

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

持続性選択 H₁ 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

ロラタジン錠10mg「ケミファ」 ロラタジンOD錠10mg「ケミファ」 Loratadine・Loratadine OD

ロラタジン錠・ロラタジン口腔内崩壊錠

剤形	ロラタジン錠10mg「ケミファ」 : 素錠 ロラタジンOD錠10mg「ケミファ」 : 素錠(口腔内崩壊錠)
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	ロラタジン錠10mg「ケミファ」 : 1錠中ロラタジン10mg含有 ロラタジンOD錠10mg「ケミファ」 : 1錠中ロラタジン10mg含有
一般名	和名 : ロラタジン(JAN) 洋名 : Loratadine(JAN、INN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認日 : 2011年7月15日 薬価基準収載年月日 : 2011年11月28日 発売年月日 : 2011年11月28日
開発・製造販売(輸入) ・提携・販売会社名	製造販売元 : ダイト株式会社 販売元 : 日本ケミファ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ケミファ株式会社 くすり相談室 TEL. 0120-47-9321 03-3863-1225/FAX.03-3861-9567 受付時間 : 8:45~17:30(土日祝祭日を除く) 医療関係者向けホームページ http://www.nc-medical.com/

本IFは2017年3月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」
<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>にてご確認下さい。

IF 利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<https://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

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

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体では、これに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、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て作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	15
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	15
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	15
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	15
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	15
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	15
5. 化学名（命名法）	2	8. 副作用	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	17
7. CAS登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	17
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	17
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	17
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	18
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	18
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	19
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	19
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	2. 毒性試験	19
4. 製剤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	20
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	1. 規制区分	20
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	2. 有効期間又は使用期限	20
7. 溶出性	6	3. 貯法・保存条件	20
8. 生物学的試験法	7	4. 薬剤取扱い上の注意点	20
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	5. 承認条件等	20
10. 製剤中の有効成分の定量法	8	6. 包装	20
11. 力価	8	7. 容器の材質	20
12. 混入する可能性のある夾雑物	8	8. 同一成分・同効薬	20
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8	9. 国際誕生年月日	20
14. その他	8	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	20
V. 治療に関する項目	9	11. 薬価基準収載年月日	21
1. 効能又は効果	9	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	21
2. 用法及び用量	9	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
3. 臨床成績	9	14. 再審査期間	21
VI. 薬効薬理に関する項目	10	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	21
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	10	16. 各種コード	21
2. 薬理作用	10	XI. 文献	22
VII. 薬物動態に関する項目	11	1. 引用文献	22
1. 血中濃度の推移・測定法	11	2. その他の参考文献	22
2. 薬物速度論的パラメータ	13	XII. 参考資料	23
3. 吸収	13	1. 主な外国での発売状況	23
4. 分布	13	2. 海外における臨床支援情報	23
5. 代謝	13	XIII. 備考	24
6. 排泄	14	1. その他の関連資料	24
7. トランスポーターに関する情報	14		
8. 透析等による除去率	14		

I.概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロラタジン製剤はアレルギー性疾患治療剤であり、本邦では 2002 年に上市されている。

ロラタジン錠 10mg「ケミファ」及びロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」は後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2011 年 7 月に承認を取得し、2011 年 11 月に上市した。その後、2012 年 2 月に 7 歳以上の小児に対する用法及び用量が追加された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、1 日 1 回投与の選択的ヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤である。
- (2) ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」は口腔内崩壊錠であり、水なし、水ありのどちらでも服用可能なため、コンプライアンスの向上が期待できる。
- (3) 重大な副作用（16 頁参照）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、黄疸があらわれることがある(頻度不明)。

Ⅱ.名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」

ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」

(2) 洋名

Loratadine

Loratadine OD

(3) 名称の由来

「有効成分」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」より命名した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ロラタジン(JAN)

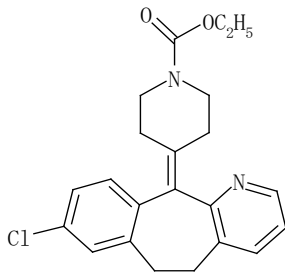
(2) 洋名（命名法）

Loratadine(JAN、INN)

(3) ステム

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 (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

79794-75-5

Ⅲ.有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
酢酸(100)	極めて溶けやすい
メタノール	溶けやすい
エタノール(99.5)	
アセトニトリル	やや溶けやすい
水	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点: 133~137℃

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

(1) 紫外可視吸光度測定法

波長 245~249nm に吸収の極大を認める。

(2) 赤外吸収スペクトル

方法: 臭化カリウム錠剤法

判定: 波長 3037 cm^{-1} 、2982 cm^{-1} 、2925 cm^{-1} 、2903 cm^{-1} 、2864 cm^{-1} 、1703 cm^{-1} 、1644 cm^{-1} 、1579 cm^{-1} 、1560 cm^{-1} 、1473 cm^{-1} 、1435 cm^{-1} 、1385 cm^{-1} 、1226 cm^{-1} 、1171 cm^{-1} 、1117 cm^{-1} 、997 cm^{-1} 、830 cm^{-1} 、781 cm^{-1} 、764 cm^{-1} 付近に吸収を認める。

(3) 炎色反応

炎色反応試験法(2)を行うとき、緑色を呈する。

4. 有効成分の定量法


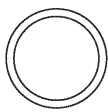
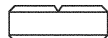

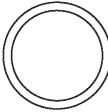
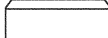
液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状

区別：ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」 素錠
 ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」 素錠
 性状：ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」 白色の円形の割線入り素錠
 ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」 白色の円形の素錠

販売名	表面	裏面	側面	色調
ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」				白色
直径：6.5mm、厚さ：2.3mm、質量：100.0mg				
ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」				白色
直径：7.0mm、厚さ：3.3mm、質量：150.0mg				

(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 「ケミファ」 本体：DK503

PTP：DK503

ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」 本体：DK504

PTP：DK504

(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 「ケミファ」 : 1 錠中にロラタジン 10.0mg を含有する。

ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」 : 1 錠中にロラタジン 10.0mg を含有する。

(2) 添加物

ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」 : 乳糖水和物、トウモロコシデンプン、アルファー化デンプン、ステアリン酸マグネシウム

ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」 : 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

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

各種条件下における安定性¹⁾²⁾³⁾

ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」

試験名	保存条件		保存期間	保存形態	結果
加速試験	40±1℃ 75±5%RH		6 ヶ月	最終包装製品 (PTP 包装品+ アルミピロー包 装+紙箱)	変化なし
長期保存試験	25±2℃ 60±5%RH		3 年間	最終包装製品 (PTP 包装品+ アルミピロー包 装+紙箱)	変化なし
無包装状態の安定性	温度	40±1℃ 75±5%RH	3 ヶ月	遮光・気密容器	変化なし
	湿度	25±2℃ 75±5%RH	3 ヶ月	遮光・開放	硬度低下 (39N→26N)
	光	2500lx、25±2℃ 45±5%RH	120 万 lx・hr	開放	着色 (規格外)

試験項目：

性状、確認試験、溶出性、定量法、純度試験（加速試験）

性状、確認試験、製剤均一性、溶出性、定量法（長期保存試験）

性状、溶出性、定量法、硬度（無包装安定性試験）

ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」

試験名	保存条件		保存期間	保存形態	結果
加速試験	40±1℃ 75±5%RH		6 ヶ月	最終包装製品 (PTP 包装品+ アルミピロー包 装+紙箱)	変化なし
長期保存試験	25±2℃ 60±5%RH		3 年間	最終包装製品 (PTP 包装品+ アルミピロー包 装+紙箱)	変化なし
無包装状態の安定性	温度	40±1℃ 75±5%RH	3 ヶ月	遮光・気密容器	変化なし
	湿度	25±2℃ 75±5%RH	3 ヶ月	遮光・開放	硬度低下 (30N→18N)
	光	2500lx、25±2℃ 45±5%RH	120 万 lx・hr	開放	変化なし

試験項目：

性状、確認試験、崩壊試験、溶出性、定量法、純度試験（加速試験）

性状、確認試験、製剤均一性、崩壊試験、溶出性、定量法（長期保存試験）

性状、崩壊試験、溶出性、定量法、硬度（無包装安定性試験）

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

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⁴⁾

溶出挙動における類似性

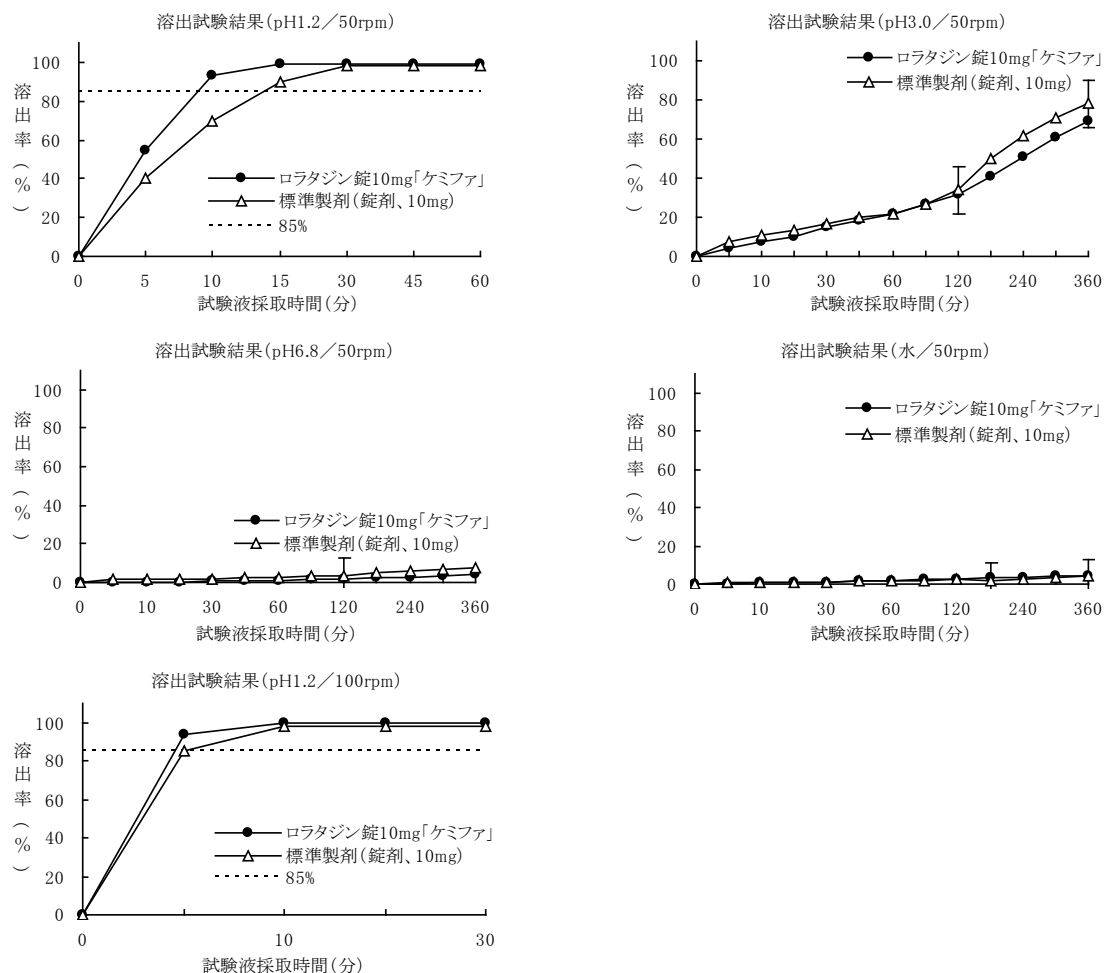
本剤は、「後発医薬品の生物学的同等性ガイドライン(平成9年12月22日医薬審第487号、平成18年11月24日一部改正)」に準拠

試験方法：溶出試験法第2法(パドル法)

試験液量：900mL

試験液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

回転数：50rpm、100rpm



回転数	試験液	判定時間	判定基準	溶出率(%)			判定
				標準製剤	試験製剤	差	
50rpm	pH1.2	15分	85%以上	90.2	98.8	+8.6	適合
	pH3.0	1/2: 120分	±12%以内	33.8	32.0	-1.8	適合
		最終: 360分		78.0	68.9	-9.1	
	pH6.8	1/2: 120分	±9%以内	3.5	1.8	-1.7	適合
		最終: 360分		7.6	4.0	-3.6	
	水	1/2: 180分	±9%以内	2.1	3.2	+1.1	適合
最終: 360分		4.2		4.4	+0.2		
100rpm	pH1.2	15分	85%以上	98.4	99.9	+1.5	適合

(2) ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」

溶出挙動における類似性

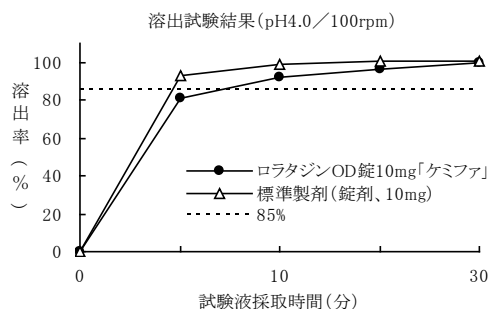
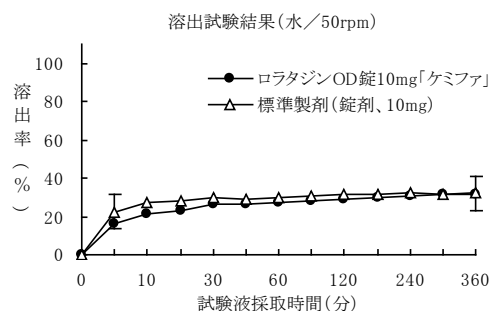
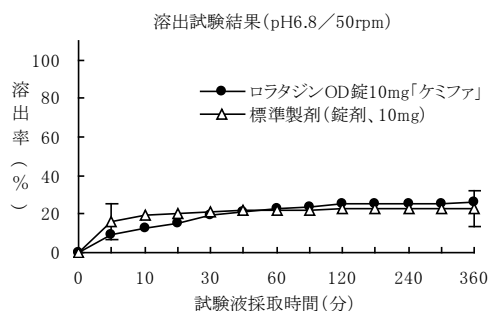
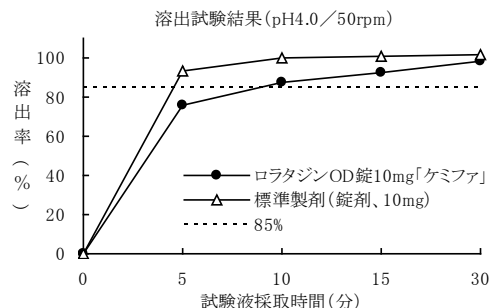
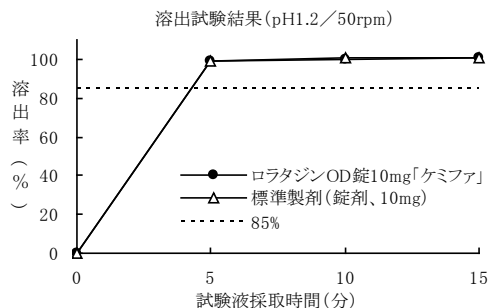
本剤は、「後発医薬品の生物学的同等性ガイドライン(平成9年12月22日医薬審第487号、平成18年11月24日一部改正)」に準拠

試験方法：溶出試験法第2法(パドル法)

試験液量：900mL

試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

回転数：50rpm、100rpm



回転数	試験液	判定時点	判定基準	溶出率(%)			判定
				標準製剤	試験製剤	差	
50rpm	pH1.2	15分	85%以上	100.4	100.5	+0.1	適合
	pH4.0	15分	85%以上	101.2	92.3	-8.9	適合
	pH6.8	1/2:15分	±9%以内	16.0	9.5	-6.5	適合
		最終:360分		22.9	25.9	+3.0	
	水	1/2:5分	±9%以内	22.4	16.1	-6.3	適合
最終:360分		32.3		31.7	-0.6		
100rpm	pH4.0	15分	85%以上	100.2	96.1	-4.1	適合

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 紫外可視吸光度測定法（極大吸収波長：245～249nm）
- (2) 薄層クロマトグラフィー
展開溶媒：ジエチルエーテル／ジエチルアミン混液（40:1）
薄層板：薄層クロマトグラフィー用シリカゲル
判定：紫外線（主波長 254nm）を照射するとき、標準溶液の青紫色のスポットと色調及び Rf 値が等しい。
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法（ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」のみ）
方法：臭化カリウム錠剤法
判定：波長 3037cm^{-1} 、 2982cm^{-1} 、 2925cm^{-1} 、 2903cm^{-1} 、 2864cm^{-1} 、 1703cm^{-1} 、 1644cm^{-1} 、 1579cm^{-1} 、 1560cm^{-1} 、 1473cm^{-1} 、 1435cm^{-1} 、 1385cm^{-1} 、 1226cm^{-1} 、 1171cm^{-1} 、 1117cm^{-1} 、 997cm^{-1} 、 830cm^{-1} 、 781cm^{-1} 、 764cm^{-1} 付近に吸収を認める。

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. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

V.治療に関する項目

1. 効能又は効果

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒

2. 用法及び用量

成人：通常、ロラタジンとして1回10mgを1日1回、食後に経口投与する。

なお、年齢・症状により適宜増減する。

小児：通常、7歳以上の小児にはロラタジンとして1回10mgを1日1回、食後に経口投与する。

<用法及び用量に関連する使用上の注意>

OD錠(口腔内崩壊錠)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。(「Ⅷ-14. 適用上の注意」の項参照)

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI.薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

第2世代 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、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、ベポタスチンベシル酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エメダスチンフマル酸塩)

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

該当資料なし

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間⁵⁾

「VII-1-(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

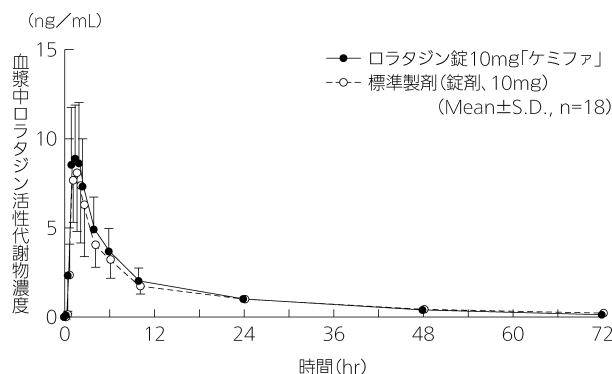
(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁵⁾

1) ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」

ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」と標準製剤を、生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日付 医薬審第 487 号)に準じ、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)を健康成人男子に絶食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、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

製剤名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→72} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」	89.48±27.76	10.17±3.42	1.5±0.5	18.8±4.0
標準製剤(錠剤、10mg)	83.16±23.21	9.04±3.34	1.3±0.4	23.0±3.6

(Mean±S.D.,n=18)



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

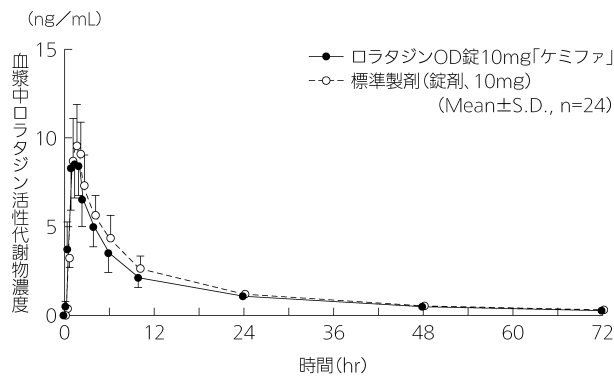
2) ロラタジン OD錠 10mg 「ケミファ」

ロラタジン OD錠 10mg 「ケミファ」と標準製剤を、生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付 医薬審第487号)に準じ、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)を健康成人男子に絶食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、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

①水あり投与

製剤名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→72} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ロラタジン OD錠 10mg 「ケミファ」	94.22 ± 36.53	9.68 ± 4.37	1.5 ± 0.5	23.8 ± 5.8
標準製剤(錠剤、10mg)	108.07 ± 44.61	10.78 ± 4.51	1.5 ± 0.4	22.7 ± 6.7

(Mean ± S.D., n=24)

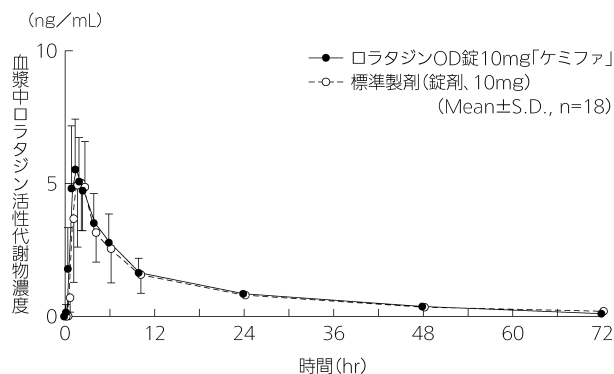


血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

②水なし投与

製剤名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→72} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ロラタジン OD錠 10mg 「ケミファ」	68.82 ± 25.44	6.13 ± 1.95	1.5 ± 0.5	19.7 ± 7.1
標準製剤(錠剤、10mg)	65.30 ± 35.39	5.53 ± 2.11	1.9 ± 0.5	22.4 ± 10.3

(Mean ± S.D., n=18)



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

- (4) 中毒域
該当資料なし
- (5) 食事・併用薬の影響
「Ⅷ-7. 相互作用」の項を参照のこと。
- (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因
該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) 吸収速度定数
該当資料なし
- (3) バイオアベイラビリティ
該当資料なし
- (4) 消失速度定数⁵⁾

製品名	投与量	投与方法	消失速度定数 (Kel) (hr ⁻¹)
ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」	10mg	—	0.0390±0.0109
ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」	10mg	水あり	0.0308±0.0074
		水なし	0.0391±0.0121

- (5) クリアランス
該当資料なし
- (6) 分布容積
該当資料なし
- (7) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

- (1) 血液-脳関門通過性
該当資料なし
- (2) 血液-胎盤関門通過性
該当資料なし
- (3) 乳汁への移行性
「Ⅷ-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照。
- (4) 髄液への移行性
該当資料なし
- (5) その他の組織への移行性
該当資料なし

5. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
該当資料なし
- (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種
ロラタジンから活性代謝物 (DCL) への代謝には CYP3A4 及び CYP2D6 の関与が確認されている。
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
該当資料なし

- (4) 代謝物の活性の有無及び比率
該当資料なし
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
該当資料なし
- 6. 排泄
 - (1) 排泄部位及び経路
主に尿中及びふん便中に排泄される。
 - (2) 排泄率
該当資料なし
 - (3) 排泄速度
該当資料なし
- 7. トランスポーターに関する情報
該当資料なし
- 8. 透析等による除去率
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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

●禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

(1) 肝障害のある患者

[ロラタジンの血漿中濃度が上昇するおそれがある。]

(2) 腎障害のある患者

[ロラタジン及び活性代謝物 descarboethoxyloratadine (DCL) の血漿中濃度が上昇するおそれがある。]

(3) 高齢者（「VIII - 9. 高齢者への投与」の項参照）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

(1) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

(2) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

7. 相互作用

ロラタジンから活性代謝物(DCL)への代謝にはCYP3A4及びCYP2D6の関与が確認されている。

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

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

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

- 1) ショック、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、チアノーゼ、呼吸困難、血圧低下、血管浮腫等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) てんかん：てんかんの既往のある患者で本剤投与後に発作があらわれたとの報告があるので使用に際しては十分な問診を行うこと。
- 3) 痙攣：痙攣があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) 肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、 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ので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
精神神経系	眠気、倦怠感、めまい、頭痛
呼吸器	咽頭痛、鼻の乾燥感
消化器	腹痛、口渇、嘔気・嘔吐、下痢、便秘、口唇乾燥、口内炎、胃炎
過敏症	発疹、蕁麻疹、紅斑、そう痒、発赤
皮膚	脱毛
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、ビリルビン値上昇、Al-P 上昇、 γ -GTP 上昇
腎臓	蛋白尿、BUN 上昇、尿閉
循環器	動悸、頻脈
血液	好酸球増多、白血球減少、好中球減少、単球増多、リンパ球減少、白血球増多、リンパ球増多、ヘマトクリット減少、ヘモグロビン減少、好塩基球増多、血小板減少、好中球増多
その他	尿糖、眼球乾燥、耳鳴、難聴、ほてり、浮腫(顔面・四肢)、味覚障害、月経不順、胸部不快感、不正子宮出血、胸痛

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

●禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

副作用

(1) 重大な副作用（頻度不明）

1) ショック、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、チアノーゼ、呼吸困難、血圧低下、血管浮腫等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
過 敏 症	発疹、蕁麻疹、紅斑、そう痒、発赤

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能(肝、腎等)が低下しており、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、投与を避けることが望ましい。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、動物試験(ラット、ウサギ)で催奇形性は認められないが、ラットで胎児への移行が報告されている。]

(2) 授乳中の婦人には、投与を避けることが望ましい。やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。[ヒト母乳中への移行が報告されている。]

11. 小児等への投与

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

(2) 低出生体重児、新生児、乳児又は3歳未満の幼児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

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

13. 過量投与

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

処 置：一般的な薬物除去法(胃洗浄、活性炭投与等)により、本剤を除去する。また、必要に応じて対症療法を行う。
なお、本剤は血液透析によって除去できない。

14. 適用上の注意

(1) 薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。

[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

(2) 服用時（ロラタジンOD錠「ケミファ」）

OD錠は舌の上のにせ唾液を浸潤させ、唾液のみ(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。

なお、寝たままの状態では水なしで服用しないこと。

15. その他の注意

16. その他

Ⅸ.非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

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

2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験
該当資料なし
- (3) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
- (4) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない
有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

気密容器(室温保存)

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

(2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

「Ⅷ-14.適用上の注意」の項参照

患者向医薬品ガイド：無し

くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」	100錠(10錠×10)
	140錠(14錠×10)
	500錠(10錠×50)
ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」	100錠(10錠×10)
	500錠(10錠×50)

7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル・アルミニウム(PTPシート)
アルミニウム・ポリエチレン(ピロー袋)

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：クラリチン錠 10mg、クラリチンレディタブ錠 10mg、
クラリチンドライシロップ 1%(MSD)

同 効 薬：エバスチン、ケトチフェンフマル酸塩、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、ヘポタスチンベシル酸塩、
エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩、
エメダスチンフマル酸塩

9. 国際誕生年月日

1987年9月15日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」	2011年7月15日	22300AMX00815000
ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」	2011年7月15日	22300AMX00816000

11. 薬価基準収載年月日

ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」 : 2011 年 11 月 28 日

ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」 : 2011 年 11 月 28 日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

2012 年 2 月 16 日 7 歳以上の小児に対する用法及び用量が追加された。

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
ロラタジン錠 10mg 「ケミファ」	121181801	4490027F1120	622118101
ロラタジン OD 錠 10mg 「ケミファ」	121182501	4490027F2126	622118201

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I .文献

1. 引用文献

- 1) ダイト株式会社 安定性に関する資料(社内資料)
- 2) ダイト株式会社 安定性(長期保存試験)に関する資料(社内資料)
- 3) ダイト株式会社 無包装の安定性に関する資料(社内資料)
- 4) ダイト株式会社 溶出に関する資料(社内資料)
- 5) ダイト株式会社 生物学的同等性に関する資料(社内資料)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報(オーストラリアの分類)

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりである。

【使用上の注意】(妊婦、産婦、授乳婦等への投与)

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、投与を避けることが望ましい。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、動物試験(ラット、ウサギ)で催奇形性は認められないが、ラットで胎児への移行が報告されている。]
- 2) 授乳中の婦人には、投与を避けることが望ましい。やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。[ヒト母乳中への移行が報告されている。]

	分類
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	B1 (2017年10月)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

B1 : Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed. Studies in animals have not shown evidence of an increased occurrence of fetal damage.

ⅩⅢ.備考

1. その他の関連資料

