

2024年2月改訂（第11版）

日本標準商品分類番号

87449

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2008に準拠して作成（一部2018に準拠）

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

ロラタジン錠10mg「VTRS」

LORATADINE Tablets

ロラタジン口腔内崩壊錠

ロラタジンOD錠10mg「VTRS」

LORATADINE OD Tablets

剤形	素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	ロラタジン錠10mg「VTRS」 1錠中 ロラタジン 10.0mg ロラタジンOD錠10mg「VTRS」 1錠中 ロラタジン 10.0mg
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：2022年 6月17日 発売年月日：2011年12月 6日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販売元：ヴィアトリス製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 https://www.viatrix-e-channel.com/

本IFは2023年11月改訂の電子化された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」<https://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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

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 判、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、添付文書で赤字・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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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。

(2008 年 9 月)

目 次

I. 概要に関する項目	1
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	2
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）	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
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	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	6
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	9
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	9
7. 溶出性	9
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	13
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	13
14. その他	13

V. 治療に関する項目	14
1. 効能又は効果	14
2. 効能又は効果に関連する注意	14
3. 用法及び用量	14
4. 用法及び用量に関連する注意	14
5. 臨床成績	14
VI. 薬効薬理に関する項目	19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	19
2. 薬理作用	19
VII. 薬物動態に関する項目	20
1. 血中濃度の推移・測定法	20
2. 薬物速度論的パラメータ	24
3. 吸収	25
4. 分布	25
5. 代謝	26
6. 排泄	27
7. 透析等による除去率	28
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	29
1. 警告内容とその理由	29
2. 禁忌内容とその理由	29
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	29
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	29
5. 重要な基本的注意とその理由	29
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	29
7. 相互作用	31
8. 副作用	31
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	32
10. 過量投与	33
11. 適用上の注意	33
12. その他の注意	33
IX. 非臨床試験に関する項目	34
1. 薬理試験	34
2. 毒性試験	34

X. 管理的事項に関する項目	35
1. 規制区分	35
2. 有効期間又は使用期限	35
3. 貯法・保存条件	35
4. 薬剤取扱い上の注意点	35
5. 承認条件等	35
6. 包装	35
7. 容器の材質	35
8. 同一成分・同効薬	36
9. 国際誕生年月日	36
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	36
11. 薬価基準収載年月日	36
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	36
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	36
14. 再審査期間	36
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	36
16. 各種コード	36
17. 保険給付上の注意	36
XI. 文献	37
1. 引用文献	37
2. その他の参考文献	38
XII. 参考資料	39
1. 主な外国での発売状況	39
2. 海外における臨床支援情報	39
XIII. 備考	40
その他の関連資料	40

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロラタジン錠 10mg「ファイザー」、ロラタジン OD 錠 10mg「ファイザー」は、ファイザー株式会社が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）に基づく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、2011 年 7 月に承認を得た製剤である。2022 年 6 月、ファイザー株式会社からマイラン EPD 合同会社（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社）へ製造販売移管したため、販売名をロラタジン錠 10mg「V T R S」、ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1 日 1 回投与の持続性選択 H_1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤
（「VI-2. (1)作用部位・作用機序」、「V-1. 効能又は効果」の項参照）
- 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み
包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている^{1) ~3)}。
- 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が、ロラタジンの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. 副作用」の項参照）

*「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロラタジン錠 10mg 「V T R S」

ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」

(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、含量及び「V T R S」を付した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ロラタジン（JAN）

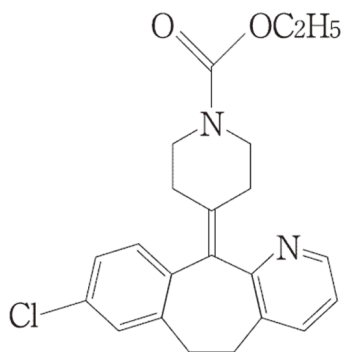
(2) 洋名（命名法）

Loratadine（JAN）

(3) ステム

三環系ヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬：-tadine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₂H₂₃ClN₂O₂

分子量：382.88

5. 化学名（命名法）

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

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

分配比：

pH	1	4	7	11
分配比 (1-オクタノール/水)	13	1.7×10^3	1.2×10^4	1.6×10^4

(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

紫外可視吸光度測定法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

炎色反応試験法

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	外形			色調等
	上面	下面	側面	
ロラタジン錠 10mg 「V T R S」				白色 円形 割線入り 素錠
	直径 6.5mm	厚さ 2.3mm	重量 100mg	
ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」				白色 円形 素錠
	直径 7.0mm	厚さ 3.3mm	重量 150mg	

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

ロラタジン錠 10mg 「V T R S」 : LR10

VLE

ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」 : D10

LR

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

ロラタジン錠 10mg「V T R S」

1 錠中 ロラタジン 10.0mg

ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」

1 錠中 ロラタジン 10.0mg

(2) 添加物

ロラタジン錠 10mg「V T R S」

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、アルファ化デンプン、ステアリン酸マグネシウム

ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」

エリスリトール、結晶セルロース、クロスポビドン、ラウリル硫酸ナトリウム、スクラロース、ステアリン酸マグネシウム

(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

加速試験^{4)、5)}

試験条件：40±1℃、75±5%RH

①ロラタジン錠 10mg「V T R S」

包装形態（PTP 包装）

項目及び規格		試験開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状（白色の円形の割線入り素錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験	紫外可視吸光度測定法	適合	—	—	適合
	薄層クロマトグラフィー	適合	—	—	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
溶出試験（45 分間：85%以上）		98.3～103.2	99.0～103.0	99.2～103.8	95.9～99.7
定量試験（95.0～105.0%）		98.7～100.1	99.3～100.1	99.6～100.8	99.0～99.8
純度試験（類縁物質質量 0.1%以下） （参考）		<LOQ～0.01	<LOQ～0.01	<LOQ～0.02	<LOQ～0.05

ロット数：3

LOQ：定量限界及び検出限界（0.01%）未満

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、ロラタジン錠 10mg「V T R S」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

②ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」

包装形態 (PTP 包装)

項目及び規格		試験開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状 (白色の円形の素錠)		適合	適合	適合	適合
確認試験	紫外可視吸光度測定法	適合	—	—	適合
	薄層クロマトグラフィー	適合	—	—	適合
	赤外吸収スペクトル	適合	—	—	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
崩壊試験		適合	適合	適合	適合
溶出試験 (15 分間 : 85%以上)		100.4~104.0	100.4~105.1	99.1~102.5	99.3~102.2
定量試験 (95.0~105.0%)		102.2~103.0	102.1~103.3	103.0~103.3	102.0~102.9
純度試験 (類縁物質 0.1%以下) (参考)		0.01	0.01	<LOQ~0.02	<LOQ~0.02

ロット数 : 3

LOQ : 定量限界及び検出限界 (0.01%) 未満

加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月) の結果、ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

無包装状態の安定性^{6)、7)}

1) ロラタジン錠 10mg 「V T R S」

保存条件 : ①温度 : 40℃±1℃、75%RH±5%RH ガラス瓶 (気密)

②湿度 : 25℃±2℃、75%RH±5%RH シャーレ (開放)

③光 : 25℃±2℃、45%RH±5%RH、曝光量 2500Lux シャーレ (開放)

測定時期 : ①、② : 開始時、1 ヶ月後、2 ヶ月後、3 ヶ月後

③ : 開始時、5 日 (30 万 Lux・hr)、10 日 (60 万 Lux・hr)、20 日 (120 万 Lux・hr)

試験項目 : 性状、含量、溶出性

試験回数 : 性状 1 回、含量 2 回、溶出性 1 回 (6 ベッセル)

①②温度・湿度に対する安定性試験結果

保存条件	測定項目	測定時期			
		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
①	性状	白色の円形の 割線入り素錠	白色の円形の 割線入り素錠	白色の円形の 割線入り素錠	白色の円形の 割線入り素錠
	含量 (%)	98.9	99.9	98.6	98.7
	[対開始時 (%)]	[100.00]	[101.0]	[99.70]	[99.80]
	溶出性 (%)	99.8	100.9	99.5	100.0
②	性状	白色の円形の 割線入り素錠	白色の円形の 割線入り素錠	白色の円形の 割線入り素錠	白色の円形の 割線入り素錠
	含量 (%)	98.9	98.9	98.9	98.6
	[対開始時 (%)]	[100.00]	[100.00]	[100.00]	[99.70]
	溶出性 (%)	99.8	100.0	99.7	99.9

③光に対する安定性試験結果

保存条件	測定項目	測定時期			
		開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
③	性状	白色の円形の 割線入り素錠	白色の円形の 割線入り素錠	照射面がごくうすい 黄色に着色	照射面がうすい 黄色に着色
	含量(%) [対開始時(%)]	98.9 [100.00]	99.0 [100.10]	98.9 [100.00]	98.5 [99.60]
	溶出性(%)	99.8	100.1	99.2	100.3

2) ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」

保存条件：①温度：40℃±1℃、75%RH±5%RH ガラス瓶（気密）

②湿度：25℃±2℃、75%RH±5%RH シャーレ（開放）

③光：25℃±2℃、45%RH±5%RH、曝光量 2500Lux シャーレ（開放）

測定時期：①、②：開始時、1 ヶ月後、2 ヶ月後、3 ヶ月後

③：開始時、30 万、60 万、120 万 Lux・hr

試験項目：性状、含量、溶出性、硬度

試験回数：性状 1 回、含量 2 回、溶出性 1 回（6 ベッセル）、硬度 1 回

①温度に対する安定性試験結果

保存条件	測定項目	測定時期			
		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
①	性状	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠
	含量(%) [対開始時(%)]	99.9 [100.0]	99.8 [99.9]	99.7 [99.8]	99.9 [100.0]
	溶出性(%)	99.9	100.7	99.4	99.5
	硬度(N)	30	37	37	38

②湿度に対する安定性試験結果

保存条件	測定項目	測定時期			
		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
②	性状	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠
	含量(%) [対開始時(%)]	99.9 [100.0]	99.9 [100.0]	99.6 [99.7]	100.0 [100.1]
	溶出性(%)	99.9	99.8	98.9	98.8
	硬度(N)	30	13	16	18

③光に対する安定性試験結果

保存条件	測定項目	測定時期			
		開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
③	性状	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠	白色の 円形の素錠
	含量(%) [対開始時(%)]	99.9 [100.0]	100.0 [100.1]	100.1 [100.2]	99.8 [99.9]
	溶出性(%)	99.9	98.6	98.8	99.1
	硬度(N)	30	32	33	35

※本剤の無包装状態での保存は弊社としては推奨していない。

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）

該当しない

7. 溶出性

溶出挙動⁸⁾、⁹⁾

① ロラタジン錠 10mg「V T R S」

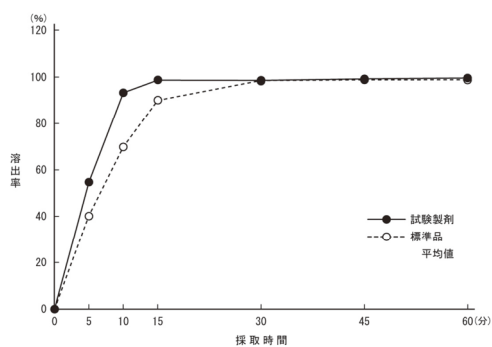
ロラタジン錠 10mg「V T R S」と標準品の溶出試験を実施した結果、ロラタジン錠 10mg「V T R S」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

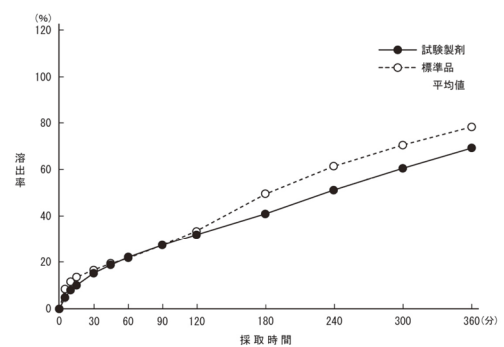
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2（日本薬局方溶出試験第1液） pH3.0（薄めた McIlvaine 緩衝液） pH6.8（日本薬局方溶出試験第2液） 水	900mL	50rpm
	pH1.2（日本薬局方溶出試験第1液）	900mL	100rpm

n=12

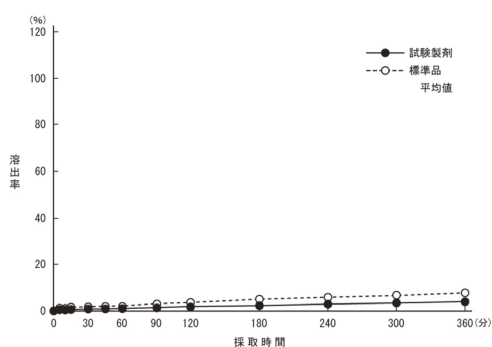
pH1.2（50rpm）



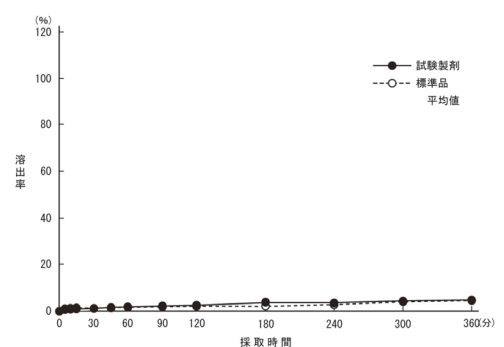
pH3.0（50rpm）



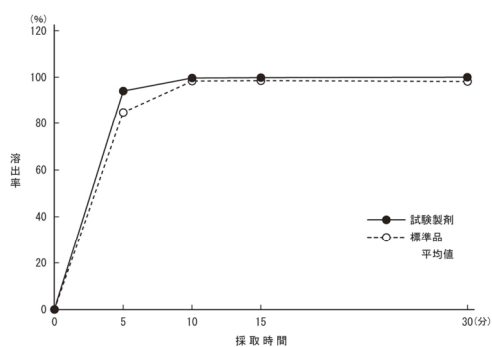
pH6.8（50rpm）



水（50rpm）



pH1.2（100rpm）



試験条件	薬剤	溶出率 (%)											
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	90分	120分	180分	240分	300分	360分
pH1.2 50rpm	ロラタジン錠 10mg 「V T R S」	54.7 ±4.3	93.3 ±4.3	98.8 ±0.8	98.7 ±0.8	98.9 ±0.7	99.3 ±0.8	—	—	—	—	—	—
	標準品	40.0 ±2.9	69.3 ±6.4	90.2 ±5.1	98.4 ±1.1	98.5 ±0.9	98.4 ±0.9	—	—	—	—	—	—
pH3.0 50rpm	ロラタジン錠 10mg 「V T R S」	4.4 ±0.9	7.8 ±1.0	9.6 ±0.7	15.0 ±1.7	18.7 ±1.5	22.0 ±1.4	27.0 ±2.0	32.0 ±2.3	41.1 ±2.7	50.8 ±4.0	60.5 ±3.2	68.9 ±3.1
	標準品	7.6 ±0.7	10.9 ±0.6	13.1 ±0.4	16.7 ±0.6	19.6 ±0.6	21.6 ±0.6	27.0 ±1.3	33.8 ±2.5	49.6 ±4.0	61.3 ±4.2	70.5 ±4.4	78.0 ±4.2
pH6.8 50rpm	ロラタジン錠 10mg 「V T R S」	0.2 ±0.1	0.1 ±0.1	0.3 ±0.1	0.5 ±0.2	0.8 ±0.2	1.0 ±0.2	1.4 ±0.2	1.8 ±0.2	2.3 ±0.4	2.9 ±0.4	3.2 ±0.5	4.0 ±0.7
	標準品	1.4 ±0.3	1.5 ±0.4	1.7 ±0.3	1.9 ±0.2	2.2 ±0.3	2.3 ±0.2	3.0 ±0.2	3.5 ±0.3	4.9 ±0.4	5.9 ±0.8	6.8 ±0.9	7.6 ±1.1
水 50rpm	ロラタジン錠 10mg 「V T R S」	0.3 ±0.1	0.7 ±0.5	0.9 ±0.6	0.9 ±0.1	1.5 ±0.3	1.9 ±0.5	2.2 ±0.5	2.5 ±0.3	3.2 ±0.3	3.1 ±0.4	3.9 ±0.4	4.4 ±0.4
	標準品	0.9 ±0.2	1.2 ±0.3	1.2 ±0.5	1.2 ±0.3	1.6 ±0.3	1.5 ±0.2	1.9 ±0.3	2.2 ±0.2	2.1 ±0.4	2.6 ±0.4	3.7 ±0.7	4.2 ±0.9
pH1.2 100rpm	ロラタジン錠 10mg 「V T R S」	93.7 ±2.5	99.7 ±0.4	99.9 ±0.5	100.0 ±0.5	—	—	—	—	—	—	—	—
	標準品	85.5 ±3.8	98.3 ±0.9	98.4 ±1.0	98.2 ±0.9	—	—	—	—	—	—	—	—

平均±SD n=12

②ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」

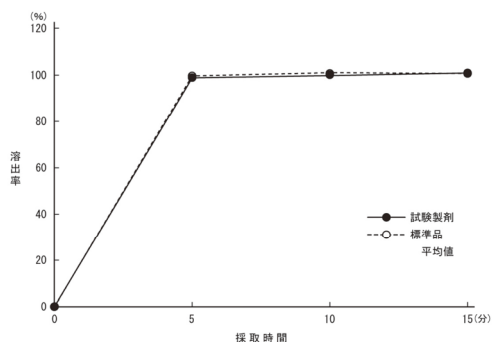
ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」と標準品の溶出試験を実施した結果、ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

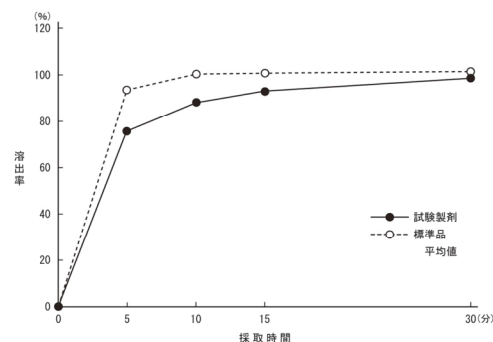
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2（日本薬局方溶出試験第1液） pH4.0（薄めた McIlvaine 緩衝液） pH6.8（日本薬局方溶出試験第2液） 水	900mL	50rpm
	pH4.0（薄めた McIlvaine 緩衝液）	900mL	100rpm

n=12

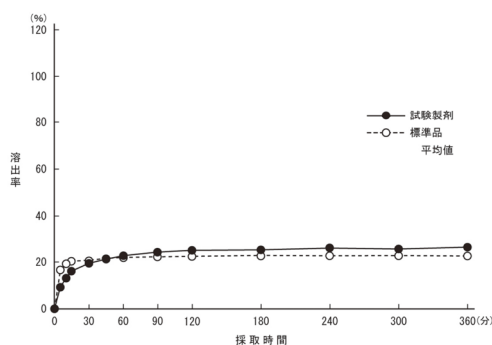
pH1.2（50rpm）



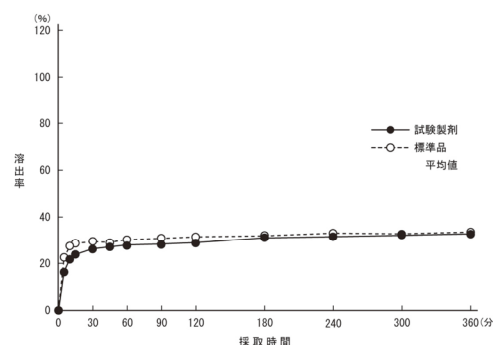
pH4.0（50rpm）



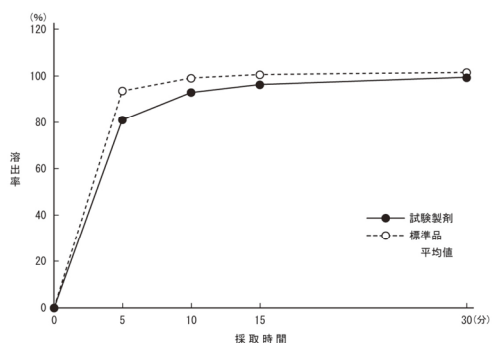
pH6.8（50rpm）



水（50rpm）



pH4.0（100rpm）



試験 条件	薬剤	溶出率 (%)											
		5 分	10 分	15 分	30 分	45 分	60 分	90 分	120 分	180 分	240 分	300 分	360 分
pH1.2 50rpm	ロラタジン OD錠 10mg 「V T R S」	98.9 ±0.8	100.1 ±0.4	100.5 ±0.5	—	—	—	—	—	—	—	—	—
	標準品	99.5 ±1.0	100.5 ±0.8	100.4 ±0.8	—	—	—	—	—	—	—	—	—
pH4.0 50rpm	ロラタジン OD錠 10mg 「V T R S」	75.6 ±4.2	87.7 ±2.4	92.3 ±0.9	98.0 ±0.5	—	—	—	—	—	—	—	—
	標準品	93.4 ±2.0	100.2 ±0.6	101.2 ±0.8	101.5 ±0.8	—	—	—	—	—	—	—	—
pH6.8 50rpm	ロラタジン OD錠 10mg 「V T R S」	9.5 ±1.7	12.9 ±1.1	15.4 ±0.9	19.6 ±0.9	21.4 ±0.5	22.9 ±0.5	24.0 ±0.5	25.0 ±0.8	25.3 ±0.8	25.7 ±0.5	25.4 ±0.4	25.9 ±0.4
	標準品	16.0 ±0.8	19.2 ±0.5	20.2 ±0.8	21.0 ±0.7	21.6 ±1.0	21.8 ±1.2	22.3 ±0.9	22.5 ±0.8	22.9 ±0.6	23.0 ±0.8	23.0 ±1.0	22.9 ±1.0
水 50rpm	ロラタジン OD錠 10mg 「V T R S」	16.1 ±1.2	21.7 ±1.1	23.4 ±1.3	26.1 ±0.6	26.7 ±0.6	27.6 ±0.7	28.1 ±0.7	28.6 ±0.7	29.8 ±0.9	30.7 ±0.8	31.2 ±0.8	31.7 ±1.0
	標準品	22.4 ±0.9	27.2 ±0.5	28.4 ±0.4	29.5 ±0.9	28.9 ±0.9	30.2 ±0.4	30.6 ±1.5	31.4 ±1.4	31.5 ±1.0	32.1 ±0.7	31.7 ±0.8	32.3 ±1.1
pH4.0 100rpm	ロラタジン OD錠 10mg 「V T R S」	80.6 ±2.5	92.3 ±1.3	96.1 ±1.4	99.5 ±0.9	—	—	—	—	—	—	—	—
	標準品	92.9 ±1.8	99.3 ±1.1	100.2 ±1.1	100.9 ±1.2	—	—	—	—	—	—	—	—

平均±SD 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

紫外可視吸光度測定法

薄層クロマトグラフィー

赤外吸収スペクトル測定法

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. 力価

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. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

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

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。

(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

〈アレルギー性鼻炎〉

①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¹⁰⁾。

②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 週間後（又は中止時）の変化量を下表に示した。

投与群	<i>n</i>	投与前 (標準誤差)	変化量	比較 ^{※2}
ロラタジン	102	8.23 (0.22)	-2.84	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¹¹⁾。

③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 週間後（又は中止時）の変化量を下表に示した。

投与群	<i>n</i>	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¹²⁾。

(蕁麻疹、皮膚疾患 (湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症) に伴うそう痒)

④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¹³⁾。

⑤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)	-0.79

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¹⁴⁾。

⑥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¹⁵⁾。

⑦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¹⁶⁾。

2) 安全性試験

〈アレルギー性鼻炎〉

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¹⁷⁾。

〈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¹⁸⁾。

(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

該当資料なし

(7) その他

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¹¹⁾、¹⁹⁾～²²⁾。

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 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¹⁹⁾。

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¹¹⁾。

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²⁰⁾（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 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²¹⁾（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²²⁾（外国人データ）。

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 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 間隔を含む心電図への影響は認められなかった²³⁾（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。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

第2世代H₁受容体拮抗剤（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、レボセチリジン塩酸塩、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、メキタジン、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、デスロラタジン、ビラスチン）

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・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^{24)～30)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 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²⁴⁾、モルモット摘出回腸のヒスタミン誘発収縮を抑制した²⁵⁾ (*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²⁶⁾。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²⁷⁾、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²⁸⁾を抑制した(*in vivo*)。

2) 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^{29)、30)} (*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³⁰⁾ (*ex vivo*)。

3) 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^{31)、32)}。

4) 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²⁷⁾ (*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³³⁾。

(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^{34)、35)}

(活性代謝物のパラメータ)

ロラタジン錠 10mg 「V T R S」

1.50±0.45 (hr)

ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」

1.48±0.45 (hr) (水で服用)

1.53±0.53 (hr) (水なしで服用)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 単回投与

健康成人男性 (6～12 例) にロラタジン錠 10、20、40mg 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³⁶⁾。

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 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³⁷⁾。

3) 生物学的同等性試験^{34)、35)}

①ロラタジン錠 10mg 「V T R S」

健康成人男子 18 名にロラタジン錠 10mg 「V T R S」とクラリチン錠 10mg 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) を、絶食時に単回経口投与して血漿中ロラタジン活性代謝物濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ (AUC、 C_{max}) 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。

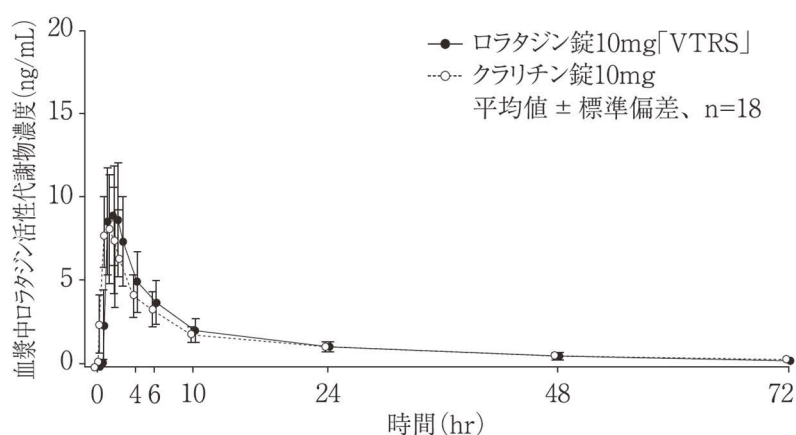
注) 本剤の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。」である。

(活性代謝物のパラメータ)

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ					
		AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	AUC _∞ (ng・hr/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	MRT (hr)	kel (/hr)	AUC ₀₋₇₂ * (ng・hr/mL)
ロラタジン錠 10mg 「V T R S」	1錠 (10mg)	89.48 ±27.76	10.166 ±3.419	95.80 ±30.34	1.50 ±0.45	18.77 ±4.00	13.65 ±2.79	0.03903 ±0.01086	12.17 ±13.67
クラリチン錠 10mg	1錠 (10mg)	83.16 ±23.21	9.037 ±3.337	91.82 ±25.58	1.31 ±0.42	22.97 ±3.62	16.44 ±2.15	0.03094 ±0.00519	11.98 ±12.95

(平均値±標準偏差、n=18)

*：未変化体



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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 「V T R S」

i) 水で服用の場合

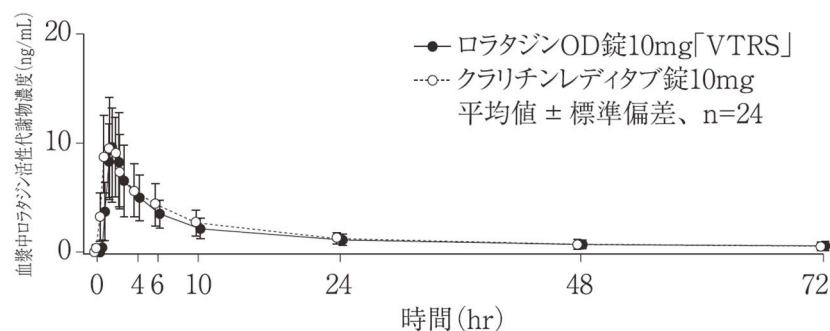
健康成人男子 24 名にロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」とクラリチンレディタブ錠 10mg をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (ロラタジンとして 10mg) を、絶食時に単回経口投与して血漿中ロラタジン活性代謝物濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ (AUC、C_{max}) について 90% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80) ～log (1.25) の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

(活性代謝物のパラメータ)

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ					
		AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	AUC _∞ (ng・hr/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	MRT (hr)	kel (/hr)	AUC ₀₋₇₂ * (ng・hr/mL)
ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」	1錠 (10mg)	94.22 ±36.53	9.678 ±4.367	104.00 ±39.26	1.48 ±0.45	23.78 ±5.82	16.78 ±2.12	0.03078 ±0.00741	13.38 ±16.79
クラリチン レディタブ錠 10mg	1錠 (10mg)	108.07 ±44.61	10.775 ±4.510	119.05 ±50.42	1.46 ±0.39	22.74 ±6.68	16.51 ±2.24	0.03275 ±0.00857	19.36 ±21.30

(平均値±標準偏差、n=24)

*：未変化体



血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 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。

ii) 水なしで服用の場合

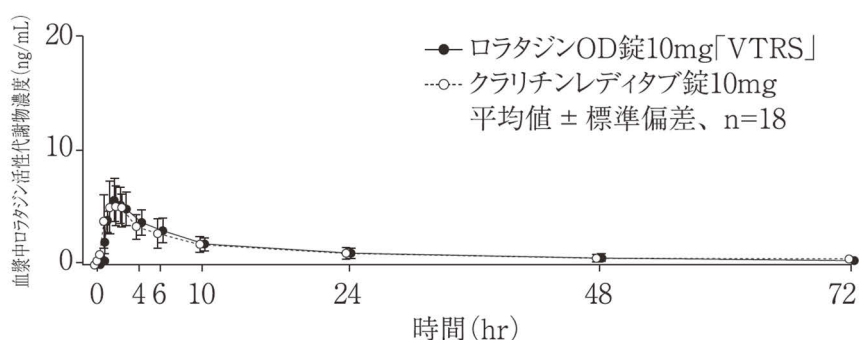
健康成人男子 18 名にロラタジン OD 錠 10mg「VTRS」とクラリチンレディタブ錠 10mg をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ロラタジンとして 10mg）を、絶食時に単回経口投与して血漿中ロラタジン活性代謝物濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について 90% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

(活性代謝物のパラメータ)

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ					
		AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	AUC _∞ (ng・hr/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	MRT (hr)	kel (/hr)	AUC ₀₋₇₂ * (ng・hr/mL)
ロラタジン OD 錠 10mg 「VTRS」	1 錠 (10mg)	68.82 ±25.44	6.131 ±1.949	75.85 ±31.61	1.53 ±0.53	19.67 ±7.09	14.57 ±3.48	0.03907 ±0.01211	35.27 ±41.23
クラリチン レディタブ錠 10mg	1 錠 (10mg)	65.30 ±35.39	5.534 ±2.111	75.48 ±48.83	1.94 ±0.51	22.37 ±10.26	15.45 ±5.01	0.03763 ±0.01661	25.78 ±31.07

(平均値±標準偏差、n=18)

*：未変化体



血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 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) 腎機能障害患者

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（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 $C_{\max}$ 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 $t_{1/2}$ はそれぞれ平均約 8 時間及び約 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³⁸⁾（外国人データ）。

〔「Ⅷ-6. (2) 腎機能障害患者」の項参照〕

5) 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（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 $C_{\max}$ が約 1.4～1.7 倍、AUC が約 2.8～3.8 倍に上昇し、DCL では $C_{\max}$ 、AUC と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³⁹⁾（外国人データ）。〔「Ⅷ-6. (3) 肝機能障害患者」の項参照〕

6) 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⁴⁰⁾（外国人データ）。

	$C_{\max}$ (ng/mL)	$t_{\max}$ (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±3.08

（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⁴¹⁾。

7) 高齢者

高齢者（12 例、66～78 歳）にロラタジンカプセル 40mg（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 $C_{\max}$ が 1.6～1.9 倍、AUC が 1.5～2.0 倍に上昇した。DCL では $C_{\max}$ 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⁴²⁾（外国人データ）。〔「Ⅷ-6. (8) 高齢者」の項参照〕

(4) 中毒域

該当資料なし

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。

(5) 食事・併用薬の影響

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。DCL の全身曝露に及ぼす食事の影響は比較的小さかった⁴³⁾ ※。

※：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、用法及び用量では食後投与を規定した。

		$C_{\max}$ (ng/mL)	$t_{\max}$ (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、 $n=12$ ）

2) 併用薬の影響

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⁴⁴⁾、⁴⁵⁾。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⁴⁵⁾（外国人データ）。〔「Ⅷ-7. 相互作用」の項参照〕

併用薬	n	ロラタジン		DCL	
		$C_{\max}$	AUC	$C_{\max}$	AUC
エリスロマイシン (500mg1 日 3 回)	22	+53%	+40%	+61%	+46%
シメチジン (300mg1 日 4 回)	24	+121%	+103%	+6%	+6%
ケトコナゾール (200mg1 日 2 回)	24	+223%	+307%	+67%	+73%

(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) コンパートメントモデル

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^{34)、35)}

(活性代謝物のパラメータ)

ロラタジン錠 10mg 「V T R S」

0.03903±0.01086 (/hr)

ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」

0.03078±0.00741 (/hr) (水で服用)

0.03907±0.01211 (/hr) (水なしで服用)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

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)⁴⁶⁾ (*in vitro*)。

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

<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。

授乳婦(6例)にロラタジンカプセル40mg(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⁴⁷⁾(外国人データ)。

〔「VIII-6. (6) 授乳婦」の項参照〕

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。

(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

ラット (n=3) に ^{14}C -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⁴⁸⁾。

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⁴⁹⁾

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⁵⁰⁾。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。[「VIII-7. 相互作用」の項参照]

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率⁴⁹⁾

descarboethoxyloratadine (DCL) : 有

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⁵¹⁾。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

①ロラタジン錠 10mg 「V T R S」

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ					
		AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	AUC _∞ (ng・hr/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	MRT (hr)	kel (/hr)	AUC ₀₋₇₂ * (ng・hr/mL)
ロラタジン錠 10mg 「V T R S」	1錠 (10mg)	89.48 ±27.76	10.166 ±3.419	95.80 ±30.34	1.50 ±0.45	18.77 ±4.00	13.65 ±2.79	0.03903 ±0.01086	12.17 ±13.67
標準製剤	1錠 (10mg)	83.16 ±23.21	9.037 ±3.337	91.82 ±25.58	1.31 ±0.42	22.97 ±3.62	16.44 ±2.15	0.03094 ±0.00519	11.98 ±12.95

平均値±標準偏差 (n=18)

* : 未変化体

②ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」

1) 水で服用の場合

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ					
		AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	AUC _∞ (ng・hr/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	MRT (hr)	kel (/hr)	AUC ₀₋₇₂ [*] (ng・hr/mL)
ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」	1 錠 (10mg)	94.22 ±36.53	9.678 ±4.367	104.00 ±39.26	1.48 ±0.45	23.78 ±5.82	16.78 ±2.12	0.03078 ±0.00741	13.38 ±16.79
標準製剤	1 錠 (10mg)	108.07 ±44.61	10.775 ±4.510	119.05 ±50.42	1.46 ±0.39	22.74 ±6.68	16.51 ±2.24	0.03275 ±0.00857	19.36 ±21.30

平均値±標準偏差 (n=24)

*：未変化体

2) 水なしで服用の場合

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ					
		AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	AUC _∞ (ng・hr/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	MRT (hr)	kel (/hr)	AUC ₀₋₇₂ [*] (ng・hr/mL)
ロラタジン OD 錠 10mg 「V T R S」	1 錠 (10mg)	68.82 ±25.44	6.131 ±1.949	75.85 ±31.61	1.53 ±0.53	19.67 ±7.09	14.57 ±3.48	0.03907 ±0.01211	35.27 ±41.23
標準製剤	1 錠 (10mg)	65.30 ±35.39	5.534 ±2.111	75.48 ±48.83	1.94 ±0.51	22.37 ±10.26	15.45 ±5.01	0.03763 ±0.01661	25.78 ±31.07

平均値±標準偏差 (n=18)

*：未変化体

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

「VII-6. (2) 排泄率」の項参照

(2) 排泄率

健康成人男性（6 例）に ¹⁴C-ロラタジン 40mg（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⁵⁰⁾（外国人データ）。

(3) 排泄速度

該当資料なし

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。

7. 透析等による除去率

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＜5mL/min）にロラタジンカプセル 40mg（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³⁸⁾（外国人データ）。〔「Ⅷ-10. 過量投与」の項参照〕

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。

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

(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

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。

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

(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		
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。

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

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。

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。

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) 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

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「V T R S」 該当しない
ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」 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

有効期間：3 年
(「IV-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

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

該当しない

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII-11. 適用上の注意」の項を参照。

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

〈ロラタジン錠 10mg「V T R S」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

420 錠 [14 錠 (PTP) × 30]

500 錠 [10 錠 (PTP) × 50]

〈ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」〉

50 錠 [10 錠 (PTP) × 5]

300 錠 [10 錠 (PTP) × 30]

7. 容器の材質

PTP シート：PVC、アルミニウム箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：クラリチン錠 10mg・レディタブ錠 10mg・ドライシロップ 1%（バイエル薬品株式会社／塩野義製薬株式会社）

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

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

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「V T R S」：22300AMX00939

ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」：22300AMX00940

11. 薬価基準収載年月日

2022 年 6 月 17 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

2012 年 1 月「小児」に対する用法・用量を追加

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第 107 号（平成 18 年 3 月 6 日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

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「V T R S」	120891702	4490027F1219	622089102
ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」	120892402	4490027F2274	622089202

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（1）
ー明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較ー」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集：25，2009
- 2) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（2）
ー低視力状態での可視性の比較ー」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集：29，2009
- 3) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（3）
ー低コントラスト状態での可視性の比較ー」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集：33，2009
- 4) 社内資料：安定性試験（加速試験）（ロラタジン錠10mg「V T R S」）
- 5) 社内資料：安定性試験（加速試験）（ロラタジンOD錠10mg「V T R S」）
- 6) 社内資料：無包装状態の安定性（ロラタジン錠10mg「V T R S」）
- 7) 社内資料：無包装状態の安定性（ロラタジンOD錠10mg「V T R S」）
- 8) 社内資料：溶出試験（ロラタジン錠10mg「V T R S」）
- 9) 社内資料：溶出試験（ロラタジンOD錠10mg「V T R S」）
- 10) 奥田稔ほか：耳展：35（補4）：327-345，1992
- 11) 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：2002.7.5承認、申請資料概要ト.1.1.3.3）
- 12) 石川哮ほか：臨床医薬：23：965-990，2007
- 13) 久木田淳ほか：臨床医薬：6：2689-2705，1990
- 14) 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：2002.7.5承認、申請資料概要ト.1.1.2.3）
- 15) 久木田淳ほか：臨床医薬：6：2443-2456，1990
- 16) 川島眞ほか：臨床医薬：23：991-1016，2007
- 17) 奥田稔ほか：耳展：35（補1）：13-26，1992
- 18) 久木田淳ほか：臨床医薬：6：2457-2468，1990
- 19) Nakano S, et al.：臨床薬理：38：401-407，2007
- 20) Roth T, et al.：J Allergy Clin Immunol.：80：94-98，1987
- 21) 鎮静作用に関する臨床薬理試験（クラリチン錠：2002.7.5承認、申請資料概要ト.1.2.3）
- 22) Neves-Pinto RM, et al.：American J Rhinology.：6：23-27，1992
- 23) 心電図に及ぼす影響の検討（クラリチン錠：2002.7.5承認、申請資料概要ト.1.2.4）
- 24) モルモットのH1受容体親和性（クラリチン錠：2002.7.5承認、申請資料概要ホ.1.4.1）
- 25) 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：2002.7.5承認、申請資料概要ホ.1.4.1）
- 26) Anthes JC, et al.：Eur J Pharmacol.：449：229-237，2002
- 27) 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：2002.7.5承認、申請資料概要ホ.1.2.1）
- 28) Barnett A, et al.：Agents Actions.：14：590-597，1984
- 29) Kreutner W, et al.：Allergy.：42：57-63，1987
- 30) 亀井千晃ほか：薬理と治療：24：49-52，1996
- 31) アレルギー性皮膚炎モデルにおける作用（クラリチン錠：2002.7.5承認、申請資料概要ホ.1.1.1）
- 32) アレルギー性鼻炎モデルにおける作用（クラリチン錠：2002.7.5承認、申請資料概要ホ.1.1.2）
- 33) 中島光好ほか：臨床医薬：6：1537-1549，1990
- 34) 社内資料：生物学的同等性試験（ロラタジン錠10mg「V T R S」）
- 35) 社内資料：生物学的同等性試験（ロラタジンOD錠10mg「V T R S」）
- 36) 第I相臨床試験（単回投与）（クラリチン錠：2002.7.5承認、申請資料概要ヘ.4.2.1）

- 37) 第 I 相臨床試験（反復投与）（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 4. 2. 2)
- 38) 腎機能障害患者における薬物動態（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 4. 6)
- 39) 肝機能障害患者における薬物動態（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 4. 5)
- 40) 小児における薬物動態（クラリチン：2007. 10. 19 承認、CTD2. 7. 6. 4. 1. 5)
- 41) 小児及び成人患者における国内製造販売後臨床試験（クラリチン：2015. 9. 17、再審査報告書）
- 42) 高齢者における薬物動態（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 4. 4)
- 43) 食事の影響（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 4. 3)
- 44) Brannan MD, et al. : Clin Pharmacol Ther. : 58 : 269-278, 1995
- 45) Kosoglou T, et al. : Br J Clin Pharmacol. : 50 : 581-589, 2000
- 46) 血漿タンパク結合（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 3. 2. 4)
- 47) Hilbert J, et al. : J Clin Pharmacol. : 28 : 234-239, 1988
- 48) ラットの組織中濃度（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 3. 2. 1)
- 49) 財団法人日本医薬情報センター編：“ロラタジン 持続性選択 H₁-受容体拮抗・アレルギー治療剤” JAPIC 医療用医薬品集 2011 : 3058, 2010
- 50) ヒトにおける薬物動態試験（代謝、排泄）（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要へ. 3. 3. 1、へ. 4. 1)
- 51) ロラタジン及びその代謝物の作用（クラリチン錠：2002. 7. 5 承認、申請資料概要ホ. 1. 5. 3)

2. その他の参考文献

参考文献 1) 藤島 一郎 監修：内服薬経管投与ハンドブック第 2 版：37-43、東京、じほう、2006

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（オーストラリアの分類）

本邦における「9.5 妊婦 9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリアの分類とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

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]

	分類
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation system for prescribing medicines in pregnancy)	B1 (2021 年 11 月)

<参考：分類の概要>

オーストラリアの分類：(An Australian categorization system for prescribing medicines in pregnancy)

B1: Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have not shown evidence of an increased occurrence of fetal damage.

XIII. 備考

その他の関連資料

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。

(掲載根拠：「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する Q&A について (その 3)」令和元年 9 月 6 日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課事務連絡)

本剤の粉砕後の安定性並びに簡易懸濁法試験（崩壊懸濁試験及び通過性試験）の報告を以下に示す。なお、本剤を粉砕あるいは簡易懸濁しての投与は、承認された剤形での投与ではなく、適正使用の観点から、弊社としては推奨していない。

本剤を粉砕あるいは簡易懸濁しての投与については、各医療担当者の裁量と判断により行うこと。

(1) 粉砕

【試験方法】

試料の調整方法：乳鉢を用いて粉砕する

保存条件：①40℃、75%RH、ガラス瓶（遮光、気密）

②25℃、75%RH、シャーレ（開放）

③25℃、45%RH、2500Lux、シャーレ（開放）

測定時期：①②：開始時、7 日、14 日、30 日

③：開始時、5 日、10 日、20 日

試験項目：外観、含量

試験回数：外観：1 回

含量：2 回

【試験結果】

ロラタジン錠 10mg「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40℃]

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	98.0 [100.0]	98.2 [100.2]	98.0 [100.0]	97.9 [99.9]

②湿度に対する安定性試験 [25℃/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	98.0 [100.0]	96.9 [98.9]	96.8 [98.8]	96.7 [98.7]

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	5 日 (30 万 Lux・hr)	10 日 (60 万 Lux・hr)	20 日 (120 万 Lux・hr)
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	98.0 [100.0]	97.3 [99.3]	97.1 [99.1]	96.2 [98.2]

ロラタジン OD 錠 10mg「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40℃]

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	99.4 [100.0]	99.7 [100.3]	99.3 [99.9]	97.5 [98.1]

②湿度に対する安定性試験 [25℃/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	99.4 [100.0]	96.5 [97.1]	96.2 [96.8]	96.2 [96.8]

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	5 日 (30 万 Lux・hr)	10 日 (60 万 Lux・hr)	20 日 (120 万 Lux・hr)
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	99.4 [100.0]	98.3 [98.9]	98.7 [99.3]	97.8 [98.4]

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの透過性

【試験方法】「内服薬経管投与ハンドブック第2版」^{参考文献1)}に準じて実施。

①崩壊懸濁試験

1錠又は1カプセルをカテーテル用ディスペンサーに入れ、これに55℃の温湯20mLを吸い取り、ディスペンサーの先端に蓋をし、横向きに5分間放置する。5分後、ディスペンサーを手で90度の角度で15回往復横転し、「崩壊・懸濁」を観察する。

5分後に崩壊・懸濁しないものは更に5分間放置し、同様の操作を行う。それでも「崩壊・懸濁」しないものは、この方法による試料調製を中止する。

中止した薬剤は、粉碎可能な錠剤は、シート（PTP、SP）の上から乳棒で数回叩いてコーティング破壊をするか、開封可能なカプセル剤は開封してカテーテル用ディスペンサーに入れ、以下、上記と同様に操作を行う。

②通過性試験

ディスペンサー内で、崩壊懸濁試験で得られた試料溶液を経管栄養カテーテルの注入先端より約2～3mL/秒の速度で注入する。カテーテルはベッド上の患者を想定して、体内挿入端から2/3を水平にする。他端（ディスペンサー注入先）は30cmの高さにセットする。経管栄養カテーテルのサイズは「8Fr」を用いる。

薬剤注入後、適量の水（約10mL）で洗浄するとき、薬剤の残存を確認する。

【試験結果】

ロラタジン錠10mg「V T R S」

崩壊懸濁試験				通過性試験
水（約 55℃）		破壊→水		
5 分	10 分	5 分	10 分	通過サイズ
×	×	○		8Fr.

×：完全に崩壊せず ○：良好な懸濁状態を示した

ロラタジンOD錠10mg「V T R S」

崩壊懸濁試験				通過性試験
水（約 55℃）		破壊→水		
5 分	10 分	5 分	10 分	通過サイズ
○				8Fr.

○：完全崩壊

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部
〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号
フリーダイヤル 0120-419-043

製造販売元

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社
〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

販売元

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

