

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

抗アレルギー点眼剤

オロパタジン点眼液0.1%「サンド」

Olopatadine Ophthalmic Solution 0.1% [SANDOZ]

＜オロパタジン塩酸塩点眼液＞

剤形	水性点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	オロパタジン点眼液0.1%「サンド」 1mL中に日局オロパタジン塩酸塩1.1mg（オロパタジンとして1mg）を含有する。
一般名	和名：オロパタジン塩酸塩 洋名：Olopatadine Hydrochloride
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日：2019年 2月15日 薬価基準収載年月日：2021年12月10日 発売年月日：2021年12月10日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：サンド株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	サンド株式会社 カスタマーケアグループ TEL 0120-982-001 FAX 03-6257-3633 受付時間：9：00～17：00（土・日、祝日及び当社休日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.sandoz.jp/medical/index.html

本IFは2021年8月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ（医薬品に関する情報）

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IFの様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」（以下、「IF記載要領2013」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	3
5. 化学名（命名法）	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5
3. 有効成分の確認試験法	5
4. 有効成分の定量法	5
IV. 製剤に関する項目	6
1. 剤形	6
2. 製剤の組成	6
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	7
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7
5. 製剤の各種条件下における安定性 ¹⁾	7
6. 溶解後の安定性	8
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	8
8. 溶出性	8
9. 生物学的試験法	8
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	8
11. 製剤中の有効成分の定量法	8
12. 力価	8
13. 混入する可能性のある夾雑物	8
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8
15. 刺激性	8
16. その他	8

V. 治療に関する項目	9
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9
3. 臨床成績	9
VI. 薬効薬理に関する項目	13
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	13
2. 薬理作用	13
VII. 薬物動態に関する項目	14
1. 血中濃度の推移・測定法	14
2. 薬物速度論的パラメータ	15
3. 吸収	17
4. 分布	17
5. 代謝	19
6. 排泄	20
7. トランスポーターに関する情報	20
8. 透析等による除去率	21
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	22
1. 警告内容とその理由	22
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	22
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	22
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	22
5. 慎重投与内容とその理由	22
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	22
7. 相互作用	22
8. 副作用	23
9. 高齢者への投与	24
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	24
11. 小児等への投与	24
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	24
13. 過量投与	24
14. 適用上の注意	25
15. その他の注意	25
16. その他	25
IX. 非臨床試験に関する項目	26
1. 薬理試験	26
2. 毒性試験	26

X. 管理的事項に関する項目	28
1. 規制区分	28
2. 有効期間又は使用期限	28
3. 貯法・保存条件	28
4. 薬剤取扱い上の注意点	28
5. 承認条件等	28
6. 包装	28
7. 容器の材質	29
8. 同一成分・同効薬	29
9. 国際誕生年月日	29
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	29
11. 薬価基準収載年月日	29
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	29
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	29
14. 再審査期間	29
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	30
16. 各種コード	30
17. 保険給付上の注意	30
X I. 文献	31
1. 引用文献	31
2. その他の参考文献	31
X II. 参考資料	32
1. 主な外国での発売状況	32
2. 海外における臨床支援情報	32
X III. 備考	33
その他の関連資料	33

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オロパタジン塩酸塩は、選択的な抗ヒスタミン作用とともに化学伝達物質の遊離・産生抑制作用などの広範囲な薬理作用を有する。

オロパタジン塩酸塩の薬理作用から、点眼剤とした場合のアレルギー性結膜炎に対する臨床応用が期待された。

オロパタジン点眼液 0.1%「サンド」は、2019年2月に製造販売承認を取得し、2021年12月に上市した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- ・アレルギー性結膜炎への高い効果を発揮する。（「V-3. 臨床成績」の項参照）
- ・選択的な抗ヒスタミン作用を示す（*in vitro*）。（「VI-2. 薬理作用 (2)薬効を裏付ける試験成績」の項参照）
- ・化学伝達物質遊離抑制作用を示す（「VI-2. 薬理作用 (2)薬効を裏付ける試験成績」の項参照）
- ・涙液に近い液性を有する。（「IV-1. 剤形 (5)pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等」の項参照）
- ・承認時までの臨床試験において、安全性評価対象例 803 例中、39 例（4.9%）に副作用が認められた。主な副作用は眼局所における眼痛 17 件（2.1%）であった。眼局所以外は頭痛 2 件（0.2%）、また、点眼前後で臨床検査の測定がなされた 736 例中、ALT (GPT) 上昇 2 件（0.3%）が認められた（パタノール点眼液 0.1%の承認時）。

使用成績調査及び特定使用成績調査において、安全性評価対象例 3512 例中、22 例（0.6%）に副作用が認められた。主な副作用は、眼刺激 5 件（0.1%）、眼痛 5 件（0.1%）、眼瞼炎 3 件（0.1%）、眼瞼浮腫 3 件（0.1%）、眼そう痒症 2 件（0.1%）等であった。なお、安全性評価対象例のうち、小児に対する投与例数 721 例中 4 例（0.6%）5 件に副作用が認められた。その内訳は、1 歳以上 7 歳未満が 195 例中 0 例、7 歳以上 15 歳未満が 526 例中 4 例（0.8%）であった。また、その副作用の内訳は、眼瞼湿疹、眼刺激、眼痛、角膜炎、眼そう痒症の各 1 件であった（パタノール点眼液 0.1%の再審査終了時）。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

オロパタジン点眼液 0.1% 「サンド」

(2) 洋名

Olopatadine Ophthalmic Solution 0.1% [SANDOZ]

(3) 名称の由来

成分名を名称の一部とした。

(一般名+剤形+含量+「社名」)

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

オロパタジン塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

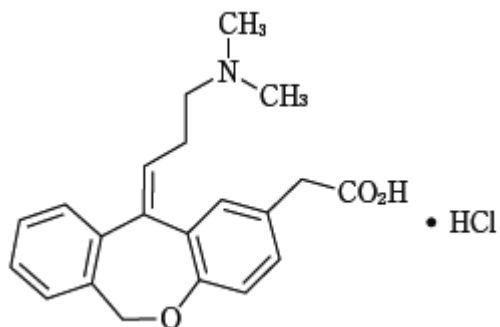
Olopatadine Hydrochloride (JAN)

Olopatadine (INN)

(3) ステム

三環系 H₁ 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 : $C_{21}H_{23}NO_3 \cdot HCl$

分子量 : 373.87

5. 化学名 (命名法)

{11- [(1Z) -3- (Dimethylamino) propylidene] -6,11-dihydrodibenzo [b,e] oxepin-2-yl} acetic acid monohydrochloride

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

「該当資料なし」

7. CAS 登録番号

Olopatadine Hydrochloride : 140462-76-6

Olopatadine : 113806-05-6

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状¹⁾

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性¹⁾

ギ酸に極めて溶けやすく、水にやや溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。

0.01mol/L塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

「該当資料なし」

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：約 250℃(分解)¹⁾

(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¹⁾

1.0g を水 100mL に溶かした液の pH は 2.3~3.3 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

		温度	湿度	光	保存形態	期間	結果
苛 酷 試 験	温 度	60℃			無色ガラス瓶 開栓	3ヵ月	変化なし
	湿 度	25℃	90%RH	暗所	無色ガラス瓶 開栓	3ヵ月	変化なし
	光	25℃		1000 ルクス	シャーレ	3ヵ月	3ヵ月の保存で分解物 がわずかに検出された
長期保存 試験		25℃	60%RH		ポリエチレン 袋+紙袋 密閉	42ヵ月	変化なし
加速 試験		40℃	75%RH		ポリエチレン 袋+紙袋 密閉	6ヵ月	変化なし

RH：相対湿度

3. 有効成分の確認試験法¹⁾

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）

4. 有効成分の定量法¹⁾

電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸）

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

点眼

(2) 剤形の区別、外観及び性状

区別：水性点眼液

外観及び性状：白色～微黄色澄明の無菌水性点眼液

(3) 製剤の物性

「該当資料なし」

(4) 識別コード

「該当しない」

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH：約 7.0

浸透圧比：0.9～1.1（生理食塩液に対する比）

(6) 無菌の有無

無菌製剤

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

オロパタジン点眼液 0.1%「サンド」：

1mL 中 オロパタジン塩酸塩 1.1mg（オロパタジンとして 1mg）

(2) 添加物

日局ベンザルコニウム塩化物、無水リン酸一水素ナトリウム、pH 調節剤、等張化剤

(3) 添付溶解液の組成及び容量

「該当しない」

3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

「該当しない」

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

「該当しない」

5. 製剤の各種条件下における安定性²⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度 40%、3 年）の結果、本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確認されている。

		温度	湿度	光	保存形態	期間	結果
苛酷試験	光	25℃	40%RH	可視光 120 万 lux・h 以上 紫外線 200Wh/m ² 以上	透明ポリエチレン製容器	4 週間	含量の低下が認められた
					透明ポリエチレン製容器及び褐色ポリエチレン製袋	4 週間	本製品、規格値と比較して全ての項目において相違がなかった
					白色不透明ポリエチレン製容器	4 週間	本製品、規格値と比較して全ての項目において相違がなかった
	凍結解凍 ^a	-20℃、30℃ サイクル	-20℃： なりゆき 30℃： 40±5%RH	暗所	透明の低密度ポリエチレン点眼容器	6 週間	本製品、規格値と比較して全ての項目において相違がなかった
長期保存試験		25℃	40%RH	暗所	透明ポリエチレン製容器及び紙箱（直立保存）	168 週間	本製品、規格値と比較して全ての項目において相違がなかった
		25℃	40%RH	暗所	透明ポリエチレン製容器及び紙箱（横倒し保存）	168 週間	本製品、規格値と比較して全ての項目において相違がなかった
		4℃	35%RH	暗所	透明ポリエチレン製容器及び紙箱	168 週間	本製品、規格値と比較して全ての項目において相違がなかった
加速試験		40℃	15%RH	暗所	透明ポリエチレン製容器及び紙箱	26 週間	本製品、規格値と比較して全ての項目において相違がなかった

RH：相対湿度

a：-20℃。30℃でそれぞれ 1 週間で 1 サイクルとして 3 サイクル実施

6. 溶解後の安定性

「該当しない」

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

「該当資料なし」

8. 溶出性

「該当しない」

9. 生物学的試験法

「該当しない」

10. 製剤中の有効成分の確認試験法¹⁾

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）

11. 製剤中の有効成分の定量法¹⁾

電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸）

12. 力価

「該当しない」

13. 混入する可能性のある夾雑物

安定性試験でみられた主なオロパタジン塩酸塩類縁物質（分解物）：N-オキシド体

14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

「該当しない」

15. 刺激性

反復点眼投与試験において、眼刺激性は認められなかった。

「IX. 非臨床試験に関する項目 2-(2)」の項を参照

16. 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

アレルギー性結膜炎

2. 用法及び用量

通常、1回1～2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

3. 臨床成績

以下の試験報告はパタノール点眼液0.1%のインタビューフォームを参考に記載した。

(1) 臨床データパッケージ

「該当しない」

(2) 臨床効果

1) 後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験）³⁾

無症状期のアレルギー性結膜炎患者（147例）を対象に、片眼にオロパタジン点眼液（0.01%群38例、0.05%群38例、0.1%群35例、0.15%群36例）、対眼にプラセボをそれぞれ1回1滴点眼し、点眼4時間後に抗原誘発を行った。抗原誘発5分後におけるそう痒感の平均スコアの0.1%群（本剤群）とプラセボ群との差と95%信頼区間は、-1.19、[-1.52, -0.85]であり、抗原誘発20分後における総合充血の平均スコアの本剤群とプラセボ群との差と95%信頼区間は、-0.93、[-1.49, -0.37]であった。

注意：本剤は0.1%点眼液で承認されている。

用法・用量は「通常、1回1～2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。」である。

3) サンド株式会社社内資料：後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験²⁾）

2) 第Ⅲ相比較試験（ケトチフェンフマル酸塩点眼液を対照薬とした二重盲検並行群間比較試験）⁴⁾

アレルギー性結膜炎患者（247例）を対象に、本剤又は0.05%ケトチフェンフマル酸塩点眼液を両眼に1回2滴、1日4回（朝、昼、夕、就寝前）28日間点眼投与したところ、そう痒感及び充血の重症度点数において、本剤は0.05%ケトチフェンフマル酸塩点眼液に劣らない有効性を示した。

4) 雑賀 寿和：あたらしい眼科 23（10），1337（2006）

(3) 臨床薬理試験

第Ⅰ相試験⁵⁾

健康成人男性10例を対象に、0.1%オロパタジン塩酸塩点眼液を両眼1回2滴、1日4回、7日間反復点眼し、眼局所及び全身に対する忍容性を検討した。

その結果、細隙灯顕微鏡検査、眼底所見及び視力、眼圧検査では、試験期間を通して全例に異常所見は認められなかった。また、副作用は認められず、臨床検査値に関しても、本剤と関連のある変動は認められなかったことから、本剤の忍容性は良好であることが確認された。

5) 社内資料：第Ⅰ相試験（1日4回点眼の安全性の検討）

(4) 探索的試験

後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験）³⁾

無症状期のアレルギー性結膜炎患者 147 例を対象に、片眼にオロパタジン点眼液（0.01%群 38 例、0.05%群 38 例、0.1%群 35 例、0.15%群 36 例）、対眼にプラセボをそれぞれ 1 回 1 滴点眼し、4 時間後に抗原誘発を行い、至適用量を検討した。

その結果、オロパタジン塩酸塩点眼液の至適用量は、0.05%と0.1%の間であることが確認された。0.05%及び0.1%が、0.01%、0.15%のいずれと比較しても良好な成績だったが、0.05%と0.1%の間において統計学的な有意差は認められなかった。

注意：本剤は0.1%点眼液で承認されている。

用法・用量は「通常、1回1～2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。」である。

3) サンド株式会社社内資料：後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験2）

(5) 検証的試験

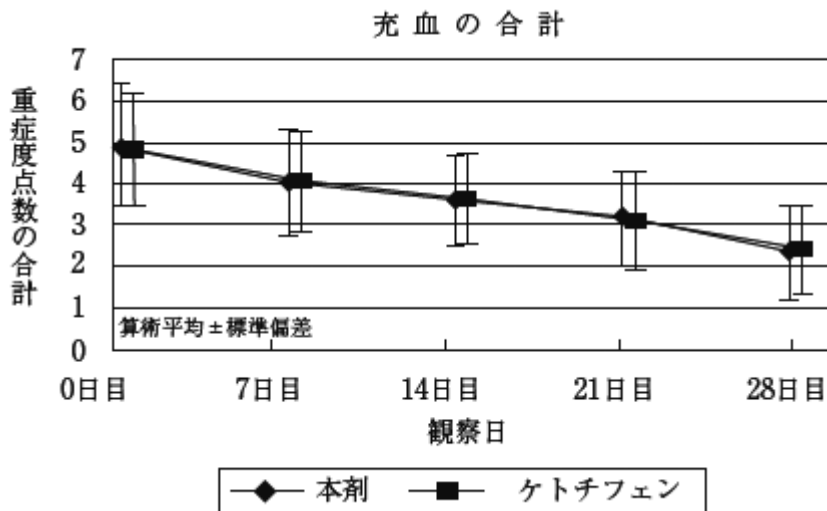
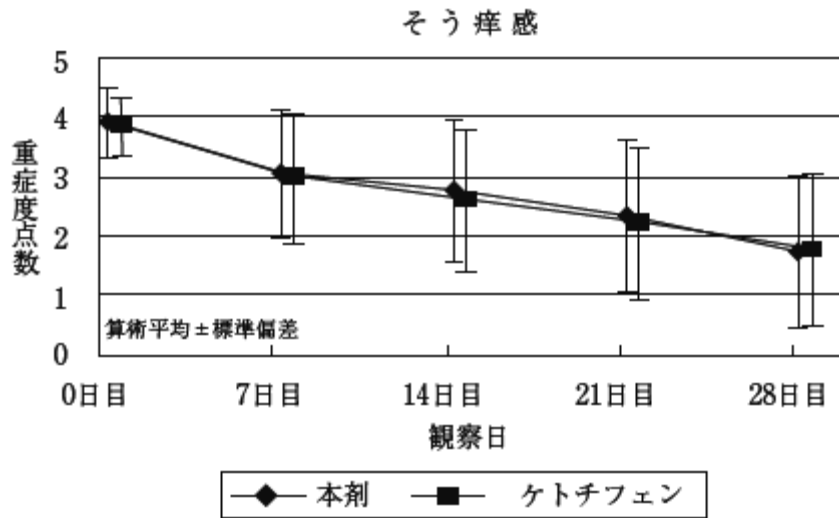
1) 無作為化並行用量反応試験

「(4) 探索的試験：用量反応探索試験」の項参照

2) 比較試験

第Ⅲ相比較試験（ケトチフェンフマル酸塩点眼液を対照薬とした二重盲検並行群間比較試験⁴⁾

アレルギー性結膜炎患者（247例）を対象に、本剤又は0.05%ケトチフェンフマル酸塩点眼液を両眼に1回2滴、1日4回（朝、昼、夕、就寝前）28日間点眼投与したところ、そう痒感及び充血の重症度点数において、本剤は0.05%ケトチフェンフマル酸塩点眼液に劣らない有効性を示した。



4) 雑賀 寿和：あたらしい眼科 23 (10) , 1337 (2006)

3) 安全性試験⁶⁾

アレルギー性結膜炎患者 20 例を対象に 0.1%オロパタジン塩酸塩点眼液を両眼 1 回 1~2 滴、1 日 4 回（朝、昼、夕及び就寝前）、10 週間（70 日間）点眼し、有効性及び安全性を非盲検試験により検討した。

その結果、そう痒感及び充血において、点眼期間の経過に伴い症状の改善が認められた。また、0.1%オロパタジン塩酸塩点眼液が投与された前例において、有意な眼圧変動など副作用は認められず、長期投与における安全性が示された。

6) 雑賀 寿和：あたらしい眼科 23 (11) , 1501 (2006)

4) 患者・病態別試験

「該当資料なし」

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

「該当しない」

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

「該当しない」

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ケトチフェンフマル酸塩、レボカバスチン塩酸塩、クロモグリク酸ナトリウム、トラニラスト、アンレキサノクス、ペミロラストカリウム、イブジラスト、アシタザノラスト水和物、エピナスチン塩酸塩等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

オロパタジン塩酸塩は、選択的ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用を主作用とし、更に肥満細胞からの化学伝達物質の遊離・産生抑制作用を有する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 抗ヒスタミン作用^{7) ~9)}

受容体結合実験において、ヒスタミン H₁ 受容体に強い拮抗作用 (K_i 値: 41.1 ~ 59.0 nmol/L) を有し、その作用は選択的である。

ヒスタミン刺激によるヒト結膜上皮細胞からのインターロイキン-6 (IC₅₀ 値: 5.5 nmol/L) 及びインターロイキン-8 (IC₅₀ 値: 1.7 nmol/L) の遊離・産生を抑制した。

2) 抗アレルギー作用^{10) 11)}

抗ヒト IgE 抗体刺激によるヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン (IC₅₀ 値: 314 ~ 859 μmol/L)、トリプターゼ (IC₅₀ 値: 1.21 mmol/L)、プロスタグランジン D₂ (IC₅₀ 値: 736 μmol/L) 及び TNF α (IC₅₀ 値: 13.1 μmol/L) の遊離・産生を抑制した。

2) 動物結膜炎モデルにおける作用¹²⁾

ヒスタミン誘発によるモルモット結膜における血管透過性亢進を抑制 (ED₅₀ 値: 0.002%) した。感作モルモットの抗原誘発による眼瞼と眼球結膜の充血及び膨疹を抑制 (ED₅₀ 値: 0.017%) した。

(3) 作用発現時間・持続時間

「該当資料なし」

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

「該当資料なし」

(2) 最高血中濃度到達時間

(参考：外国人データ)¹³⁾

アレルギー患者 12 例を対象に、0.1%オロパタジン塩酸塩点眼液を両眼に 1 回 2 滴、6 時間ごとに (1 日 4 回点眼) 4 日間反復点眼した。オロパタジン (未変化体) の 4 日目の最高血中濃度到達時間 (Tmax) の平均値は、1.23 時間であった (外国人データ)。

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 健康男性における血漿中濃度¹⁴⁾

健康男性 9 例を対象に、0.15%オロパタジン塩酸塩点眼液を両眼に 1 回 2 滴、1 日 2 回、14 日間点眼し、1、8、15 日目のオロパタジン (未変化体) の血漿中濃度を測定した結果、全症例ともほとんどの時点で定量限界未満であった。

注意：本剤は0.1%点眼液で承認されている。

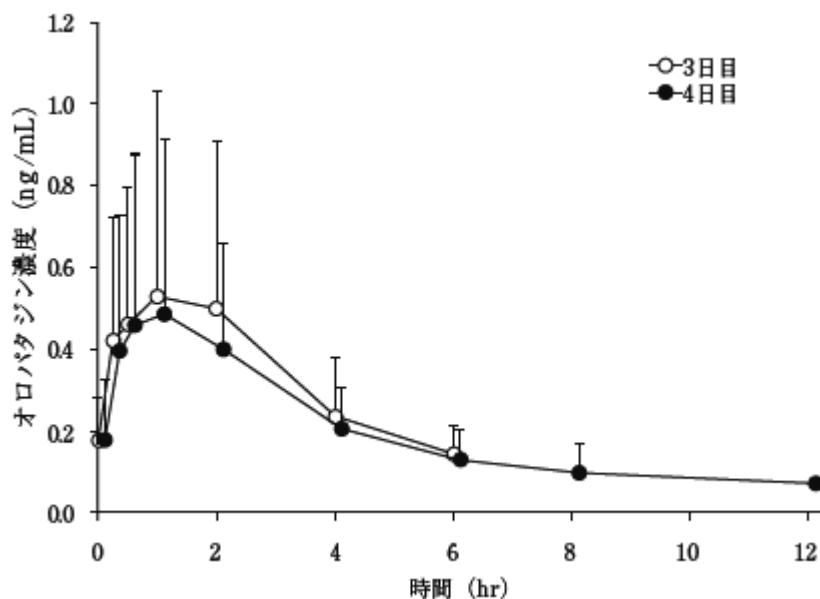
用法・用量は「通常、1回1~2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。」である。

2) アレルギー患者における血漿中濃度

(参考：外国人データ)¹³⁾

アレルギー患者 (12 名) に 0.1%オロパタジン点眼液を、両眼に 1 回 2 滴、6 時間ごとに (1 日 4 回点眼) 4 日間反復点眼したときのオロパタジン (未変化体) の血漿中濃度推移及び薬物動態パラメータは以下のとおりであった (定量限界値は 0.05ng/mL)。

オロパタジン（未変化体）血漿中濃度推移（平均値±標準偏差 n=12）



オロパタジン（未変化体）の薬物動態パラメータ（平均値±標準偏差 n=12）

点眼日	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	AUC_{0-6} (ng · hr/mL)	消失半減期 (hr)
3日目	0.610 ± 0.518	1.21 ± 0.62	2.07 ± 1.46	算出できず
4日目	0.520 ± 0.416	1.23 ± 0.62	1.90 ± 1.16* ²	3.1 ± 1.3
検定* ¹ (Paired t test)	p=0.0814	検定せず	p=0.1249	検定せず

*1: 3日目と4日目の比較、*2: n=11

(4) 中毒域

「該当資料なし」

(5) 食事・併用薬の影響

「該当資料なし」

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

「該当資料なし」

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

「該当資料なし」

(2) 吸収速度定数

点眼による該当資料なし

(参考) ¹⁵⁾

健康成人男性（摂食下）12例にオロパタジン塩酸塩10mgを単回経口投与したときの吸収速度定数Kaは2.95 (hr⁻¹) と算出された。その時の吸収ラグタイムは0.24時間であった。

(3) バイオアベイラビリティ

(参考：ウサギ) ¹⁶⁾

ウサギにおける0.15%オロパタジン塩酸塩点眼液の単回点眼及び単回静脈内投与（0.1mg/kg）の血漿中薬物動態は以下のとおりであった。AUC_{0→∞}値から算出した点眼投与時のバイオアベイラビリティは83%と推察された。

投与経路	投与量	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	AUC _{0→∞} (ng/hr/mL)	t _{1/2} (hr)	Cl (L/hr/kg)	Vd (L/kg)	MRT (hr)	F ^a (%)
点眼	0.032mg/kg	0.56 ±0.31	10.2 ±5.0	12.9 ±1.2	0.81 ±0.17	-	-	NC	83±8
静注	0.1mg/kg	-	191 ^b ±26	48.5 ±7.4	0.67 ±0.09	2.10 ±0.36	2.06 ±0.64	0.662 ±0.034	
静注	1.0mg/kg	-	1585 ^b ±350	538 ±42	0.66 ±0.04	1.89 ±0.11	1.79 ±0.20	0.571 ±0.071	

(平均値±S. D.)

NC：パラメータを算出しなかった

-：パラメータを算出せず、または当該投与経路に適用しない

a：バイオアベイラビリティ（0.1mg/kgの静注用量で標準化されたAUC値を標準化して算出した）

b：データの逆外挿に基づいたC₀の測定値

(4) 消失速度定数

点眼による該当資料なし

(参考) ¹⁵⁾

健康成人男性（摂食下）12例にオロパタジン塩酸塩10mgを単回経口投与したときの消失速度定数Kelが0.0716 (hr⁻¹) と算出された。

(5) クリアランス

点眼による該当資料なし

(参考) ¹⁵⁾

健康成人男性（摂食下）12例にオロパタジン塩酸塩10mgを単回経口投与したときのクリアランスCl/Fは平均で19.33L/hrと算出された。

注意：本邦におけるオロパタジン塩酸塩錠の用法・用量は「成人：通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mgを朝及び就寝前の1日2回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

(6) 分布容積

点眼による該当資料なし

(参考)¹⁷⁾

健康成人男性（摂食下）5例にオロパタジン塩酸塩10mgを単回経口投与したときの分布容積 $Vd\beta/F$ は平均で305Lと算出された。

(7) 血漿蛋白結合率

点眼による該当資料なし

(参考)¹⁷⁾

健康成人男性（摂食下）6例に対する、オロパタジン塩酸塩10mgの単回経口投与後2時間及び12時間の血漿蛋白非結合率は、2時間後32.1%、12時間後34.4%であった。

注意：本邦におけるオロパタジン塩酸塩錠の用法・用量は「成人：通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mgを朝及び就寝前の1日2回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

3. 吸収

「該当資料なし」

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

「該当資料なし」

(2) 血液－胎盤関門通過性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」を参照すること

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」を参照すること

(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

(参考：ウサギ)

眼組織への移行¹⁸⁾

白色ウサギ及びタ食ウサギの右眼に0.15%¹⁴C-オロパタジン塩酸塩点眼液を1滴(30 μ L)単回点眼投与し、各組織内の放射能度を測定した。¹⁴C-オロパタジン塩酸塩は、点眼後眼組織に速やかに移行し、ほとんどの組織で30分から1時間後までに最高濃度に達した。虹彩・毛様体及び脈絡膜におけるC_{max}は、有色ウサギの方が高く、半減期は有色ウサギの方で白色ウサギに比べて長かった。

0.15%¹⁴C-オロパタジン塩酸塩点眼液の眼組織内及び血漿中の薬物動態パラメータ

白色ウサギ

組織	C _{max} (μ g eq/g)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	AUC _{0→8hr} (ng eq/hr/g)
結膜	0.398±0.037	0.5	1.9	588
角膜	1.850±1.170	0.5	1.8	3254
房水	0.155±0.055	1	1.4	401
虹彩・毛様体	0.108±0.037	1	1.4	279
水晶体	0.0026±0.0008	2	9.0	16.2
脈絡膜	0.0219±0.0089	0.5	0.9	-
網膜	BLQ	-	-	-
硝子体液	BLQ	-	-	-
血漿	0.0033±0.0026	0.5	1.3	-

(平均値±S. D.)

-：採取されなかった組織またはデータから算出できなかったパラメータ値

BLQ：定量限界未満

有色ウサギ

組織	C _{max} (μ g eq/g)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
房水	0.129±0.019	1	1.6
虹彩・毛様体	0.238±0.09	5	12.8
脈絡膜	0.055±0.016	1	15.6
網膜	0.008±0.004	0.5	-
血漿	0.008±0.003	1	-

(平均値±S. D.)

-：濃度が低く消失が速やかなため、推定できなかった

5. 代謝

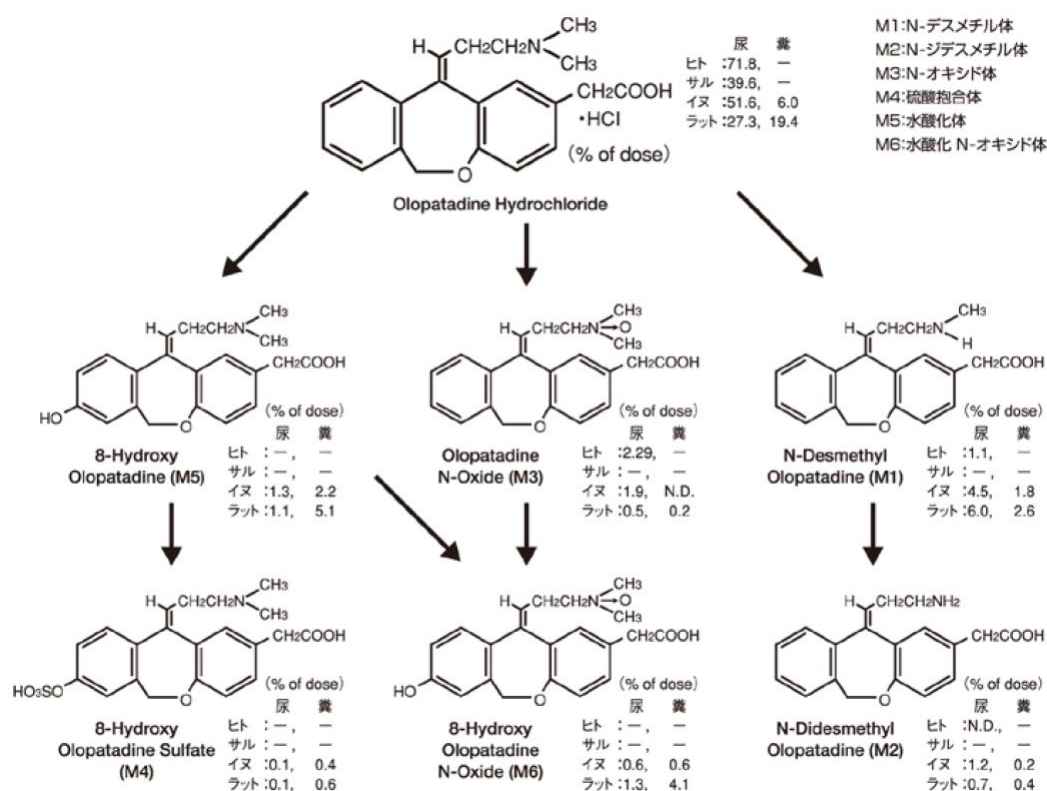
(1) 代謝部位及び代謝経路

点眼による該当資料なし

(参考) ¹⁵⁾¹⁹⁾²⁰⁾

代謝部位：肝臓と推定される。

代謝経路：ヒト、サルにオロパタジン塩酸塩、イヌ、ラットに14C-オロパタジン塩酸塩を経口投与したときの推定代謝経路は、ジメチルアミノ・プロピリデン側鎖のN-脱メチル化とNの酸化、C-8でのジヒドロベンズ[b,e]オキセピン環の水酸化及びC-8水酸基の硫酸抱合化である。ヒトにおける主要代謝物は、N-デスメチル体とN-オキシド体である。



(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

「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比率²¹⁾

ヒト結膜肥満細胞を N-オキシド体（オロパタジン塩酸の主な代謝物）で 15 分間処置した後、抗ヒト IgE で刺激し、ヒスタミン遊離を測定した。オロパタジン N-オキシド体は、0.2mmol/L 以上の濃度において、有意に濃度依存的なヒスタミン遊離抑制を示した（IC₅₀ : 3.07mmol/L）。

また、*in vitro* で行った受容体結合試験において N-オキシド体は、ヒスタミン H₁ 受容体のみ結合し、10 μmol/L の結合阻害率は 87.12% であった。同様に代謝物である N-デスメチル体のヒスタミン H₁ 受容体に対する 10 μmol/L の結合阻害率は 96.31% であった。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

「該当資料なし」

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

点眼による該当資料なし

(参考)¹⁵⁾

経口投与において、尿中に排泄される。

(2) 排泄率

点眼による該当資料なし

(参考)¹⁵⁾

オロパタジン塩酸塩 5、10、20、40、80mg を健康成人男性に単回経口投与したとき、48 時間までの未変化体の平均尿中累積排泄率は投与量の 58.5~73.4% だった。

また、1 回 10mg を 1 日 2 回 6 日間、1 日目に 1 回の計 13 回反復経口投与した場合も単回経口投与後の尿中排泄率と同程度だった。

注意：本邦におけるオロパタジン塩酸塩錠の用法・用量は「成人：通常、成人には 1 回オロパタジン塩酸塩として 5mg を朝及び就寝前の 1 日 2 回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

(3) 排泄速度

「該当資料なし」

7. トランスポーターに関する情報

オロパタジン塩酸塩は P 糖タンパク質の基質となる可能性が示唆されている²²⁾。

8. 透析等による除去率

「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

「該当しない」

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

「該当しない」

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「該当しない」

5. 慎重投与内容とその理由

「該当しない」

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (1) 本剤はベンザルコニウム塩化物を含有するため、含水性ソフトコンタクトレンズを装着したまま点眼することは避けること。[「適用上の注意」の項参照]
- (2) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないよう注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

「該当しない」

(2) 併用注意とその理由

「該当しない」

8. 副作用

(1) 副作用の概要

承認時までの臨床試験において、安全性評価対象例 803 例中、39 例（4.9%）に副作用が認められた。主な副作用は眼局所における眼痛 17 件（2.1%）であった。眼局所以外は頭痛 2 件（0.2%）、また、点眼前後で臨床検査の測定がなされた 736 例中、ALT（GPT）上昇 2 件（0.3%）が認められた（パタノール点眼液 0.1%の承認時）。

使用成績調査及び特定使用成績調査において、安全性評価対象例 3512 例中、22 例（0.6%）に副作用が認められた。主な副作用は、眼刺激 5 件（0.1%）、眼痛 5 件（0.1%）、眼瞼炎 3 件（0.1%）、眼瞼浮腫 3 件（0.1%）、眼そう痒症 2 件（0.1%）等であった。なお、安全性評価対象例のうち、小児に対する投与例数 721 例中 4 例（0.6%）5 件に副作用が認められた。その内訳は、1 歳以上 7 歳未満が 195 例中 0 例、7 歳以上 15 歳未満が 526 例中 4 例（0.8%）であった。また、その副作用の内訳は、眼瞼湿疹、眼刺激、眼痛、角膜炎、眼そう痒症の各 1 件であった（パタノール点眼液 0.1%の再審査終了時）。

(2) 重大な副作用と初期症状

「該当しない」

(3) その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には、投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。

種 類	0.5～5%未満	0.5%未満	頻度不明
眼	眼痛	角膜炎、そう痒症、眼刺激、眼瞼浮腫、眼の異常感、充血、眼瞼炎、眼脂、結膜濾胞、結膜出血、眼瞼湿疹、眼瞼紅斑、流涙増加、眼の異物感、眼部不快感、眼瞼障害	眼乾燥、眼瞼縁痂皮、霧視、眼瞼痛
精神神経系		頭痛	味覚異常、めまい
肝 臓		ALT (GPT) 上昇、AST (GOT) 上昇	
その他		ヘマトクリット減少、尿中ブドウ糖陽性	接触性皮膚炎、口内乾燥、悪心、過敏症、咽喉乾燥

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

「該当資料なし」

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

「該当資料なし」

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

9. 高齢者への投与

「該当しない」

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
(2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。[動物実験（ラット、経口）で乳汁中への移行及び出生児の体重増加抑制が報告されている。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

「該当資料なし」

13. 過量投与

「該当資料なし」

14. 適用上の注意

(1) 投与経路

点眼用にのみ使用すること。

(2) 投与时

患者に対し次の点に注意するよう指導すること。

- 1) 点眼のとき、薬液が眼瞼皮膚等についた場合は、すぐにふき取ること。
- 2) 薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- 3) 点眼に際しては、原則として仰臥位をとり、患眼を開瞼して結膜囊内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- 4) 本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物は、ソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、点眼時はコンタクトレンズをはずし、10分以上経過後装用すること。^{23) 24)}

15. その他の注意

「該当しない」

16. その他

「該当資料なし」

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験

「該当資料なし」

(3) 安全性薬理試験

「該当資料なし」

(4) その他の薬理試験

「該当資料なし」

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

「該当資料なし」

(2) 反復投与毒性試験

点眼投与試験²⁵⁾

動物種	投与期間	投与量	結果
ウサギ	1ヵ月	0、0.1、0.2%を右眼に2滴/4回/日又は0.2%を2滴/6回/日及び無処置	毒性が認められなかった最高用量：0.2%を2滴/6回/日
ウサギ	6ヵ月	0、0.15、0.5、1.0%を右眼に2滴/4回/日及び無処置	毒性が認められなかった最高用量：1.0%を2滴/4回/日
サル	6ヵ月	0、0.1、0.2、0.5%を右眼に2滴/4回/日及び無処置	毒性が認められなかった最高用量：0.5%を2滴/4回/日
ウサギ	1ヵ月	不純物・分解物を含む0.1%オロパタジン塩酸塩を右眼に2滴/4回/日	眼又は全身毒性は認められない

(3) 生殖発生毒性試験

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」を参照すること

(4) その他の特殊毒性

抗原性²⁶⁾

モルモットを用いた Maximization 試験が実施され、75%及び100%のオロパタジン塩酸塩を感作後に局所塗布した結果、遅延型接触過敏症を惹起しなかった。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：包装に表示（3年）

3. 貯法・保存条件

貯 法：遮光、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

「特になし」

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法、14. 適用上の注意」を参照すること。

「患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり」

(3) 調剤時の留意点について

「特になし」

5. 承認条件等

「該当しない」

6. 包装

オロパタジン点眼液 0.1% 「サンド」：5mL×10本

7. 容器の材質

キャップ：ポリプロピレン

ボトル：ポリエチレン

中栓：ポリエチレン

ラベル：ポリスチレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：パタノール点眼液 0.1%（ノバルティスファーマ株式会社）

同効薬：ケトチフェンフマル酸塩、レボカバスチン塩酸塩、クロモグリク酸ナトリウム、トラニラスト、アンレキサノクス、ペミロラストカリウム、イブジラスト、アシタザノラスト水和物、エピナスチン塩酸塩等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2019年2月15日

承認番号：23100AMX00254000

11. 薬価基準収載年月日

2021年12月10日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

「該当しない」

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

「該当しない」

14. 再審査期間

「該当しない」

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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

16. 各種コード

販売名	包装単位	HOT 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
オロパタジン 点眼液 0.1% 「サンド」	5mL×10 本	1287905010101	1319752Q1067	622879001

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書（廣川書店）C-1204（2016）
- 2) 社内資料：安定性試験に関する資料
- 3) 社内資料：後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験 2）
- 4) 雑賀 寿和：あたらしい眼科 23(10)：1337-1352（2006）
- 5) 社内資料：第Ⅰ相試験（1日4回点眼の安全性の検討）
- 6) 雑賀 寿和：あたらしい眼科 23(10)：1501-1510（2006）
- 7) Sharif N.A. et al.：J. Ocul. Pharmacol. Ther. 12(4)：401-407（1996）
- 8) 社内資料：作用機序（ヒスタミン受容体拮抗作用）
- 9) Yanni J.M. et al.：Arch. Ophthalmol. 117(5)：643-647（1999）
- 10) 社内資料：作用機序（ヒト結膜肥満細胞からの炎症性伝達物質遊離へ及ぼす影響）
- 11) Cook E.B. et al.：Ann. Allergy Asthma Immunol. 84(5)：504-508（2000）
- 12) Yanni J.M. et al.：J. Ocul. Pharmacol. Ther. 12(4)：389-400（1996）
- 13) 社内資料：アレルギー患者における血中濃度
- 14) 社内資料：健康男性における血中濃度
- 15) 角尾道夫、他：基礎と臨床、29(16)：4129-4147（1995）
- 16) 社内資料：ウサギにおける全身薬物動態
- 17) 立石智則、他：臨床薬理、27(4)：673-681、1996
- 18) 社内資料：ウサギにおける眼組織分布
- 19) 栗原隆、他：薬物動態、10(5)：722-735（1995）
- 20) 大石孝義、他：薬物動態、10(5)：689-706（1995）
- 21) 社内資料：代謝物がヒスタミン遊離・受容体結合に及ぼす影響
- 22) Mimura N, et al.：Drug Metab. Pharmacokinet, 23(2)：106-114（2008）
- 23) Momose T. et al.：CLAO J. 23(2)：96-99（1997）
- 24) Christensen MT, et al.：CLAO J, 24(4)：227-231（1998）
- 25) 社内資料：反復点眼投与毒性試験（サル、ウサギ）
- 26) 社内資料：モルモットにおける抗原性試験

2. その他の参考文献

「特になし」

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

<参考>

先発医薬品パタノール点眼液 0.1%は、欧州諸国を含む世界 120 ヶ国以上で承認されている。
(2021年11月現在)

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦への投与に関する情報

Pregnancy Category

オーストラリア：Category B1

注意：本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」は以下のとおりである。

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- 2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。〔動物実験（ラット、経口）で乳汁中への移行及び出生児の体重増加抑制が報告されている。〕

(2021年11月現在)

(2) 小児への投与に関する情報

(参考：パタノール点眼液 0.1%に関連する情報)

出典	記載内容
米国先発医薬品の添付文書* (2020年8月)	Safety and effectiveness in pediatric patients below the age of 3 years have not been established.
イギリスのSPC* (2020年11月)	Opatanol may be used in paediatric patients three years of age and older at the same dose as in adults. The safety and efficacy of Opatanol in children aged under 3 years has not been established. No data are available.

注意：本邦における使用上の注意「小児等への投与」は以下のとおりである。

低出生体重児、新生児、乳児に対する安全性は確立していない（使用経験がない）。

*：本邦での用法・用量は、米国、イギリスの1日2回点眼と異なり1日4回点眼で承認されている

XⅢ. 備考

その他の関連資料

「該当資料なし」

製造販売

サンド株式会社

東京都港区虎ノ門1-23-1