

○クラリチン錠, ○ロラタジンOD錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ロラタジン (U) Loratadine 【分類】抗ヒスタミン薬

【単位】◎10mg/錠

【常用量】10mg/日

【用法】1日1回食後(1) [朝食後でもよい]

【透析患者への投与方法】常用量(5) 活性代謝物を含め透析性もなく、半減期も延長しない (Matzke GR, et al: J Clin Pharmacol 1990 PMID: 2140371)

【その他の報告】消失半減期は延長しないが、AUCが増加するため、10mgを48hr毎(12)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要はないが、未変化体および活性代謝物の血中濃度が上昇するおそれがあるため慎重投与(1)

【その他の報告】GFR10~50mL/min: 10mgを24~48hr毎(12)

【特徴】持続性の選択的H1受容体拮抗剤。鎮静作用は少なく、QTc延長等は認められない。眠気を催しにくいため朝食後投与も選択できる。

【主な副作用・毒性】ショック、アナフィラキシー、血管浮腫、眠気、倦怠感、頭痛、口渇、口内炎、悪心・嘔吐、肝障害、過敏症、てんかん発作、痙攣など

【吸収】ほぼ完全に吸収される(11) 吸収部位は小腸で、空腹時投与と比較して食後投与では約2倍のAUCの上昇が認められている(1) 食後投与で40%の吸収増加(U)

【F】不明であるがCYP3Aにより初回通過効果を受けるため、おそらく低くであろう(13) 初回通過効果を受け低い(1)

【tmax】未変化体1.2~1.6hr, DCL1.7~2.3hr(1) 1hr, 活性代謝物DCL2.4hr(11) 2hr, 活性代謝物DCL2.6hr(13) 1.3hr(U) 透析患者で1.1hr (Matzke GR, et al. J Clin Pharmacol 1990 PMID: 2140371)

【Cmax】10mg/日を7日間投与したときのCmaxは未変化体3.4ng/mL, 活性代謝物4.1ng/mL, 加齢により上昇する(13)

【代謝】小腸又は肝臓において速やかに活性代謝物DCL (descarboethoxyloratadine) へと代謝された後、3位、5位又は6位水酸化体に代謝され、グルクロン酸抱合体となる(1)肝でCYP3A4によって急速に活性代謝物DCLへ代謝されるが、阻害剤を併用すると2D6でも代謝される(11)小腸または肝臓で代謝される。CYP3A4, 2D6による代謝を受ける(12) 代謝は主にCYP3A4が関与するが、3A4阻害剤の存在下では同様の反応が2D6によって触媒される(1) CYP2C8による3-水酸化体の生成にはUGT2B10によるグルクロン酸抱合を要する (Kazmi F, et al: Drug Metab Dispos 2015 PMID: 25595597)

【排泄】未変化体としての尿中排出はほとんど認められない(1) DCLとしての尿中回収率2%未満(1) 代謝物として尿中、糞便中に同程度の割合で投与量の80%が排泄される(U) 投与後24hrまでの活性代謝物DCL (descarboethoxyloratadine) 抱合体の尿中排泄率27%(11) 尿中未変化体排泄率は無視できるくらい低い(13)

【CL】未変化体として239mL/kg/min, 透析例で137mL/kg/min (Matzke GR, et al. J Clin Pharmacol 1990 PMID: 2140371) 401±275L/hr [po] (1) 142mL/min/kg, 肝硬変で低下(13) DCLとして249±59.1L/hr [po] (1)

【t1/2】■未変化体 8.4hr [3~20hr] (U) 10hr (11) 8~24hr (12) 8.7hr (Matzke GR, et al. J Clin Pharmacol 1990 PMID: 2140371) ■活性代謝物 DCL 28hr [8.8~92] hr (U) 18.2hr (11) 28hr (12) 8hr, 加齢・肝硬変で延長(13)

【透析患者のt1/2】腎機能正常者と同じ(12) ■未変化体 8.6hr (β1相) 12.9hr (β2相) (Matzke GR, et al. J Clin Pharmacol 1990 PMID: 2140371) ■活性代謝物 DCL 14.9hr (β1相) 21.1hr (β2相) (Matzke GR, et al. J Clin Pharmacol 1990 PMID: 2140371)

【蛋白結合率】96.8~97.9% (1) 97% (13,U) 活性代謝物のDCL 73~77% (U) 73~76% (1)

【Vd】119L/body, 透析患者 92L/body (Matzke GR, et al: J Clin Pharmacol 30: 364-71,1990)

【MW】382.89

【透析性】除去されない(11) 未変化体, DCLいずれも除去されない(1) ロラタジン0.087%で透析CLはロラタジン29.7mL/min, DCL29.9mL/min (Matzke GR, et al. J Clin Pharmacol 1990 PMID: 2140371)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない【pKa】5.2【O/W係数】12000 [1-オクタノール/水系, pH7.0] (1)

【相互作用】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 [活性代謝物の血漿中濃度が上昇する機序は不明] (1)

【更新日】20241001

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。