

ロラタジン錠

ロラタジン口腔内崩壊錠

ロラタジン錠10mg「YD」

ロラタジンOD錠10mg「YD」

LORATADINE TABLETS  
LORATADINE OD TABLETS

貯法：室温保存

有効期間：3年

	錠10mg	OD錠10mg
承認番号	22300AMX01009	22300AMX01010
販売開始	2011年11月	2011年11月

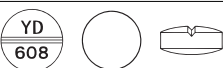
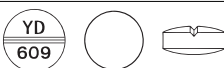
**2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）**

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

**3. 組成・性状****3.1 組成**

販売名	ロラタジン錠10mg「YD」	ロラタジンOD錠10mg「YD」
有効成分	1錠中、ロラタジン10mg	1錠中、ロラタジン10mg
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ステアリン酸Mg	D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、スクラロース、ケイ酸Al、ヒドロキシプロピルスターチ、セルロース、クロスポリドン、香料、ステアリン酸Mg

**3.2 製剤の性状**

販売名	ロラタジン錠10mg「YD」	ロラタジンOD錠10mg「YD」
性状・剤形	白色の割線入りの素錠	白色の割線入りの素錠
外形		
直径	約6.5mm	約7.0mm
厚さ	約2.6mm	約3.2mm
重量	100mg	120mg
識別コード	YD608	YD609

**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

**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。

**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、好発季節を考慮して、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。

**9. 特定の背景を有する患者に関する注意****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]

**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。

**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。

**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。

**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。

**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。

**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。

**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	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]

**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。

**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。

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		好酸球增多、白血球減少、好中球減少、単球增多、リンパ球減少、白血球增多、リンパ球增多、ヘマトクリット減少、ヘモグロビン減少、好塩基球增多、血小板減少、好中球增多		
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）

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。

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。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

〈製剤共通〉

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

〈OD錠〉

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

14.1.3 本剤は寝たままの状態では水なしで服用しないこと。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

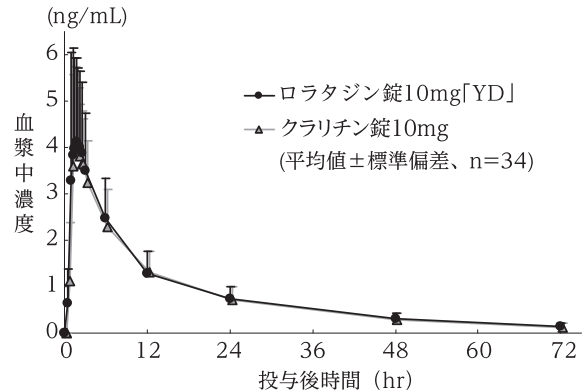
16.1.1 生物学的同等性試験

〈ロラタジン錠10mg [YD]〉

ロラタジン錠10mg [YD] 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）、健康成人男子34名に絶食単回経口投与して、血漿中の活性代謝物Descarboethoxyloratadine（DCL）濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>1)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ロラタジン錠10mg[YD]	59.12 ±19.40	5.12 ±2.00	2.0±1.2	20.4±4.3
クラリチン錠10mg	56.95 ±19.92	4.75 ±1.45	1.7±0.6	19.8±3.3

(平均値±標準偏差、n=34)



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。

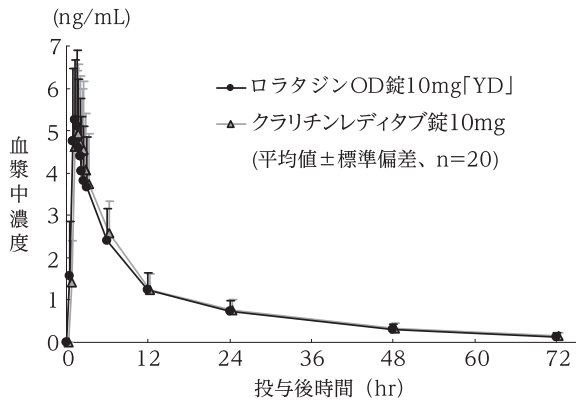
〈ロラタジンOD錠10mg [YD]〉

(1) 水で服用した場合

ロラタジンOD錠10mg [YD] 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）、健康成人男子20名に絶食単回経口投与して、血漿中活性代謝物Descarboethoxyloratadine（DCL）濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>2)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ロラタジンOD錠10mg [YD]	60.31 ±18.42	5.60 ±1.67	1.3±0.2	20.6±3.6
クラリチンレディタブ錠10mg	62.17 ±18.59	5.61 ±1.78	1.4±0.3	20.8±2.8

(平均値±標準偏差、n=20)



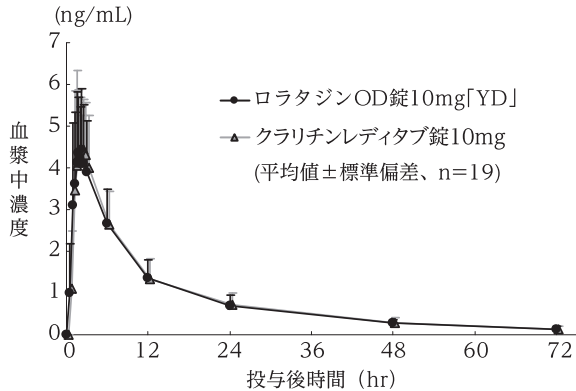
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## (2) 水なしで服用した場合

ロラタジンOD錠10mg [YD] 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）、健康成人男子19名に絶食単回経口投与して、血漿中活性代謝物Descarboethoxyloratadine (DCL) 濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>2)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ロラタジンOD錠10mg [YD]	60.09 ±18.29	5.19 ±1.58	1.7±0.6	19.1±2.7
クラリチンレディタブ錠10mg	61.09 ±17.54	5.50 ±1.57	1.7±0.6	18.5±4.0

(平均値±標準偏差、n=19)



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。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

ロラタジン及びDCLは、ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗作用を示す<sup>3)</sup>。また、ヒスタミン、ロイコトリエンC<sub>4</sub>の遊離抑制作用を示す<sup>4),5)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ロラタジン (Loratadine)

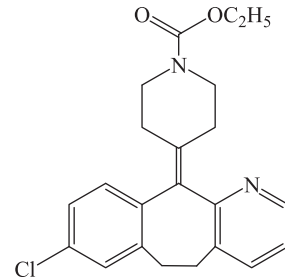
化学名：Ethyl 4-(8-chloro-5,6-dihydro-11H-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridin-11-ylidene)-1-piperidinecarboxylate

分子式：C<sub>22</sub>H<sub>23</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>

分子量：382.88

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。  
メタノール、エタノール (99.5)、アセトン又はトルエンに溶けやすく、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。

化学構造式：



## 20. 取扱い上の注意

### <OD錠>

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

## 22. 包装

### <ロラタジン錠10mg [YD]>

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [10錠 (PTP) ×50]

### <ロラタジンOD錠10mg [YD]>

100錠 [10錠 (PTP) ×10、乾燥剤入り]

500錠 [10錠 (PTP) ×50、乾燥剤入り]

## 23. 主要文献

- 1) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験（錠10mg）
- 2) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験（OD錠10mg）
- 3) モルモットのH<sub>1</sub>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))
- 4) Kreutner, W. et al.: Allergy. 1987; 42: 57-63
- 5) 亀井千晃 他：薬理と治療. 1996; 24(1): 49-52

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

株式会社陽進堂 お客様相談室  
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号  
☎ 0120-647-734

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

 株式会社陽進堂  
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号