0.5g	A	外観	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物	白色と赤白色の混合物
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(100.9)	-	-	99.1					
	メイアクトMS小児用細粒 10% 外観：だいたい色 におい：芳香あり	セフジトレ ンピボキシ ル	0.45g	0.5g	A	外観	白色とだいたい色の混合物	白色とだいたい色の混合物	白色とだいたい色の混合物	白色とだいたい色の混合物
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
湿潤性						なし	なし	なし	なし	
流動性						良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(101.3)	-	-	99.8						
セフジトレンピボキシ ル小児用細粒10%「サワイ」 外観：だいたい色 におい：芳香あり	セフジトレ ンピボキシ ル	0.45g	0.5g	A	外観	白色とだいたい色の混合物	白色とだいたい色の混合物	白色とだいたい色の混合物	白色とだいたい色の混合物	
					におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(101.4)	-	-	100.0						

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前の外観、におい)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
抗 生 物 質 製 剤	セフゾン細粒小児用10% 外観：淡赤白色 におい：芳香あり	セフジニル	0.45g	0.5g	A	外観	白色と淡赤白色の混合物	白色と淡赤白色の混合物	白色と淡赤白色の混合物	白色と淡赤白色の混合物
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(102.6)	-	-	99.2					
	セフジニル細粒小児用 10%「サワイ」 外観：淡赤白色 におい：ストロベリー様の芳香	セフジニル	0.45g	0.5g	A	外観	白色と淡赤白色の混合物	白色と淡赤白色の混合物	白色と淡赤白色の混合物	白色と淡赤白色の混合物
						におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						湿潤性	なし	なし	なし	なし
						流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(103.2)	-	-	99.7					
	クラリスドライシロップ10% 小児用 外観：微赤白色 におい：わずかに甘いにおい	クラリスロマイシン	0.75g	0.5g	A	外観	白色と微赤白色の混合物	白色と微赤白色の混合物	白色と微赤白色の混合物	白色と微赤白色の混合物
						におい	わずかに甘いにおい	わずかに甘いにおい	わずかに甘いにおい	わずかに甘いにおい
湿潤性						なし	なし	なし	なし	
流動性						良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(102.2)	-	-	99.5						
クラリスロマイシンDS10% 小児用「サワイ」 外観：白色 におい：ストロベリー様の芳香	クラリスロマイシン	0.75g	0.5g	A	外観	白色	白色	白色	白色	
					におい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい	
					湿潤性	なし	なし	なし	なし	
					流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(97.0)	-	-	99.3						

【シロップ剤との配合】

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前の外観、におい、pH)	成分名	配合量				配合直後	1日後	3日後	7日後
去 た ん 剤	ムコダインシロップ5% 外観：褐色 におい：特異な芳香 pH：6.58	L-カルボシ ステイン	3mL	0.5g*	B	外観	褐色の懸濁液	褐色の懸濁液	褐色澄明の液 沈殿あり	褐色澄明の液 沈殿あり
						におい	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	6.61	6.61	6.60	6.49
含量(%)	100.0(99.8)	-	-	100.3						
小児用ムコソルバン シロップ0.3% 外観：無色澄明 におい：果実様の芳香 pH：2.68	アムプロキシ ール塩酸塩	1.5mL	0.5g*	B	外観	白色の懸濁液	微白色の懸濁液 白色の沈殿	無色澄明の液 白色の沈殿	無色澄明の液 白色の沈殿	
					におい	果実様の芳香	果実様の芳香	果実様の芳香	果実様の芳香	
					再分散性	良好	良好	良好	良好	
					pH	3.37	3.36	3.35	3.40	
含量(%)	100.0(100.8)	-	-	99.4						
気 管 支 拡 張 剤	メプチンシロップ 5μg/mL 外観：無色澄明 におい：オレンジ様の芳香 pH：3.98	プロカテロー ル塩酸塩水和 物	3.8mL	0.5g*	B	外観	白色の懸濁液	無色澄明の液 白色の沈殿	無色澄明の液 白色の沈殿	無色澄明の液 白色の沈殿
						におい	オレンジ様の芳香	オレンジ様の芳香	オレンジ様の芳香	オレンジ様の芳香
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	4.03	3.97	3.98	4.02
含量(%)	100.0(100.0)	-	-	95.9						
副 腎 ホ ル モ ン 剤	セレスタミン配合シロップ 外観：橙色澄明 におい：特異なにおい pH：3.27	ベタメタゾン・ d-クロルフ ェニラミンマ レイン酸塩	5mL	0.5g*	B	外観	橙色の懸濁液	橙色の僅かに 懸濁した液、沈殿あり	橙色の僅かに 懸濁した液、沈殿あり	橙色の僅かに 懸濁した液、沈殿あり
						におい	特異なにおい	甘いにおい	甘いにおい	甘いにおい
						再分散性	良好	良好	良好	良好
						pH	3.31	3.28	3.27	3.32
含量(%)	100.0(101.8)	-	-	99.4						

*当社製剤に配合薬剤を加えて混合した後、精製水を加え全量を10mLとした。

【食品・飲料との配合】

分類	配合薬剤		当社製剤 配合量	配合 方法	試験 項目	配合結果				
	品名 (配合前の外観、におい)	配合量				配合直後	1時間後	3時間後	6時間後	24時間後
食品・飲料	グリコプッチンプリン 外観：微赤黄色のゲル状 におい：プリンのにおい	10g	0.5g	C	外観	微赤黄色のゲル状	微赤黄色のゲル状	微赤黄色のゲル状	微赤黄色のゲル状	微赤黄色のゲル状
					におい	プリンのにおい	プリンのにおい	プリンのにおい	プリンのにおい	プリンのにおい
					含量(%)	100.0(100.1)	-	-	-	99.8
	ハーゲンダッツバニラ アイスクリーム 外観：微黄白色の液 におい：バニラ様のにおい	10g	0.5g	C	外観	微黄白色の液	微黄白色の液	微黄白色の液	微黄白色の液	微黄白色の液
					におい	バニラ様のにおい	バニラ様のにおい	バニラ様のにおい	バニラ様のにおい	バニラ様のにおい
					含量(%)	100.0(99.2)	-	-	-	100.2
	明治ブルガリアヨーグルト プレーン 外観：白色のゲル状 におい：ヨーグルトのにおい	10g	0.5g	C	外観	白色のゲル状	白色のゲル状	白色のゲル状	白色のゲル状	白色のゲル状
					におい	ヨーグルトのにおい	ヨーグルトのにおい	ヨーグルトのにおい	ヨーグルトのにおい	ヨーグルト様のわずかに 腐敗したにおい
					含量(%)	100.0(102.9)	-	-	-	98.8
	おくすり飲めたね (嚥下補助ゼリー、いちご味) 外観：淡赤色のゼリー状 におい：いちご様のにおい	10g	0.5g	C	外観	淡赤色と白色の ゼリー状混合物	淡赤色と白色の ゼリー状混合物	淡赤色と白色の ゼリー状混合物	淡赤色と白色の ゼリー状混合物	淡赤色と白色の ゼリー状混合物
					におい	いちご様のにおい	いちご様のにおい	いちご様のにおい	いちご様のにおい	いちご様のにおい
					含量(%)	100.0(102.5)	-	-	-	97.1
	サントリー南アルプス天然水 外観：無色澄明の液 におい：なし	10mL	0.5g	C	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液 白色の沈殿	白色の懸濁液 白色の沈殿	白色の懸濁液 白色の沈殿	うすい白色の懸濁液 白色の沈殿
					におい	わずかに甘いにおい	わずかに甘いにおい	わずかに甘いにおい	わずかに甘いにおい	わずかに甘いにおい
					再分散性	良好	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100.0(101.8)	-	-	-	100.1
	カルピスウォーター 外観：白色の液 におい：甘酸っぱいにおい	10mL	0.5g	C	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液	白色の懸濁液 白色の沈殿
					におい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい
					再分散性	良好	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100.0(101.2)	-	-	-	99.4
	バンホーテンココア 外観：茶褐色の液 におい：ココアのにおい	10mL	0.5g	C	外観	茶褐色の液	茶褐色の液	茶褐色の液	茶褐色の液	茶褐色の液 茶褐色の沈殿
におい					ココアのにおい	ココアのにおい	ココアのにおい	ココアのにおい	ココアのにおい	
再分散性					良好	良好	良好	良好	良好	
含量(%)					100.0(100.3)	-	-	-	100.0	
ビーンスタークポカリスエット 外観：無色澄明の液 におい：芳香あり	10mL	0.5g	C	外観	白色の懸濁液	白色の懸濁液 白色の沈殿	白色の懸濁液 白色の沈殿	白色の懸濁液 白色の沈殿	うすい白色の懸濁液 白色の沈殿	
				におい	芳香あり	芳香あり	芳香あり	芳香あり	芳香あり	
				再分散性	良好	良好	良好	良好	良好	
				含量(%)	100.0(101.5)	-	-	-	99.2	
Doleオレンジジュース100% 外観：黄色の液 におい：オレンジのにおい	10mL	0.5g	C	外観	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液	黄色の懸濁液	
				におい	オレンジのにおい	オレンジのにおい	オレンジのにおい	オレンジのにおい	オレンジのにおい	
				再分散性	良好	良好	良好	良好	良好	
				含量(%)	100.0(100.9)	-	-	-	99.1	
明治おいしい牛乳 外観：白色の液 におい：牛乳のにおい	10mL	0.5g	C	外観	白色の液	白色の液	白色の液	白色の液	白色の液	
				におい	牛乳のにおい	牛乳のにおい	牛乳様のわずかに 甘いにおい	甘いにおい	牛乳様のわずかに 腐敗したにおい	
				再分散性	良好	良好	良好	良好	良好	
				含量(%)	100.0(100.3)	-	-	-	99.0	

