2017年3月改訂（第4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2013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OD錠10mg「アメル」

LORATADINE OD Tab. 10mg "AMEL"

〈ロラタジン口腔内崩壊錠〉

剤形	素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中ロラタジン10mgを含有
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	製造販売承認年月日：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：2014年　1月　6日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：共和薬品工業株式会社 販　売　元：株式会社三和化学研究所
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	株式会社三和化学研究所 コンタクトセンター TEL 0120-19-8130 FAX(052)950-1305 医療関係者向けホームページ http://med.skk-net.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http://www.pmda.go.jp/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，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ホームページ（http://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を掲載する医薬品医療機器総合機構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総合機構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があり，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．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
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） ･･･ 2
６．慣用名，別名，略号，記号番号 ･･･ 2
７．CAS 登録番号 ･･･ 2
Ⅲ．有効成分に関する項目
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 ･･･ 3
４．有効成分の定量法 ･･･ 3
Ⅳ．製剤に関する項目
１．剤形 ･･･ 4
２．製剤の組成 ･･･ 4
３．懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 ･･･ 4
４．製剤の各種条件下における安定性 ･･･ 5
５．調製法及び溶解後の安定性 ･･･ 5
６．他剤との配合変化（物理化学的変化） ･･･ 5
７．溶出性 ･･･ 5
８．生物学的試験法 ･･･ 7
９．製剤中の有効成分の確認試験法 ･･･ 7
１０．製剤中の有効成分の定量法 ･･･ 7
１１．力価 ･･･ 7
１２．混入する可能性のある夾雑物 ･･･ 7
１３．注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 ･･･ 7
１４．その他 ･･･ 7
Ⅴ．治療に関する項目
１．効能又は効果 ･･･ 8
２．用法及び用量 ･･･ 8
３．臨床成績 ･･･ 8
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 ･･･ 10
２．薬理作用 ･･･ 10
Ⅶ．薬物動態に関する項目
１．血中濃度の推移・測定法 ･･･ 11
２．薬物速度論的パラメータ ･･･ 13

３．吸収 13
４．分布 13
５．代謝 14
６．排泄 14
７．トランスポーターに関する情報 15
８．透析等による除去率 15
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 16
２．禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） 16
３．効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 16
４．用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 16
５．慎重投与内容とその理由 16
６．重要な基本的注意とその理由及び処置方法 16
７．相互作用 16
８．副作用 17
９．高齢者への投与 18
１０．妊婦，産婦，授乳婦等への投与 18
１１．小児等への投与 18
１２．臨床検査結果に及ぼす影響 18
１３．過量投与 18
１４．適用上の注意 19
１５．その他の注意 19
１６．その他 19
Ⅸ．非臨床試験に関する項目
１．薬理試験 20
２．毒性試験 20
Ⅹ．管理的事項に関する項目
１．規制区分 21
２．有効期間又は使用期限 21
３．貯法・保存条件 21
４．薬剤取扱い上の注意点 21
５．承認条件等 21
６．包装 21
７．容器の材質 21
８．同一成分・同効薬 22
９．国際誕生年月日 22
１０．製造販売承認年月日及び承認番号 22
１１．薬価基準収載年月日 22
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 22
１３．再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 22
１４．再審査期間 22
１５．投薬期間制限医薬品に関する情報 22

１６．各種コード……22
１７．保険給付上の注意……22
ＸＩ．文献
１．引用文献……23
２．その他の参考文献……23
ＸⅡ．参考資料
１．主な外国での発売状況……24
２．海外における臨床支援情報……24
ＸⅢ．備考
その他の関連資料……26

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

ロラタジンは、抗アレルギー作用を有する持続性選択H_1受容体拮抗剤で、第2世代の抗ヒスタミン薬として、本邦では2002年に上市されている。

ロラタジンOD錠10mg「アメル」は、共和薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、平成17年3月31日付薬食発第0331015号厚生労働省医薬食品局長通知「医薬品の承認申請について」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15日に承認を取得した。

ロラタジンOD錠10mg「アメル」は、2012年2月13日に、小児への用法・用量の追加承認を取得した。（「Ⅹ.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」の項参照）

その後、2014年1月6日に株式会社三和化学研究所が販売を開始した。

２．製品の治療学的・製剤学的特性

（1）本剤はロラタジンを有効成分とする持続性選択 H_1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

（2）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。（「Ⅷ.8.(2)重大な副作用と初期症状」の項参照）

Ⅱ．名称に関する項目

１．販売名

（１）**和　名**：ロラタジン OD 錠 10mg「アメル」

（２）**洋　名**：LORATADINE OD Tab.10mg “AMEL”

（３）**名称の由来**：有効成分名に基づき命名

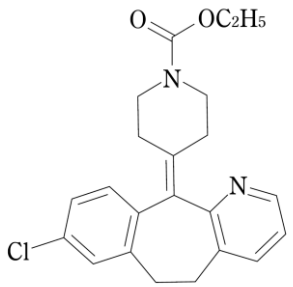
２．一般名

（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**：-tadine　三環系ヒスタミン H_1 受容体拮抗薬

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）

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

溶媒名	本品 1g を溶かすのに要する溶媒量	溶解性
酢　酸　（１００）	1mL 未満	極めて溶けやすい
メ　タ　ノ　ー　ル	1mL 以上　10mL 未満	溶けやすい
エタノール(99.5)	1mL 以上　10mL 未満	溶けやすい
アセトニトリル	10mL 以上　30mL 未満	やや溶けやすい
水	10000mL 以上	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

（２）赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

（３）炎色反応試験法（2）

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

１）区別：素錠

２）外観：

販売名	剤　形	色	外形・大きさ等	識　別 コード (表/裏)
ロラタジン OD錠10mg 「アメル」	円形の素錠	白色	 直径：約　7.0mm 厚さ：約　3.3mm 質量：約150.0mg	Kw LOR /OD10

３）性状：白色の円形の素錠

（２）製剤の物性

硬度：25N(2.5kg)以上

（３）識別コード

Kw LOR OD10（錠剤本体、PTP に表示）

（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

１錠中、ロラタジン 10mg を含有する。

（２）添加物

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を含有する。

（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

（１）加速試験[1)]

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
加速試験	40±1℃、 75±5%RH	6 カ月	PTP 包装※1	変化なし

測定項目：性状、確認試験、製剤均一性試験、崩壊性、溶出性、定量

参考として純度試験

※1　未包装バルク製剤を高防湿ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔で PTP 包装し、アルミニウム袋に充てんしたもの。

最終包装製品を用いた加速試験（40±1℃、相対湿度 75±5%、6 ヵ月）の結果、ロラタジン OD 錠 10mg「アメル」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）無包装安定性試験[2)]

試験項目		保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
無包装安定性試験	温度	40±1℃、 75±5%RH	90 日	遮光・気密容器※2	変化なし
				遮光・分包※3	変化なし
	湿度	25±2℃、 75±5%RH	90 日	遮光・開放※4	30 日目より硬度の低下がみられた（規格の範囲外）。その他の項目に変化なし。
				遮光・分包※3	変化なし
	光	25±2℃、 45±5%RH、 120 万 lx･h	20 日	開放※4	変化なし
				分包※3	変化なし

測定項目：性状、崩壊性、溶出性、定量、硬度

※2　ガラス瓶

※3　セロファン＋ポリエチレン

※4　シャーレ

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（物理化学的変化）

該当しない

７．溶出性

○溶出挙動の類似性[3)]

平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」に基づき実施。

試験方法：「日局」一般試験法溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

試験液の温度：37±0.5℃

回転数：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）、100rpm（pH4.0）

試験液：pH1.2＝「日局」溶出試験の第1液

pH4.0＝薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH6.8＝「日局」溶出試験の第2液

水 ＝「日局」精製水

判定基準：以下の基準に適合するとき、溶出挙動が類似していると判定する。

①：標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

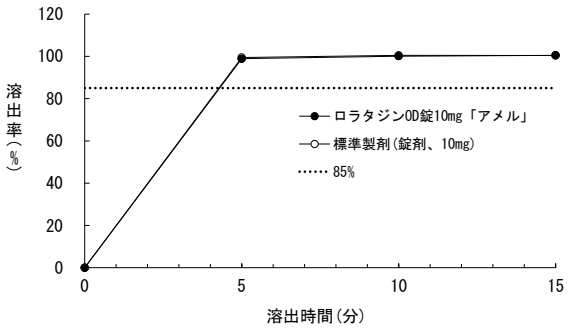
試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

③c：標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合、以下の基準に適合する。

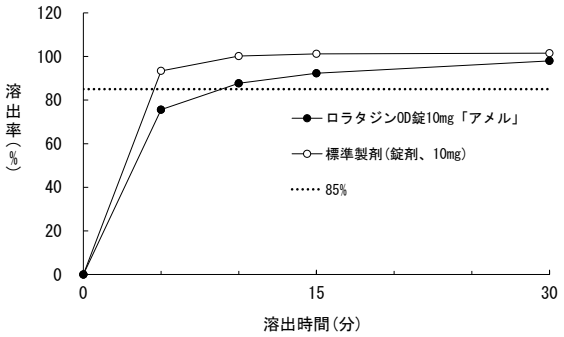
規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又はf2関数の値は53以上である。

結果：溶出性は判定基準に適合した。

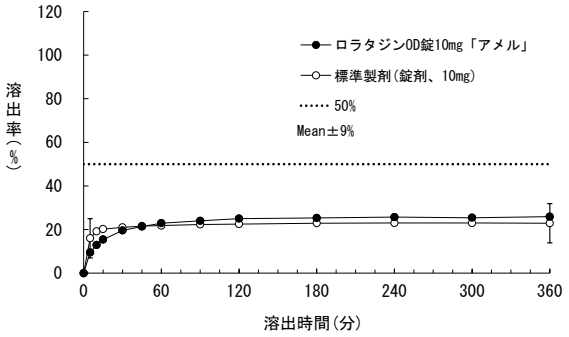
試験液：pH1.2、判定基準①



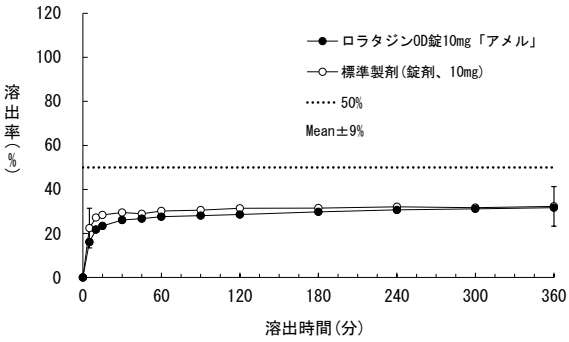
試験液：pH4.0（50rpm）、判定基準①



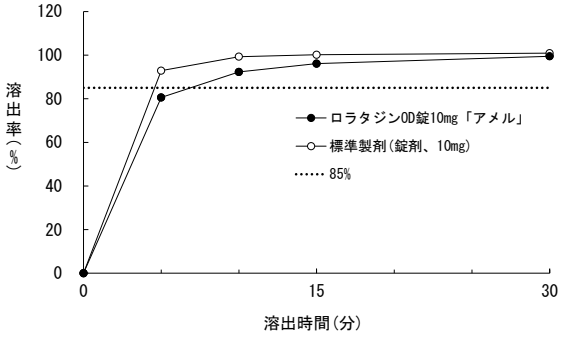
試験液：pH6.8、判定基準③c



試験液：水、判定基準③c



試験液：pH4.0（100rpm）、判定基準①



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

（２）薄層クロマトグラフィー

（３）赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

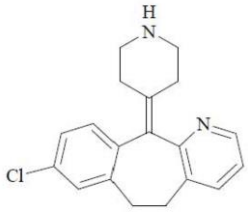
１０．製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

１１．力価

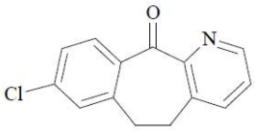
該当しない

１２．混入する可能性のある夾雑物

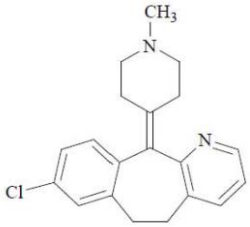


4-(8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine-11-ylidene)piperidine

（活性代謝物：descarboethoxyloratadine(DCL)）



8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine-11-one(ヘプタノン体)



4-(8-Chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine-11-ylidene)-1-methylpiperidine

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

該当しない

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＞

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。

３．臨床成績

（１）臨床データパッケージ

該当資料なし

（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

オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、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等

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[4)]

1.53±0.53(h)(Mean±S.D.,n=18)

(ロラタジンOD錠10mg「アメル」1錠を水なし、絶食単回経口投与時)

1.48±0.45(h)(Mean±S.D.,n=24)

(ロラタジンOD錠10mg「アメル」1錠を水あり、絶食単回経口投与時)

（3）臨床試験で確認された血中濃度[4)]

平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」に基づき実施。

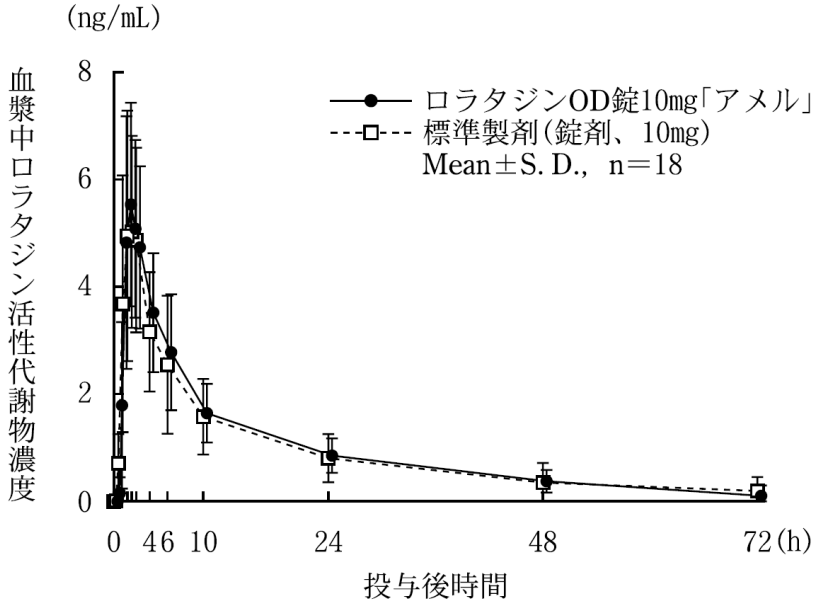
ロラタジンOD錠10mg「アメル」と標準製剤（錠剤、10mg）を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ロラタジンとして10mg）健康成人男子（水なし18例、水あり24例）に絶食単回経口投与してLC/MS/MS法により血漿中ロラタジン活性代謝物濃度を測定した（水あり投与は150mLの水とともに服用)。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、$AUC_{(0\to72)}$及びCmaxの対数値の平均値の差の90%信頼区間はそれぞれ水なしでは log(1.0152)～log(1.1737)及び log(1.0290)～log(1.2166)、水ありでは log(0.8266)～log(0.9321)及び log(0.8346)～log(0.9590)であり、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であることから、両剤の生物学的同等性が確認された。

（注）本剤の承認された用法は、食後投与である。

水なし投与

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{(0\to72)}$ (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (h)	$T_{1/2}$ (h)
ロラタジンOD錠 10mg「アメル」	68.82±25.44	6.13±1.95	1.53±0.53	19.67±7.09
標準製剤 （錠剤 、10mg）	65.30±35.39	5.53±2.11	1.94±0.51	22.37±10.26

(Mean±S.D.,n=18)

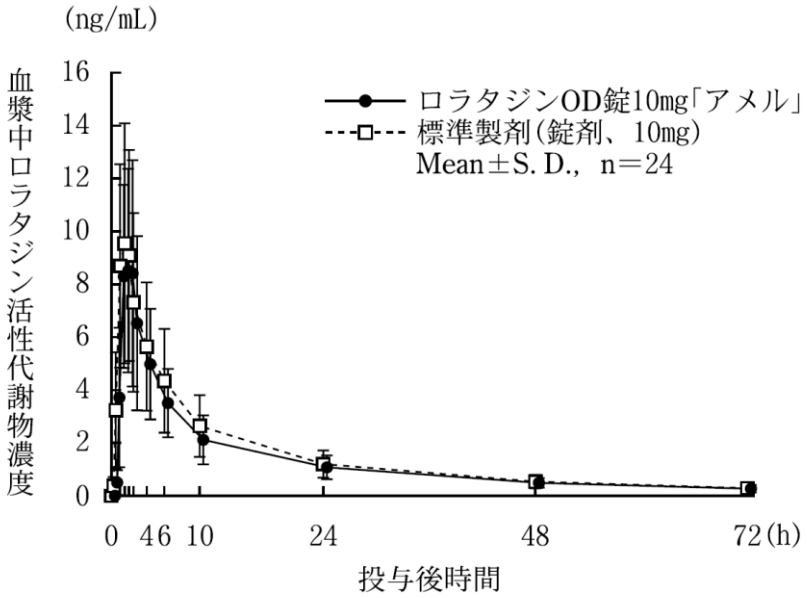


血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

水あり投与

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{(0\to72)}$ (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (h)	$T_{1/2}$ (h)
ロラタジン OD 錠 10mg「アメル」	94.22±36.53	9.68±4.37	1.48±0.45	23.78±5.82
標準製剤 (錠剤 、10mg)	108.07±44.61	10.78±4.51	1.46±0.39	22.74±6.68

(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。

（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」の項参照

（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

0.03907±0.01211(h^{-1})（活性代謝物：DCL）

（ロラタジンOD錠10mg「アメル」1錠を水なし、絶食単回経口投与時）

0.55665±0.24029(h^{-1})（活性代謝物：DCL）

（ロラタジンOD錠10mg「アメル」1錠を水あり、絶食単回経口投与時）

（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

＜参考　動物試験データ＞

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。（「Ⅷ.10.妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項参照）

（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。（「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

有り　descarboethoxyloratadine(DCL)

（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

該当資料なし

（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

本剤は血液透析によって除去できない

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）

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」の項参照

５．慎重投与内容とその理由

（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

（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

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（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

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。

その他の副作用（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

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：**

本剤は舌の上にのせ唾液を湿潤させ、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

該当しない

１６．その他

該当資料なし

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：ロラタジン OD 錠 10mg「アメル」　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

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）

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。）

服用時：本剤は舌の上にのせ唾液を湿潤させ、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。

くすりのしおり：有り

（3）調剤時の留意点について

該当しない

５．承認条件等

該当しない

６．包装

PTP100 錠（10 錠×10）、500 錠（10 錠×50）

７．容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

ピロー：ポリエチレン、アルミ箔

個装箱：紙

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%

同　効　薬：オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、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等

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

製造販売承認年月日：2011 年 7 月 15 日

承認番号：22300AMX00833

１１．薬価基準収載年月日

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 13 日

	新	旧
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。	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。

※下線部の変更

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 OD 錠 10mg「アメル」	120928002	4490027F2100	622092801

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。

ＸＩ．文献

１．引用文献

１）共和薬品工業株式会社　社内資料：安定性試験(加速試験)
２）共和薬品工業株式会社　社内資料：安定性試験(無包装)
３）共和薬品工業株式会社　社内資料：溶出試験
４）共和薬品工業株式会社　社内資料：生物学的同等性試験
５）Gerald GB,et al：Drugs in Pregnancy and Lactation 8th ed. 1072,Lippincott Williams & Wilkins,2008
６）Therapeutic Goods Administration, Prescribing medicines in pregnancy database ＜http://www.tga.gov.au/prescribing-medicines-pregnancy-database＞ (2017/02/22 アクセス)
７）American Academy of Pediatrics：Pediatrics 108：781,2001

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

（１）本剤と同一製剤は外国で発売されていない。

（２）ロラタジン製剤としては、各国で販売されている。

２．海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA 分類、オーストラリアの分類）[5,6]

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り、米 FDA 分類、オーストラリアの分類とは異なる。

＜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
FDA：Pregnancy Category	B（2008 年）
オーストラリアの分類： An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy	B1（2017 年 2 月現在）

参考：分類の概要

＜FDA：Pregnancy Category＞

B：Either animal-reproduction studies have not demonstrated a fetal risk but there are no controlled studies in pregnant women or animal-reproduction studies have shown an adverse effect (other than a decrease in fertility) that was not confirmed in controlled studies in women in the first trimester (and there is no evidence of a risk in later trimesters).

［動物を用いた研究では胎児への危険性は否定されている。しかしながらヒト妊婦に関する対照比較研究は実施されていないもの。あるいは、動物を用いた研究で有害作用が証明されているが、ヒト妊婦の対照比較研究では実証されなかったもの。動物の知見にもかかわらず、妊娠期間中に使用した場合の胎児への障害の可能性はうすいであろうもの。］

＜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.

［妊婦および妊娠可能年齢の女性への使用経験はまだ限られているが、この薬による奇形やヒト胎児への直接・間接的有害作用の発生頻度増加は観察されていない。動物を用いた研究では、胎児への障害発生が増加したという証拠は示されていない。］

授乳婦（乳児）に関する海外情報(米国小児科学会(AAP)の分類基準)[7)]

本邦における使用上の注意「妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項の記載は前述のとおりであり、米国小児科学会(AAP)の分類基準とは異なる。

＜米国小児科学会(AAP：American Academy of Pediatrics)の分類基準（2001年9月）＞

Maternal Medication Usually Compatible With Breastfeeding

［母親への薬物療法は一般に授乳と両立しうる。］

ＸⅢ．備考

その他の関連資料

該当資料なし