

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H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

デスロラタジン錠

デスロラタジン錠5mg「サワイ」

DESLORATADINE Tablets [SAWAI]

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品 ^{注)} 注)注意—医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1錠中デスロラタジン5mg含有
一般名	和名：デスロラタジン(JAN) 洋名：Desloratadine(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2026年2月16日 薬価基準収載年月日：2026年6月12日 販売開始年月日：2026年6月12日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2026年6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(<http://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て、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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	22
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	22
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	22
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	22
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	22
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	22
6. RMPの概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	22
II. 名称に関する項目	2	7. 相互作用	23
1. 販売名	2	8. 副作用	23
2. 一般名	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	24
3. 構造式又は示性式	2	10. 過量投与	24
4. 分子式及び分子量	2	11. 適用上の注意	24
5. 化学名(命名法)又は本質	2	12. その他の注意	24
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	IX. 非臨床試験に関する項目	25
III. 有効成分に関する項目	3	1. 薬理試験	25
1. 物理化学的性質	3	2. 毒性試験	25
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	X. 管理的事項に関する項目	26
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 規制区分	26
IV. 製剤に関する項目	4	2. 有効期間	26
1. 剤形	4	3. 包装状態での貯法	26
2. 製剤の組成	4	4. 取扱い上の注意	26
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	5. 患者向け資材	26
4. 力価	5	6. 同一成分・同効薬	26
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	7. 国際誕生年月日	26
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	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	26
7. 調製法及び溶解後の安定性	8	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	27
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	27
9. 溶出性	9	11. 再審査期間	27
10. 容器・包装	10	12. 投薬期間制限に関する情報	27
11. 別途提供される資材類	10	13. 各種コード	27
12. その他	10	14. 保険給付上の注意	27
V. 治療に関する項目	11	XI. 文献	28
1. 効能又は効果	11	1. 引用文献	28
2. 効能又は効果に関連する注意	11	2. その他の参考文献	29
3. 用法及び用量	11	XII. 参考資料	30
4. 用法及び用量に関連する注意	11	1. 主な外国での発売状況	30
5. 臨床成績	11	2. 海外における臨床支援情報	30
VI. 薬効薬理に関する項目	15	XIII. 備考	31
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	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	31
2. 薬理作用	15	2. その他の関連資料	32
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	19		
5. 分布	19		
6. 代謝	20		
7. 排泄	20		
8. トランスポーターに関する情報	20		
9. 透析等による除去率	20		
10. 特定の背景を有する患者	21		
11. その他	21		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

デスロラタジン錠5mg「サワイ」は、デスロラタジンを含む持続性選択H₁受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2026年2月
上市	2026年6月

2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤は、「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」の効能又は効果を有する。(V. -1. 参照)
- 2) 本剤の用法は、「1日1回投与」である。(V. -3. 参照)
- 3) デスロラタジンはロラタジンの活性代謝物であり、持続的なヒスタミンH₁受容体拮抗作用を有するアレルギー性疾患治療薬である¹⁾。(VI. -2. 参照)
- 4) 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、黄疸が報告されている。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

「IV. 製剤に関する項目」及び沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」
<https://med.sawai.co.jp/> 参照

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

(2026年6月12日時点)

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

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

デスロラタジン錠 5mg「サワイ」

2) 洋名

DESLORATADINE Tablets [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

デスロラタジン(JAN)

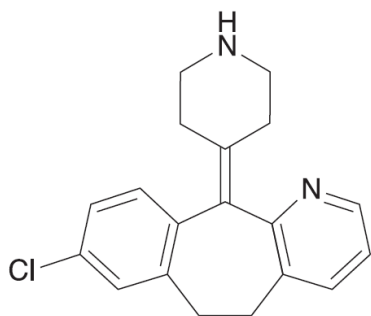
2) 洋名(命名法)

Desloratadine(JAN)

3) ステム(stem)

-tadine : tricyclic histamine-H₁ receptor antagonists, tricyclic compounds

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₁₉H₁₉ClN₂

分子量 : 310.82

5. 化学名(命名法)又は本質

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

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
白色の粉末である。
 - 2) 溶解性
メタノール、エタノール(99.5)又はベンジルアルコールに溶けやすく、2-プロパノール又は酢酸(100)にやや溶けやすく、アセトンにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。
 - 3) 吸湿性
吸湿性は認められない。
 - 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点
該当資料なし
 - 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>
赤外吸収スペクトル測定法
 - <定量法>
液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目


IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

2) 製剤の外観及び性状

外形	
性状	うすい赤色
直径(mm)	6.5
厚さ(mm)	2.8
重量(mg)	約104

3) 識別コード

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：デスロラタジン 5 サワイ

4) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

有効成分 [1錠中]	デスロラタジン 5mg
添加剤	カルナウバロウ、結晶セルロース、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、タルク、デンプングリコール酸Na、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、リン酸水素Ca

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

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) 加速試験²⁾

目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を短期間で推定するため、加速試験を実施する。

方法

「安定性試験ガイドラインの改定について」(平成15年6月3日 医薬審発第0603001号)に基づいて、本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

試験条件及び検体

保存条件	40±2℃/75±5%RH
保存期間	6ヵ月
試験回数	3回/ロット
保存形態	PTP(ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム/アルミニウム箔)/ピロー(アルミニウム袋)/紙箱
ロット番号	①814T1S5021、②814T1S5022、③814T1S5023

結果

いずれのロットもすべての試験項目において規格に適合した。

ロット番号 試験項目	イニシャル			6ヵ月後		
	①	②	③	①	②	③
性状	うすい赤色のフィルムコーティング錠			うすい赤色のフィルムコーティング錠		
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
純度試験(類縁物質)	適合	適合	適合	適合	適合	適合
純度試験(N-ニトロソ デスロラタジン※)	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量均一性試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合

※：ニトロソアミン原薬関連不純物(NDSRI)

2) 長期保存試験²⁾

目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を確認するため、長期保存試験を実施する。

IV. 製剤に関する項目

方法

「安定性試験ガイドラインの改定について」(平成15年6月3日 医薬審発第0603001号)に基づいて、本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。「安定性データの評価に関するガイドラインについて」(平成15年6月3日 医薬審発第0603004号)に従い、本製剤の有効期間を評価する。

試験条件及び検体

保存条件	25±2℃/60±5%RH
保存期間	30ヵ月
試験回数	3回/ロット
保存形態	PTP(ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム/アルミニウム箔)/ピロー(アルミニウム袋)/紙箱
ロット番号	①814T1S5021、②814T1S5022、③814T1S5023

結果

いずれのロットもすべての試験項目において規格に適合した。

ロット番号 試験項目	イニシャル			30ヵ月後		
	①	②	③	①	②	③
性状	うすい赤色のフィルムコーティング錠			うすい赤色のフィルムコーティング錠		
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
純度試験(類縁物質)	適合	適合	適合	適合	適合	適合
純度試験(N-ニトロソ デスロラタジン※)	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量均一性試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合

※：ニトロソアミン原薬関連不純物(NDSRI)

結論

1)加速試験及び2)長期保存試験(30ヵ月)の結果、本製剤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。

3)無包装下の安定性試験³⁾

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
814T1S5021	温度	40℃、遮光気密容器
	湿度	25℃/75%RH、遮光開放
	室温	25℃/60%RH、遮光開放
	光	25℃/60%RH、白色蛍光灯(4000lx)、開放

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・硬度* (5錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・溶出試験・定量試験	1回
純度試験(N-ニトロソデスロラタジン†)	3回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

†：ニトロソアミン原薬関連不純物(NDSRI)

結果

試験項目 保存条件・期間		性状	硬度(N)	純度試験		溶出試験	定量試験※
				類縁物質	N-ニトロソ デスロラタジン		
イニシャル		(a)	95.8	適合	適合	試験実施中	100.0
温度	5週	変化なし	変化なし 96.4	変化なし	—	試験実施中	変化なし 100.6
	13週	変化なし	変化なし 102.6	変化なし	変化なし	試験実施中	変化なし 100.9
湿度	5週	変化なし	変化あり (規格内) 62.0	変化なし	—	試験実施中	変化なし 101.1
	13週	変化なし	変化あり (規格内) 61.0	変化なし	変化なし	試験実施中	変化なし 100.3
室温	5週	変化なし	変化なし 83.0	変化なし	—	試験実施中	変化なし 101.5
	13週	変化なし	変化なし 85.6	変化なし	変化なし	試験実施中	変化なし 100.3
光	60万lx・h	変化なし	変化なし 79.2	変化なし	—	試験実施中	変化なし 102.2
	120万lx・h	変化なし	変化なし 82.0	変化なし	変化なし	試験実施中	変化なし 100.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：うすい赤色のフィルムコーティング錠

—：実施なし

4) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁴⁾

目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

IV. 製剤に関する項目

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
814T1S5021	室温	25°C/60%RH、遮光

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・硬度* (5錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・溶出試験・定量試験	1回
純度試験(N-ニトロソデスロラタジン†)	3回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

†：ニトロソアミン原薬関連不純物(NDSRI)

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(N)	純度試験		溶出試験	定量試験*
			類縁物質	N-ニトロソ デスロラタジン		
イニシャル	(a)	95.8	適合	適合	試験実施中	100.0
室温	13週	変化なし 100.2	変化なし	—	試験実施中	変化なし 100.1
	26週	変化なし 90.6	変化なし	変化なし	試験実施中	変化なし 100.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：うすい赤色のフィルムコーティング錠

—：実施なし

A) 評価分類基準

	分類	評価基準
性状	変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
	変化あり(規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合
	変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合
硬度	変化なし	硬度変化が30%未満の場合
	変化あり(規格内)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合
	変化あり(規格外)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合
定量試験	変化なし	含量低下が3%未満の場合
	変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
	変化あり(規格外)	規格値外の場合
その他の 試験項目	変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
	変化あり(規格外)	規格値外の場合

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

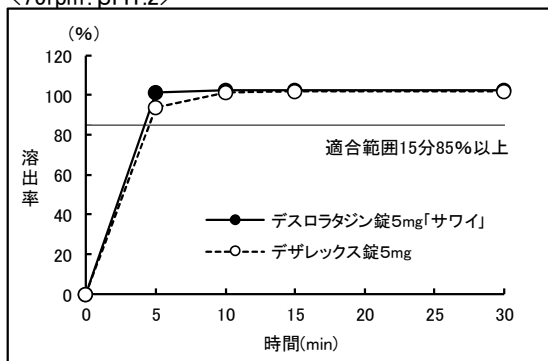
該当資料なし

9. 溶出性

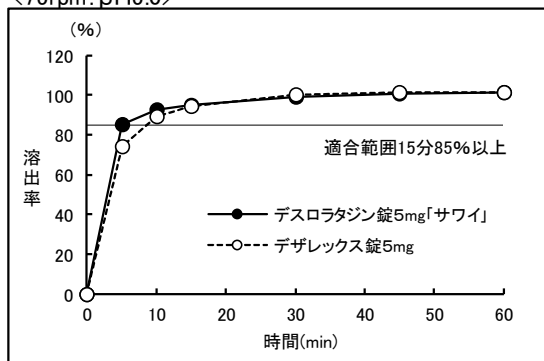
<溶出挙動における同等性及び類似性>⁵⁾

目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性の判定を行うため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日薬生薬審発0319第1号)に準じ、溶出試験を実施する。	
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
条件	回転数・試験液	75rpm : pH1.2、75rpm : pH5.0、75rpm : pH6.8、75rpm : 水
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5℃
	試験数	12 ベッセル
検体	試験製剤	デスロラタジン錠5mg「サワイ」(ロット番号: 814T1S5021)
	標準製剤	デザレックス錠5mg(ロット番号: W027132)
結果	<p><75rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><75rpm : pH5.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><75rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><75rpm : 水> 標準製剤の平均溶出率が60%(10分)及び85%(15分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲になかったが、f2関数の値が42以上であった。</p>	
結論	以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	

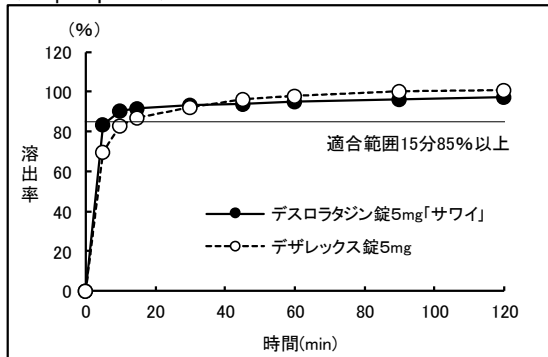
<75rpm: pH1.2>



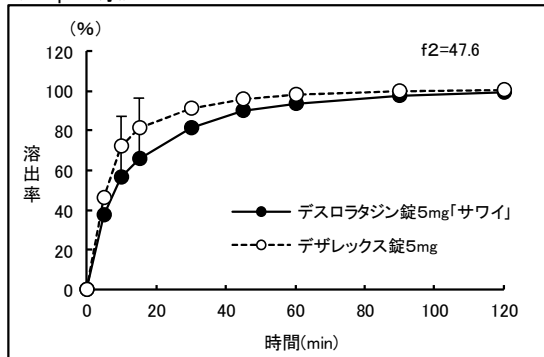
<75rpm: pH5.0>



<75rpm: pH6.8>



<75rpm: 水>



([] : 判定基準の適合範囲)

IV. 製剤に関する項目

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

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

PTP : 100錠 (10錠×10)、500錠 (10錠×50)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP : [PTPシート] ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミニウム箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

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

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

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

通常、12歳以上の小児及び成人にはデスロラタジンとして1回5mgを1日1回経口投与する。

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

該当資料なし

2) 臨床薬理試験

17.3 その他

17.3.1 眠気及び運転・機械操作能力に対する影響

デスロラタジン服用後の眠気、精神運動機能及び自動車運転能力に対する影響はプラセボ服用後と同程度であった⁶⁾。

(1) 健康成人男女を対象に日中の眠気及び精神運動機能を評価した2試験の結果(19例及び22例)、デスロラタジン7.5mg^{註)}単回投与時の日中の眠気(覚醒維持検査スコア及び睡眠潜時反復検査スコア)及び精神運動機能はプラセボ投与時と有意差がなかった^{7, 8)}(外国人データ)。

(2) 健康成人男性(21例)を対象に飛行条件を模した低圧室内での眠気及び操縦操作能力に及ぼす影響を検討したとき、デスロラタジン5mg単回投与時の眠気及び操縦操作能力はプラセボ投与時と有意差がなかった⁹⁾(外国人データ)。

(3) 健康成人男女(18例)を対象に路上での自動車運転能力及び精神運動機能に及ぼす影響を検討したとき、デスロラタジン5mg単回投与時の自動車運転能力及び精神運動機能はプラセボ投与時と差がなかった¹⁰⁾(外国人データ)。

V. 治療に関する項目

17.3.2 心血管系に及ぼす影響

健康成人男女(24例)にデスロラタジン45mg^{註)}(臨床用量の9倍)を1日1回10日間反復投与したとき、臨床的に意味のあるQTc間隔の延長は認められなかった¹¹⁾(外国人データ)。注)本剤の承認された用量は、1日1回5mgである。

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

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

(1) 16歳以上の季節性アレルギー性鼻炎患者を対象とした第Ⅲ相二重盲検比較試験の結果、患者評価による投与2週間平均の4鼻症状スコアの合計(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感の各スコアの合計)のベースラインからの変化量において、デスロラタジン5mgの1日1回投与は、プラセボの1日1回投与に対して優越性を示した($p < 0.001$) (表1)。

表1 患者評価による投与2週間の4鼻症状の合計スコアのベースラインからの変化量(FAS)

	デスロラタジン5mg群	プラセボ群
ベースライン ^{a)}	8.33±1.27 (223)	8.39±1.29 (225)
投与2週間 ^{b)}	6.93±1.93 (223)	7.79±1.81 (225)
ベースラインからの変化量	-1.40±1.83 (223)	-0.60±1.69 (225)
プラセボ群との最小二乗平均差 [95%信頼区間] ^{c)} 、p値 ^{c)}	-0.83[-1.14, -0.51] p<0.001	

平均値±標準偏差(例数)

a) 二重盲検期開始前3日間の平均値

b) 二重盲検期2週間の平均値

c) 時点、時点と投与群の交互作用、時点と重症度(無作為化前3日間における患者評価による4鼻症状合計スコアが11点/日未満・11点/日以上)の交互作用を説明変数とし、被験者内で無構造共分散構造を仮定し、ベースライン値を結果変数に含めた制約付き経時測定データ解析モデル

副作用は、223例中13例(5.8%)に認められた。主なものは、尿中蛋白陽性、白血球数増加の各3例(1.3%)、傾眠2例(0.9%)であった^{12,13)}。

(2) 12歳以上の通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした第Ⅲ相二重盲検比較試験の結果、医師評価による2週間投与後の4鼻症状スコアの合計のベースラインからの変化量において、デスロラタジン5mgの1日1回投与は、プラセボの1日1回投与に対して優越性を示さなかった。

副作用は認められなかった¹⁴⁾。

〈蕁麻疹〉

17.1.2 国内第Ⅲ相試験

12歳以上の慢性蕁麻疹患者を対象とした第Ⅲ相二重盲検比較試験の結果、医師評価による2週間投与後の痒みスコア(日中又は夜間の症状のうち程度の高い方)と発斑スコア(総合)の合計のベースラインからの変化量において、デスロラタジン5mgの1日1回投与は、プラセボの1日1回投与に対して優越性を示した($p < 0.001$)。

表2 医師評価による投与2週間後の痒みスコア及び発斑スコアの合計のベースラインからの変化量(FAS)

	デスロラタジン5mg群	プラセボ群
ベースライン	4.98±1.02 (80)	4.91±0.75 (80)
投与2週後	1.79±1.52 (80)	2.81±1.83 (72)
ベースラインからの変化量	-3.19±1.68 (80)	-2.07±1.83 (72)
プラセボ群との最小二乗平均差 [95%信頼区間] ^{a)} 、p値 ^{a)}	-1.17[-1.69, -0.65] p<0.001	

平均値±標準偏差(例数)

a) 時点、時点と投与群の交互作用、時点と年齢層(12歳以上20歳未満・20歳以上)の交互作用、時点と重症度(医師評価による痒みスコア及び発斑スコアの合計が4点・5点以上)の交互作用を説明変数とし、被験者内で無構造共分散構造を仮定し、ベースライン値を結果変数に含めた制約付き経時測定データ解析モデル

副作用は、80例中7例(8.8%)に認められた。主なものは、傾眠3例(3.8%)であった^{15,16)}。

(2) 安全性試験

〈皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒〉

17.1.3 国内第Ⅲ相試験

12歳以上の湿疹・皮膚炎及び皮膚そう痒症患者を対象とした第Ⅲ相長期投与試験の結果、デスロラタジン5mgを1日1回2週間投与後の医師評価による痒みスコア(日中の症状及び夜間の症状)の合計のベースラインからの変化量は表3のとおりであった。

表3 医師評価による投与2週間後の痒みスコアの合計のベースラインからの変化量(FAS)

	湿疹・皮膚炎群	皮膚そう痒症群	全体
ベースライン	4.75±1.10 (65)	5.10±1.47 (29)	4.86±1.23 (94)
投与2週後	3.06±1.33 (63)	2.93±1.69 (29)	3.02±1.44 (92)
ベースラインからの変化量	-1.67±1.32 (63)	-2.17±1.91 (29)	-1.83±1.54 (92)
変化量の最小二乗平均 [95%信頼区間] ^{a)}	-1.63 [-2.01, -1.25]	-2.17 [-2.74, -1.61]	-1.99 [-2.39, -1.59]

平均値±標準偏差(例数)

a) 疾患群、時点、時点と疾患群の交互作用を説明変数とし、被験者内で無構造共分散構造を仮定し、ベースライン値を結果変数に含めた経時測定データ解析モデル

副作用は、94例中8例(8.5%)に認められた。主なものは、傾眠4例(4.3%)であった^{17,18)}。

5) 患者・病態別試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

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

該当しない

7) その他

該当資料なし

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

抗ヒスタミン作用：

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベボタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩¹⁹⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、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

18.1 作用機序

デスロラタジンはロラタジンの活性代謝物であり、持続的なヒスタミンH₁受容体拮抗作用を有するアレルギー性疾患治療薬である¹⁾。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒスタミンH₁受容体拮抗作用

デスロラタジンはヒトヒスタミンH₁受容体に対して親和性を示し²⁰⁾、モルモット摘出回腸のヒスタミン収縮を抑制した²¹⁾ (*in vitro*)。デスロラタジンは経口又は局所投与によりヒスタミン拮抗作用を示し、マウスのヒスタミン誘発足蹠浮腫、モルモットのヒスタミン誘発致死及びヒスタミン誘発鼻腔内色素漏出反応、並びにカニクイザルのヒスタミン誘発気道収縮を抑制した²¹⁾ (*in vivo*)。デスロラタジンは経口投与後24時間にわたって、モルモットのヒスタミン誘発致死防御作用を示した²¹⁾ (*in vivo*)。

18.3 炎症性サイトカイン等の産生抑制作用

デスロラタジンはヒト肥満細胞又は好塩基球からの各種刺激によるインターロイキン(IL)-4、IL-6、IL-8及びIL-13の産生を抑制した^{22,23)} (*in vitro*)。デスロラタジンはヒト血管内皮細胞のヒスタミンによる接着因子(P-セレクチン)の発現、並びにIL-6及びIL-8の産生を抑制した²⁴⁾ (*in vitro*)。

3) 作用発現時間・持続時間

VI. -2. -2) 参照

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

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男性にデスロラタジン錠2.5、5及び10mg^{注1)}を空腹時単回経口投与したとき、血漿中デスロラタジン濃度は以下の表に示したとおりであり、 C_{max} 及びAUCについて用量比例性が認められた²⁵⁾。

表1 デスロラタジン錠を空腹時単回経口投与したときの薬物動態パラメータ

用量	例数	T_{max}^{\dagger} (hr)	C_{max}^{\ddagger} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}^{\ddagger}$ (ng・hr/mL)	$t_{1/2}^{\ddagger}$ (hr)
2.5mg	8	2.50[1-4]	1.46(24)	20.1(29)	19.7(11)
5mg	8	1.75[0.5-3]	3.55(37)	43.1(37)	19.5(18)
10mg	8	1.50[1-2.5]	6.95(14)	84.8(26)	18.5(18)

[†] 中央値[最小値-最大値]

[‡] 幾何平均(%CV)

16.1.2 反復投与

健康成人男性(8例)にデスロラタジン錠5mgを空腹時に1日1回10日間反復経口投与したとき、血漿中デスロラタジン濃度は投与開始後5日目までに定常状態に到達し、 C_{max} 及び AUC_{0-24hr} について算出した累積係数はそれぞれ1.30及び1.47であった²⁵⁾。

表2 デスロラタジン錠を空腹時1日1回10日間反復投与したときの定常状態時の薬物動態パラメータ

用量	例数	T_{max}^{\dagger} (hr)	C_{max}^{\ddagger} (ng/mL)	AUC_{0-24hr}^{\ddagger} (ng・hr/mL)	$t_{1/2}^{\ddagger}$ (hr)
5mg	8	2.00[1-4]	4.21(32)	47.4(42)	22.7(19)

[†] 中央値[最小値-最大値]

[‡] 幾何平均(%CV)

注1) 本剤の承認された用量は、1日1回5mgである。

<生物学的同等性試験>^{26, 27)}

目的

デスロラタジン錠5mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

方法

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(令和2年3月19日 薬生薬審発0319第1号以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、デスロラタジン錠5mg「サワイ」とデザレックス錠5mgをそれぞれ1錠(デスロラタジンとして5mg)健康成人男性に絶食下单回経口投与し、血漿中デスロラタジン濃度を測定する。

VII. 薬物動態に関する項目

採血時点	0、0.17、0.33、0.5、0.75、1、1.5、2、2.5、3、4、5、6、8、12、24、48、72hr
休薬期間	14日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	デスロラタジン錠 5mg「サワイ」(ロット番号:814T1S5021)
標準製剤	デザレックス錠 5mg(ロット番号:W027132)

評価

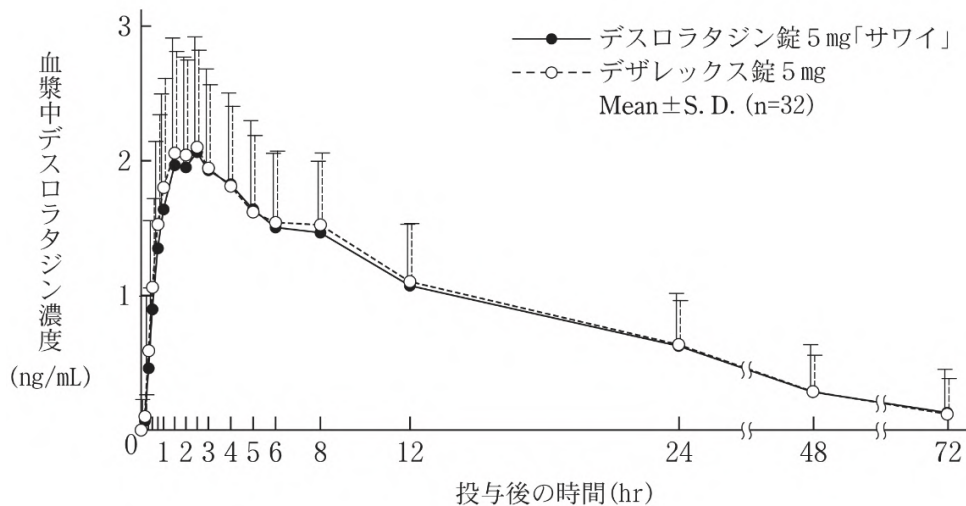
ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUCtおよびCmaxの対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれ $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

結果

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-72hr} (ng・hr/mL)
デスロラタジン錠 5mg 「サワイ」	2.25 ± 0.90	2.9 ± 2.3	21.6 ± 19.4	44.07 ± 25.53
デザレックス錠 5mg	2.27 ± 0.69	2.5 ± 2.1	21.6 ± 20.2	44.91 ± 21.12

(Mean ± S.D., n=32)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-72hr}	$\log(0.95)$	$\log(0.91) \sim \log(1.00)$
Cmax	$\log(0.96)$	$\log(0.90) \sim \log(1.02)$

血漿中濃度ならびにAUCt、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。

結論

得られた薬物動態パラメータ (AUCt、Cmax) の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準である $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

3) 中毒域

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

4) 食事・併用薬の影響

16.2.1 食事の影響

健康成人(24例)にデスロラタジン錠5mgを食後(高脂肪高カロリー食)に単回経口投与したとき、血漿中デスロラタジン及び3-OHデスロラタジン濃度(C_{max} 及びAUC)への影響はいずれも認められなかった²⁸⁾(外国人データ)。

表4 デスロラタジンの薬物動態に及ぼす食事の影響(幾何平均比及び90%信頼区間、外国人)

比較	例数	デスロラタジン		3-OHデスロラタジン	
		C_{max}	AUC _{0-∞}	C_{max}	AUC _{0-∞}
食事の影響 (食後/空腹時)	24	1.08 [0.96-1.20]	1.07 [0.97-1.19]	0.98 [0.88-1.09]	0.98 [0.90-1.07]

16.7 薬物相互作用

健康成人を対象として、CYP3A4の阻害剤(ケトコナゾール^{注2)}、エリスロマイシン、アジスロマイシン)、CYP2D6の阻害剤(フルオキセチン)又はCYP3A4及び2D6の阻害剤(シメチジン)とデスロラタジン錠5mg又は7.5mg^{注1)}を反復併用投与したとき、血漿中デスロラタジン及び3-OHデスロラタジン濃度の変化率は下表に示すとおりであり²⁹⁾、いずれの併用においてもQTc間隔を含め心電図への影響は認められなかった³⁰⁾(外国人データ)。^[10.2参照]

表7 デスロラタジンの薬物動態に及ぼす他剤の影響(幾何平均比及び90%信頼区間、外国人)

併用薬	例数	デスロラタジン		3-OHデスロラタジン	
		C_{max}	AUC _{0-24hr}	C_{max}	AUC _{0-24hr}
ケトコナゾール [†] 200mg 1日2回	24	1.29 [1.06-1.56]	1.21 [1.01-1.45]	1.77 [1.27-2.47]	2.10 [1.63-2.70]
ケトコナゾール [‡] 400mg 1日1回	30	1.56 [1.43-1.70]	1.67 [1.56-1.80]	1.59 [1.48-1.71]	1.68 [1.58-1.78]
エリスロマイシン [†] 500mg 1日3回	24	1.24 [1.17-1.31]	1.14 [1.08-1.19]	1.43 [1.39-1.48]	1.40 [1.34-1.46]
アジスロマイシン [‡] 500mg単回(初日) +250mg 1日1回	18	1.15 [0.92-1.44]	1.05 [0.82-1.34]	1.15 [0.98-1.36]	1.04 [0.88-1.22]
フルオキセチン [‡] 20mg 1日1回	18	1.15 [0.95-1.39]	1.00 [0.82-1.23]	1.17 [1.00-1.36]	1.13 [0.96-1.32]
シメチジン [‡] 600mg 1日2回	18	1.12 [0.86-1.45]	1.19 [0.88-1.61]	0.89 [0.73-1.07]	0.97 [0.81-1.16]

デスロラタジンの投与量：[†]7.5mg 1日1回、[‡]5mg 1日1回

注1)本剤の承認された用量は、1日1回5mgである。

注2)国内では外用剤のみ発売

VIII. -7. 参照

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

デスロラタジン錠 5 mg「サワイ」を健康成人男性に 1 錠(デスロラタジンとして 5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{26, 27)}

0.039±0.010hr⁻¹

4) クリアランス

該当資料なし

5) 分布容積

VII. -5. 参照

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

該当資料なし

5. 分布

16.3 分布

16.3.1 分布容積

健康成人にデスロラタジン錠 5 mgを単回経口投与したときの見かけの分布容積は約 3,300Lであった³¹⁾。

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

VIII. -6. -5)参照

VII. 薬物動態に関する項目

3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 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

6) 血漿蛋白結合率

16.3.2 血漿蛋白結合

ヒト血漿に¹⁴C-デスロラタジンを添加したときの蛋白結合率は82.8%~87.2%であった³²⁾ (*in vitro*)。

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

ヒトに経口投与したとき、デスロラタジンは主に3-OHデスロラタジンに代謝されたのち、グルクロン酸抱合体へと代謝される³³⁾ (外国人データ)。

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

該当資料なし

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比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人男性(5例)に¹⁴C-デスロラタジン10mg^{注1)}を空腹時に単回経口投与したとき、投与放射能の87.1%が代謝物として尿(40.6%)及び糞(46.5%)中に排泄された。未変化体の尿中及び糞中への排泄率はそれぞれ1.7%及び6.7%であった³³⁾ (外国人データ)。

注1) 本剤の承認された用量は、1日1回5mg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

VIII. -10. 参照

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

軽度[クレアチニンクリアランス (CL_{Cr}) : 51~80mL/min/1.73m²、6例]、中等度 (CL_{Cr} : 30~50mL/min/1.73m²、6例) 又は重度 (CL_{Cr} : 10~29mL/min/1.73m²、6例) の慢性腎機能障害患者にデスロラタジン錠 5 mg を反復経口投与したとき、健康成人 (CL_{Cr} : >80mL/min/1.73m²、9例) と比較して C_{max} 及び AUC_{0-24hr} は軽度~中等度腎機能障害患者で約1.3~2.1倍、重度腎機能障害患者で約2.6倍に、それぞれ上昇した³⁴⁾ (外国人データ)。
[9.2参照]

表5 腎機能障害患者におけるデスロラタジン錠 1日1回14日間反復投与したときの定常状態時の薬物動態パラメータ (外国人)

腎機能障害	例数	T _{max} [†] (hr)	C _{max} [‡] (ng/mL)	AUC _{0-24hr} [‡] (ng・hr/mL)
軽度	6	3.50 [1.5-5]	4.33 (21)	59.9 (28)
中等度	6	3.00 [1.5-12]	6.11 (73)	95.8 (104)
重度	6	1.75 [1.5-5]	7.61 (70)	120 (89)
正常	9	3.00 [1.5-8]	2.96 (50)	45.5 (61)

† 中央値 [最小値-最大値]

‡ 幾何平均 (%CV)

16.6.2 肝機能障害患者

軽度 (Child-Pughスコア : 5~6)、中等度 (Child-Pughスコア : 7~9) 又は重度 (Child-Pughスコア : 10~15) の慢性肝機能障害患者 (各4例) 及び健康成人 (8例) にデスロラタジン錠 7.5mg^{注1)} を空腹時に単回経口投与したとき、血漿中デスロラタジン濃度の薬物動態パラメータは以下の表に示したとおりであった。肝機能障害患者の C_{max} 及び AUC は、健康成人と比較してそれぞれ約1.8~2.2倍及び約2.0~2.9倍に上昇した³⁵⁾ (外国人データ)。
[9.3参照]

表6 肝機能障害患者におけるデスロラタジン錠単回投与時の薬物動態パラメータ (外国人)

肝機能障害	例数	T _{max} [†] (hr)	C _{max} [‡] (ng/mL)	AUC _{0-∞} [‡] (ng・hr/mL)	t _{1/2} [‡] (hr)
軽度	4	6.75 [1-24]	5.07 (19)	312 (110)	68.7 (63)
中等度	4	1.75 [1-2]	6.48 (52)	245 (19)	60.3 (10)
重度	4	1.75 [1-5]	5.90 (40)	345 (55)	62.3 (27)
正常	8	5.00 [4-8]	2.89 (23)	120 (123)	43.4 (80)

† 中央値 [最小値-最大値]

‡ 幾何平均 (%CV)

16.6.3 高齢者

高齢者 (17例、年齢 : 65~70歳) にデスロラタジン錠 5 mg を 1日1回10日間反復経口投与したとき、血漿中デスロラタジン濃度の C_{max} 及び AUC は、非高齢対照 (95例、年齢 : 19~64歳) と比較していずれも約20%上昇した。高齢者でのデスロラタジンの t_{1/2} は平均31.0時間 (幾何平均) であり、非高齢対照群と比較して約30%延長した³⁶⁾ (外国人データ)。

注1) 本剤の承認された用量は、1日1回5mg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 本剤の成分又はロラタジン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……………
設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………
設定されていない

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。

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。発作があらわれることがある。[11. 1. 2参照]

2) 腎機能障害患者

- 9.2 腎機能障害患者
デスロラタジン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
デス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、投与を避けることが望ましい。本剤の動物試験(ラット、ウサギ)で催奇形性は認められていないが、ロラタジン投与したラットの試験でデスロラタジンの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。ロラタジンの臨床試験で、デスロラタジンのヒト母乳中への移行が報告されている³⁷⁾。

7) 小児等

9.7 小児等

国内において、低出生体重児、新生児、乳児、幼児及び12歳未満の小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

一般に生理機能が低下している。

7. 相互作用

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 ケトコナゾール [16.7参照]	デスロラタジン及び3-OHデスロラタジンの血漿中濃度の上昇が認められた。	機序不明

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)

ショック、アナフィラキシー(チアノーゼ、呼吸困難、血圧低下、血管浮腫等)があらわれることがある。

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)

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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		
	2%未満	頻度不明
神経系障害	傾眠	頭痛、精神運動亢進
心臓障害		頻脈、動悸
胃腸障害		口内乾燥
皮膚及び皮下組織障害		発疹
一般・全身障害及び投与部位の状態		疲労
その他	白血球数増加、血中コレステロール増加	食欲亢進

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日前から本剤の投与を中止すること。

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 処置

本剤は血液透析によって除去できない。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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。

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」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
VIII. -6. -5) 参照
 - 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

規制区分	
製剤	処方箋医薬品 ^{注)}
有効成分	劇薬

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

有効期間：3年

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

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分：デザレックス錠 5mg

同効薬：抗ヒスタミン作用

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメタジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩¹⁹⁾

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

製品名	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
デスロラタジン錠 5mg 「サワイ」	2026年 2月 16日	30800AMX00017000	2026年 6月 12日	2026年 6月 12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
 該当しない

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(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

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番号	レセプト電算処理システ ム用コード
4490032F1040	4490032F1040	130136601	623013601

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)作用機序(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.6.1)
- 2)沢井製薬(株)社内資料[安定性試験] デスロラタジン錠5mg「サワイ」
- 3)沢井製薬(株)社内資料[無包装下の安定性試験] デスロラタジン錠5mg「サワイ」
- 4)沢井製薬(株)社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] デスロラタジン錠5mg「サワイ」
- 5)沢井製薬(株)社内資料[溶出試験] デスロラタジン錠5mg「サワイ」
- 6)眠気及び運転・機械操作能力に対する影響(デザレックス錠：2016年9月28日承認、審査報告書)
- 7)日中の傾眠及び精神運動機能への影響評価試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 8)睡眠潜時反復検査(MSLT)評価試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 9)操縦能力への影響評価試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 10)自動車運転能力への影響評価試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 11)高用量心電図試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 12)国内第Ⅲ相試験(季節性アレルギー性鼻炎)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.6.3)
- 13)国内第Ⅲ相試験(季節性アレルギー性鼻炎)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、審査報告書)
- 14)国内第Ⅲ相試験(通年性アレルギー性鼻炎)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.6.3)
- 15)国内第Ⅲ相試験(蕁麻疹)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.6.3)
- 16)国内第Ⅲ相試験(蕁麻疹)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、審査報告書)
- 17)国内第Ⅲ相試験(皮膚疾患に伴うそう痒)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.6.4)
- 18)国内第Ⅲ相試験(皮膚疾患に伴うそう痒)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、審査報告書)
- 19)薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2026/6/12 アクセス)
- 20)Anthes, J. C. et al. : Eur. J. Pharmacol., 2002 ; 449 : 229-237
- 21)Kreutner, W. et al. : Arzneimittelforschung, 2000 ; 50 : 345-352
- 22)Lippert, U. et al. : Exp. Dermatol., 1995 ; 4 : 272-276
- 23)Schroeder, J. T. et al. : Clin. Exp. Allergy, 2001 ; 31 : 1369-1377
- 24)Molet, S. et al. : Clin. Exp. Allergy, 1997 ; 27 : 1167-1174
- 25)日本人での単回及び反復投与試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 26)土田竜平他, 診療と新薬, 63(3), 137(2026)
- 27)沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験] デスロラタジン錠5mg「サワイ」
- 28)食事の影響(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.1.2)
- 29)薬物相互作用試験(薬物動態)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2)
- 30)薬物相互作用試験(薬力学)(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.6.2)

- 31) 分布容積(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.3, 2.7.6.2)
- 32) 血漿蛋白結合(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.6.4.4)
- 33) マスバランス試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.6.5.8, 2.7.2.2)
- 34) 腎機能障害による影響(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 35) 肝機能障害による影響(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 36) 高齢者を含む健康成人を対象とした試験(デザレックス錠：2016年9月28日承認、申請資料概要2.7.2.2, 2.7.6.2)
- 37) Hilbert, J. et al. : J. Clin. Pharmacol., 1988 ; 28 : 234-239
- 38) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] デスロラタジン錠 5mg「サワイ」
- 39) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] デスロラタジン錠 5mg「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報.....
 該当資料なし

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。

1) 粉砕

<粉砕後の安定性試験>³⁸⁾

目的

本製剤の粉砕後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を粉砕し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{B)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
814T1S5021	室温	25°C/60%RH、遮光、開放シャーレ*
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx)、開放シャーレ*

*：通気性を確保し飛散しないようにポリ塩化ビニリデン製フィルムで覆う

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・純度試験(類縁物質)・定量試験	1回
純度試験(N-ニトロソデスロラタジン [†])	3回

†：ニトロソアミン原薬関連不純物(NDSRI)

B) 評価分類基準

試験項目	分類	評価基準
性状	変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
	変化あり	形状変化や色調変化が認められる場合
定量試験	変化なし	含量低下が3%未満の場合
	変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
	変化あり(規格外)	規格値外の場合
その他の試験項目	変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
	変化あり(規格外)	規格値外の場合

結果

試験項目 保存条件・期間		性状	純度試験		定量試験※
			類縁物質	N-ニトロソ デスロラタジン	
イニシャル		(a)	適合	適合	100.0
室温	5週	変化なし	変化なし	—	変化なし 100.8
	13週	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし 101.7
光	10万lx・h	変化なし	変化なし	—	変化なし 101.1
	30万lx・h	変化なし	変化なし	—	変化なし 99.9
	60万lx・h	変化あり (b)	変化なし	変化なし	変化なし 99.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)
 (a)：うすい赤色のフィルム片を含む白色の粉末
 —：実施なし
 (b)：うすい赤色のフィルム片を含むごくうすい黄色の粉末

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

<崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>³⁹⁾

目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、試験を実施する。

方法

1. 本製剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、お湯(約55℃)20mLを吸い取る。
2. 5分間放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を観察する。崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返す。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液をチューブに注入し、水20mLでフラッシュ後、通過状態を観察する。

使用器具

シリンジ：テルフィードEDシリンジ 20mL
 チューブ：ジェイフィード栄養カテーテル(DEHPフリー)
 [120cm、8Fr.(外径2.7mm)]

ロット番号	814T1S5023
試験回数	1回

結果

崩壊・懸濁状態	5分後 懸濁液となったが、試料の一部は沈殿した。
チューブ通過性	通過したが、シリンジに付着が認められた。
チューブ通過液のpH	約9.6

2. その他の関連資料

患者向け資料

- ・デスロラタジン錠5mg「サワイ」を服用される方へ
- ・花粉症のセルフケアと治療法

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

