※※2019年４月改訂（第７版）
※2017年４月改訂

日本標準商品分類番号
87449

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「EE」
Loratadine tab.10mg「EE」
ロラタジンOD錠10mg「EE」
Loratadine OD tab.10mg「EE」

	錠10mg	OD錠10mg
承認番号	22300AMX01027000	22300AMX01028000
薬価収載	2011年11月	2011年11月
販売開始	2011年11月	2011年11月

〈ロラタジン錠、ロラタジン口腔内崩壊錠〉

〔貯　　法〕室温保存
開封後湿気を避けて保存すること。
〔使用期限〕外箱又はラベルに表示の使用期限内に使用すること。

【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

【組成・性状】

販売名	ロラタジン錠10mg「EE」			ロラタジンOD錠10mg「EE」		
有効成分（１錠中）	ロラタジン 10mg			ロラタジン 10mg		
添加物	ステアリン酸マグネシウム、デキストリン、トウモロコシデンプン、乳糖水和物			クロスポビドン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルスターチ、ヒドロキシプロピルセルロース、フマル酸ステアリルナトリウム、D-マンニトール		
性状・剤形	白色の割線入りの素錠			白色の素錠（口腔内崩壊錠）		
外形	表	裏	側面	表	裏	側面
						
	直径（mm）	質量（mg）	厚さ（mm）	直径（mm）	質量（mg）	厚さ（mm）
	6.5	100	2.6	7.0	140	2.9
識別コード	EE233			EE72		

【効能・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

【用法・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・用量に関連する使用上の注意〉
ロラタジンOD錠10mg「EE」は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込むこと。
〔「適用上の注意」の項参照〕

【使用上の注意】

１．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〔「高齢者への投与」の項参照〕

２．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。

３．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。

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〕

４．副作用
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。
(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)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。
(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
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、瘙痒、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

	頻度不明
循環器	頻脈、動悸
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

5．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。

6．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。〕

7．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）。

8．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。

9．過量投与

(1)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。

(2)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。

10. 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（OD錠のみ）

1)本剤は舌の上にのせ唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後唾液のみで服用可能である。

2)本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

【薬物動態】

1.生物学的同等性試験

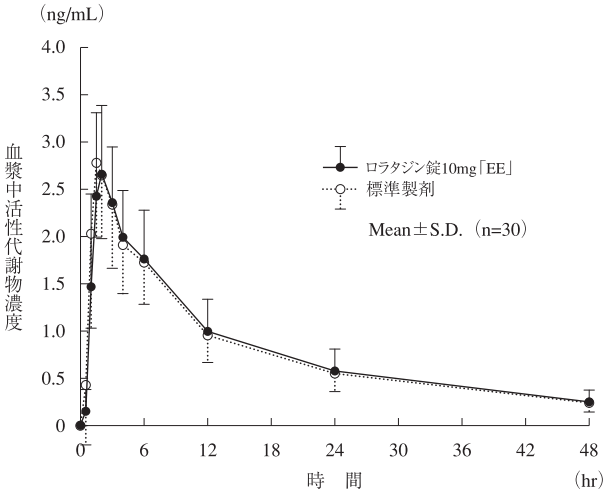
1)ロラタジン錠10mg「EE」

ロラタジン錠10mg「EE」と標準製剤を、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下単回経口投与して血漿中の活性代謝物（DCL）濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）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。[1)]

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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}48hr}$ (ng・hr／mL)	C_{max} (ng／mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
ロラタジン錠10mg「EE」	38.9±12.0	2.88±0.72	1.9±0.5	18.3±3.0
標準製剤	38.1±10.1	3.00±0.76	1.7±0.5	18.4±2.6

（Mean±S.D., n＝30）



10mg錠１錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移

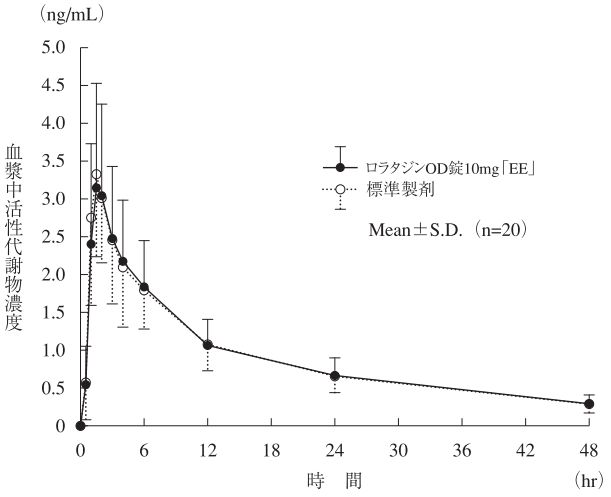
2)ロラタジンOD錠10mg「EE」

ロラタジンOD錠10mg「EE」と標準製剤を、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下、水あり及び水なしで単回経口投与して血漿中の活性代謝物（DCL）濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）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。[1)]

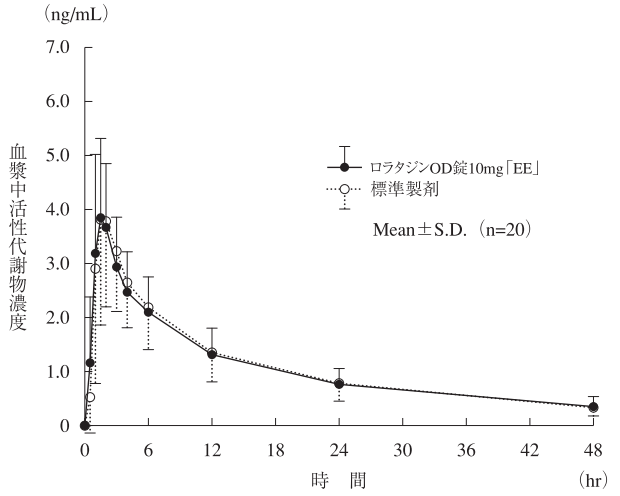
血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

		判定パラメータ		参考パラメータ	
		$AUC_{0\text{-}48hr}$ (ng・hr／mL)	C_{max} (ng／mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
水あり投与	ロラタジンOD錠10mg「EE」	43.5±14.0	3.38±1.31	1.7±0.7	19.5±2.8
	標準製剤	43.3±12.6	3.44±1.04	1.6±0.3	19.2±2.9
水なし投与	ロラタジンOD錠10mg「EE」	51.7±17.2	4.10±1.35	1.8±1.1	19.5±3.8
	標準製剤	52.7±18.7	4.45±1.68	2.0±1.1	18.2±3.1

（Mean±S.D., n＝20）



10mgOD錠１錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移（水あり）



10mgOD錠１錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移（水なし）

【有効成分に関する理化学的知見】

一 般 名：ロラタジン（Loratadine）

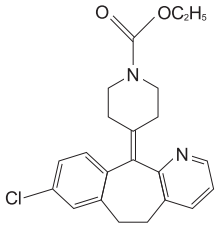
化 学 名：Ethyl 4-(8-chloro-5,6-dihydro-11*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-*b*]pyridin-11-ylidene)-1-piperidinecarboxylate

分 子 式：$C_{22}H_{23}ClN_2O_2$

分 子 量：382.88

融　　点：133～137℃

構 造 式：



物理化学的性状：

ロラタジンは白色の結晶性の粉末である。
本品は、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。

【取扱い上の注意】

長期保存試験

長期保存試験（25℃、相対湿度60％、36ヵ月）の結果、ロラタジン錠10mg「EE」及びロラタジンOD錠10mg「EE」（最終包装）は、通常の市場流通下において３年間安定であることが確認された。[2)]

【包　　装】

ロラタジン錠10mg「EE」……300錠（バラ）
100錠（PTP）・500錠（PTP）

ロラタジンOD錠10mg「EE」……300錠（バラ）
100錠（PTP）・140錠（PTP）・500錠（PTP）

※※【主要文献】

※※ 1）生物学的同等性に関する資料（エルメッド株式会社　社内資料）
※※ 2）安定性に関する資料（エルメッド株式会社　社内資料）

※※【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社　お客様サポートセンター
〒930－8583　富山市総曲輪１丁目６番21
TEL（0120）517－215
Fax（076）442－8948

※※ 製造販売元
エルメッド株式会社
NICHI-IKO 富山市総曲輪1丁目6番21

※※ 販 売 元
日医工株式会社
NICHI-IKO 富山市総曲輪1丁目6番21