2026年7月改訂（第12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2018（2019年更新版）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

デスロラタジン錠

デザレックス®錠5mg

DESALEX® Tablets 5mg

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：注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1錠中にデスロラタジンとして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・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日　：2016年9月28日 薬価基準収載年月日　：2016年11月18日 販売開始年月日　：2016年11月18日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元　：オルガノン株式会社 発売元　：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	杏林製薬株式会社　くすり情報センター TEL　0120-409-341 受付時間：9:00～17:30（土・日・祝日・会社休日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.kyorin-pharm.co.jp/prodinfo/

本ＩＦは2026年7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。

(01)14987060008418

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－

（2020 年 4 月改訂）

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（https://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、「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。

目　次

Ⅰ. 概要に関する項目 1

1．開発の経緯 1
2．製品の治療学的特性 1
3．製品の製剤学的特性 2
4．適正使用に関して周知すべき特性 2
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項 2
(1)承認条件 2
(2)流通・使用上の制限事項 2
6．ＲＭＰの概要 3

Ⅱ. 名称に関する項目 4

1．販売名 4
(1)和名 4
(2)洋名 4
(3)名称の由来 4
2．一般名 4
(1)和名(命名法) 4
(2)洋名(命名法) 4
(3)ステム(stem) 4
3．構造式又は示性式 4
4．分子式及び分子量 4
5．化学名(命名法)又は本質 4
6．慣用名、別名、略号、記号番号 4

Ⅲ. 有効成分に関する項目 5

1．物理化学的性質 5
(1)外観・性状 5
(2)溶解性 5
(3)吸湿性 5
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点 5
(5)酸塩基解離定数 5
(6)分配係数 5
(7)その他の主な示性値 5
2．有効成分の各種条件下における安定性 6
3．有効成分の確認試験法、定量法 6

Ⅳ. 製剤に関する項目 7

1．剤形 7
(1)剤形の区別 7
(2)製剤の外観及び性状 7
(3)識別コード 7
(4)製剤の物性 7
(5)その他 7
2．製剤の組成 7
(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤 7
(2)電解質等の濃度 7
(3)熱量 7
3．添付溶解液の組成及び容量 7
4．力価 7
5．混入する可能性のある夾雑物 7
6．製剤の各種条件下における安定性 8
7．調製法及び溶解後の安定性 8
8．他剤との配合変化(物理化学的変化) 8
9．溶出性 8
10．容器・包装 8
(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 8
(2)包装 8
(3)予備容量 8
(4)容器の材質 8
11．別途提供される資材類 8
12．その他 8

Ⅴ. 治療に関する項目 9

1．効能又は効果 9
2．効能又は効果に関連する注意 9
3．用法及び用量 9
(1)用法及び用量の解説 9
(2)用法及び用量の設定経緯・根拠 9
4．用法及び用量に関連する注意 10
5．臨床成績 10
(1)臨床データパッケージ 10
(2)臨床薬理試験 11
(3)用量反応探索試験 13
(4)検証的試験 14
(5)患者・病態別試験 21
(6)治療的使用 21
(7)その他 23

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 25

1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 25
2．薬理作用 25
(1)作用部位・作用機序 25
(2)薬効を裏付ける試験成績 25
(3)作用発現時間・持続時間 32

Ⅶ. 薬物動態に関する項目 34

1．血中濃度の推移 34
(1)治療上有効な血中濃度 34
(2)臨床試験で確認された血中濃度 34
(3)中毒域 35
(4)食事・併用薬の影響 36
2．薬物速度論的パラメータ 37
(1)解析方法 37
(2)吸収速度定数 37
(3)消失速度定数 37
(4)クリアランス 37
(5)分布容積 37
(6)その他 38
3．母集団(ポピュレーション)解析 38
(1)解析方法 38
(2)パラメータ変動要因 38
4．吸収 38
5．分布 38
(1)血液－脳関門通過性 38
(2)血液－胎盤関門通過性 38
(3)乳汁への移行性 38
(4)髄液への移行性 38
(5)その他の組織への移行性 39

(6)血漿蛋白結合率.....39
6．代謝.....39
(1)代謝部位及び代謝経路.....39
(2)代謝に関与する酵素(ＣＹＰ等)の分子種、寄与率.....39
(3)初回通過効果の有無及びその割合.....39
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率.....40
7．排泄.....40
8．トランスポーターに関する情報.....40
9．透析等による除去率.....40
10. 特定の背景を有する患者.....40
11. その他.....42

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目.....43

1．警告内容とその理由.....43
2．禁忌内容とその理由.....43
3．効能又は効果に関連する注意とその理由.43
4．用法及び用量に関連する注意とその理由.43
5．重要な基本的注意とその理由.....43
6．特定の背景を有する患者に関する注意....44
(1)合併症・既往歴等のある患者.....44
(2)腎機能障害患者.....44
(3)肝機能障害患者.....44
(4)生殖能を有する者.....45
(5)妊婦.....45
(6)授乳婦.....45
(7)小児等.....45
(8)高齢者.....45
7．相互作用.....46
(1)併用禁忌とその理由.....46
(2)併用注意とその理由.....46
8．副作用.....47
(1)重大な副作用と初期症状.....47
(2)その他の副作用.....47
9．臨床検査結果に及ぼす影響.....49
10. 過量投与.....49
11. 適用上の注意.....49
12. その他の注意.....49
(1)臨床使用に基づく情報.....49
(2)非臨床試験に基づく情報.....49

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目.....50

1．薬理試験.....50
(1)薬効薬理試験.....50
(2)安全性薬理試験.....50
(3)その他の薬理試験.....52
2．毒性試験.....53
(1)単回投与毒性試験.....53
(2)反復投与毒性試験.....53
(3)遺伝毒性試験.....53
(4)がん原性試験.....54
(5)生殖発生毒性試験.....54
(6)局所刺激性試験.....55
(7)その他の特殊毒性.....55

Ⅹ. 管理的事項に関する項目.....56

1．規制区分.....56
2．有効期間.....56
3．包装状態での貯法.....56
4．取扱い上の注意.....56
5．患者向け資材.....56
6．同一成分・同効薬.....56
7．国際誕生年月日.....56
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.....56
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.....56
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....57
11. 再審査期間.....57
12. 投薬期間制限に関する情報.....57
13. 各種コード.....57
14. 保険給付上の注意.....57

ⅩⅠ. 文献.....58

1．引用文献.....58
2．その他の参考文献.....58

ⅩⅡ. 参考資料.....59

1．主な外国での発売状況.....59
2．海外における臨床支援情報.....60

ⅩⅢ. 備考.....63

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.....63
(1)粉砕.....63
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性.....63
2．その他の関連資料.....63

略　語　集

なし（個別に各項目において解説する。）

Ⅰ. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

デザレックス®錠5mgの有効成分であるデスロラタジンは、旧Schering-Plough Corporation （現Organon LLC, a subsidiary of Organon & Co., Inc., Jersey City, NJ., USA.）により創製、開発された非鎮静性で長時間作用型の第二世代抗ヒスタミン薬であり、既承認のロラタジンの主要活性代謝物である。
本剤は、海外では2001年1月に欧州で承認されて以降、米国、欧州をはじめとする国や地域で、通年性及び季節性アレルギー性鼻炎、慢性特発性蕁麻疹の症状緩和を適応として承認されている。
本邦での臨床開発は2012年に開始され、デスロラタジンが日本人患者においてもアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒に対する有効性、安全性及び忍容性を有することが確認され、2016年9月に「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」を効能又は効果として承認された。
同年11月に、MSD株式会社が製造販売元、杏林製薬株式会社が発売元、科研製薬株式会社がプロモーション提携として販売を開始した。
2021年6月2日に製造販売元が、MSD株式会社から、オルガノン株式会社へ承継された。
5692 例の使用成績調査（季節性アレルギー性鼻炎、通年性アレルギー性鼻炎、蕁麻疹・皮膚疾患に伴うそう痒）を実施し令和6年（2024年）12月20日に再審査申請を行った結果、令和7年（2025年）12月10日付通知より、薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの再審査結果を得た。
契約期間満了に伴い、2026年6月30日をもって、科研製薬株式会社とのコ・プロモーションを終了した。

2. 製品の治療学的特性

1. デスロラタジンは、ヒスタミンH_1受容体に高い親和性を示す（*in vitro*）。
（「Ⅵ. 2. (2)薬効を裏付ける試験成績」の項参照）

2. 国内第Ⅲ相二重盲検比較試験において、季節性アレルギー性鼻炎における鼻症状を改善した。
（「Ⅴ. 5. (4)検証的試験」の項参照）

3. 国内第Ⅲ相二重盲検比較試験において、慢性蕁麻疹、国内第Ⅲ相非盲検長期投与試験において、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎，皮膚そう痒症）に伴うそう痒を改善した。
（「Ⅴ. 5. (4)検証的試験」の項参照）

4. 1日1回経口投与で服用時間に関する規定はない。
（「Ⅴ. 3. 用法及び用量」及び「Ⅶ.1.(4)食事・併用薬の影響」参照）

5. 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. (1)重大な副作用と初期症状」の項参照）

4.効能又は効果
〇アレルギー性鼻炎
〇蕁麻疹
〇皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

6.用法及び用量
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。

３．製品の製剤学的特性

1. フィルムコーティング錠である。
（「Ⅳ．1．(1)剤形の区別」の項参照）

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、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
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 7 月 1 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

＜参考＞

本剤（承認日 2016 年 9 月 28 日）の「承認条件」として、医薬品リスク管理計画の策定と実施が付与されていたが、再審査において製造販売後における安全性及び有効性に関する検討、並びに追加の安全性監視活動及び追加のリスク最小化活動が適切に実施されたと当局に判断され、承認条件を継続すべきとの判断はなされなかったため 2026 年 1 月に電子添文の承認条件の記載が削除された。削除前の RMP を以下に示す。

なお、承認条件が解除されるまでの過程でどのような議論が行われたのかを理解するため、再審査報告書も併せて確認すること。

医薬品リスク管理計画書（RMP）の概要

（再審査時）

安全性検討事項		
【重要な特定されたリスク】	【重要な潜在的リスク】	【重要な不足情報】
ショック、アナフィラキシー 肝機能障害、黄疸 痙攣、てんかん	なし	なし
有効性に関する検討事項		
・日常診療下での本剤の有効性		

↓上記に基づく安全性監視のための活動

医薬品安全性監視計画の概要
通常の医薬品安全性監視活動
追加の医薬品安全性監視活動 ・なし
有効性に関する調査･試験の計画の概要
・なし

↓上記に基づくリスク最小化のための活動

リスク最小化計画の概要
通常のリスク最小化活動
追加のリスク最小化活動 ・なし

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名
デザレックス®錠 5mg

(2) 洋名
DESALEX® Tablets 5mg

(3) 名称の由来
デスロラタジン（Desloratadine）を有効成分とし、アレルギー（Allergy）が関与する疾患の治療剤のため、デザレックス（DESALEX）と命名した。

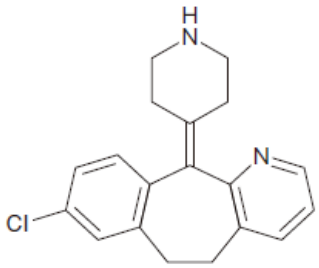
2. 一般名

(1) 和名(命名法)
デスロラタジン（ＪＡＮ）

(2) 洋名(命名法)
Desloratadine （ＪＡＮ)、desloratadine（ＩＮＮ）

(3) ステム(stem)
三環系ヒスタミンH_1受容体拮抗薬：-tadine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{19}H_{19}ClN_2$
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-5*H*-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-*b*]pyridine

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

会社又は研究所コード：SCH 34117、MK-4117

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1)外観・性状

本品は白色の粉末である。

(2)溶解性

1)各種溶媒における溶解度

メタノールに溶けやすく、2-プロパノールにやや溶けやすく、アセトンにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

表　デスロラタジンの各種溶媒における溶解性

溶　媒	溶解度（mg/mL）	日本薬局方の溶解度表記
メタノール	>400	溶けやすい
2-プロパノール	47.6	やや溶けやすい
アセトン	20.3	やや溶けにくい
水	0.10	ほとんど溶けない

2)各種 pH 溶媒に対する溶解度

表　デスロラタジンの各種 pH 条件下の溶解性

溶　媒	溶解度（mg/mL）†
0.1N 塩酸	39.7
0.05N 酢酸塩緩衝液（pH4.5）	26.2
0.05N リン酸塩緩衝液（pH6.8）	10.3
0.05N リン酸塩緩衝液（pH7.4）	1.5
水	0.1

†：成り行き温度

(3)吸湿性

デスロラタジンを室温（約 23℃）/97%RH に 2 週間保存した際の質量増加は 0.5%未満で、吸湿性は認められなかった。

(4)融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：約 156.5℃

(5)酸塩基解離定数

電位差滴定法（メタノール/水混液での結果を 100%水に外挿）により求めた pKa は 4.3 及び 9.7 で、それぞれピリジン及びピペリジンに由来するものであった。

(6)分配係数

n-オクタノール/リン酸塩緩衝液（pH7）の分配係数（log Ko/w）は、1.02 であった。

(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

試験区分		保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験		25℃、60%RH	60 ヵ月	二重の低密度ポリエチレン袋（袋と袋の間にシリカゲルを入れる）／金属容器	変化なし
加速試験		40℃、75%RH	12 ヵ月	二重の低密度ポリエチレン袋（袋と袋の間にシリカゲルを入れる）／金属容器	変化なし
苛酷試験	光	総照度として 120 万 lx・hr 以上及び総近紫外放射エネルギーとして 200W・h/m^2 以上		透明な石英製容器	わずかな変色が認められた。

測定項目：性状、定量、類縁物質、水分含量、溶状等

3．有効成分の確認試験法、定量法

1)確認試験法

本品につき、赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

2)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

フィルムコーティング錠である。

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	外　形			質　量	色調
	表　面	裏　面	側　面		
デザレックス®錠 5mg	 直径：6.4mm		 厚さ：3.0mm	約 107mg	うすい赤色

(3) 識別コード

表示部位：錠剤、PTP シート／表示内容：C5

(4) 製剤の物性

含量均一性試験：日局の判定基準に適合した。

(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

販売名	デザレックス®錠 5mg
有効成分	1 錠中　デスロラタジン　5mg
添加剤	リン酸水素カルシウム水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、 タルク、乳糖水和物、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 400、 三二酸化鉄、黒酸化鉄、カルナウバロウ、サラシミツロウ

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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

6. 製剤の各種条件下における安定性

試験の種類	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃ 60%RH	24 ヵ月	PTP	類縁物質及び水分の増加[注1)]が認められた。
中間的試験条件	30℃ 65%RH	24 ヵ月	PTP	類縁物質の増加[注2)]及び水分の増加[注1)]が認められた。
加速試験	40℃ 75%RH	6 ヵ月	PTP	類縁物質の増加[注3)]及び水分の増加[注1)]が認められた。
光安定性試験	総照度として 120 万 lx・hr 以上及び総近紫外放射エネルギーとして 200W・h/m^{2}以上		無包装	類縁物質の増加が認められた。
			PTP	類縁物質の増加が認められた。
			PTP/個装箱	対照群（アルミホイルで包んだ試料）と差なし

測定項目：性状、定量、類縁物質、溶出性、水分等

注 1)：保存期間中、変動は規格の範囲内

注 2)：12 ヵ月まで規格の範囲内

注 3)：1 ヵ月まで規格の範囲内

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(物理化学的変化)

該当資料なし

9. 溶出性

日局　溶出試験法　パドル法による。

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

該当しない

(2)包装

100 錠［10 錠（PTP）×10］

500 錠［10 錠（PTP）×50］(2025 年 12 月に販売中止を案内)

(3)予備容量

該当しない

(4)容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル（PVC）／ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム（PCTFE）及びアルミニウム箔

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

Ⅴ. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果
〇アレルギー性鼻炎
〇蕁麻疹
〇皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

［解説］
季節性アレルギー性鼻炎患者、慢性蕁麻疹患者、並びに湿疹・皮膚炎患者及び皮膚そう痒症患者を対象とした国内第Ⅲ相臨床試験において、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹及び皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒に対するデスロラタジン錠の有効性が確認されたことから、デスロラタジン錠の効能又は効果として「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」を設定した。
（「Ⅴ．5. (4)検証的試験」の項参照）

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

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。

(1) 用法及び用量の解説

デスロラタジンの薬物動態に対する食事の影響は認められなかったことから、食事の有無に関係なく投与することが可能であることが支持された。また、このことは、食事の制限を設けずに実施した複数の第Ⅲ相試験で得られた結果によって裏付けられた。
以上のことから、服用時間の規定は設けず、「1 回 5mg を 1 日 1 回経口投与する」とした。
（「Ⅶ.1.(4)食事・併用薬の影響」の項を参照）

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

・薬物動態の観点から
デスロラタジンは、ロラタジンの主要活性代謝物である。
日本人健康成人にデスロラタジン錠 5mg を単回経口投与した際のデスロラタジンの曝露量は、ロラタジン 10mg（承認用量）を単回経口投与した際のデスロラタジンの曝露量と同程度であることが示されている。この結果は、外国人健康成人で得られた試験結果と一貫していた。
また、日本人健康成人に、デスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 10 日間反復経口投与した際の血漿中デスロラタジン濃度の最高血漿中濃度到達時間（T_{max}、中央値）は投与後 2 時間で、見かけの消失半減期（$t_{1/2}$、幾何平均）は 22.7 時間であり、1 日 1 回投与が可能であることが示されている。
なお、デスロラタジン錠 5mg を単回及び反復投与時の日本人及び外国人健康成人の薬物動態は類似していた。外国人健康成人にデスロラタジン錠 5mg を食後（高脂肪カロリー食）に単回投与したとき、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）への影響は認められなかった。
・有効性の観点から
日本人患者（12 歳以上の小児及び成人）を対象に実施した第Ⅲ相臨床試験において、デスロラタジン錠 5mg 1 日 1 回投与の、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、及び皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒に対する有効性が示されたことから、有効性の面からはデスロラタジン錠の至適用量は 5mg を 1 日 1 回投与と考えられた。
・安全性の観点から
国内外の臨床試験において、デスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回経口投与した際の安全性はプラセボを投与した際の安全性と類似しており、さらに 2001 年の海外での販売開始以降に蓄積された市販後使用経験においてもデスロラタジン錠 5mg の 1 日 1 回投与は良好な安全性プロファイルが示されていることから、安全性の面から

は日本人患者におけるデスロラタジン錠の 5mg 1 日 1 回投与の忍容性は良好と考えられた。

これらの結果から、デスロラタジン錠の用法及び用量として「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。」を設定した。

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

Phase	試験内容	試験番号 (実施地域)	試験 デザイン	対象	評価資料/ 参考資料
第Ⅰ相	食事の影響試験（7.5mg）	C98-215(海外)	非盲検	健康成人	○
	食事の影響試験（5mg）	P01379(海外)	非盲検	健康成人	○
	バイオアベイラビリティ試験	P00311(海外)	非盲検	健康成人	○
	単回・反復投与試験	P191(国内)	非盲検	健康成人	◎
	用量漸増単回投与試験	I97-248(海外)	二重盲検	健康成人	○
	用量漸増反復投与試験	C98-013(海外)	二重盲検	健康成人	○
	単回投与試験	C98-214(海外)	非盲検	健康成人	○
	反復投与試験	P00117(海外)	非盲検	健康成人	○
	マスバランス試験	C98-097(海外)	非盲検	健康成人	○
	反復投与試験（性別及び人種）	C98-356(海外)	非盲検	健康成人	○
	反復投与試験（成人及び高齢者）	P00275(海外)	非盲検	健康成人	○
	単回投与試験（小児及び成人）	P01228(海外)	非盲検	健康な小児及び成人	○
	単回投与試験（肝機能障害）	C98-354(海外)	非盲検	健康成人及び 肝機能障害患者	○
	反復投与試験（中等度肝機能障害）	P00272(海外)	非盲検	健康成人及び 肝機能障害患者	○
	単回投与試験（腎機能障害）	C98-355(海外)	非盲検	健康成人及び 腎機能障害患者	○
	反復投与試験（腎機能障害）	P03312(海外)	非盲検	健康成人及び 腎機能障害患者	○
	ケトコナゾール相互作用試験（7.5mg）	C98-352(海外)	第三者盲検	健康成人	○
	ケトコナゾール相互作用試験（5mg）	P01429(海外)	非盲検	健康成人	○
	エリスロマイシン相互作用試験	C98-353(海外)	第三者盲検	健康成人	○
	アジスロマイシン相互作用試験	P01381(海外)	第三者盲検	健康成人	○
	フルオキセチン相互作用試験	P01378(海外)	第三者盲検	健康成人	○
	シメチジン相互作用試験	P01868(海外)	非盲検	健康成人	○
	グレープフルーツジュースの影響試験	P01380(海外)	非盲検	健康成人	○
	膨疹及び発赤反応抑制効果評価試験	P01196(海外)	第三者盲検	健康成人	○
	膨疹及び発赤反応抑制効果評価試験	P01426(海外)	非盲検	アレルギー症状を有する健康成人	○
	高用量心電図評価試験	C98-357(海外)	二重盲検	健康成人	○
第Ⅱ相	精神運動機能評価試験（日中傾眠）	C98-335(海外)	二重盲検	健康成人	○
	精神運動機能評価試験（睡眠潜時）	C98-606(海外)	二重盲検	健康成人	○
	精神運動機能評価試験（アルコール併用）	C98-551(海外)	二重盲検	健康成人	○
	精神運動機能評価試験（操縦能力）	P00090(海外)	二重盲検	健康成人	○
	精神運動機能評価試験（自動車運転能力）	I98-552(海外)	二重盲検	健康成人	○
第Ⅲ相	国内第Ⅲ相二重盲検プラセボ対照比較試験 （通年性アレルギー性鼻炎）	P200(国内)	二重盲検	通年性アレルギー性 鼻炎患者	◎
	国内第Ⅲ相二重盲検プラセボ対照比較試験 （季節性アレルギー性鼻炎）	P204(国内)	二重盲検	季節性アレルギー性 鼻炎患者	◎
	国内第Ⅲ相二重盲検プラセボ対照比較試験 （蕁麻疹）	P201(国内)	二重盲検	慢性蕁麻疹患者	◎
	国内第Ⅲ相非盲検非対照長期投与試験 （湿疹・皮膚炎及び皮膚そう痒症）	P202(国内)	非盲検	湿疹・皮膚炎及び 皮膚そう痒症患者	◎
第Ⅱ・ Ⅲ相	海外第Ⅱ相又は第Ⅲ相、実薬又はプラセボ対照、二重盲検比較、反復投与試験（29 試験）の併合解析	（海外）	二重盲検	各疾患患者	○
第Ⅳ相	海外第Ⅳ相二重盲検比較試験	P04849（海外）	二重盲検	慢性特発性蕁麻疹患者	○

◎：評価資料　　○：参考資料

(2)臨床薬理試験

1)膨疹及び発赤反応抑制作用（外国人）

アレルギー症状を有する成人男女 30 例にデスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 180 日間反復投与したとき、投与期間を通して、ヒスタミン及びアレルゲン誘発皮内反応（膨疹及び発赤）を抑制し、タキフィラキシーは認められなかった。

表　アレルギー症状を有する被験者にデスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 180 日間投与したときの 180 日目及び終了時のヒスタミン又はアレルゲン誘発性膨疹及び発赤面積のベースラインからの変化量

		ヒスタミン誘発性膨疹		ヒスタミン誘発性発赤	
来所	例数	算術平均†	95%信頼区間	算術平均†	95%信頼区間
ベースライン	30	51.13	(43.00, 59.27)	830.07	(716.83, 943.31)
180 日目	26	-20.96	(-31.70, -10.22)	-592.9	(-759.4, -426.4)
終了時 ‡	30	-19.37	(-28.84, -9.89)	-602.3	(-746.5, -458.1)
最小値 §	30	-38.50	(-46.60, -30.40)	-739.1	(-850.2, -628.1)
最大値 ‖	30	-4.17	(-14.49, 6.16)	-307.8	(-451.5, -164.0)
		アレルゲン誘発性膨疹		アレルゲン誘発性発赤	
ベースライン	30	26.97	(20.57, 33.36)	376.47	(291.42, 461.51)
180 日目	26	-9.46	(-17.64, -1.28)	-352.4	(-449.1, -255.8)
終了時 ‡	30	-8.53	(-15.62, -1.44)	-330.0	(-421.0, -238.9)
最小値 §	30	-20.00	(-25.98, -14.02)	-368.2	(-452.3, -284.1)
最大値 ‖	30	-0.63	(-8.13, 6.86)	-256.1	(-341.4, -170.8)

†面積の平均、mm^2

‡終了時は、ベースライン以降（1 日目の投与前から）に測定されたすべてのデータの最終観察データを示す。

§最小値は、投与後に測定されたすべてのデータの最小面積を示す。

‖最大値は、投与後に測定されたすべてのデータの最大面積を示す。

（P01426 試験）

2)眠気及び運転・機械操作能力に対する影響（外国人）

デスロラタジン錠服用後の眠気、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。

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）、デスロラタジン錠 7.5mg 単回投与時の日中の眠気［覚醒維持検査(MWT)スコア及び睡眠潜時反復検査(MSLT)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[1)、2)]。

表　健康成人にデスロラタジン錠 7.5mg 又はプラセボを単回投与したときの覚醒維持検査(MWT)スコアのベースラインからの変化量の平均値

評価時点	デスロラタジン(DL)錠 7.5mg			変化率の平均(%)	プラセボ(PL)			変化率の平均(%)	p 値‡
	例数	最小二乗平均†	変化量の最小二乗平均†		例数	最小二乗平均†	変化量の最小二乗平均†		DL/PL
ベースライン	19	20.02	—	—	19	19.82	—	—	—
2時間後	19	18.32	-1.70	-8.3	19	18.77	-1.05	-5.3	0.69
4時間後	19	19.46	-0.56	-2.5	19	18.85	-0.97	-4.9	0.78
6時間後	19	17.05	-2.97	-14.5	19	17.04	-2.78	-13.7	0.91
8時間後	19	18.69	-1.33	-6.6	19	19.72	-0.10	-0.4	0.31
10時間後	17	19.36	-0.63	-3.1	17	20.00	0.17	0.8	0.37
平均§	19	18.60	-1.42	-6.9	19	18.84	-0.97	-4.8	0.61

† 分散分析モデルに基づく最小二乗平均
‡ 分散分析モデルに基づく対比較
§ 各被験者の投与後2～10時間の平均値

表　健康成人に各薬剤又はプラセボを単回投与したときの睡眠潜時反復検査(MSLT)スコアの平均値及び比較

評価時点	デスロラタジン錠 7.5mg (A)	セチリジン 10mg (B)	ジフェンヒドラミン 50mg (C)	プラセボ (D)	p 値‡					
	最小二乗平均†				A/B	A/C	A/D	B/C	B/D	C/D
2時間後	681.46	601.73	386.36	540.91	0.38	<0.01	0.12	0.02	0.50	0.09
4時間後	767.92	584.81	375.22	721.15	0.05	<0.01	0.60	0.02	0.13	<0.01
6時間後	647.07	528.38	506.06	627.12	0.15	0.09	0.81	0.78	0.23	0.14
8時間後	576.21	511.97	559.01	690.08	0.42	0.83	0.15	0.55	0.03	0.10
10時間後	733.53	681.93	669.39	818.33	0.56	0.47	0.34	0.89	0.13	0.10
平均§	681.24	581.76	499.21	679.52	0.05	<0.01	0.97	0.11	0.06	<0.01

例数：22
† 分散分析モデルに基づく最小二乗平均
‡ 分散分析モデルに基づく対比較
§ 各被験者の投与後2～10時間の平均値

(C98-335 試験及び C98-606 試験)

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

②健康成人男女（23 例）を対象にアルコール併用又は非併用下で精神運動機能に及ぼす影響を検討したとき、アルコール併用の有無にかかわらず、デスロラタジン錠 7.5mg 単回投与時の精神運動機能はプラセボ投与時と有意差がなかった。

(C98-551 試験)

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

③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、デスロラタジン錠 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[3]。
（P00090 試験）

④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、デスロラタジン錠 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有意差がなかった[4]。

表　健康成人に各薬剤を単回投与したときの
標準高速道路運転テスト及び追従走行テストの平均値（標準誤差）

	デスロラタジン錠 5mg (A)	ジフェンヒドラミン 50mg(B)	プラセボ (C)	モデルに基づく標準誤差	p 値†		
					A vs B	A vs C	B vs C
例数	18	18	18				
側線からのずれの標準偏差（cm）	20.29 (1.14)	24.64 (1.25)	20.71 (1.10)	0.45	<0.001	0.510	<0.001
運転速度の標準偏差（km/h）	1.99 (0.11)	2.19 (0.10)	2.11 (0.11)	0.07	0.045	0.217	0.412
ブレーキ反応時間（msec）	473.72 (14.39)	541.22 (24.08)	512.06 (21.10)	12.19	0.001	0.033	0.100
先導車との距離‡（m）	21.93 (0.76)	22.14 (0.83)	22.14 (1.08)	0.71	0.878	0.900	0.977

† 分散分析モデルに基づく対比較
‡ デスロラタジン群：16 例、ジフェンヒドラミン群：17 例、プラセボ群：17 例

（I98-552 試験）

3)心血管系に及ぼす影響（外国人）

健康成人男女（24 例）にデスロラタジン錠 45mg（臨床用量の 9 倍）を 1 日 1 回 10 日間反復投与したとき、QTcB 間隔の最大値の変化量はプラセボと比較して統計的に有意な差は認められず、臨床的に意味のある心電図所見及び QTcB 間隔の延長は認められなかった[5]。

表　健康成人にデスロラタジン錠 45mg 又はプラセボを 1 日 1 回 10 日間反復投与したときの
心電図パラメータの最大値の変化量の比較

心電図パラメータ	変化量の算術平均 [(10 日目の最大値)-(-1 日目の最大値)]		群間比較の p 値	群間比較の 95%信頼区間
	デスロラタジン錠 45mg	プラセボ		
PR（msec）	2.3	6.2	0.10	-8.5～ 0.8
QRS（msec）	-0.7	0.0	0.63	-3.5～ 2.2
QT（msec）	-17.8	3.8	0.00	-32.3～ -11.0
QTcB（msec）	4.3	0.3	0.09	-0.6～ 8.7
心拍数（bpm）	13.6	4.2	0.00	3.7～ 15.1

例数：24
QTcB： Bazett の式を用いた心拍数で補正した QT 間隔

（C98-357 試験）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」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

①第Ⅲ相二重盲検比較試験：通年性アレルギー性鼻炎（P200 試験）

試験デザイン	多施設共同、無作為化、プラセボ対照、第Ⅲ相二重盲検試験
対象	12 歳以上の通年性アレルギー性鼻炎患者 608 例
主な登録基準	(1) 通年性アレルギー性鼻炎患者 (2) 患者本人又は代諾者が患者日記を欠かさず記載できる者 (3) 12 歳以上の男女 割付け時 (4) 直近 1 週間の症状が以下の基準をすべて満たす者 ・通年性アレルギー性鼻炎の重症度が中等症以上 ・4 鼻症状(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感)スコア合計が 4 点以上 (5) 通年性抗原(ダニ・ハウスダスト)に対するアレルギー性が確認された者
主な除外基準	(1) 下気道の呼吸器感染症を合併している者及び治療を要する程度と判断される鼻咽頭感染症(急性上気道炎、急性咽喉頭炎又は急性扁桃炎等)を合併している者 (2) 有効な抗菌剤の存在しない感染症又は全身性の真菌症を合併している者 (3) 気管支喘息を合併しており、治療中である者 (4) 鼻中隔潰瘍、鼻の手術、鼻外傷が治癒していない者 (5) 血管運動性鼻炎又は好酸球増多性鼻炎を合併している者 (6) 治験薬の効果判定に影響を及ぼすと考えられる鼻疾患を合併している者 (7) 抗ヒスタミン薬又は治験薬の成分に対し過敏症の既往のある者 割付け時 (8) 割付け前 7 日間に鼻症状に影響を及ぼす程度の疾患（急性上気道炎、急性咽喉頭炎又は急性扁桃炎等）を合併した者 (9) 特異的 IgE 抗体定量検査又は皮膚テストで、花粉を重複アレルゲンとして保持しており、かつ割付け前 7 日から治験薬投与終了までの間がその花粉の飛散期にあたる者
試験方法	1 週間の観察期間後、デスロラタジン錠 10mg 群、デスロラタジン錠 5mg 群又はプラセボ群の各群に 1：1：1 の比で無作為に割り付け、二重盲検下で 2 週間 1 日 1 回朝経口投与した。
評価項目	〈有効性〉 主要評価項目：投与 2 週後における治験責任（分担）医師の評価した 4 鼻症状(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感)スコア合計のベースラインからの変化量 副次評価項目：投与 3 日、1 週、2 週後の下記項目 ・ 各時点（2 週後以外）の治験責任（分担）医師の評価した 4 鼻症状スコア合計のベースラインからの変化量 ・ 各鼻症状スコア（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感の各スコア)、各鼻所見スコア（下鼻甲介粘膜の腫脹、下鼻甲介粘膜の色調、水様性分泌量の各スコア)、眼症状（そう痒感）スコア及び日常生活の支障度スコアのベースラインからの変化量 ・ 治験責任（分担）医師の評価した全般改善度（中等度改善以上の割合） ・ 患者日記による 4 鼻症状スコア合計、各鼻症状スコア、眼症状（そう痒感）スコア及び日常生活の支障度スコアのベースラインからの変化量 〈安全性〉 有害事象、臨床検査値

（P200 試験）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

結果	〈有効性〉 主要評価項目 投与 2 週後の治験責任（分担）医師の評価した 4 鼻症状スコア合計（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（最小二乗平均）は、デスロラタジン錠 10mg 群、5mg 群及びプラセボ群でそれぞれ-1.94、-1.96 及び-1.87 であった。また、投与 2 週後の治験責任（分担）医師の評価した 4 鼻症状スコア合計のベースラインからの変化量（最小二乗平均）のプラセボ群との差は、デスロラタジン錠 10mg 群では-0.08、5mg 群では-0.09 であり、デスロラタジン錠 10mg 群及び 5mg 群のいずれも、プラセボ群との間に統計的に有意な差は認められなかった。 副次評価項目 投与 3 日後における治験責任（分担）医師の評価した 4 鼻症状スコア合計のベースラインからの変化量（最小二乗平均）は、デスロラタジン錠 10mg 群及び 5mg 群ともに、プラセボ群と比較して統計的に有意な差が認められた（それぞれ p=0.013、p=0.010）が、投与 1 週後では、デスロラタジン錠 10mg 群及び 5mg 群のいずれも、プラセボ群との間に統計的に有意な差は認められなかった。投与 3 日、1 週及び 2 週後における治験責任（分担）医師の評価した各鼻症状スコア、各鼻所見スコア、眼症状（そう痒感）スコア、日常生活の支障度スコア、並びに患者日記の 4 鼻症状スコア合計、各鼻症状スコア、眼症状（そう痒感）スコア及び日常生活の支障度スコアのベースラインからの変化量（最小二乗平均）は、全般的に、主要評価項目［投与 2 週後の治験責任（分担）医師の評価した 4 鼻症状スコア合計のベースラインからの変化量］と類似した結果であった。また、治験責任（分担）医師の評価した全般改善度（中等度改善以上の割合）についても、デスロラタジン錠 10mg 群、5mg 群及びプラセボ群で同程度の改善率であった。 〈安全性〉 有害事象の発現率は、デスロラタジン錠 5mg 群 13.4%（27/202 例）、デスロラタジン錠 10mg 群 14.3%（29/203 例）及びプラセボ群 10.0%（20/201 例）であった。最も多く認められた有害事象は鼻咽頭炎で、デスロラタジン錠 5mg 群 5.4%（11/202 例）、デスロラタジン錠 10mg 群 8.4%（17/203 例）及びプラセボ群 4.5%（9/201 例）の発現率であった。 副作用の発現率は、デスロラタジン錠 5mg 群 0%（0/202 例）、デスロラタジン錠 10mg 群 3.0%（6/203 例）及びプラセボ群 1.0%（2/201 例）であった。最も多く認められた副作用は傾眠で、デスロラタジン錠 10mg 群のみに 1.5%（3/203 例）の発現率であった。 本試験では死亡例は認められなかった。その他の重篤な有害事象としてデスロラタジン錠 5mg 群の 1 例にてんかんが認められ、本症例は他院に入院したが、治験責任（分担）医師により治験薬との因果関係は否定された。 臨床検査値は、いずれの投与群でも臨床的に意味のある変化は認められなかった。
結論	・ 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、主要評価項目である投与 2 週後の治験責任（分担）医師の評価した 4 鼻症状スコア合計のベースラインからの変化量において、デスロラタジン錠 10mg 及び 5mg の 1 日 1 回投与のプラセボ 1 日 1 回投与に対する優越性は示されなかった。 ・ 副次評価項目においても、全般的に、主要評価項目の結果と類似していた。 ・ デスロラタジン錠 10mg 又は 5mg の 1 日 1 回 2 週間投与は安全で、良好な忍容性を示した。

（P200 試験）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

②第Ⅲ相二重盲検比較試験：季節性アレルギー性鼻炎（P204 試験）

試験デザイン	多施設共同、無作為化、プラセボ対照、第Ⅲ相二重盲検試験
対象	16 歳以上の季節性アレルギー性鼻炎患者 448 例
主な登録基準	(1) 過去 2 年以上、典型的な季節性アレルギー性鼻炎の症状を有する患者 (2) 患者日記を読み、理解し、かつ欠かさずに記載できる者 (3) 16 歳以上の男女 (4) 特異的 IgE 抗体定量検査で、スギ花粉に対するスコアが 2 以上 症状観察期開始時 (5) スギ花粉飛散後の来院前の連続 2 日間の症状が以下の基準をすべて満たす者 ・4 鼻症状(くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感)スコア合計が 1 日 7 点以上 ・鼻閉スコアが 1 日 1 点以下 割付け時 (6) 割付前の連続する 3 日間の症状が以下の基準をすべて満たす者 ・4 鼻症状スコア合計が 1 日 7 点以上 ・鼻閉スコアが 1 日 2 点以下 ・4 鼻症状のうち、3 日間連続でスコアが 4 点となる鼻症状が 2 症状以上ない
主な除外基準	(1) 下気道の呼吸器感染症を合併している者及び治療を要する程度と判断される鼻咽頭感染症(急性上気道炎、急性咽喉頭炎又は急性扁桃炎等)を合併している者 (2) 有効な抗菌剤の存在しない感染症又は全身性の真菌症を合併している者 (3) 喘息を合併しており、治療中である者又はコントロール不良の者 (4) 鼻中隔潰瘍、鼻の手術、鼻外傷が治癒していない者 (5) 血管運動性鼻炎又は好酸球増多性鼻炎を合併している者 (6) 治験薬の効果判定に影響を及ぼすと考えられる鼻疾患を合併している者 (7) 抗ヒスタミン薬又は治験薬の成分に対し過敏症の既往のある者 (8) 患者日記を適切に記載できない又は実施医療機関からの日記の記載確認に応答しない者
試験方法	1 週間の観察期間後、デスロラタジン錠 5mg 群又はプラセボ群の各群に 1：1 の比で無作為に割り付け、二重盲検下で 2 週間 1 日 1 回朝経口投与した。
評価項目	〈有効性〉 主要評価項目：投与 2 週間（治療期 2 週間の平均）における、患者日記による 4 鼻症状スコア合計のベースライン（治療期開始前 3 日間の平均）からの変化量 副次評価項目： ・投与 1 週時及び 2 週時（評価時点前 1 週間の平均）における、患者日記による 4 鼻症状スコア合計のベースラインからの変化量 ・投与 1 週時、2 週時及び 2 週間における患者日記による各鼻症状（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感）スコア、眼症状（眼のかゆみ、流涙、及び眼のかゆみ又は流涙のいずれか症状の強い方）スコア及び日常生活の支障度スコアのベースラインからの変化量 ・投与 2 週後における、治験責任（分担）医師及び患者の評価した全般的印象の改善率（「よくなった」以上の割合） 探索的評価項目：投与 1、2、3 日目における、患者日記による 4 鼻症状スコア合計、各鼻症状スコア、眼症状スコア及び日常生活の支障度スコア、並びに投与 1 週及び 2 週後における治験責任（分担）医師による各鼻所見（下鼻甲介粘膜の腫脹、下鼻甲介粘膜の色調、水様性分泌量、鼻汁の性状）スコアを評価 〈安全性〉 有害事象、臨床検査値

（P204 試験）

結果	〈有効性〉 主要評価項目 投与2週間の4鼻症状（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感）スコアの合計（治療期2週間の平均）のベースライン（症状観察期における治療期前3日間の平均）からの変化量（最小二乗平均）は、デスロラタジン錠5mg群及びプラセボ群で、それぞれ-1.41及び-0.59、投与群間の差（95%信頼区間）は、-0.83（-1.14,-0.51）であり、デスロラタジン錠5mg群のプラセボ群に対する優越性が示された（p<0.001）。 副次評価項目 投与1週時及び2週時の4鼻症状スコア合計のベースラインからの変化量（最小二乗平均）は、デスロラタジン錠5mg群でプラセボ群と比較して統計的に有意に低下した（p<0.001）。各鼻症状スコア、眼症状スコア及び日常生活の支障度スコアにおいても投与1週時、2週時及び2週間でデスロラタジン錠 5mg 群はプラセボ群と比較して統計的に有意に低下した（p≦0.037）。投与2週後の全般的印象の改善率（「よくなった」以上の割合）では、患者の評価した全般的印象でプラセボ群に比較して、デスロラタジン錠 5mg 群で統計的に有意な改善が認められた（p<0.001）。治験責任（分担）医師の評価した全般的印象では、統計的に有意ではないものの、プラセボ群と比較して、デスロラタジン錠5mg群で数値的な改善が認められた。 これらの結果は、主要評価項目の結果を支持していた。 探索的評価項目 投与1、2、3日目における、4鼻症状スコア合計及び各鼻症状スコアのベースラインからの変化量（最小二乗平均）は、3日目の鼻閉スコアを除き、デスロラタジン錠5mg群ではプラセボ群と比較して統計的に有意に低下した（p≦0.007）。眼症状スコア及び日常生活の支障度スコアのベースラインからの変化量は、流涙スコアが1日目から、眼のかゆみスコア及び日常生活の支障度スコアについては2日目から、プラセボ群と比較してデスロラタジン錠 5mg 群で統計的に有意に低下した（p≦0.032）。 投与1週後及び2週後の各鼻所見スコアのベースラインからの変化量（最小二乗平均）は、いずれの項目においてもデスロラタジン 5mg 群とプラセボ群との間に統計的に有意な差は認められなかった。 〈安全性〉 有害事象の発現率は、デスロラタジン錠5mg群8.5%（19/223例）及びプラセボ群5.8%（13/225例）であった。デスロラタジン錠5mg群で最も多く認められた有害事象は鼻咽頭炎で、デスロラタジン錠5mg群2.2%（5/223例）及びプラセボ群0.4%（1/225例）の発現率であった。 副作用の発現率は、デスロラタジン錠5mg群5.8%（13/223例）及びプラセボ群4.0%（9/225例）であった。最も多く認められた副作用は尿中蛋白陽性で、デスロラタジン錠 5mg 群 1.3%（3/223例）及びプラセボ群1.8%（4/225例）の発現率であった。 本試験では死亡例は認められなかった。その他の重篤な有害事象としてデスロラタジン錠5mg群の1例に術後創感染が認められ、当該患者は他院に入院したが、治験責任（分担）医師により治験薬との因果関係は否定された。 臨床検査値では、両投与群とも臨床的に意味のある変化は認められなかった。
結論	・ 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、主要評価項目である投与2週後の患者日記による投与2週間平均の4鼻症状スコア合計（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）。 ・ 副次評価項目の結果も、主要評価項目の結果を支持していた。 ・ デスロラタジン錠5mgの1日1回2週間投与は安全で、良好な忍容性を示した。

（P204 試験）

③第Ⅲ相二重盲検比較試験：蕁麻疹（P201 試験）

試験デザイン	多施設共同、無作為化、プラセボ対照、第Ⅲ相二重盲検比較試験
対象	12 歳以上の慢性蕁麻疹患者 239 例
主な登録基準	(1) 慢性蕁麻疹患者 (2) 患者本人又は代諾者が患者日記を欠かさず記載できる者 (3) 12 歳以上の男女 (4) 痒み、発斑（紅斑・膨疹）の症状の程度が以下の条件を満たす者 ①日中及び夜間の症状スコアのうちいずれかが 2 点以上の患者 ②発斑（紅斑・膨疹）が以下の条件の両方を満たす患者 ・紅斑スコア又は膨疹スコアのどちらかが 2 点（軽度）以上 ・総合スコアが 2 点（軽度）以上
主な除外基準	(1) 刺激誘発型の蕁麻疹である者 (2) 規定の前治療薬の休薬期間が不十分である者 (3) 抗ヒスタミン薬又は治験薬の成分に対し過敏症の既往のある者
試験方法	2 週間以内の観察期間後、デスロラタジン錠 10mg 群、デスロラタジン錠 5mg 群又はプラセボ群の各群に 1：1：1 の比で無作為に割り付け、二重盲検下で 2 週間 1 日 1 回夕方経口投与した。
評価項目	〈有効性〉 主要評価項目：投与 2 週後における治験責任（分担）医師の評価した痒みスコア（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 副次評価項目：投与 3 日、1 週、2 週後の下記項目 ・ 各時点（2 週後以外）の治験責任（分担）医師の評価した痒みスコア（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 ・ 治験責任（分担）医師の評価した各痒みスコア（日中の症状、夜間の症状、日中又は夜間の症状のうち程度の高い方、日中及び夜間の症状の合計）と各発斑スコア（紅斑、膨疹、総合、紅斑及び膨疹のスコアの合計）のベースラインからの変化量 ・ 患者が記録した痒みの程度［VAS（100mm)］のベースラインからの変化量 ・ 治験責任（分担）医師の評価した全般改善度の改善率（中等度改善以上の割合） ・ 患者日記の各痒みスコア及び各発斑スコアのベースラインからの変化量 探索的評価項目：投与 1 週及び 2 週後に皮膚の状態に関するアンケート（DLQI：Dermatology Life Quality Index）を実施し、総合得点及び 6 つの下位尺度得点（症状・感情、日常活動、レジャー、仕事・学校、人間関係及び治療）について評価 〈安全性〉 有害事象、臨床検査値
結果	〈有効性〉 主要評価項目 投与 2 週後の治験責任（分担）医師の評価した痒みスコア（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（最小二乗平均）は、デスロラタジン錠 10mg 群、5mg 群及びプラセボ群でそれぞれ-3.16、-3.19 及び-2.02 であった。また、投与 2 週後の治験責任（分担）医師の評価した痒みスコアと発斑スコアの合計のベースラインからの変化量（最小二乗平均）のプラセボ群との差は、デスロラタジン錠 10mg 群では-1.13、5mg 群では-1.17 であり、デスロラタジン錠 10mg 群及び 5mg 群のいずれも、プラセボ群と比較して統計的に有意に低下した（いずれも $p<0.001$）。

（P201 試験）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

結果	副次評価項目 投与3日及び1週後における治験責任（分担）医師の評価した痒みスコア（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（最小二乗平均）は、デスロラタジン錠10mg群及び5mg群ともにプラセボ群と比較して統計的に有意に低下した（いずれもp<0.001）。 その他の項目についても、主要評価項目の結果を支持していた。 探索的評価項目 DLQIでは、投与1週及び2週後の総合得点のベースラインからの変化量（最小二乗平均）は、デスロラタジン錠10mg群及び5mg群のいずれにおいてもプラセボ群と比較して統計的に有意な低値を示した（投与1週後：p<0.001、投与2週後：p=0.001）。また、下位尺度得点については、症状・感情、日常活動、仕事・学校の項目で、デスロラタジン錠10mg群及び5mg群ともプラセボ群よりも統計的に有意な低値を示した（p<0.05）。 〈安全性〉 有害事象の発現率は、デスロラタジン錠5mg群30.0%（24/80例）、10mg群22.8%（18/79例）及びプラセボ群20.3%（16/79例）であった。最も多く認められた有害事象は鼻咽頭炎で、デスロラタジン錠5mg群10.0%（8/80例）、10mg群3.8%（3/79例）及びプラセボ群2.5%（2/79例）の発現率であった。 副作用の発現率は、デスロラタジン錠5mg群8.8%（7/80例）、10mg群13.9%（11/79例）及びプラセボ群2.5%（2/79例）であった。最も多く認められた副作用は傾眠で、デスロラタジン錠5mg群3.8%（3/80例）、10mg群6.3%（5/79例）及びプラセボ群2.5%（2/79例）の発現率であった。 本試験では、死亡及びその他の重篤な有害事象は認められなかった。 臨床検査値は、有害事象又は副作用と報告されたγ-GTP増加（デスロラタジン錠10mg群：1例）及び白血球数減少（デスロラタジン錠5mg群：1例）を除き、臨床的に問題となるものはなかった。
結論	・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、主要評価項目である医師評価による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）。 ・副次評価項目の結果も、主要評価項目の結果を支持していた。 ・デスロラタジン錠10mg又は5mgの1日1回2週間投与は安全で、良好な忍容性を示した。

（P201 試験）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

2)安全性試験

第Ⅲ相長期試験（P202 試験）

試験デザイン	多施設共同、非盲検、第Ⅲ相長期投与試験
対象	12歳以上の湿疹・皮膚炎患者65例、皮膚そう痒症患者29例
主な登録基準	(1) 湿疹・皮膚炎又は皮膚そう痒症の患者 (2) 患者本人又は代諾者が患者日記を欠かさず記載できる患者 (3) 12歳以上の男女 (4) 痒みの程度が以下の条件を満たす者 ・日中及び夜間の症状の痒みスコアの合計が2点以上
主な除外基準	(1) 規定の前治療薬の休薬期間が不十分である者 (2) 抗ヒスタミン薬又は治験薬の成分に対し過敏症の既往のある者

（P202 試験）

試験方法	2週間以内の観察期間後、デスロラタジン錠5mgを非盲検下で1日1回夕方に経口投与した。投与開始後4週時以降8週時まで、治験責任（分担）医師により、効果不十分｛痒みの程度［VAS（100mm）］のベースラインからの変化量が50%未満の改善であった場合、又は痒みスコア（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が1以下の改善であった場合｝かつ安全性に問題がないと判断された患者は、デスロラタジン錠を10mgに増量することとした。増量後はその用量を維持することとしたが、治験責任（分担）医師が患者の安全性に問題があると判断した場合には、痒みの症状・程度を考慮し、デスロラタジン錠5mgへの減量を可とし、減量後の再度の増量は不可とした。
評価項目	〈有効性〉 主要評価項目：投与2週後の治験責任（分担）医師の評価した痒みスコア（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（疾患群別） 副次評価項目： ・ 各時点§（2週後以外）の治験責任（分担）医師の評価した痒みスコア（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（疾患群別） ・ 各時点§の治験責任（分担）医師の評価した全般改善度の改善率（中等度改善以上の割合）（疾患群別） ・ 各時点§の患者が記録した痒みの程度［VAS（100mm）］のベースラインからの変化量（疾患群別） 探索的評価項目： ・ 各時点§の治験責任（分担）医師の評価した各痒みスコア（日中の症状、夜間の症状、日中又は夜間の症状のうち程度の高い方）のベースラインからの変化量 ・ 各時点§の患者日記の各痒みスコア（日中の症状、夜間の症状、日中又は夜間の症状のうち程度の高い方、日中及び夜間の症状スコアの合計）のベースラインからの変化量 ・ 投与2、4、12週後の皮膚の状態に関するアンケート(DLQI)の総合得点及び各下位尺度得点(総合、症状・感情、日常活動、レジャー、仕事・学校、人間関係及び治療)のベースラインからの変化量(16歳以上) §投与3日、1週、2週、4週、6週、8週及び12週後 〈安全性〉 有害事象、臨床検査値
結果	〈有効性〉 主要評価項目 投与2週後の治験責任（分担）医師の評価した痒みスコア（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（最小二乗平均）は、湿疹・皮膚炎群で-1.63、皮膚そう痒症群で-2.17であり、いずれの疾患群においても、痒みスコアの合計はベースラインから有意に低下し、痒みスコアの改善が認められた（$p<0.001$）。 副次評価項目 すべての副次評価項目において、いずれの疾患群でも投与3日時点で改善が認められ、投与12週後まで改善が維持された。 探索的評価項目 各評価項目において、いずれの疾患群でも継時的な改善が示された。 〈安全性〉 有害事象の発現率は、全体で52.1%（49/94例）、湿疹・皮膚炎群で53.8%（35/65例）、皮膚そう痒症群で48.3%(14/29例)であった。最も多く認められた有害事象は鼻咽頭炎で、全体18.1%（17/94例）、湿疹・皮膚炎群20.0%（13/65例）及び皮膚そう痒症群13.8%（4/29例）の発現率であった。

（P202 試験）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

	副作用の発現率は、全体で 8.5%（8/94 例）、湿疹・皮膚炎群で 10.8%（7/65 例）、皮膚そう痒症群で 3.4%（1/29 例）であった。最も多く認められた副作用は、傾眠［全体：4.3%（4/94 例）、湿疹・皮膚炎群：6.2%（4/65 例）、皮膚そう痒症群：0%（0/29 例）］であったが、すべて投与中に回復した。 本試験では死亡は認められなかった。 その他の重篤な有害事象として湿疹・皮膚炎群の 1 例に入院を必要とする軽度の皮膚の新生物が認められたが、治験薬との因果関係は治験責任（分担）医師により否定された。 臨床検査値は、いずれの疾患群でも臨床的に意味のある変化は認められなかった。 〈増量例での有効性・安全性〉 94 例中 66 例は、投与 4 週目以降にデスロラタジン錠 10mg1 日 1 回へ増量された。いずれの疾患群でも増量後に痒みスコアの数値上の改善が認められた。また、増量例の有害事象の発現率は、51.5%（34/66 例）、副作用発現率は 9.1%（6/66 例）であった。最も多く認められた副作用は傾眠で、4.5%（3/66 例）に認められたが、発現時期はいずれも増量前であり、また、すべて増量前に回復した。
結論	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、痒みに関連した有効性評価項目において、投与 3 日目から改善が認められ、投与 12 週後まで改善は維持された。デスロラタジン錠 5mg 又は 10mg（増量時）の 1 日 1 回 8～12 週間投与は安全で、良好な忍容性を示した。

（P202 試験）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

(5) 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（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

使用成績調査（終了）

試験の目的	日常の診療下において、承認された用法用量に従い処方された際の本剤のアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒に対する、有効性及び安全性に関する情報の検出及び確認を行う。
調査対象	アレルギー性鼻炎、蕁麻疹及び皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒の患者
調査方式	Electronic Data Capture システムを用い、プロスペクティブな中央登録方式
調査期間等	調査期間：2017 年 9 月 - 2022 年 8 月 （5 年間） 登録期間：2017 年 9 月 - 2021 年 8 月 （4 年間） 観察期間：本剤服薬開始後 2 週以上最長 6 ヵ月間 実施施設数：781 施設
主な評価項目	【安全性検討事項】 1）ショック、アナフィラキシー 2）肝機能障害、黄疸 3）痙攣、てんかん 【有効性評価項目】 全般改善度（臨床効果）、鼻症状スコア（くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉及び鼻内そう痒感）、眼症状スコア（目の痒み、流涙）、皮膚臨床症状（痒みスコア、発斑スコア（紅斑（赤み）、膨疹（盛り上がり）、総合））

症例数	登録症例：5692 例 　季節性アレルギー性鼻炎:2028 例 　通年性アレルギー性鼻炎:1781 例 　蕁麻疹・皮膚疾患に伴うそう痒:1883 例 調査票回収症例：5579 例 　季節性アレルギー性鼻炎:1980 例 　通年性アレルギー性鼻炎:1760 例 　蕁麻疹・皮膚疾患に伴うそう痒:1839 例 安全性解析対象症例※1：3783 例 　季節性アレルギー性鼻炎:1407 例 　通年性アレルギー性鼻炎:1206 例 　蕁麻疹・皮膚疾患に伴うそう痒:1170 例 有効性解析対象症例数※2：3222 例 　季節性アレルギー性鼻炎:1229 例 　通年性アレルギー性鼻炎:1064 例 　蕁麻疹・皮膚疾患に伴うそう痒:929 例 ※1 収集症例から、初診後の再診がない 1458 例、自主回収に伴う服薬中断 382 例、初回服薬日から登録までが 7 日間を超える又は初回服薬以前の登録 1 例が除外された（除外理由の重複あり）。 ※2 安全性解析対象症例から、全般改善度が「判定不能」96 例、本剤が間歇投与され、継続して 2 週間以上服薬されていない 496 例、承認外用量 3 例が除外された（除外理由の重複あり）。
主な 試験結果	・副作用発現状況 安全性解析対象症例における副作用の発現割合は 1.61%(61/3783 例)であった。 また、季節性アレルギー性鼻炎の副作用の発現割合は 1.35%(19/1407 例)、通年性アレルギー性鼻炎では 1.74%(21/1206 例)、蕁麻疹・皮膚疾患に伴うそう痒では 1.79%(21/1170 例)であった。 主な副作用(3 例以上)は、傾眠 20 例(0.53%)、季節性アレルギー5 例(0.13%)、通年性鼻炎、便秘及び蕁麻疹が各 3 例(0.08%)であった。また、季節性アレルギー性鼻炎では傾眠 8 例(0.57%)及び季節性アレルギー5 例(0.36%)であった。通年性アレルギー性鼻炎では傾眠 6 例(0.50%)及び通年性鼻炎 3 例(0.25%)であった。蕁麻疹・皮膚疾患に伴うそう痒では傾眠 6 例(0.51%)及び蕁麻疹 3 例(0.26%)であった。 重篤な副作用は詳細情報が不明なけが（損傷）1 例であった。 【安全性検討事項】 医薬品リスク管理計画書に基づき、重要な特定されたリスク「ショック、アナフィラキシー」、「肝機能障害、黄疸」、「痙攣、てんかん」を安全性検討事項として設定した。 安全性解析対象症例において発現した、安全性検討事項に該当する副作用は、「肝機能障害、黄疸」に該当する肝機能異常 2 例(0.05%)、及び肝酵素上昇 1 例(0.03%)のみであり、いずれも非重篤であった。 【有効性評価項目】 有効性解析対象症例における有効※3割合は 90.75%（2924/3222 例）であった。また、鼻症状、眼症状、痒み及び発斑スコアの変化量の推移について服薬前と比較した結果、服薬 1 週後、1 週超～2 週後、2 週超～1 ヵ月後、1 ヵ月超～3 ヵ月後及び 3 ヵ月超～6 ヵ月後のほぼすべての時点において統計学的な有意差が認められた。また、QOL においても、患者の日常生活の不便さが軽減されることが示された。 ※3 全般改善度の著明改善、中等度改善、軽度改善、不変、悪化及び判定不能の中から、調査担当医師が著明改善、中等度改善及び軽度改善と判断した場合、有効症例とした。

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

国内第Ⅲ相試験における有効性評価の統計解析には最小二乗平均を用いたため、電子添文に記載の算術平均による結果を以下に示す。

1) 季節性アレルギー性鼻炎

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、デスロラタジン錠 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　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）

	デスロラタジン錠 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

（P204 試験）

2) 通年性アレルギー性鼻炎

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、デスロラタジン錠 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。

（P200 試験）

3)蕁麻疹

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 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）

	デスロラタジン錠 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

（P201 試験）

4)皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

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のとおりであった。

表　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

（P202 試験）

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

ヒスタミンH_1受容体拮抗薬

一般名：ロラタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、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、ビラスチン等

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

デスロラタジンは、H_1受容体においてヒスタミンとの拮抗作用を示し、各種刺激によるヒスタミン遊離抑制（*in vitro*［花粉症又は非花粉症由来ヒト末梢血白血球］）、IgE受容体の架橋によるヒスタミン遊離抑制、並びにロイコトリエンC_4及びプロスタグランジンD_2産生抑制（*in vitro*［ヒト肺組織由来肥満細胞］）、炎症性サイトカイン産生抑制（*in vitro*［HMC-1細胞、KU812細胞、ヒト末梢血好塩基球］）、血管内皮細胞の接着因子発現抑制及び炎症性サイトカイン産生抑制（*in vitro*［HUVEC］）などの抗アレルギー性炎症作用が考えられる。

(2)薬効を裏付ける試験成績

1)ヒスタミンH_1受容体に対する親和性（*in vitro*）[6)]

①ヒスタミンH_1受容体に対する競合結合試験

ヒトヒスタミンH_1受容体を発現させたCHO(チャイニーズハムスター卵巣)細胞より調製した膜標品において、デスロラタジンは^{3}H-ピリラミン（ヒスタミンH_1受容体リガンド）の結合を濃度依存的に阻害し、その阻害定数（K_i値）は0.9nM（0.28ng/mL）であった。

表　ヒトヒスタミンH_1受容体に対するK_i値

薬物	例数	Ki値（nM）［ng/mL］
デスロラタジン	4	0.9 ± 0.08 [0.28]
ロラタジン	4	138 ± 23 [52.8]
フェキソフェナジン	4	175 ± 68 [87.8]
クロルフェニラミン	3	2.0 ± 0.2 [0.55]
エピナスチン	3	0.4 ± 0.06 [0.10]
ケトチフェン	3	0.14 ± 0.01 [0.04]
アゼラスチン	3	1.1 ± 0.3 [0.42]
エバスチン	4	51.7 ± 6.8 [24.3]
セチリジン	4	47.2 ± 10 [18.4]

各値はK_i値の平均値±標準誤差を示す。

②ヒスタミンH_1受容体に対する飽和結合試験、結合試験及び解離試験

ヒトヒスタミンH_1受容体を発現させたCHO細胞より調製した膜標品における飽和結合試験で、^{3}H-デスロラタジンのヒトヒスタミンH_1受容体に対する結合は濃度依存的であり、結合に飽和がみられた。デスロラタジンの解離定数（K_D値）は1.1±0.2nM（0.34ng/mL）であった。

膜標品に^{3}H-デスロラタジンを結合させた結合試験にて、時間依存的にデスロラタジンのヒトヒスタミンH_1受容体への結合量が増加し、約60分で結合量はほぼ飽和した。

さらに、^{3}H-デスロラタジンを膜標品に結合させた後、非標識デスロラタジンを添加して解離を誘導した解離試験では、デスロラタジンのヒトヒスタミンH_1受容体からの解離速度は遅く、6時間後の解離率は37%であった。

2)抗ヒスタミン作用（*in vitro*）

①モルモット摘出回腸のヒスタミン誘発収縮に対する作用[7)]

モルモット摘出回腸を用いて、ヒスタミン誘発収縮に対するデスロラタジン、ロラタジン及びデスロラタジンの代謝物の作用を検討した結果、デスロラタジンはヒスタミンに対して拮抗作用を示し、デスロラタジンの pA_2 値は 8.2（$10^{-8.2}$=6.3nM、2.0ng/mL）であり、ロラタジンの 7.3 よりも高値を示した。デスロラタジンと比較して、代謝物であるデスロラタジンの 6 位水酸化体（6-OH デスロラタジン）の pA_2 値はほぼ同程度であったが、3 及び 5 位水酸化体（3-OH デスロラタジン及び 5-OH デスロラタジン）の各値は低かった。

②抗ヒスタミン作用の阻害様式[6)]

ヒトヒスタミン H_1 受容体を発現させた CHO 細胞を用いて、ヒスタミンによる反応を細胞内 Ca^{2+}濃度（$[Ca^{2+}]_i$）の上昇により評価した結果、デスロラタジンはヒスタミンによる$[Ca^{2+}]_i$上昇の濃度－反応曲線を濃度依存的に右にシフトさせ、ヒスタミンの最大反応を低下させた。

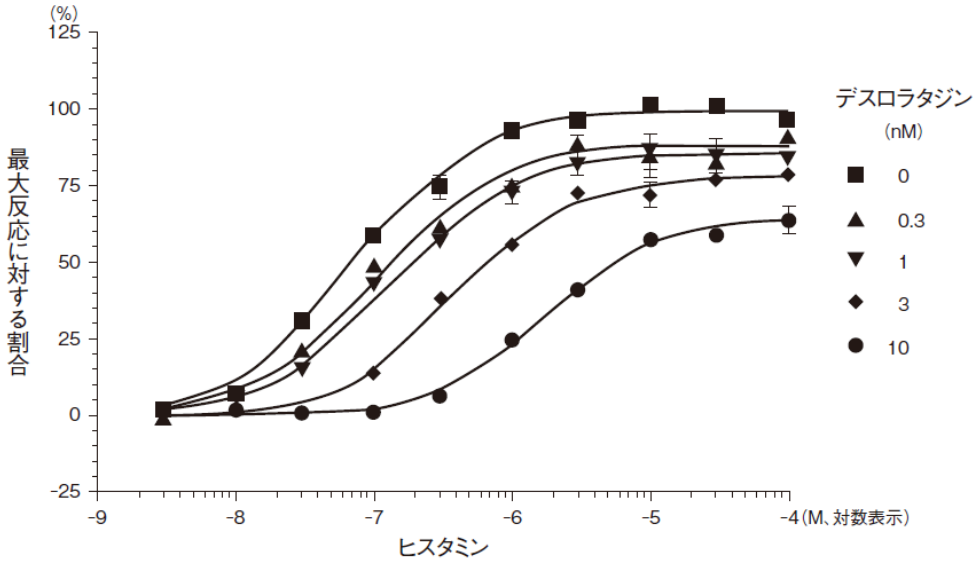


図　ヒスタミン誘発$[Ca^{2+}]_i$の上昇に対する拮抗作用

各点はデスロラタジン非処理時の 100μM のヒスタミンによる$[Ca^{2+}]_i$の最大反応（蛍光強度）に対する割合（%）の平均値±標準誤差を示す（例数:3）。

3)抗ヒスタミン作用（*in vivo*）

①1 日投与回数の検討マウスのヒスタミン誘発足蹠浮腫に対する作用[7)]

デスロラタジン（0.03～1.0mg/kg）又はロラタジン（0.3～3.0mg/kg）をマウスに経口投与 1 時間後、後肢足蹠皮下へ生理食塩液に溶解したヒスタミン二塩酸塩（右）及び生理食塩液（左）を投与し、30 分後に切断して重量差を求めた。その結果、デスロラタジンはヒスタミン誘発足蹠浮腫を抑制し、そのときのデスロラタジンの 50%作用用量（ED_{50} 値）は 0.15mg/kg とロラタジン（0.60mg/kg）の 1/4 であった。

表　マウスのヒスタミン誘発足蹠浮腫に対する作用

薬物	ED_{50} 値（95%信頼限界）［mg/kg、経口］
デスロラタジン	0.15（0.09-0.24）*
ロラタジン	0.60（0.29-0.99）

*：$p<0.05$ でロラタジン群に比して有意差あり（95%信頼限界による比較）。

②モルモットのヒスタミン誘発致死に対する作用 [7)]

モルモットにデスロラタジン又はロラタジンを経口投与1時間後、致死量のヒスタミン二塩酸塩を静脈内投与して 30 分後の致死防御率を求めた。その結果、デスロラタジンはヒスタミン誘発致死防御作用を示し、そのときのデスロラタジンの ED_{50} 値は 0.15mg/kg であり、ロラタジン（0.37mg/kg）の 1/2.5 であった。

表　モルモットのヒスタミン誘発致死に対する作用

薬物	ED_{50} 値（95%信頼限界）［mg/kg、経口］
デスロラタジン	0.15（0.03-0.26）[NS]
ロラタジン	0.37（0.23-0.55）

[NS]：p>0.05 でロラタジン群に比して有意差なし（95%信頼限界による比較）。

③モルモットのヒスタミン誘発鼻腔内色素漏出に対する作用 [7)]

モルモットにデスロラタジン、ロラタジン又は局所抗ヒスタミン薬であるレボカバスチンを点鼻投与し、10 分後にヒスタミン誘発鼻腔内色素漏出に対する抑制作用を検討した。その結果、デスロラタジンの局所抗ヒスタミン作用の ED_{50} 値は 0.9μg/両鼻腔であり、ロラタジン及びレボカバスチンの、それぞれ約 1/10 及び 36 倍であった。

表　モルモットのヒスタミン誘発鼻腔内色素漏出に対する作用

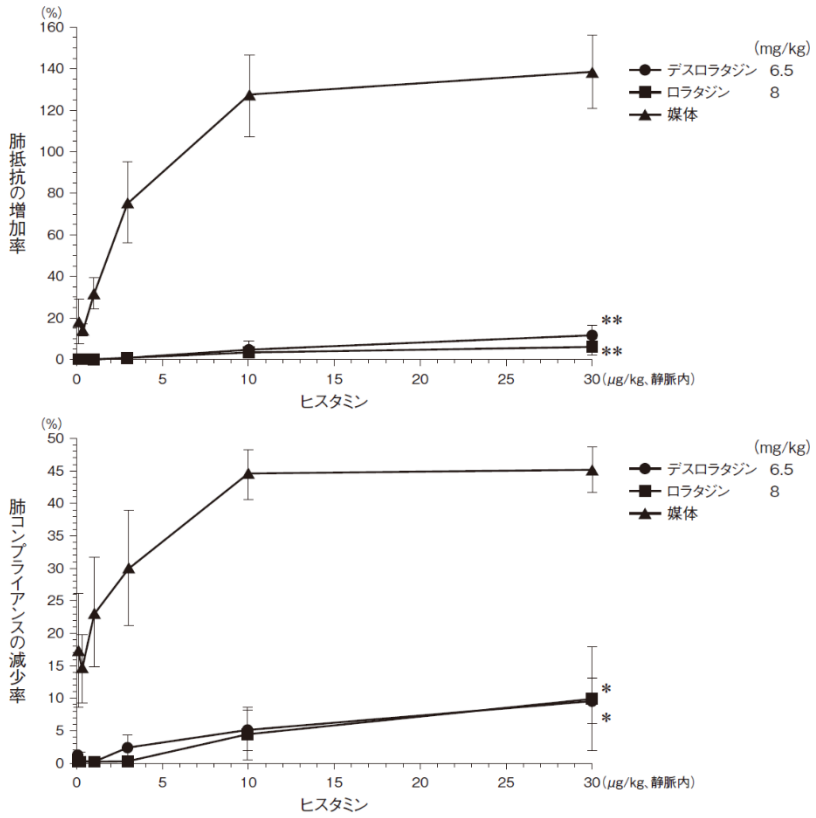
薬物	用量（μg/両鼻腔）	抑制率（%）	例数	ED_{50} 値（μg/両鼻腔）
デスロラタジン	0.1	0	4	0.9
	0.3	36 ± 24	4	
	1.0	50 ± 12*	8	
	3.0	69 ± 7*	6	
ロラタジン	1.0	13 ± 13	8	8.7
	3.0	41 ± 6*	8	
	10.0	49 ± 6*	8	
レボカバスチン	0.01	39 ± 15*	8	0.025
	0.03	47 ± 8*	8	
	0.1	73 ± 6*	8	
	1.0	85 ± 8*	8	

各値は抑制率（%）の平均値±標準誤差を示す。

*：p<0.05 で媒体対照群に比して有意差あり。

④カニクイザルのヒスタミン誘発気道収縮に対する作用[7)]

麻酔カニクイザルにデスロラタジン又はロラタジンを胃内投与2時間後、ヒスタミンを累積的に静脈内投与してヒスタミン誘発気道収縮に対する作用を検討した結果、デスロラタジン 6.5mg/kg によりヒスタミン誘発気道収縮（肺抵抗増加及び肺コンプライアンス減少）はほぼ完全に抑制された。また、ロラタジンもほぼ同程度であった。



各点はヒスタミン誘発前置に対する変化率（%）の平均値±標準誤差を示す（例数:6）。
＊：$p<0.01$ で媒体対照群に比して有意差あり（反復測定分散分析）。
＊＊：$p<0.0001$ で媒体対照群に比して有意差あり（反復測定分散分析）。

図　カニクイザルのヒスタミン誘発気道収縮に対する作用

4)アレルギー性炎症に対する作用(*in vitro*)

①各種刺激によるヒスタミン遊離に対する作用[8)]

花粉症（24例）のヒト末梢血白血球を抗原（オオアワガエリ花粉抗原抽出液）で刺激、あるいは非花粉症（22例）のヒト末梢血白血球を抗IgE抗体、Con A、fMLP、TPA又はA23187で刺激したときのヒスタミン遊離に対して、デスロラタジンは各種刺激に対するヒスタミン遊離を抑制し、その IC_{30} 値は 4.8～60.2μM（1.5～18.7μg/mL）であった。

表　ヒト末梢血白血球からの各種刺激によるヒスタミン遊離に対するデスロラタジンの作用

刺激（濃度）	ヒスタミン遊離率が30%以上の実験回数の割合†	最大抑制率（%）‡	IC_{30}値（μM）§ ［μg/mL］
抗原（100SQ/mL）	24/24	69 ± 5	5.5 ± 1.1［ 1.7 ］
抗IgE抗体（100IU/mL）	18/22	68 ± 3	8.2 ± 1.2［ 2.5 ］
Con A（10μg/mL）	12/22	62 ± 6	4.8 ± 1.4［ 1.5 ］
fMLP（1μM）	11/22	22 ± 7	60.2 ± 1.2［18.7 ］
TPA（10ng/mL）	9/22	21 ± 9	27.6 ± 1.7［ 8.58］
A23187（100ng/mL）	22/22	60 ± 4	11.1 ± 1.2［ 3.45］

†：ヒスタミン遊離率が30%以上の実験結果をデスロラタジンの最大抑制率（%）及び IC_{30} 値の算出に用いた。
‡：各値は最大抑制率（%）の平均値±標準誤差を示す。
§：各値は IC_{30} 値の幾何平均値±標準誤差を示す。
A23187：カルシウムイオノフォアA23187
Con A：コンカナバリンA
fMLP：*N*-formyl-methionyl-leucyl-phenylalanine
IU：international unit
SQ：standardized quality
TPA：12-*O*-tetradecanoylphorbol-13-acetate

②IgE受容体の架橋によるヒスタミン遊離、並びにロイコトリエン C_4 及びプロスタグランジン D_2 産生に対する作用[9)]

ヒト肺組織由来肥満細胞を抗IgE受容体抗体で刺激したときの、ヒスタミン遊離（蛍光法）、ロイコトリエン C_4（LTC_4）及びプロスタグランジン D_2（PGD_2）産生（放射免疫測定法）に対するデスロラタジンの作用を検討した結果、約10μM（3.1μg/mL）以上で抑制傾向を示した。

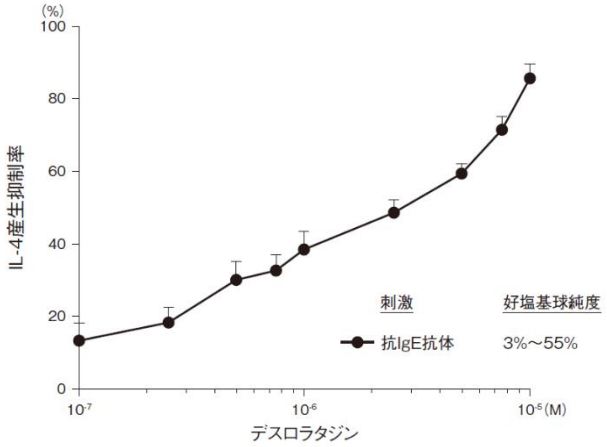
③炎症性サイトカイン等の産生抑制作用

ⅰ)インターロイキン（IL）-6、IL-8 産生に対するデスロラタジンの作用[10)]

炎症細胞を TPA 及び A23187 で共刺激したときの IL-6 及び IL-8 の産生に対して、デスロラタジンは、10nM（3.1ng/mL）で、HMC-1 細胞（ヒト肥満細胞由来細胞株）及び KU812 細胞（ヒト好塩基球由来細胞株）からの IL-6 産生をそれぞれ 44%及び 38%抑制し、IL-8 産生をそれぞれ 48%及び 42%抑制した。デキサメタゾン 10nM（3.9ng/mL）は両細胞からの IL-6 及び IL-8 産生を 52～71%抑制した。

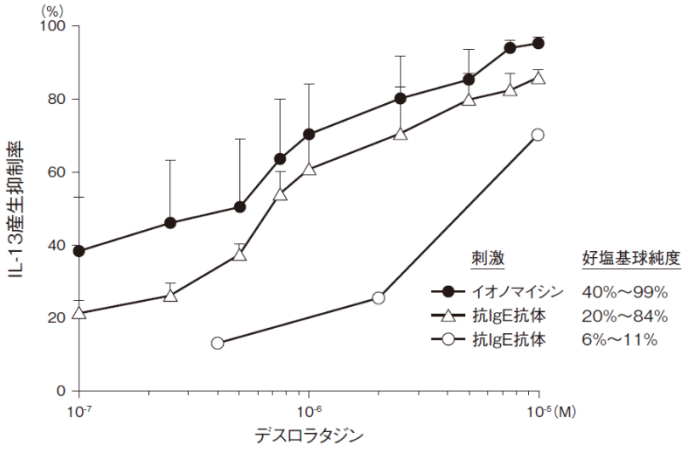
ⅱ)IL-4、IL-13 産生に対するデスロラタジンの作用[11)]

ヒト末梢血好塩基球からの IL-4 及び IL-13 の産生に対して、デスロラタジンは、100nM（31ng/mL）以上で、抗 IgE 抗体刺激による純度 3%～55%好塩基球からの IL-4 産生抑制傾向、純度 20～84%好塩基球からの IL-13 産生抑制傾向が示されたが、純度 6～11%好塩基球からの IL-13 産生抑制率は低値であった。また、イオノマイシン（カルシウムイオノフォア）刺激による純度 40～99%好塩基球からの IL-13 産生の抑制傾向が示された。



各点は IL-4 産生抑制率（%）の平均値+標準誤差を示す（例数:5）。

図　ヒト末梢血好塩基球からの抗 IgE 抗体刺激による IL-4 産生に対する作用



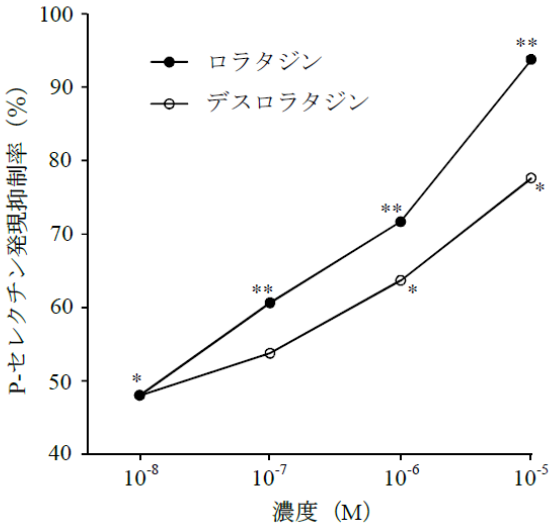
各点は IL-13 産生抑制率（%）の平均値（例数:2）又は平均値+標準誤差を示す（例数:3）。

図　ヒト末梢血好塩基球からの抗 IgE 抗体又はイオノマイシン刺激による IL-13 産生に対する作用

④血管内皮細胞の接着因子の発現及び炎症性サイトカイン産生に対する作用[12)]

ⅰ)接着因子の発現に対するデスロラタジンの作用

ヒト臍帯静脈内皮細胞（HUVEC）をヒスタミン（10^{-4}M）で刺激したときのP-セレクチン発現に対して、デスロラタジン及びロラタジンは抑制作用を示し、IC_{50}値がそれぞれ23及び13nM（7.1及び5.0ng/mL）であった。



各点はP-セレクチン発現抑制率（%）の平均値を示す（例数:5）。

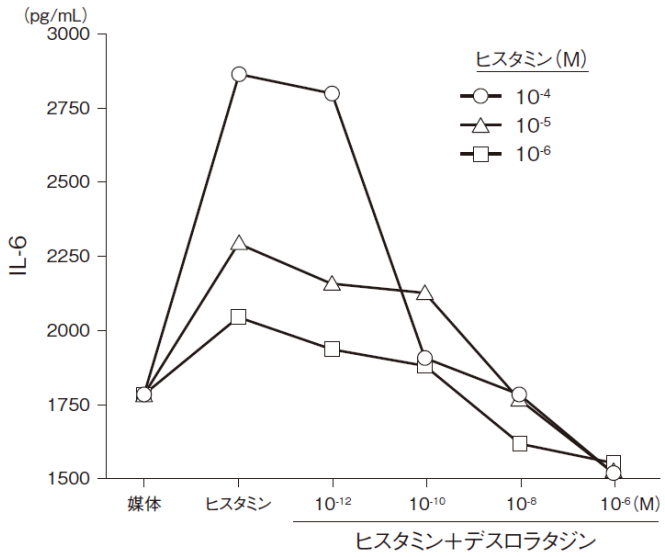
*：p<0.05で媒体対照群に比して有意差あり。

**：p<0.01で媒体対照群に比して有意差あり。

図　HUVECのヒスタミン刺激によるP-セレクチン発現に対する作用

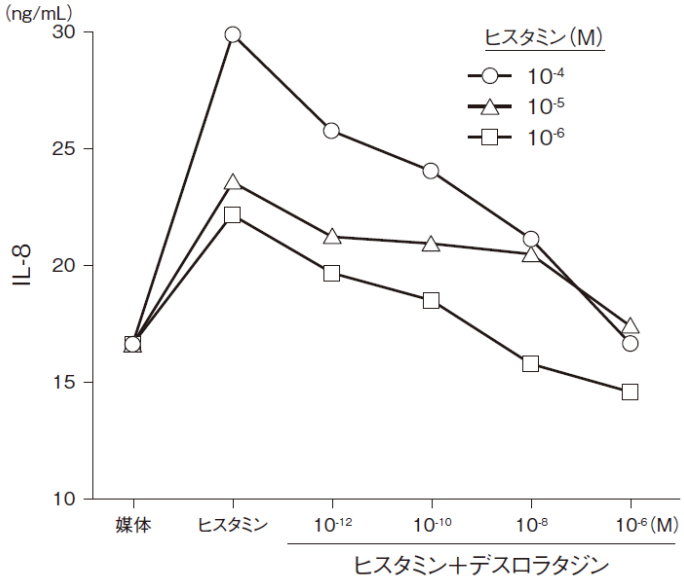
ⅱ)炎症性サイトカインの産生に対するデスロラタジンの作用

HUVECをヒスタミン（10^{-4}M）で刺激したときのIL-6及びIL-8の産生に対して、デスロラタジンはいずれも抑制作用を示し、IC_{50}値はIL-6産生に対して2.6pM（0.81pg/mL）、IL-8産生に対して1nM（0.31ng/mL）であった。



IL-6の産生量（pg/mL）の平均値を示す（例数:6）。

図　HUVECのヒスタミン刺激によるIL-6に対する作用



IL-8 の産生量（ng/mL）の平均値を示す（例数:6）。

図　HUVEC のヒスタミン刺激による IL-8 に対する作用

(3) 作用発現時間・持続時間

膨疹及び発赤反応抑制作用（健康成人：外国人）

健康成人男女 28 例をデスロラタジン錠 5mg 又はプラセボのいずれかに 14 例ずつ割り付け、1 日 1 回 28 日間反復経口投与した。皮膚プリック法にてヒスタミンを塗布し、塗布後の膨疹面積を測定し、ヒスタミンの反応を評価した結果、ヒスタミン誘発性膨疹面積の最小値のベースラインからの変化量は、すべての測定日（1、7、14、21 及び 28 日目）でデスロラタジン錠 5mg 群の方がプラセボ群よりも有意に小さかった（p≦0.05）。

タキフィラキシーは認められなかった。

なお、1 日目の時間ごとの検討では、早期の 1 時間後及び 24 時間後でも群間のベースラインからの変化量に有意な差が認められた(p=0.016 及び p=0.020)。

表　健康成人にデスロラタジン錠 5mg 又はプラセボを 1 日 1 回 28 日間反復経口投与したときのヒスタミン誘発性膨疹面積の最小値のベースラインからの平均変化量の差

	1 日目	7 日目	14 日目	21 日目	28 日目
最小二乗平均の差†	-9.5	-11.07	-10.43	-12.01	-12.49
95%信頼区間	(-18.99, -0.01)	(-20.79, -1.35)	(-19.09, -1.77)	(-22.23, -1.80)	(-23.3, -1.66)
p 値	0.05	0.027	0.02	0.023	0.026

†デスロラタジン錠 5mg－プラセボ、mm^2

表　健康成人にデスロラタジン錠 5mg 又はプラセボを単回経口投与したときのヒスタミン誘発膨疹面積のベースラインから変化量の平均値（1 日目の時間ごとの解析結果）

	デスロラタジン錠 5mg		プラセボ		解析	
時間	例数	最小二乗平均†	例数	最小二乗平均†	p 値	95%信頼区間 デスロラタジン錠5mg －プラセボ
ベースライン‡	14	26.43	14	18.50	0.067	(-0.59, 16.45)
ベースラインからの変化量						
1 時間	14	-10.50	14	2.57	0.016	(-23.53, -2.61)
3 時間	14	-8.93	14	-0.36	0.163	(-20.85, 3.71)
6 時間	14	-4.93	14	6.14	0.063	(-22.78, 0.64)
12 時間	14	-7.14	14	6.36	0.035	(-25.96, -1.04)
24 時間	14	-7.21	14	7.36	0.020	(-26.71, -2.44)
最小値	14	-16.71	14	-7.21	0.050	(-18.99, -0.01)

† 面積の平均、mm^2

‡ 1 日目の 0 時間

（P01196 試験）

〈参考〉

1)作用発現時間

モルモットにデスロラタジン（0.1～1mg/kg）又はロラタジン（0.3～3mg/kg）を急速静脈内投与したときの、抗ヒスタミン作用の発現時間を検討した結果、デスロラタジンでは、静脈内投与直後に抗ヒスタミン作用の発現がみられ、投与 2 分後の ED_{50} 値は 0.27mg/kg であった。さらに、10、30 及び 60 分後の ED_{50} 値は、それぞれ 0.16、0.11 及び 0.11mg/kg に低下し、60 分後まで抗ヒスタミン作用の増強がみられた。

表　モルモットのヒスタミン誘発気道収縮に対する作用の発現時間

薬物	ED_{50}値（mg/kg、静脈内）			
	2分後	10分後	30分後	60分後
デスロラタジン	0.27	0.16†	0.11†	0.11†
ロラタジン	2.3‡	0.94	0.58	0.41§

†：0.1 及び 0.3mg/kg のデータより算出した。

‡：1 及び 3mg/kg のデータより算出した。

§：0.3 及び 1mg/kg のデータより算出した。

2)作用持続時間 [7)]

モルモットにデスロラタジン又はロラタジンを経口投与したときの、ヒスタミン誘発致死に対する防御作用の持続時間について検討した結果、デスロラタジン及びロラタジンは 24 時間にわたって致死防御作用を示し、その持続作用は両薬物で類似していた。

表　モルモットのヒスタミン誘発致死に対する防御作用の持続時間

薬物	用量 （mg/kg、経口）	例数	致死防御率（%）				
			1 時間後	4 時間後	8 時間後	18 時間後	24 時間後
デスロラタジン	0.5	5	100	100	100	60	40
ロラタジン	1	5	80	100	100	80	60

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

1) 単回投与

日本人健康成人男性にデスロラタジン錠 2.5、5 及び 10mg（各 8 例）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図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[13]。

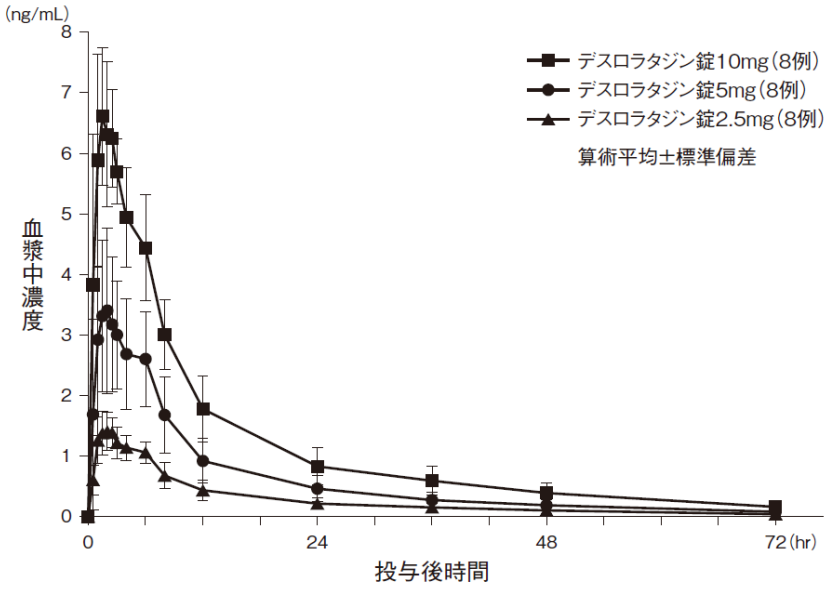


図　デスロラタジン錠を空腹時単回経口投与したときの血漿中濃度推移

表　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} † (hr)	C_{max} ‡ (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ ‡ (ng･hr/mL)	$t_{1/2}$ ‡ (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）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

2) 反復投与

日本人健康成人男性（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 [13]。

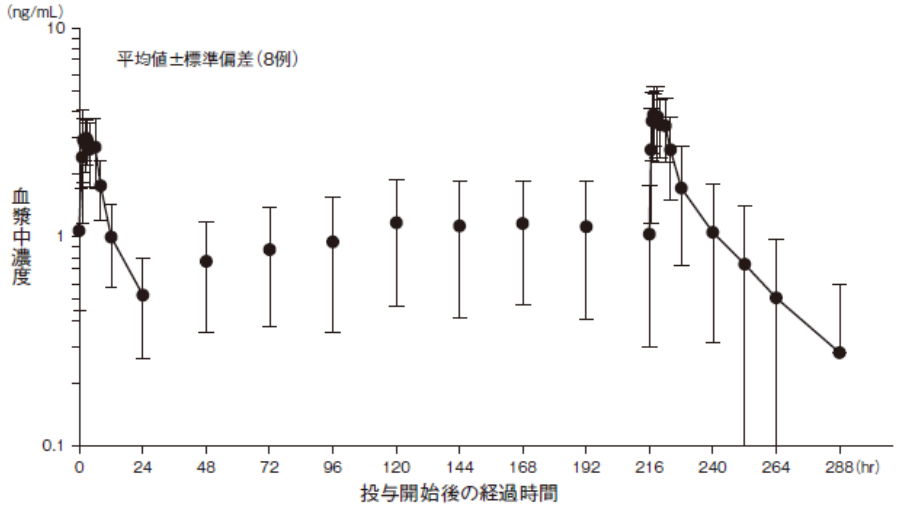


図　デスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 10 日間空腹時反復経口投与したときの
血漿中デスロラタジン濃度－時間プロファイル

表　デスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 10 日間空腹時反復経口投与したときの薬物動態パラメータ

	例数	T_{max} † (hr)	C_{max} ‡ (ng/mL)	AUC_{0-24hr} ‡ (ng･hr/mL)	$t_{1/2}$ ‡ (hr)
1 日目	8	2.75[1.5-6]	3.23(24)	32.2 (31)	－
10 日目（定常状態時）	8	2.00 [1-4]	4.21(32)	47.4 (42)	22.7(19)
累積係数（10 日目/1 日目） §	－	－	1.30 (1.09, 1.55)	1.47 (1.29, 1.68)	－

† 中央値［最小値-最大値］
‡ 幾何平均（%CV）
§ 混合効果モデルに基づく幾何平均比（90%信頼区間）

(3) 中毒域

該当資料なし

(4)食事・併用薬の影響

1)食事の影響（外国人）

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[14]。

表　デスロラタジン錠5mgの薬物動態に及ぼす食事の影響（外国人）

高脂肪高カロリー食	例数	デスロラタジン		3-OHデスロラタジン	
		C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng･hr/mL)
空腹時†	24	2.98(69)	56.6(76)	1.12(46)	30.0(31)
食後†		2.96(46)	57.6(72)	1.12(50)	30.0(37)
比較‡ (食後／空腹時)		1.08 [0.96-1.20]	1.07 [0.97-1.19]	0.98 [0.88-1.09]	0.98 [0.90-1.07]

† 算術平均（%CV）
‡ 幾何平均比[90%信頼区間]

2)グレープフルーツジュースの影響（外国人）

健康成人（23例）にデスロラタジン錠5mgをグレープフルーツジュース摂取後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。

表　デスロラタジン錠5mgの薬物動態に及ぼすグレープフルーツジュースの影響（外国人）

グレープフルーツジュース摂取	例数	デスロラタジン		3-OHデスロラタジン	
		C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng･hr/mL)
なし†	23	2.06(43)	52.5(110)	0.923 (47)	26.2 (39)
あり†		2.14(36)	55.5(105)	0.980 (51)	27.2 (37)
比較‡ (あり／なし)		1.07 [1.00-1.15]	1.09 [1.04-1.14]	1.05 [1.00-1.11]	1.05 [0.99-1.10]

† 算術平均（%CV）
‡ 幾何平均比[90%信頼区間]

3)併用薬の影響（外国人）

健康成人を対象として、CYP3A4 の阻害剤（ケトコナゾール*、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 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った[15]。

また、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[16]。

＊ 国内では外用剤のみ発売

表　デスロラタジン錠の薬物動態に及ぼす他剤の影響（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）+250mg1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

§ 幾何平均比（併用投与／単独投与）[90%信頼区間]

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

（「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照）

2. 薬物速度論的パラメータ

(1)解析方法

デスロラタジンの薬物動態について、デスロラタジンを単回経口投与した際の薬物動態はいずれも non-compartment モデル解析によって評価した。

(2)吸収速度定数

該当資料なし

(3)消失速度定数

該当資料なし

(4)クリアランス

日本人健康成人8例にデスロラタジン錠5mgを単回経口投与した際の見かけの全身クリアランス(幾何平均(%CV))は、116(37)L/hr であった。

(5)分布容積

日本人健康成人 8 例にデスロラタジン錠 5mg を単回経口投与した際の見かけの分布容積（幾何平均（%CV））は 3260(39)L であった[17]。

(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

^{14}C-デスロラタジン 10mg を健康男性成人（外国人 6 例）に単回経口投与したマスバランス試験では、投与放射能の 87.1%が糞中（46.5%）及び尿中（40.6%）に排泄された。糞中放射能（投与放射能の 46.5%）のうち、投与量の約 7%に相当する放射能が未変化体として排泄され、残る 40%は代謝物であった。
代謝物として糞中に排泄された放射能は分解生成物や腸内細菌叢に由来するものではなく、一旦吸収され、胆汁中に排泄された放射能に由来するものであることが示唆されたことから、デスロラタジンの吸収率は、少なくとも 81%（糞中 40%及び尿中 41%の合計）と推定された。

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

5．分布

(1) 血液－脳関門通過性
ヒトでの該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性
ヒトでの該当資料なし

〈参考〉

妊娠ラットに ^{14}C-ロラタジン 8mg/kg を単回投与したときの、胎児中のデスロラタジンの曝露量を検討した。胚形成の後期（妊娠 14 日目）及び分娩直前（妊娠 20 日目）のいずれにおいても、放射能は胎盤を通過した。妊娠 20 日目における胎児及び母獣での血漿中デスロラタジンの最高濃度の推定値は、各々0.039 及び 0.101 μg 当量/g（投与後 5 時間）であった。投与後 1、5 及び 24 時間に採取した血漿における、放射能濃度に対するデスロラタジンの割合（いずれも μg 当量/g 試料）は、母獣及び胎児でほぼ同じであった。

(3) 乳汁への移行性
ヒトでの該当資料なし

〈参考〉

ロラタジンの 40mg カプセル*を授乳婦（外国人、6 例、年齢 19～28 歳）に単回経口投与した海外試験において、デスロラタジンの母乳中への移行が認められている[18]。投与後 48 時間までに母乳中に分泌されたロラタジン及びデスロラタジンの割合は、投与量のそれぞれ 0.01%及び 0.02%であった。

＊ ロラタジンの 40mg カプセルは、国内では発売されていない。

(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

ヒトでの該当資料なし

〈参考〉

ラットに ^{14}C-デスロラタジンを単回経口投与したとき、投与放射能は大部分の組織に広範に分布し、特に下垂体、甲状腺、副腎、肺及び肝臓に高濃度に分布した。組織中放射能濃度は血漿より高く、脂肪、有色眼、腎臓及び甲状腺では、血漿又はその他の組織と比較して放射能の消失が遅延した。

(6) 血漿蛋白結合率

ヒト血漿に ^{14}C-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(*in vitro*)[19]。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位：肝臓

代謝経路：ヒト（外国人）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[20]。

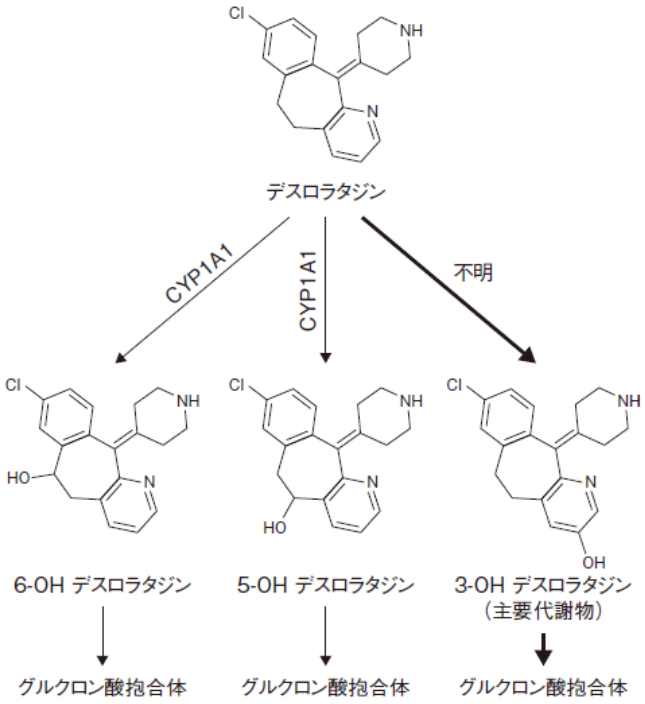


図　ヒトにおけるデスロラタジンの推定代謝経路

(2) 代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率

デスロラタジンの酸化的代謝に関与している代謝酵素のうち、5-OH デスロラタジン及び 6-OH デスロラタジンの生成にはチトクロム P450（CYP）1A1 の関与が明らかであるが、3-OH デスロラタジンの生成に関与している代謝酵素は同定されていない。3-OH デスロラタジンのグルクロン酸抱合については、ヒト肝ミクロソームを用いた試験の結果から、ウリジン二リン酸グルクロン酸転移酵素(UGT) 1A1、1A3 及び 2B15 の関与が示唆されている。

*In vitro*試験の結果、臨床曝露域においてデスロラタジン及び3-OHデスロラタジンは主要なCYP分子種(CYP1A2、2C9、2C19、3A4 及び 2D6）による代謝を阻害しなかった。

(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

ヒトでの主代謝物であるデスロラタジンの 3-OH デスロラタジンの *in vitro* での抗ヒスタミン作用は、pA_2 値に基づくとデスロラタジンの約 0.3 倍であり、血中存在比（デスロラタジンの約 60%）を考慮すると、未変化体が主に薬効に寄与しているものと考えられた。

日本人健康成人男性 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、3-OH デスロラタジンの薬物動態パラメータは下記のとおりであった。

表　デスロラタジン錠 5mg を空腹時 1 日 1 回 10 日間反復経口投与したときの 3-OH デスロラタジン薬物動態パラメータ

	例数	T_{max} † (hr)	C_{max} ‡ (ng/mL)	AUC_{0-24hr} ‡ (ng･hr/mL)	$t_{1/2}$ ‡ (hr)
1 日目	8	6.00［2.5-8］	1.12（41）	15.4（34）	－
10 日目	8	4.50［1-6］	1.89（16）	30.9（14）	32.7（16）

† 中央値［最小値-最大値］
‡ 幾何平均（%CV）

7．排泄

健康成人男性（外国人 5 例）に ^{14}C-デスロラタジン 10mg を空腹時に単回経口投与したとき、240 時間までに投与放射能の 87.1%が代謝物として尿中（40.6%）及び糞中（46.5%）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[20)]。

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

8．トランスポーターに関する情報

デスロラタジンの臨床用量では、デスロラタジンは P-糖蛋白を介した他の薬物の輸送に影響を及ぼさないことが示唆された。

9．透析等による除去率

デスロラタジンは血液透析によってほとんど除去されず、末期腎不全患者（外国人 6 例）にデスロラタジン錠 7.5mg を単回投与後 4～8 時間に実施した血液透析による除去率は、投与量の約 0.3%（算術平均）であった。

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

10．特定の背景を有する患者

1)小児（外国人）

健康な小児（24 例、年齢：12～17 歳）及び成人（12 例、年齢：18～45 歳）に、デスロラタジン錠 5mg を単回経口投与した結果、血漿中デスロラタジン濃度はいずれも投与後 2 時間（T_{max} の中央値）に最高値を示した。小児及び成人におけるデスロラタジンの薬物動態は、概して類似していた。

表　健康小児及び健康成人にデスロラタジン錠 5mg を単回経口投与したときの薬物動態パラメータ（外国人）

	例数	T_{max} † (hr)	C_{max} ‡ (ng/mL)	AUC_{0-last} ‡ (ng･hr/mL)
小児	24	2.00	2.27（34）	48.4（41）
成人	12	2.00	2.18（28）	53.7（54）

† 中央値
‡ 幾何平均（%CV）

2)高齢者（外国人）

健康な高齢者(17 例、年齢：65～70 歳）にデスロラタジン錠 5mg 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[21]。

表　健康成人にデスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 10 日間反復投与したときの 10 日目における年齢ごとのデスロラタジンの薬物動態パラメータ（外国人）

年齢		例数	T_{max}† (hr)	C_{max}‡ (ng/mL)	AUC_{0-24hr}‡ (ng･hr/mL)	$t_{1/2}$‡ (hr)
非高齢	19～45 歳	65	3.00［1-8］	3.47（43）	46.8（55）	23.5（34）
	46～64 歳	30	2.00［1-6］	3.61（41）	49.9（43）	25.9（13）
高齢者（65～70 歳）		17	2.00［1-5］	4.34（41）	59.2（50）	31.0（36）

† 中央値[最小値-最大値]
‡ 幾何平均（%CV）

3)肝機能障害患者（外国人）

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）及び肝機能が正常な健康成人（8 例）にデスロラタジン錠 7.5mg 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[22]。

表　肝機能障害患者にデスロラタジン錠 7.5mg を単回投与したとき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)	$AUC_{0-\infty}$‡ (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）

中等度（Child-Pugh スコア：7～9）の慢性肝機能障害患者（12 例）及び肝機能が正常な健康成人（9 例）にデスロラタジン錠 5mg 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。肝機能障害患者では、健康成人と比較して C_{max} 及び AUC がいずれも約 1.4 倍に上昇した。

表　肝機能障害患者にデスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 10 日間反復投与したとき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_{0-24hr}‡ (ng･hr/mL)	$t_{1/2}$‡ (hr)
中等度	12	4.50[0.5-12]	7.31(43)	120　(41)	46.7(24)
正常	9	6.00[1.5- 8]	5.31(76)	84.1(113)	44.8(60)

† 中央値［最小値-最大値］
‡ 幾何平均（%CV）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

4)腎機能障害患者（外国人）

血液透析を受けている末期腎不全患者を含む重症度の異なる慢性腎機能障害患者(各 6～7 例)及び腎機能が正常な健康成人(12 例)にデスロラタジン錠 7.5mg を単回投与したとき、軽度腎機能障害患者[クレアチニンクリアランス（CLcr）：51～80mL/min/1.73m^2]と中等度腎機能障害患者（CLcr：30～50mL/min/1.73m^2）の間でデスロラタジンの曝露量の違いはほとんど認められなかったが、重度腎機能障害患者（CLcr：<30mL/min/1.73m^2）では、健康成人と比べ、C_{max}及び AUC の中央値がそれぞれ約 1.8 倍及び約 2.5 倍上昇した。

血液透析患者（6 例）にデスロラタジン錠 7.5mg を空腹時に単回経口投与後 4～8 時間（計 4 時間）に血液透析を行ったとき、デスロラタジンは透析液中にほとんど排出されなかった。

表　腎機能障害患者にデスロラタジン錠 7.5mg を単回投与したときの薬物動態パラメータ（外国人）

腎機能障害	CLcr (mL/min/1.73m^2)	例数	T_{max}† (hr)	C_{max}‡ (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$‡ (ng･hr/mL)
軽度	51～80	7	6.00[1.5-8]	4.35(33)	153　(110)
中等度	30～50	6	4.00[1-8]	4.97(44)	146　(101)
重度	<30	6	2.00[1-6]	6.08(22)	150　(40)
透析患者（末期腎不全）	透析実施せず	6	3.00[1-4]	5.32(47)	128　(39)
	4 時間透析	6	4.00[2-4.5]	4.68(26)	113　(40)
正常	>80	12	2.00[1-6]	3.50(31)	61.5(32)

† 中央値［最小値-最大値］
‡ 幾何平均（%CV）

軽度（CLcr：51～80mL/min/1.73m^2、6 例）、中等度（CLcr：30～50mL/min/1.73m^2、6 例）又は重度（CLcr：10～29mL/min/1.73m^2、6 例）の慢性腎機能障害患者にデスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 14 日間反復経口投与したとき、腎機能が正常な健康成人（CLcr：>80mL/min/1.73m^2、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[23]。

表　腎機能障害患者にデスロラタジン錠 5mg を 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	CLcr (mL/min/1.73m^2)	例数	T_{max}† (hr)	C_{max}‡ (ng/mL)	AUC_{0-24hr}‡ (ng･hr/mL)	C_{max}比§	AUC_{0-24hr}比§
軽度	51～80	6	3.50［1.5- 5］	4.33（21）	59.9（28）	1.32[0.74-2.35]	1.46[0.92-2.33]
中等度	30～50	6	3.00［1.5-12］	6.11（73）	95.8（104）	2.10[1.18- 3.76]	2.06[1.29-3.29]
重度	10～29	6	1.75［1.5- 5］	7.61（70）	120　（89）	2.64[1.48- 4.71]	2.57[1.61-4.09]
正常	>80	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）
§ 幾何平均比（軽度、中等度、重度の腎機能障害患者／健康成人）［90%信頼区間］

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

11. その他

該当しない

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

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

[解説]
医薬品全般に対する一般的な注意事項として、設定した。
デスロラタジン錠の有効成分であるデスロラタジン及びデスロラタジン錠に含まれる添加剤[注)]又はロラタジンにより過敏症を発現した患者に再投与された場合、アレルギー症状を呈する可能性が高く、ショックなどの重篤な副作用が発現する可能性があるため、デスロラタジン錠を投与しないこと。

注）デスロラタジン錠に含まれる添加剤
リン酸水素カルシウム水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、タルク、乳糖水和物、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 400、三二酸化鉄、黒酸化鉄、カルナウバロウ、サラシミツロウ

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。

[解説]
デスロラタジン錠は長期にわたり投与される可能性があるが、効果が認められないまま漫然と長期投与が行われることのないように記載した。

〈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。

[解説]
「鼻アレルギー診療ガイドライン－通年性鼻炎と花粉症－（改訂第 9 版）」(2020）では「例年、強い花粉症症状を示す症例では初期療法を勧める。予測される花粉飛散量と、最も症状の強い時期における病型、重症度を基に用いる薬剤を選択する」と記載されており、「くしゃみ・鼻漏型では、第 2 世代抗ヒスタミン薬、ケミカルメディエーター遊離抑制薬、鼻噴霧用ステロイド薬を用いる」ことが推奨されている。また、「初期療法の開始時期は、使用する薬剤の効果発現に要する時間と、患者の例年の飛散花粉に対する過敏性を念頭において、第 2 世代抗ヒスタミン薬、抗ロイコトリエン薬、鼻噴霧用ステロイド薬は花粉飛散予測日または症状が少しでも現れた時点で開始」すると記載されている。

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. 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。発作があらわれることがある。[11.1.2 参照]

[解説]
海外におけるプラセボ及び実薬対照の二重盲検比較試験、29 試験を併合し、解析した結果、痙攣及び関連の有害事象の報告はなかった。国内における臨床試験で併合解析を行ったところ、デスロラタジンで、てんかんがみられた(1/505 例[0.2%])が、デスロラタジンとの関連性が否定された症例であった。しかしながら、海外の製造販売後の自発報告(自発報告:2001 年 1 月 15 日～2014 年 1 月 31 日)では、痙攣 47 例(10 万人・年当たり 0.140)、てんかん 22 例(10 万人・年当たり 0.066)、大発作痙攣などが報告されていること、また、デスロラタジンはロラタジンから速やかに代謝されることから、ロラタジンで報告されている痙攣及びてんかんがデスロラタジンでも発現する可能性が否定できないことを鑑み、デスロラタジンの重要な特定されたリスクとして設定した。
(「Ⅷ. 8. (1)重大な副作用と初期症状」の項参照)

(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]

[解説]
海外の臨床試験において、軽度(クレアチニンクリアランス(CLcr):51～80mL/min/1.73m^2、6 例)、中等度(CLcr:30～50mL/min/1.73m^2、6 例)又は重度(CLcr:10～29mL/min/1.73m^2、6 例)の外国人慢性腎機能障害患者にデスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 14 日間反復経口投与したとき、健康成人(CLcr:>80mL/min/1.73m^2、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[23]。したがって、腎障害のある患者では、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。
なお、外国人末期腎不全患者(6 例)にデスロラタジン 7.5mg(承認用量外)を空腹時に単回経口投与後 4～8 時間(計 4 時間)に血液透析を行ったとき、デスロラタジンの除去率は投与量の 0.3%で、ほとんど除去されなかった。
(「Ⅶ. 10. 4)腎機能障害患者(外国人)」及び「Ⅷ. 10. 過量投与」の項参照)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

(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]

[解説]
海外の臨床試験において、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)の外国人慢性肝機能障害患者(各 4 例)及び肝機能が正常な健康成人(8 例)にデスロラタジン 7.5mg(承認用量外)を空腹時に単回経口投与したとき、肝機能障害患者のデスロラタジンの 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。また、別の海外臨床試験において、中等度(Child-Pugh スコア:7～9)の外国人慢性肝機能障害患者(12 例)及び健康成人(9 例)にデスロラタジン錠 5mg を 1 日 1 回 10 日間反復経口投与したとき、肝機能障害患者のデスロラタジンの C_{max} 及び AUC は、健康成人と比較していずれも約 1.4 倍に上昇した[22]。したがって、肝障害のある患者では、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。
(「Ⅶ. 10. 3)肝機能障害患者(外国人)」の項参照)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

(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、ロラタジンを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。

[解説]

動物試験（ラット、ウサギ）において催奇形性は認められていないが、ロラタジンの動物試験（ラット）でデスロラタジンの胎児への移行が報告されていることから、妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、デスロラタジン錠の投与を避けることが望ましい。なお、デスロラタジン錠を投与したすべての臨床試験において妊婦あるいは妊娠している可能性のある女性は除外した。

（「Ⅶ. 5. (2)血液－胎盤関門通過性」、「Ⅸ. 2. (5)生殖発生毒性試験」の項参照）

(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[18)]。

[解説]

海外で実施されたロラタジンの臨床試験において、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。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。

外国人授乳婦（6例）にロラタジン40mg（承認用量外）を単回経口投与したとき、投与後48時間までに微量のロラタジン（投与量の0.01%）及び活性代謝物のデスロラタジン（ロラタジン換算で投与量の0.02%）が母乳中で検出された。ロラタジンとデスロラタジンを合せた母乳中移行率は投与量の 0.03%であった。また、ロラタジン及びデスロラタジンの $AUC_{母乳}/AUC_{血漿}$ 比は、それぞれ1.2及び0.8であった。

（「Ⅶ. 5. (3)乳汁への移行性」の項参照）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

(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。

[解説]

国内において、12歳未満の小児等を対象にした臨床試験が行われていないため、その旨を記載した。

（「Ⅶ. 10. 1)小児（外国人)」の項参照）

(8)高齢者

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

[解説]

外国人高齢者（17例、年齢：65～70歳）にデスロラタジン錠5mg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。また、外国人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。

一般的に高齢者では、腎臓や肝臓等の生理機能が低下しているため、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

（「Ⅶ. 10. 2)高齢者（外国人)」の項参照）

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. 相互作用

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

［解説］

海外の臨床薬物相互作用試験において、外国人健康成人に CYP3A4 の阻害剤（ケトコナゾール経口剤*、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 又はデスロラタジン 7.5mg（承認用量外）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前述のとおりで、すべての薬物動態パラメータの分布範囲は、安全性及び忍容性に基づいて設定した臨床的許容上限（9 倍）の範囲内であった[15)]。したがって、これらのデスロラタジンの曝露量の上昇は、臨床的に意味のあるものではなく、デスロラタジン錠と CYP3A4 又は 2D6 の阻害剤との併用に際しては、いずれの薬剤も用量を調整する必要はないものと考えられる。また、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[16)]。

また、CYP3A4 で代謝を受ける薬物でグレープフルーツの影響が認められることがあるが、外国人健康成人(23 例)にデスロラタジン錠 5mg をグレープフルーツジュース摂取後に単回投与したとき、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）への影響は認められなかった。

しかしながら、エリスロマイシンについては、ロラタジンとの併用によりロラタジン及びデスロラタジンの血漿中濃度の増加がみられており、またデスロラタジンとの併用でもわずかではあるが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増加がみられていること、その増加の機序がいずれも不明であることから併用注意の薬剤名等及び機序・危険因子の項にエリスロマイシンを記載し、注意喚起することとした。

一方、ケトコナゾール*については、デスロラタジンとの併用時にわずかではあるが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増加がみられたことから、機序・危険因子の項にのみ「機序は不明であるが、エリスロマイシン又はケトコナゾールとの併用で血漿中濃度の上昇が認められた。」と記載していたが、新記載要領への電子添文の当局相談を行った結果、当局指導により機序・危険因子の項から薬剤名等の項に記載を移動することとなった（2021 年 4 月）。

＊：ケトコナゾール：国内では外用剤のみ発売

（「Ⅶ. 1. (4)食事・併用薬の影響)」の項参照）

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

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、血管性浮腫等）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）

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。

［解説］

ロラタジンを投与した際、速やかにデスロラタジンに代謝されるため、ロラタジンで報告されている副作用が、デスロラタジン錠投与後に発現する可能性がある。また、海外の市販後において、これらの重大な副作用が報告されているため、異常が認められた場合にはデスロラタジン錠の投与を中止し、適切な処置を行うこと。

（「Ⅷ. 6. (1)合併症・既往歴等のある患者」の項参照）

(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

［解説］

国内第Ⅲ相プラセボ対照試験（P200試験、P201試験及びP204試験）の併合解析でデスロラタジン錠5mg投与例において2例以上認められ、かつプラセボ投与例よりも発現頻度が高かった副作用を、その発現頻度に従い、「2%未満」の列に記載した。また、海外の臨床試験においてプラセボよりも発現頻度が高かった副作用及び海外の市販後において報告された副作用のうち重大な副作用以外の副作用を「頻度不明」として「頻度不明」の列に記載した。

12～23ヵ月の幼児[注)]を対象とした海外臨床試験において、デスロラタジン投与群で食欲亢進がプラセボ群より多くみとめられた。本邦での製造販売後において、本剤との関連性を示唆する報告は無い（2018年1月現在）が、デスロラタジンの薬理作用による食欲への影響が考えられることから、注意喚起のため、「食欲亢進」を追記した（2018年7月）。

注）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

◆副作用発現頻度一覧表

表　副作用の種類別発現頻度一覧（国内第Ⅲ相臨床試験）

副作用	プラセボ対照試験*			長期投与試験**
	5mg	10mg 注1)	プラセボ	5～10mg 注1)
検討症例数（例）	505	282	505	94
副作用発現例数（%）	20（4.0）	17（6.0）	13(2.6)	8（8.5）

副作用の種類	発現例数（%） 注2)			
	プラセボ対照試験*			長期投与試験**
	5mg	10mg 注1)	プラセボ	5～10mg 注1)
神経系障害	6（1.2）	8（2.8）	5(1.0)	5（5.3）
傾眠	5（1.0）	8（2.8）	4(0.8)	4（4.3）
浮動性めまい	1（0.2）	－	－	－
頭痛	－	－	1(0.2)	1（1.1）
呼吸器、胸郭および縦隔障害	1（0.2）	－	－	－
咳嗽	1（0.2）	－	－	－
胃腸障害	2（0.4）	3（1.1）	1(0.2)	－
口内乾燥	1（0.2）	－	1(0.2)	－
便秘	1（0.2）	－	－	－
嚥下障害	－	1（0.4）	－	－
口腔内潰瘍形成	－	1（0.4）	－	－
口内炎	－	1（0.4）	－	－
皮膚および皮下組織障害	－	－	2(0.4)	1（1.1）
発疹	－	－	1(0.2)	－
蕁麻疹	－	－	1(0.2)	－
皮脂欠乏性湿疹	－	－	－	1（1.1）
一般・全身障害および投与部位の状態	1（0.2）	3（1.1）	1(0.2)	1（1.1）
口渇	1（0.2）	3（1.1）	1(0.2)	1（1.1）
異常感	－	－	－	1（1.1）
肝胆道系障害	－	2（0.7）	－	－
肝機能異常	－	2（0.7）	－	－
臨床検査	11（2.2）	3（1.1）	7(1.4)	3（3.2）
尿中蛋白陽性	4（0.8）	－	5(1.0)	－
白血球数増加	3（0.6）	－	2(0.4)	－
血中コレステロール増加	2（0.4）	－	－	－
赤血球数増加	1（0.2）	－	－	－
ヘマトクリット増加	1（0.2）	－	－	－
ヘモグロビン増加	1（0.2）	－	－	－
血小板数減少	1（0.2）	－	－	－
γ-グルタミルトランスフェラーゼ増加	1（0.2）	1（0.4）	－	1（1.1）
アラニンアミノトランスフェラーゼ増加	－	1（0.4）	－	1（1.1）
尿中ウロビリノーゲン増加	－	1（0.4）	－	－
血中ビリルビン増加	－	－	1(0.2)	－
アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加	－	－	－	1（1.1）
血中アルブミン減少	－	－	－	1（1.1）
好酸球数増加	－	－	－	1（1.1）
肝酵素上昇	－	－	－	1（1.1）

MedDRA 基本語による集計（MedDRA/J Ver 18.0）
承認時社内集計（承認時評価資料）

*：P200 試験、P204 試験及び P201 試験の併合解析　／　**：P202 試験

注 1）本剤の承認された用法及び用量は、「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。」である。

注 2）同一症例で複数の副作用が発現している。

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 日前から本剤の投与を中止すること。

[解説]

デスロラタジン錠投与中の患者ではヒスタミン H_1 受容体拮抗作用及びヒスタミン、ロイコトリエン等のケミカルメディエーターの遊離抑制作用により、アレルゲン皮内反応が抑制されるため、検査結果が誤って陰性となる可能性がある。アレルゲン皮内反応検査を実施する際には、3～5 日前よりデスロラタジン錠の投与を一時中断し、検査を実施すること。

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。

[解説]

デスロラタジン錠過量投与時の症状は明らかではないが、過量投与が起きた場合は、一般的な薬物除去法によりデスロラタジン錠を除去し、必要に応じて対症療法を行うこと。なお、末期腎不全患者（外国人）に血液透析を行ったとき、デスロラタジンはほとんど除去されなかった。

（「Ⅶ. 9. 透析による除去率」及び「Ⅶ. 10. 4)腎機能障害患者（外国人)」の項参照）

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。

[解説]

デスロラタジン錠には Press Through Package（以下 PTP）包装の仕様があるので、日薬連発第 240 号（平成 8 年 3 月 27 日付）及び第 304 号（平成 8 年 4 月 18 日付）「PTP の誤飲対策について」に従って記載した。錠剤やカプセル剤の PTP シートの誤飲､すなわち患者が PTP シートから薬剤を取り出さず､分割したシートごとに飲み込み、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という誤飲事故が報告されている。こうした事故を防ぐため、薬剤交付時に PTP シートから取り出して服用するよう患者に指導すること。

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」の項参照

(2)安全性薬理試験

一般薬理作用として中枢神経系、心血管系、呼吸器系・胃腸管系・腎泌尿器系に対する作用を検討した。

試験項目	動物/細胞	薬物濃度/用量(投与経路)	試験結果
デスロラタジン			
中枢神経系 マウス行動・神経系	マウス	30、100、300mg/kg(経口)	300mg/kg まで行動、神経、自律神経機能に影響なかった。300mg/kg のみに散瞳、眼瞼下垂がみられ、それより低濃度では影響はなかった。
電撃誘発痙攣	マウス	～320mg/kg(経口)	ED_{50}>160mg/kg 160mg/kg で痙攣抑制作用はなかった。
酢酸ライジング	マウス	～320mg/kg(経口)	ED_{50}=147mg/kg 160mg/kg で 6/10 匹の抑制作用を示し、80mg/kg で抑制作用はなかった(0/10 匹)
フィゾスチグミン誘発致死	マウス	～300mg/kg(経口)	ED_{50}>300mg/kg 300mg/kg まで抑制作用はなかった。
ラット行動・神経系	ラット	1、4、12mg/kg(経口)	行動、神経系及び自律神経系機能への影響はなかった。
モルモット脳波	モルモット	(ロラタジン:3～100mg/kg、静脈内)	脳波への活動抑制はなかった。
心血管系 *In vitro* 試験 K^+チャネル hERG assay	ヒト	10nM～10μM	1μM まで阻害なし。3～10μM で hERG チャネルを 10～15%抑制した。
心室筋細胞の K^+ チャネル	ラット、モルモット	0.25～10μM	ラット及びモルモットの I_{K1}、ラット I_{to}、ラット I_{ped}、モルモット I_{Ks} に対して 1μM まで影響はなかった。
ヒト心臓由来 Kv1.5 発現細胞の K^+チャネル	HEK293 細胞	1～30μM	IC_{50} 値は 5.6μM。
	マウス Ltk^-細胞	1～100μM	Kv1.5 電流を 12.5μM の K_D 値で阻害した。
心室筋細胞の K^+ チャネル	ウサギ	1～30μM	I_{K1} に対して 10μM で影響はなかった。 I_{Kr} に対して 5μM で 50%阻害した。
心室筋細胞の Na^+ チャネル	ウサギ	10μM	10μM で Na^+チャネルを阻害した。
心室乳頭筋の活動電位	モルモット	10～100μM	活動電位持続時間に影響はなかった(～100μM)。活動電位最大立ち上がり速度(V_{max})を減少させた(≧30μM)。
摘出心臓のランゲンドルフ灌流心	ウサギ	0.2、0.5～50μM	0.5μM 以上の濃度で、QT 延長がみられ、経時的に増大した。QT の延長は QRS 群の増大によるものであり、JT には変化はなかった。0.2μM では QRS、QT、JT に変化はなかった。

試験項目	動物/細胞	薬物濃度/用量（投与経路）	試験結果
デスロラタジン（続き）			
心血管系 *In vivo* 試験 血圧、心拍数、心電図	ラット	4、12mg/kg（経口）	血圧、心電図に変化なかった。心拍数は 12mg/kg 群の投与 6 時間後のみに増加がみられたが、その他は変化はなかった。
	ラット	10mg/kg（腹腔内）	血圧、心拍数に変化はなかった。
血圧、心拍数、心電図	モルモット	（ロラタジン:30、100mg/kg）（静脈内）	血圧、心拍数、心電図に変化はなかった。
	モルモット	25mg/kg（静脈内）	血圧、心拍数、心電図に変化はなかった。
心電図	サル	12mg/kg（経口）	PR、QRS 間隔及び QTc 間隔に変化はなかった。RR 間隔が短縮した。
血圧、心拍数、心電図	サル	4、12mg/kg（7 日間反復経口）	投与初日及び 7 日目の血圧、心拍数及び心電図に変化はなかった。
呼吸器系	ラット	4、12mg/kg（経口）	呼吸数、1 回及び分時換気量に変化はなかった。
	ラット	1、4、12mg/kg（経口）	呼吸の有意な変化はなかった。
胃腸管系	ラット	4、12mg/kg（経口）	胃内容排出能、小腸炭末輸送能に変化はなかった。胃潰瘍誘発作用はなかった。
腎・泌尿器系	ラット	4、12mg/kg（経口）	尿量、尿中 Na^+及び K^+排出量、クレアチニン・クリアランス、尿中グルコース、ビリルビン、ケトン、pH 及び蛋白質に変化はなかった。
代謝物（3-OH デスロラタジン）			
一般症状及び行動	マウス	3、10、30、100mg/kg（腹腔内）	100mg/kg まで作用はなかった。
血圧・心拍数	ラット	10mg/kg（腹腔内）	血圧、心拍数に影響はなかった。

(3)その他の薬理試験

副次的薬理試験（参考情報）

試験項目	動物/細胞	薬物濃度/用量 （投与経路）	試験結果
非鎮静性	モルモット	DL：6mg/kg L：6mg/kg CP：2mg/kg （腹腔内）	CP は摘出脳膜標品への ^{3}H-メピラミンの結合を阻害したが、DL 及び L は阻害しなかった。
各種受容体、イオンチャネル、細胞増殖、酵素等に対する作用	各種膜標品、細胞、酵素等	スクリーニング：1,10μM 濃度依存性：0.001～10μM （*in vitro*）	1μM で大部分の受容体、イオンチャネル、細胞増殖、酵素等に対して親和性又は阻害作用を示さなかった。
ムスカリン及びヒスタミンのサブタイプ受容体に対する親和性	ヒト遺伝子組換えムスカリン受容体膜標品 モルモットヒスタミン受容体膜標品	（*In vitro*）	ムスカリンの各サブタイプ受容体及びヒスタミン H_2 受容体に対する DL の K_i 値は 47～353nM、モルモット脳及び肺ヒスタミン H_1 受容体に対する K_i 値は、それぞれ 5.7 及び 13nM であった。
抗コリン作用 *In vitro* 抗コリン作用	ラット摘出子宮	DL：1、10μM L：10、100μM A:0.1、1μM （*in vitro*）	ラット摘出子宮のアセチルコリン誘発収縮に対する DL の pA_2 値は 6.2、L は 5.3、A は 8.0 であった。
	モルモット摘出回腸	（*in vitro*）	モルモット摘出回腸のアセチルコリン誘発収縮に対する DL の pA_2 値は 7.9、L は 6.1、T は 6.6、A は 8.5 であった。
	モルモット摘出右心房	DL：0.1～300μM L：0.1～1000μM T：0.1～100μM A：0.1～1000μM DPH:0.1～1000μM （*in vitro*）	モルモット摘出右心房のアセチルコリン誘発の拍動減少に対する DL の pA_2 値は 6.8、L 及び T は 10μM で活性はなく（pA_2 値<5）、A は 9.0、DPH は 6.7 であった。
In vivo 抗コリン作用	マウス	30、100、300mg/kg （経口）	最高用量の 300mg/kg にのみ散瞳及び眼瞼下垂がみられた。
	マウス	～300mg/kg （経口）	フィゾスチグミン誘発致死に対する防御作用は最高用量の 300mg/kg までなかった。
	マウス	0.01、0.1、1.0、5.0mg/kg （腹腔内）	オキソトレモリン誘導の振戦を 5.0mg/kg で 30%阻害したが、1.0mg/kg 以下では変化はなかった。同時に誘導される流涎及び流涙を 5.0mg/kg で阻害しなかった。フェニレフリンの前処理により、1.0mg/kg で振戦を 60%阻害した。

A：アトロピン、CP：クロルフェニラミン、DL：デスロラタジン、DPH：ジフェンヒドラミン、L：ロラタジン、T：テルフェナジン

2. 毒性試験

(1)単回投与毒性試験

デスロラタジンを経口投与した際の概略の致死量は、マウスで500mg/kg、ラットの雄で250mg/kg、雌で500mg/kgであり、臨床用量の5mg/日（ヒトの体重を50kgとした場合の0.1mg/kgに相当）に比較して著しく高く、それぞれ5000、2500及び5000倍に相当した。
カニクイザルを用いた経口投与試験において、23.5mg/kg 以上の投与で嘔吐がみられた。嘔吐がみられなかった用量（11.75mg/kg）は臨床用量の118倍に相当した。サルにおける同用量での曝露量（C_{max}）は、臨床用量をヒトに反復投与（単回・反復投与試験：P191 試験）した際の C_{max}（4.21ng/mL）の約87倍に相当した。

概略の致死量

動物種	投与経路	投与量(mg/kg)	概略の致死量(mg/kg)	
			雄	雌
マウス	腹腔内	0、25、50、125、250、500	50	50
	経口	0、50、125、250、500	500	500
ラット	腹腔内	0、25、50、125、250、500	125	50
	経口	0、50、125、250、500、2000	250	500
サル	経口	0、11.75、23.5、46.9、93.75、125、250（漸増投与）	>250	>250

(2)反復投与毒性試験

動物種	投与経路	投与期間	投与量（mg/kg/日）	無毒性量（mg/kg/日）	主な毒性所見
ラット	経口	3ヵ月	0、3、30、60、120	3	≧30mg/kg/日：死亡及び全身状態悪化、糞便の変化（抗コリン作用に関連）、体重増加抑制、リン脂質症、肝細胞肥大、精子低形成 ≧60mg/kg/日：摂餌量減少、尿細管の細胞壊死・拡張・円柱、骨格筋の筋線維変性・筋線維化・単核細胞浸潤、子宮成熟遅延
サル	経口	3ヵ月	0、6、12、18/24*	6	≧12mg/kg/日：リン脂質症 18/24mg/kg/日：糞便の変化

＊：18mg/kg/日で5週間投与後、一般状態に変化がみられなかったため、投与6週目に24mg/kg/日に増量した。

(3)遺伝毒性試験

デスロラタジンの遺伝毒性について、ネズミチフス菌及び大腸菌を用いた復帰突然変異試験、ヒト末梢血リンパ球を用いた染色体異常試験及びマウス骨髄の多染性赤血球を用いた小核試験において、細胞毒性又は骨髄毒性が認められる用量まで検討した結果、いずれの試験においても遺伝毒性は認められなかった。

(4)がん原性試験

デスロラタジンを用いたマウス 2 年間投与がん原性試験（投与量；雄：4、16 及び 48mg/kg/日、雌：10、32 及び 96mg/kg/日）を実施した。高用量（雄 48mg/kg/日、雌 96 mg/kg/日）群では多数の死亡が観察されたことから、これらの用量は最大耐量を超えていると考えられた。最大耐量を超える用量まで投与した本がん原性試験において、がん原性を示唆する変化は認められなかった。

なお、最高用量（96mg/kg/日）での曝露量（51400ng･hr/mL）は臨床曝露量の 1084 倍に相当した。

〈参考〉

デスロラタジンを用いたラットのがん原性試験を実施していないが、ロラタジンを用いて実施したラットがん原性試験でデスロラタジンの十分な曝露量が得られていることから、同試験の成績を利用可能と考えた。ロラタジンを用いて実施したラットのがん原性試験で、ヒトでのがん原性を示唆する変化は認められなかった。最高用量を投与した際のデスロラタジンの曝露量（7017ng･hr/mL）は臨床曝露量の 148 倍に相当した。

(5)生殖発生毒性試験

1)受胎能及び着床までの初期胚発生に関する試験

動物種	投与期間	投与経路	投与量（mg/kg/日）1 日 1 回投与	無毒性量[a)]（mg/kg/日）	主な毒性所見[a)]
ラット	雄：交配前 28 日から交配期間終了[b)] 雌：交配 14 日前から妊娠 7 日	経口	0、6、12、24	親動物の一般毒性 雄：24 雌：12 雌雄生殖毒性：12	雌：24mg/kg/日で体重増加抑制、摂餌量減少、着床前死亡の増加を伴う着床数・生存胚数の減少

a）抗コリン作用に関連する糞便の変化を除く

b）合計 43～49 日間

2)胚・胎児発生に関する試験

動物種	投与期間	投与経路	投与量（mg/kg/日）1 日 1 回投与	無毒性量[a)]（mg/kg/日）	主な毒性所見[a)]
ラット	妊娠 6 日から 15 日	経口	0、6、24、48	・母動物の一般毒性：6 ・胚・胎児発生：6	・母動物：≧24mg/kg/日で体重増加抑制、摂餌量減少 ・胚・胎児：≧24mg/kg/日で体重減少、未骨化・不完全骨化の発現頻度の増加（子宮内の胎児の成長遅延に関連） ・催奇形性を示唆する変化なし
ウサギ	妊娠 7 日から 19 日	経口	0、15、30、60	・母動物の一般毒性：30 ・胚・胎児発生：30	・母動物：60mg/kg/日で体重増加抑制、摂餌量減少 ・胚・胎児：60mg/kg/日で吸収胚数のごく軽度の増加 ・催奇形性を示唆する変化なし

a）抗コリン作用に関連する糞便の変化を除く

3)出生前及び出生後の発生並びに母体の機能に関する試験

動物種	投与期間	投与経路	投与量 (mg/kg/日) 1日1回投与	無毒性量[a)] (mg/kg/日)	主な毒性所見[a)]
ラット	妊娠6日から授乳21日	経口	0、3、9、18	・母動物の一般毒性：9 ・母動物生殖能及び出生児発生：3	・母動物：18mg/kg/日で体重増加抑制、摂餌量軽度減少 ・出生児：≧9mg/kg/日で軽度の低体重及び正向反射獲得の軽度遅延、18mg/kg/日で生後1～4日の生存率の軽度低下 ・F_1世代の生殖、F_2世代の発生への潜在的な影響なし

a) 抗コリン作用に関連する糞便の変化を除く

(6)局所刺激性試験

該当資料なし

(7)その他の特殊毒性

1)代謝物の毒性

3-OHデスロラタジンの遺伝毒性について、ネズミチフス菌及び大腸菌を用いた復帰突然変異試験及びマウス骨髄の多染性赤血球を用いた小核試験において、細胞毒性又は骨髄毒性が認められる用量まで検討した結果、いずれの試験においても遺伝毒性は認められなかった。

2)不純物の毒性

デスロラタジンの原薬及び製剤で規格設定した不純物の安全性を確認するため、不純物を添加して規格値以上の不純物を含むデスロラタジン原薬を用いてラット及びサルの1ヵ月間反復経口投与試験、細菌を用いた復帰突然変異試験及びヒト末梢血リンパ球を用いた染色体異常試験を実施した。

不純物添加原薬と無添加原薬を用いたラット及びサルの1ヵ月間投与試験では、いずれの試験においても、不純物の添加により、デスロラタジンの毒性プロファイルは変化しなかった。復帰突然変異試験及び染色体異常試験では、いずれの試験においても、不純物を添加した原薬に遺伝毒性は認められなかった。

以上、原薬及び製剤に規格設定した不純物は、その規格値以下であれば、安全性上の懸念はないことを確認した。

Ⅹ. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製　　剤：デザレックス®錠 5mg　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
有 効 成 分：デスロラタジン　劇薬

2. 有効期間

2 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意
外箱開封後は遮光して保存すること。

［解説］
本剤は、PTP 包装の状態で、光により類縁物質の増加が認められている。
（「Ⅳ. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

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：なし

6. 同一成分・同効薬

同 一 成 分 薬：なし
同　効　薬：ロラタジン（クラリチン）、フェキソフェナジン塩酸塩（アレグラ）、オロパタジン塩酸塩（アレロック）、セチリジン塩酸塩（ジルテック）、レボセチリジン塩酸塩（ザイザル）、エピナスチン塩酸塩（アレジオン）、エバスチン（エバステル）、ベポタスチンベシル酸塩（タリオン）、オキサトミド、アゼラスチン塩酸塩（アゼプチン）、ケトチフェンフマル酸塩（ザジテン）、エメダスチンフマル酸塩（レミカット）、ビラスチン（ビラノア）、ルパタジン（ルパフィン）等

7. 国際誕生年月日

2000 年 9 月 27 日

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

販売名	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
デザレックス®錠 5mg	2016 年 9 月 28 日	22800AMX00687000	2016 年 11 月 18 日	2016 年 11 月 18 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

再審査結果通知年月日：2025（令和 7）年 12 月 10 日

内　容：カテゴリー1（医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しない。）と判断した。

11. 再審査期間

8 年：2016 年 9 月 28 日～2024 年 9 月 27 日（終了）

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第 97 号(平成 20 年 3 月 19 日付)に基づく「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

13. 各種コード

販売名	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（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
デザレックス®錠 5mg	4490032F1023	4490032F1023	125149401	622514901

14. 保険給付上の注意

該当しない

ＸＩ．文献

１．引用文献

1) 社内資料：日中の傾眠及び精神運動機能への影響評価試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
2) 社内資料：睡眠潜時反復検査（MSLT）評価試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
3) 社内資料：操縦能力への影響評価試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD2.7.2.2
4) 社内資料：自動車運転能力への影響評価試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
5) 社内資料：高用量心電図試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
6) Anthes J.C., et al. :Eur J Pharmacol. 2002 ;449 :229-237 (PMID:12167464)
7) Kreutner W., et al. :Arzneimittelforschung. 2000 ;50 :345-352 (PMID:10800633)
8) Kleine-Tebbe J., et al. :J Allergy Clin Immunol. 1994 ;93 :494-500 (PMID:7509820)
9) Genovese A., et al. :Clin Exp Allergy. 1997 ;27 :559-567 (PMID:9179431)
10) Lippert U., et al. :Exp Dermatol. 1995 ;4 :272-276 (PMID:8528601)
11) Schroeder J.T., et al. :Clin Exp Allergy. 2001 ;31 :1369-1377 (PMID:11591186)
12) Molet S., et al. :Clin Exp Allergy. 1997 ;27 :1167-1174 (PMID:9383257)
13) 社内資料：日本人での単回及び反復投与試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
14) 社内資料：食事の影響．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.1.2
15) 社内資料：薬物相互作用試験（薬物動態）．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD2.7.2.2
16) 社内資料：薬物相互作用試験（薬力学）．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD2.7.6.2
17) 社内資料：分布容積．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.3
18) Hilbert J., et al. :J Clin Pharmacol. 1988 ;28 :234-239 (PMID:2966185)
19) 社内資料：血漿蛋白結合．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.6.4.4
20) 社内資料：マスバランス試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
21) 社内資料：高齢者を含む健康成人を対象とした試験．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
22) 社内資料：肝機能障害による影響．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2
23) 社内資料：腎機能障害による影響．2016 年 9 月 28 日承認 ;CTD 2.7.2.2

２．その他の参考文献

「Ⅰ．1．開発の経緯」に関する参考資料　第二世代抗ヒスタミン薬

参 1) 日本耳鼻咽喉科免疫アレルギー学会編．鼻アレルギー診療ガイドライン－通年性鼻炎と花粉症－．2020 年版

ⅩⅡ. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。国内の承認内容の範囲で本剤を使用すること。

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
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。

海外での主な承認状況（2023年1月時点）

国名	販売名	承認年月日*	剤形・含量	効能又は効果	用法及び用量
米国	・CLARINEX® Tablets ・CLARINEX® Oral Solution	2001年12月21日	・錠剤 5mg ・経口液剤 0.5mg/mL	・季節性アレルギー性鼻炎の鼻症状及び非鼻症状の緩和 ・通年性アレルギー性鼻炎の鼻症状及び非鼻症状の緩和 ・慢性特発性蕁麻疹のそう痒症症状の緩和、蕁麻疹の個数の減少、及び蕁麻疹の大きさの縮小	・錠剤 12歳以上:1日1回1錠を服用する。 ・経口液剤 12歳以上:1日1回小さじ2杯(10mL中に5mg含有）を服用する。 6～11歳：1日1回小さじ1杯（5mL中に2.5mg含有）を服用する。 12ヵ月～5歳：1日1回小さじ½杯（2.5mL中に1.25mg含有)を服用する。 6～11ヵ月：1日1回2mL（1mg）を服用する。
EU	・Aerius 5mg film-coated tablets ・Aerius 2.5mg orodispersible tablets ・Aerius 5mg orodispersible tablets ・Aerius 0.5mg/mL oral solution	2001年1月15日	・フィルムコーティング錠 5mg ・口腔内崩壊錠 2.5mg及び5mg ・経口液剤 0.5mg/mL	・アレルギー性鼻炎 ・蕁麻疹	・フィルムコーティング錠 5mg 成人及び小児(12歳以上):1日1回1錠を服用する。 ・口腔内崩壊錠 2.5mg 成人及び小児(12歳以上):1日1回2錠を服用する。 小児(6歳以上11歳以下):1日1回1錠を服用する。 ・口腔内崩壊錠 5mg 成人及び小児(12歳以上):1日1回1錠を服用する。 ・経口液剤 成人及び小児(12歳以上):1日1回10mL（5mg）を服用する。 小児（1歳以上5歳以下):1日1回2.5mL（1.25mg）を服用する。 小児(6歳以上11歳以下):1日1回5mL（2.5mg）を服用する。
カナダ	・AERIUS® ・AERIUS KIDS®	2001年5月29日	・錠剤 5mg ・シロップ剤 0.5mg/mL	・アレルギー性鼻炎に伴う複数の鼻症状及び非鼻症状 ・慢性特発性蕁麻疹に伴う症状	・錠剤 成人及び小児(12歳以上):1日1回1錠を服用する。 ・シロップ剤 小児（2歳以上5歳以下):1日1回2.5mL（1.25mg）を服用する。 小児(6歳以上11歳以下):1日1回5mL（2.5mg）を服用する。

*：複数の効能又は効果のうちの最初の承認日

2023年1月現在、米国、欧州連合（EU）（英国、ドイツ、フランス等）、カナダ（処方箋の必要がない医薬品として承認されている）等を含む120以上の国や地域で承認されている。
なお、2023年1月時点で、102ヵ国で発売されているが、DESALEX®の名称が使用されているのは、日本、ブラジル、コロンビアの3ヵ国である。

2．海外における臨床支援情報

1)妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

日本の電子添文の「9.5妊婦」、「9.6授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、米国FDA、オーストラリア分類とは異なる。

9.特定の背景を有する患者に関する注意
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、ロラタジンを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。
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[18)]。

FDA（米国添付文書の記載）
desloratadine（CLARINEX Tablets-5mg、CLARINEX Oral Solution -0.5mg/1mL：2022年8月改訂）

8.1 Pregnancy

Risk Summary

The limited available data with CLARINEX in pregnant women are not sufficient to inform a drug-associated risk for major birth defects and miscarriage. There are no adequate and well-controlled studies in pregnant women. Desloratadine given during organogenesis to pregnant rats was not teratogenic at the summed area under the concentration-time curve (AUC)-based exposures of desloratadine and its metabolite approximately 320 times that at the recommended human daily oral dose (RHD) of 5 mg/day. Desloratadine given during organogenesis to pregnant rabbits was not teratogenic at the AUC-based exposures of desloratadine approximately 230 times that at the RHD. Desloratadine given to pregnant rats during organogenesis through lactation resulted in reduced body weight and slow righting reflex of F1 pups at the summed AUC-based exposures of desloratadine and its metabolite approximately 70 times or greater than that at the RHD *[see Data]*.
The estimated background risk of major birth defects and miscarriage for the indicated populations is unknown. In the U.S. general population, the estimated background risk of major birth defects and miscarriage in clinically recognized pregnancies is 2-4% and 15-20%, respectively.

Data

Animal Data

Desloratadine was given orally during organogenesis to pregnant rats at doses of 6, 24 and 48 mg/kg/day (approximately 50, 200 and 320 times the summed AUC-based exposure of desloratadine and its metabolite at the RHD). No fetal malformations were present. Reduced fetal weights and skeletal variations noted at doses of 24 and 48 mg/kg/day were likely secondary to the maternal toxicities of reduced body weight gain and food consumption observed at the same doses. Desloratadine was also given orally during organogenesis to pregnant rabbits at doses of 15, 30 and 60 mg/kg/day (approximately 30, 70 and 230 times the AUC-based exposure of desloratadine at the RHD). No adverse effects to the fetus were noted. Reduced maternal body weight gain was noted in rabbits at 60 mg/kg/day. In a peri-and post-natal development study, desloratadine was given to rats orally during the perinatal (Gestation Day 6) through lactation periods (Postpartum Day 21) at doses of 3, 9 and 18 mg/kg/day. Reduced body weight and slow righting reflex were reported in F1 pups at doses of 9 mg/kg/day or greater (approximately 70 times or greater than the summed AUC-based exposure of desloratadine and its

metabolite at the RHD). Desloratadine had no effect on F1 pup development at 3 mg/kg/day (approximately 10 times the summed AUC-based exposure of desloratadine and its metabolite at the RHD). Maternal toxicities including reduced body weight gain and food consumption were noted at 18 mg/kg/day for F0 dams. F1 offspring were subsequently mated and there was no developmental toxicity for F2 pups observed.

8.2 Lactation

Risk Summary

Desloratadine passes into breast milk. There are not sufficient data on the effects of desloratadine on the breastfed infant or the effects of desloratadine on milk production. The decision should be made whether to discontinue nursing or to discontinue desloratadine, taking into account the developmental and health benefits of breastfeeding, the nursing mother's clinical need, and any potential adverse effects on the breastfed infant from desloratadine or from the underlying maternal condition.

(2026年6月8日時点)

オーストラリアの分類:An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy

B1

B1:Drugs which have been teken 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.

(2026年6月8日時点)

2)小児等に関する記載

日本の電子添文の記載は以下のとおりであり、米国添付文書とは異なる。

9.特定の背景を有する患者に関する注意

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。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2022 年 8 月)	**8. USE IN SPECIFIC POPULATIONS** **8.4 Pediatric Use** The recommended dose of CLARINEX Oral Solution in the pediatric population is based on cross-study comparison of the plasma concentration of CLARINEX in adults and pediatric subjects. The safety of CLARINEX Oral Solution has been established in 246 pediatric subjects aged 6 months to 11 years in three placebo-controlled clinical studies. Since the course of seasonal and perennial allergic rhinitis and chronic idiopathic urticaria and the effects of CLARINEX are sufficiently similar in the pediatric and adult populations, it allows extrapolation from the adult efficacy data to pediatric patients. The effectiveness of CLARINEX Oral Solution in these age groups is supported by evidence from adequate and well-controlled studies of CLARINEX Tablets in adults. The safety and effectiveness of CLARINEX Tablets or CLARINEX Oral Solution have not been demonstrated in pediatric patients less than 6 months of age. *[See Clinical Pharmacology (12.3).]* The CLARINEX RediTabs 2.5-mg tablet has not been evaluated in pediatric patients. Bioequivalence of the CLARINEX RediTabs Tablet and the previously marketed RediTabs Tablet was established in adults. In conjunction with the dose-finding studies in pediatrics described, the pharmacokinetic data for CLARINEX RediTabs supports the use of the 2.5-mg dose strength in pediatric patients 6 to 11 years of age.

(2026 年 6 月 8 日時点)

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

(1) 粉砕

錠剤が粉砕された状態での薬物動態試験、有効性試験、安全性試験は実施されておらず、その有効性・安全性を評価する情報は存在しない。
以上の理由により、デスロラタジン錠の粉砕投与は推奨されない。

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

弊社インターネットサイト

・医療従事者向けサイト（電子添文、インタビューフォーム、剤形写真、お知らせ、製品コード等）
https://www.kyorin-pharm.co.jp/prodinfo/

製造販売元
オルガノン株式会社
東京都港区南青山1−24−3
発売元
杏林製薬株式会社
東京都千代田区大手町一丁目3番7号