2026年6月改訂（第9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2018（2019年更新版）に準拠して作成

持続性選択H_1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 Tablets, OD Tablets 10mg “Chemiphar”

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・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日	2011年 7月15日
	薬価基準収載年月日	2011年11月28日
	販売開始年月日	2011年11月28日
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：9:00～17:30（土日、祝日および当社休業日を除く）医療関係者向けホームページ https://www.nc-medical.com/	

本IFは2024年1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（https://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、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
1. 開発の経緯 ……1
2. 製品の治療学的特性 ……1
3. 製品の製剤学的特性 ……1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 ……1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 ……1
6. ＲＭＰの概要 ……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)又は本質 ……2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 ……2

Ⅲ.有効成分に関する項目 ……3
1. 物理化学的性質 ……3
2. 有効成分の各種条件下における安定性 ……3
3. 有効成分の確認試験法、定量法 ……3

Ⅳ.製剤に関する項目 ……4
1. 剤形 ……4
2. 製剤の組成 ……4
3. 添付溶解液の組成及び容量 ……4
4. 力価 ……5
5. 混入する可能性のある夾雑物 ……5
6. 製剤の各種条件下における安定性 ……5
7. 調製法及び溶解後の安定性 ……6
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化) ……6
9. 溶出性 ……6
10.容器・包装 ……8
11.別途提供される資材類 ……9
12.その他 ……9

Ⅴ.治療に関する項目 ……10
1. 効能又は効果 ……10
2. 効能又は効果に関連する注意 ……10
3. 用法及び用量 ……10
4. 用法及び用量に関連する注意 ……10
5. 臨床成績 ……10

Ⅵ.薬効薬理に関する項目 ……15
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ……15
2. 薬理作用 ……15

Ⅶ.薬物動態に関する項目 ……16
1. 血中濃度の推移 ……16
2. 薬物速度論的パラメータ ……19
3. 母集団(ポピュレーション)解析 ……19
4. 吸収 ……20
5. 分布 ……20
6. 代謝 ……20
7. 排泄 ……21
8. トランスポーターに関する情報 ……21
9. 透析等による除去率 ……21
10.特定の背景を有する患者 ……21
11.その他 ……22

Ⅷ.安全性（使用上の注意等）に関する項目 ……23
1. 警告内容とその理由 ……23
2. 禁忌内容とその理由 ……23
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ……23
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ……23
5. 重要な基本的注意とその理由 ……23
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 ……23
7. 相互作用 ……24
8. 副作用 ……24
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 ……26
10.過量投与 ……26
11.適用上の注意 ……26
12.その他の注意 ……26

Ⅸ.非臨床試験に関する項目 ……27
1. 薬理試験 ……27
2. 毒性試験 ……27

Ⅹ.管理的事項に関する項目 ……28
1. 規制区分 ……28
2. 有効期間 ……28
3. 包装状態での貯法 ……28
4. 取扱い上の注意 ……28
5. 患者向け資材 ……28
6. 同一成分・同効薬 ……28
7. 国際誕生年月日 ……28
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 28
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 28
10.再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 28
11.再審査期間 ……28
12.投薬期間制限に関する情報 ……28
13.各種コード ……29
14.保険給付上の注意 ……29

ⅩⅠ.文献 ……30
1. 引用文献 ……30
2. その他の参考文献 ……31

ⅩⅡ.参考資料 ……32
1. 主な外国での発売状況 ……32
2. 海外における臨床支援情報 ……32

ⅩⅢ.備考 ……33
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33
2. その他の関連資料 ……34

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. 製品の治療学的特性

(1) 本剤は、1 日 1 回投与の選択的ヒスタミン H_1 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）（「Ⅷ.-8. 副作用」の項参照）。

3. 製品の製剤学的特性

(1) 普通錠・OD 錠の 2 つの剤形を揃えている。
(2) OD 錠には、矯味剤としてエリスリトール、スクラロースを含有している。
(3) 薬剤の判別を容易にするため、PTP シートの表面か裏面に 1 錠単位で『ロラタジン（OD)』、『規格』、『アレルギー用薬』、『識別コード』を表記している。

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、最適使用推進ガイドライン等	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

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

(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「ケミファ」
ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」

(2) 洋名

Loratadine Tablets 10mg "Chemiphar"
Loratadine OD Tablets 10mg “Chemiphar”

(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）

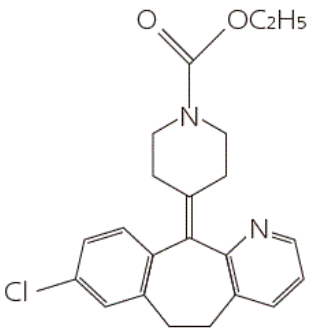
(2) 洋名（命名法）

Loratadine（JAN、INN）

(3) ステム

三環系ヒスタミン H_1 受容体拮抗薬：-tadine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{22}H_{23}ClN_2O_2$
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（IUPAC）

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

溶媒	日局の溶解度表記
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、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（臭化カリウム錠剤法）

(3) 炎色反応試験法(2)

定量法：

液体クロマトグラフィー

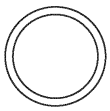
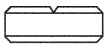
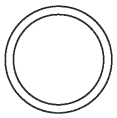
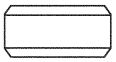
Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

ロラタジン錠 10mg「ケミファ」　　素錠
ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」　口腔内崩壊錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	表面	裏面	側面	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
	直径：6.5mm、厚さ：2.3mm、質量：100.0mg			
ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」				白色の円形の素錠
	直径：7.0mm、厚さ：3.3mm、質量：150.0mg			

(3) 識別コード

	ロラタジン錠 10mg「ケミファ」	ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」
識別コード	DK503	DK504
記載場所	錠剤、PTP シート	

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加物

	ロラタジン錠 10mg「ケミファ」	ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」
有効成分 （1 錠中）	1 錠中にロラタジン 10.0mg を含有する。	1 錠中にロラタジン 10.0mg を含有する。
添加剤	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	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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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[1),2),3),4)]

(1) 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 ヵ月	最終包装製品 (PTP 包装品＋ アルミピロー包装 ＋紙箱)	規格内
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)	規格内
無包装状態の安定性	温度	40±1℃ 75±5%RH	3 ヵ月	遮光・気密容器	規格内
	湿度	25±2℃ 75±5%RH	3 ヵ月	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〉

(2) 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 ヵ月	最終包装製品 (PTP 包装品＋ アルミピロー包装 ＋紙箱)	規格内
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)	規格内
無包装状態の安定性	温度	40±1℃ 75±5%RH	3 ヵ月	遮光・気密容器	規格内
	湿度	25±2℃ 75±5%RH	3 ヵ月	遮光・開放	硬度低下 (30N→18N)
	光	2500lx、25±2℃ 45±5%RH	120 万 lx･hr	開放	規格内

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〉

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果	試験名
一包化後の安定性	温度	40±1℃ 75±5%RH	3ヵ月	セロファン＋ポリエチレンで分包、遮光・気密容器	規格内
	湿度	25±2℃ 75±5%RH	3ヵ月	セロファン＋ポリエチレンで分包、遮光・開放	規格内
	光	2500lx、25±2℃ 45±5%RH	120万lx･hr	セロファン＋ポリエチレンで分包、開放	規格内

試験項目： 性状、崩壊試験、溶出試験、定量試験、硬度〈一包化後の安定性試験〉

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

9. 溶出性[5)]

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

1）ロラタジン錠10mg「ケミファ」

方法

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

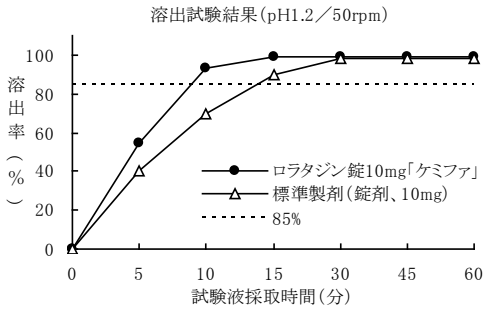
試験液量：900mL

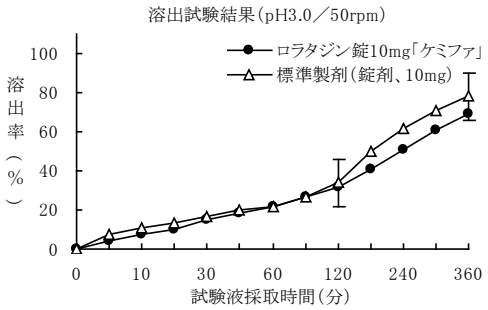
試 験 液：pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

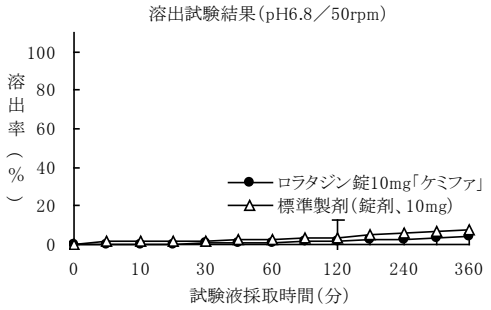
回 転 数：50rpm、100rpm

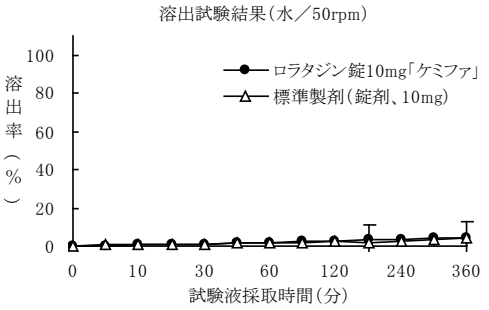
結果

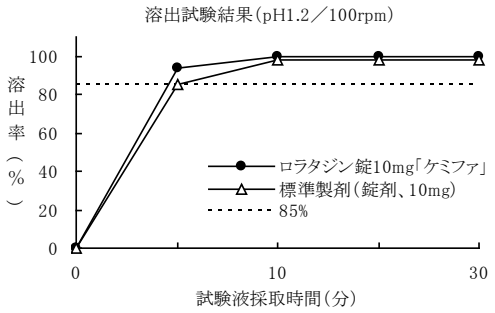
ロラタジン錠 10mg「ケミファ」と標準製剤であるクラリチン錠 10mg について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従って溶出試験を実施した結果、両製剤の溶出挙動の類似性が確認された。











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」

方法

試験方法：溶出試験法第 2 法（パドル法）

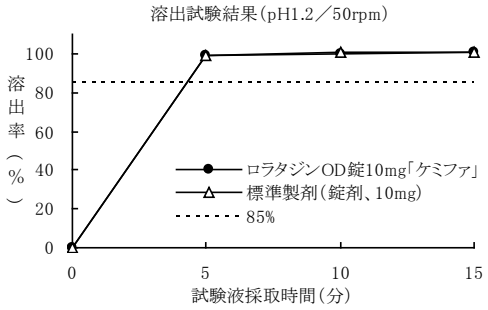
試験液量：900mL

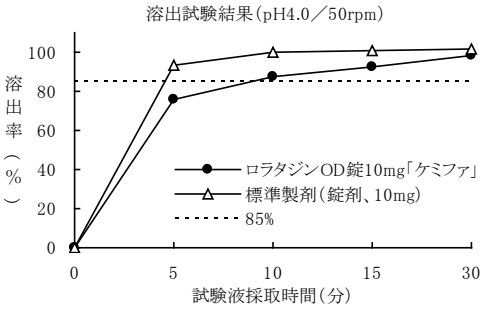
試 験 液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

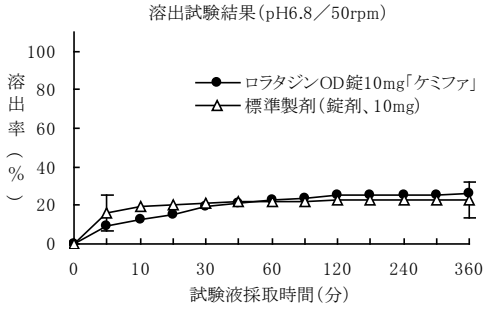
回 転 数：50rpm、100rpm

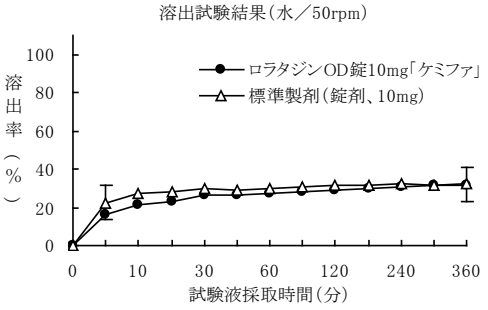
結果

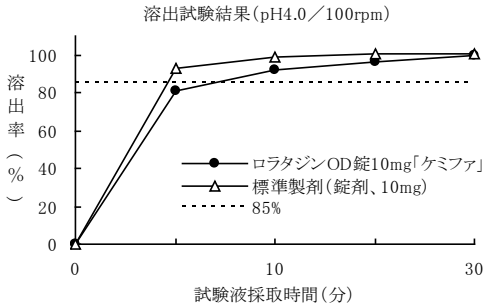
ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」と標準製剤であるクラリチンレディタブ錠 10mg について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従って溶出試験を実施した結果、両製剤の溶出挙動の類似性が確認された。











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

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

該当しない

(2) 包装

ロラタジン錠 10mg「ケミファ」　100 錠　(10 錠（PTP）×10)
ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」　100 錠　(10 錠（PTP）×10)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 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）

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. 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

〇アレルギー性鼻炎
〇蕁麻疹
〇皮膚疾患（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

該当項目なし

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

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

該当しない

(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[6]。

(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）	－2.84	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[7]。

(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[8]。

〈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[9]。

(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[10]。

(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[11]。

(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（ロラタジンーケトチフェン）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[12)]。

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[13)]。

〈蕁麻疹、皮膚疾患（皮疹・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[14)]。

(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。

(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 [注)]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[15)]。

(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[7]。
(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[16]（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[注)]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[17]（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[18]（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[注)]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[19]（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. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

第２ 世代 H_1 受容体拮抗剤（レボセチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、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）

注意：関連のある化合物の効能・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

ロラタジン及び DCL は、ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用を示す。また、ヒスタミン、ロイコトリエン C_4 の遊離抑制作用を示す[20]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用

ロラタジン及び DCL は、モルモットの肺 H_1 受容体においてヒスタミンと拮抗し[21]、モルモット摘出回腸のヒスタミン誘発収縮を抑制した[22]（*in vitro*）。DCL のヒト H_1 受容体拮抗作用はロラタジンよりも強かった[23]。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[36]、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[25]を抑制した（*in vivo*）。

2) ヒスタミン及びロイコトリエン C_4 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 C_4 遊離を抑制し[26,27]（*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[27]（*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[28,29]。

(3) 作用発現時間・持続時間

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[24]（*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[30]。

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

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 31)。

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。

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 32)。

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。

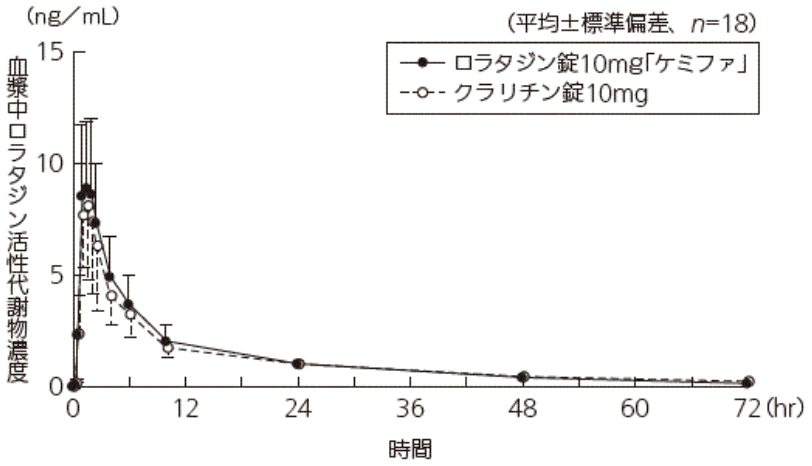
3) 生物学的同等性試験

〈ロラタジン錠 10mg「ケミファ」〉

ロラタジン錠 10mg「ケミファ」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）健康成人男性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）～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 33)。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}72}$ (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
クラリチン錠 10mg	83.16±23.21	9.04±3.34	1.3±0.4	23.0±3.6

（平均±標準偏差、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。

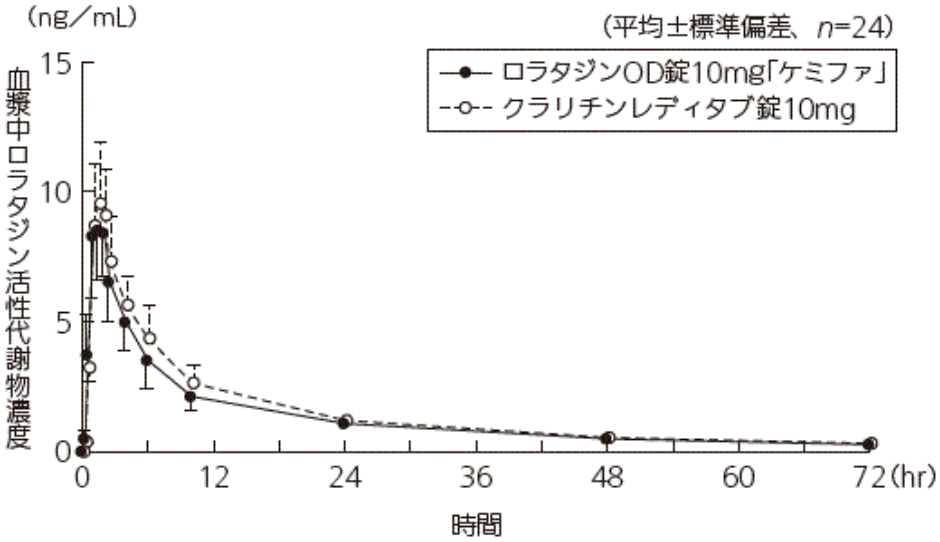
〈ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」〉

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）健康成人男性に絶食単回経口投与（水で服用及び水なしで服用）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）～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[33]。

(1) 水で服用

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}72}$ (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
クラリチン レディタブ錠 10mg	108.07±44.61	10.78±4.51	1.5±0.4	22.7±6.7

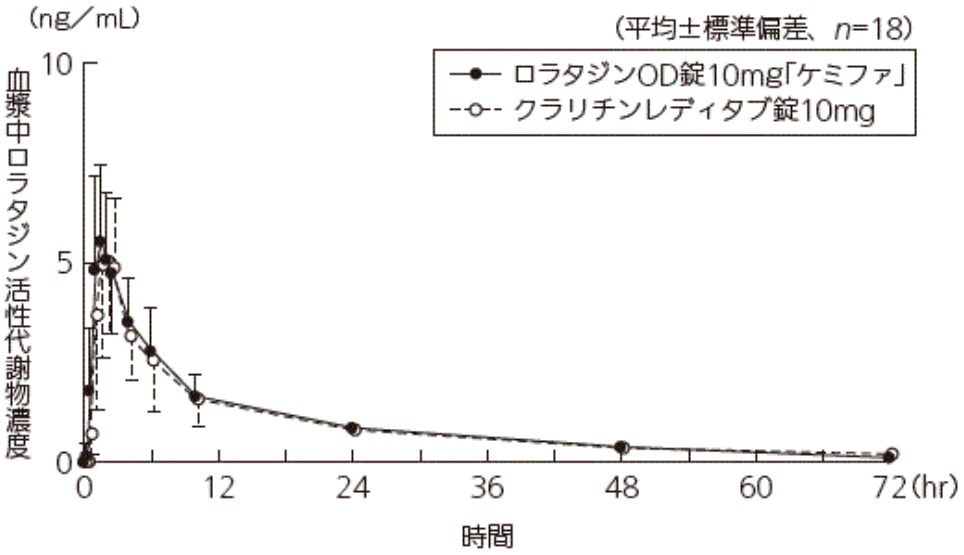
（平均±標準偏差、n=24）



(2) 水なしで服用

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}72}$ (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
クラリチン レディタブ錠 10mg	65.30±35.39	5.53±2.11	1.9±0.5	22.4±10.3

(平均±標準偏差、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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

(1) 食事の影響（錠 10 mg）

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[34)※]。

※：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)

(2) 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[35),36)]。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[36)]（外国人データ）。

併用薬	*n*	ロラタジン		DCL	
		Cmax	AUC	Cmax	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%

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

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

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(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) 食事・併用薬の影響」の項参照

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

組織中放射能濃度（ラット）

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[37]。

(2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

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[38]（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。

(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

(6) 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）[39]（*in vitro*）。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

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[40]。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

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[41]。

(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活性化、存在比率

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[42]。

7. 排泄

健康成人男性（6 例）に ^{14}C-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 40)（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。

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

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 43)（外国人データ）

（「Ⅶ-10 特定の背景を有する患者」の項参照）

10. 特定の背景を有する患者

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≦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 43)（外国人データ）。

(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<5mL/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 43)（外国人データ）。

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 44)（外国人データ）。

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 45)（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[46]。

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[47]（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。

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

「Ⅴ. 治療に関する項目」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「Ⅴ. 治療に関する項目」の項参照

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、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		
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」の項参照

(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

該当資料なし

(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

製　　剤：該当しない
有効成分：該当しない

2. 有効期間

使用期限：3 年（安定性試験結果に基づく）

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当しない

5. 患者向け資材

「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

6. 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%（バイエル薬品）
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

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

販売名	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「ケミファ」	2011 年 7 月 15 日	22300AMX00815000	2011 年 11 月 28 日	2011 年 11 月 28 日
ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」	2011 年 7 月 15 日	22300AMX00816000	2011 年 11 月 28 日	2011 年 11 月 28 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

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。

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	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（9 桁）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「ケミファ」	4490027F1120	4490027F1120	121181801	622118101
ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」	4490027F2126	449002F2126	121182501	622118201

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。

ＸⅠ．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 一包化後の安定性に関する資料（社内資料）
5) ダイト株式会社 溶出に関する資料(社内資料)
6) 奥田稔他：耳展．1992；35（補 4）：327-345
7) 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)）
8) 石川哮他：臨床医薬．2007；23：965-990
9) 久木田淳他：臨床医薬．1990；6：2689-2705
10) 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)）
11) 久木田淳他：臨床医薬．1990；6：2443-2456
12) 川島眞他：臨床医薬．2007；23：991-1016
13) 奥田稔他：耳展．1992；35（補 1）：13-26
14) 久木田淳他：臨床医薬．1990；6：2457-2468
15) Nakano S, et al.：臨床薬理. 2007；38：401-407
16) Roth T, et al.：J Allergy Clin Immunol. 1987；80：94-98
17) 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)）
18) Neves-Pinto RM, et al.：American J Rhinology. 1992；6：23-27
19) 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)）
20) 効力を裏付ける試験（クラリチン錠：2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1）
21) 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)）
22) 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)）
23) Anthes JC, et al.：Eur J Pharmacol. 2002；449：229-237
24) 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)）
25) Barnett A, et al.：Agents Actions. 1984；14：590-597
26) Kreutner W, et al.：Allergy. 1987；42：57-63
27) 亀井千晃他：薬理と治療．1996；24：49-52
28) 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)）
29) 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)）
30) 中島光好他：臨床医薬．1990；6：1537-1549
31) 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)）
32) 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)）
33) ダイト株式会社：生物学的同等性に関する資料（社内資料）
34) 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)）
35) Brannan MD, et al.：Clin Pharmacol Ther. 1995；58：269-278
36) Kosoglou T, et al.：Br J Clin Pharmacol. 2000；50：581-589
37) 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)）
38) Hilbert J, et al.：J Clin Pharmacol. 1988；28：234-239

39) 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)）
40) 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)）
41) Yumibe N, et al.：Biochem Pharmacol. 1996；51：165-172
42) 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)）
43) 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)）
44) 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)）
45) 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）
46) 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 日承認、再審査報告書）
47) 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)）
48) ダイト株式会社　粉砕後の安定性に関する資料（社内資料）
49) ダイト株式会社　簡易懸濁法に関する資料（社内資料）

2. その他の参考文献

該当資料なし

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

該当しない

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。

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）

(1) 粉砕

粉砕後の安定性[48)]

製品名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
ロラタジン錠 10mg「ケミファ」	40±1℃ 75±5%RH	30日	遮光・気密容器	変化なし
	25±2℃ 75±5%RH	30日	遮光・気密容器	含量低下（規格内）
	25±2℃ 45±5%RH 2500lx	総照射度 120万 lx･hr	開放	含量低下（規格内）
ロラタジンOD錠 10mg「ケミファ」	40±1℃ 75±5%RH	30日	遮光・気密容器	変化なし
	25±2℃ 75±5%RH	30日	遮光・気密容器	含量低下（規格内）
	25±2℃ 45±5%RH 2500lx	総照射度 120万 lx･hr	開放	含量低下（規格内）

試験項目：性状及び定量試験

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性[49)]

1)ロラタジン錠 10mg「ケミファ」

● 目的

ロラタジン錠10mg「ケミファ」について簡易懸濁法の適否を検討するため、崩壊懸濁試験および通過性試験を実施した。

● 試験製剤

ロラタジン錠10mg「ケミファ」（ダイト株式会社）／ロラタジンとして10.0mg含有。

● 試験方法

『内服薬経管投与ハンドブック第2版』（㈱じほう社）に記載されている方法に従って試験を行い、経管投与判定基準に従い、判定を行った。

① 崩壊懸濁試験：シリンジ内に1錠を入れ、55℃の温湯20mLを吸い取り、5分間放置した。5分後にシリンジを90度で15往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認した。5分後に崩壊しない場合は、更に5分間放置後、同様の操作を行う。

② 通過性試験 ：崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を、8Fr.の経管チューブの注入端より2～3mL/秒の速度で注入し、通過性を観察した。

● 結果

試験項目	試験結果
崩壊懸濁試験	10 分間時で錠剤は完全に崩壊せず、液はある程度懸濁状態を示した。錠剤を粉砕したところ、5 分間時で良好な懸濁状態を示した。
通過性試験	懸濁液はチューブサイズ 8Fr.を通過した。

● 結論

ロラタジン錠 10mg「ケミファ」を簡易懸濁法により試験し、各試験項目につき検討した。その結果、崩壊懸濁試験では錠剤を粉砕した場合に限り、完全に崩壊し、良好な懸濁状態を示した。通過性試験では、懸濁液の経管チューブの通過性は良好であった。以上より、本剤については錠剤を粉砕した場合に限り、簡易懸濁法の適用は可能と判断した。

2)ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」

● 目的

ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」について簡易懸濁法の適否を検討するため、崩壊懸濁試験および通過性試験を実施した。

● 試験製剤

ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」（ダイト株式会社）／ロラタジンとして 10.0mg 含有

● 試験方法

『内服薬経管投与ハンドブック第 2 版』(㈱じほう社）に記載されている方法に従って試験を行い、経管投与判定基準に従い、判定を行った。

① 崩壊懸濁試験：シリンジ内に 1 錠を入れ、55℃の温湯 20mL を吸い取り、5 分間放置した。5 分後にシリンジを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認した。5 分後に崩壊しない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行う。

② 通過性試験 ：崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を、8Fr.の経管チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、通過性を観察した。

● 試験結果

試験項目	試験結果
崩壊懸濁試験	5 分間時で完全に崩壊し、良好な懸濁状態を示した。
通過性試験	懸濁液はチューブサイズ 8Fr.を通過した。

● 結論

ロラタジン OD 錠 10mg「ケミファ」を簡易懸濁法により試験し、各試験項目につき検討した。その結果、崩壊懸濁試験では完全に崩壊し、良好な懸濁状態を示した。
通過性試験では、懸濁液の経管チューブの通過性は良好であった。
以上より、本剤については簡易懸濁法の適用は可能と判断した。

2. その他の関連資料

該当資料なし