

## 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

アレルギー性疾患治療剤

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」

オロパタジン塩酸塩錠5mg「タカタ」

日本薬局方 オロパタジン塩酸塩錠

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「タカタ」

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「タカタ」

オロパタジン塩酸塩口腔内崩壊錠

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD

剤形	錠 2.5mg・5mg : 錠剤 (フィルムコーティング錠) OD錠 2.5mg・5mg : 錠剤 (裸錠)
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠 2.5mg/OD錠 2.5mg : 1錠中 オロパタジン塩酸塩 2.5mg 錠 5mg/OD錠 5mg : 1錠中 オロパタジン塩酸塩 5mg
一般名	和名: オロパタジン塩酸塩 (JAN) 洋名: Olopatadine Hydrochloride (JAN)、olopatadine (INN)
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 : 2012年 8月 15日 薬価基準収載年月日 : 2012年 12月 14日 発売年月日 : 2012年 12月 14日
開発・製造販売(輸入) ・提携販売会社名	製造販売元: 高田製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社 TEL:0120-989-813 FAX:048-816-4183 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.takata-seiyaku.co.jp">https://www.takata-seiyaku.co.jp</a>

本IFは2021年7月改訂(第6版)(錠)、2021年7月改訂(第6版)(OD錠)の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

## 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 年が経過した現在、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医療機器情報提供ホームページ(<http://www.info.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に審査・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 2008」(以下、「IF 記載要領 2008」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 21 年 4 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、今後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て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)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>37</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 警告内容とその理由.....	37
2. 製品の治療学的・製剤学的特性.....	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	37
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由..	37
1. 販売名 .....	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由..	37
2. 一般名 .....	2	5. 慎重投与内容とその理由 .....	37
3. 構造式又は示性式.....	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法.....	37
4. 分子式及び分子量.....	2	7. 相互作用 .....	37
5. 化学名（命名法） .....	3	8. 副作用.....	38
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	9. 高齢者への投与.....	39
7. CAS登録番号.....	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	39
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	11. 小児等への投与.....	39
1. 物理化学的性質.....	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	39
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	4	13. 過量投与 .....	39
3. 有効成分の確認試験法.....	4	14. 適用上の注意 .....	39
4. 有効成分の定量法 .....	4	15. その他の注意 .....	40
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>	16. その他 .....	40
1. 剤形 .....	5	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>41</b>
2. 製剤の組成.....	6	1. 薬理試験 .....	41
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	6	2. 毒性試験 .....	41
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	6	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>42</b>
5. 調整法及び溶解後の安定性.....	17	1. 規制区分 .....	42
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	17	2. 有効期間又は使用期限.....	42
7. 溶出性.....	17	3. 貯法・保存条件.....	42
8. 生物学的試験法.....	26	4. 薬剤取扱い上の注意点.....	42
9. 製剤中の有効成分の確認試験法.....	26	5. 承認条件等.....	42
10. 製剤中の有効成分の定量法.....	26	6. 包装.....	42
11. 力価 .....	26	7. 容器の材質.....	43
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	26	8. 同一成分・同効薬.....	43
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	26	9. 国際誕生年月日 .....	43
14. その他.....	26	10. 製造販売承認年月日及び承認番号 .....	43
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>27</b>	11. 薬価基準収載年月日.....	44
1. 効能又は効果 .....	27	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.....	44
2. 用法及び用量.....	27	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	44
3. 臨床成績 .....	27	14. 再審査期間.....	44
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>29</b>	15. 投与期間制限医薬品に関する情報 .....	44
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .....	29	16. 各種コード.....	44
2. 薬理作用 .....	29	17. 保険給付上の注意 .....	44
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>30</b>	<b>XI. 文献</b> .....	<b>45</b>
1. 血中濃度の推移・測定法 .....	30	1. 引用文献 .....	45
2. 薬物速度論的パラメータ .....	33	2. その他の参考文献.....	45
3. 吸収 .....	34	<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>46</b>
4. 分布 .....	34	1. 主な外国での発売状況.....	46
5. 代謝 .....	35	2. 海外における臨床支援情報.....	46
6. 排泄 .....	35	<b>XIII 備考</b> .....	<b>47</b>
7. トランスポーターに関する情報.....	35	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 .....	47
8. 透析等による除去率 .....	35	2. その他の関連資料 .....	50

## 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、抗アレルギー薬である。

2012年8月に、オロパタジン塩酸塩錠2.5mg・5mg/OD錠2.5mg・5mg「タカタ」は高田製薬株式会社が後発医薬品として承認を得た。錠2.5mg・5mg/OD錠2.5mg・5mgは、高田製薬株式会社が開発を企画した。

2014年12月に、7歳以上の小児へのアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎・皮膚掻痒症）に伴う掻痒に対する「効能・効果」及び「用法・用量」が承認を得た。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) オロパタジン塩酸塩は、抗アレルギー薬である。ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF等）の産生・遊離抑制作用を現す。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する。<sup>1)</sup>
- (2) 第二世代の抗ヒスタミン剤である。
- (3) 重大な副作用として、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸があらわれることがある。（「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」参照）

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「タカタ」

オロパタジン塩酸塩錠5mg「タカタ」

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「タカタ」

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「タカタ」

#### (2) 洋名

Olopatadine Hydrochloride Tablets 2.5mg “TAKATA”

Olopatadine Hydrochloride Tablets 5mg “TAKATA”

Olopatadine Hydrochloride OD Tablets 2.5mg “TAKATA”

Olopatadine Hydrochloride OD Tablets 5mg “TAKATA”

#### (3) 名称の由来

一般名による

### 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）

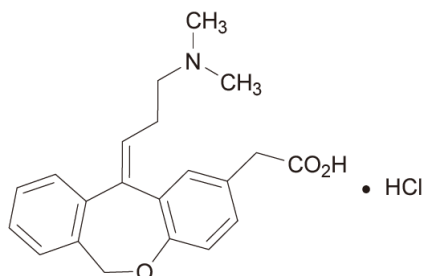
Olopatadine Hydrochloride (JAN)

olopatadine (INN)

#### (3) ステム

ヒスタミン- $H_1$ 受容体拮抗薬、三環系化合物：-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 (IUPAC)

## 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

## 7. CAS 登録番号

140462-76-6(Olopatadine Hydrochloride)

113806-05-6(olopatadine)

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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の塩酸試液に溶ける。

(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)

(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

1.0g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

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「オロパタジン塩酸塩」の確認試験による。

#### 4. 有効成分の定量法







日局「オロパタジン塩酸塩」の定量法による。









#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別、外観及び性状

品名		オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」
性状		淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠
外形	表面 直径	 約 6.1mm	 約 7.1mm
	裏面 重さ	 約 0.079 g	 約 0.120g
	側面 厚さ	 約 2.7mm	 約 2.9mm
識別コード		TTS-555	TTS-556

品名		オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「タカタ」	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」
性状		黄色の裸錠	黄色の裸錠
外形	表面 直径	 約 6.1mm	 約 8.1mm
	裏面 重さ	 約 0.100 g	 約 0.200 g
	側面 厚さ	 約 2.6mm	 約 3.1mm
識別コード		TTS-375	TTS-376

###### (2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

「IV. 1. (1) 剤型の区別、外観及び性状」参照

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

## 2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/OD 錠 2.5mg 「タカタ」 : 1 錠中 オロパタジン塩酸塩 2.5mg

オロパタジン塩酸塩錠 5mg/OD 錠 5mg 「タカタ」 : 1 錠中 オロパタジン塩酸塩 5mg

(2) 添加物

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」 オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」	乳糖水和物、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 6000、黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄、カルナウバロウ
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「タカタ」 オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「タカタ」	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、アセスルファムカリウム、ステアリン酸マグネシウム、黄色三二酸化鉄、含水二酸化ケイ素、 <i>l</i> -メントール

(3) その他

該当資料なし

## 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 長期保存試験

下記の保存条件において全て規格内であった。

●オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」<sup>2)</sup>

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
25℃ 60%RH / PTP 包装 (PTP/紙箱)	36 箇月	性状	淡黄赤色のフィルム コーティング錠	淡黄赤色のフィルム コーティング錠
		確認試験	適	適
		溶出性 (%)	97-99	95-96
		定量法 (%)	97.1	99.2

●オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」<sup>3)</sup> (1ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
25℃ 60%RH / バラ包装 (プラスチック瓶/紙箱)	36 箇月	性状	淡黄赤色のフィルム コーティング錠	淡黄赤色のフィルム コーティング錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性 (%)	98-102	96-99
		定量法 (%)	96.8	97.8

●オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「タカタ」<sup>4)</sup> (1ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
25℃ 60%RH / バラ包装 (プラスチック瓶/紙箱)	36 箇月	性状	黄色の裸錠	黄色の裸錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		崩壊性(秒)	37	34
		溶出性 (%)	92-100	98-102
		定量法 (%)	100.3	100.3

●オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「タカタ」<sup>5)</sup> (1ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
25℃ 60%RH / PTP 包装 (PTP/アルミ ピロー/ 紙箱)	36 箇月	性状	黄色の裸錠	黄色の裸錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		崩壊性(秒)	40	39
		溶出性 (%)	98-100	95-98
		定量法 (%)	99.2	99.2

(2) 加速試験

下記の保存条件において全て規格内であった。

●オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」<sup>2)</sup> (3ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
40℃ 75%RH / PTP 包装 (PTP/紙箱)	6 箇月	性状	淡黄赤色のフィルム コーティング錠	淡黄赤色のフィルム コーティング錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性 (%)	95.8-101.9	96.5-102.3
		定量法 (%)	98.69-99.47	98.92-99.12

●オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」<sup>3)</sup>

(3ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
40℃ 75%RH / PTP包装 (PTP/紙箱)	6箇月	性状	淡黄赤色のフィルム コーティング錠	淡黄赤色のフィルム コーティング錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性(%)	91.3-101.7	97.1-102.7
		定量法(%)	98.96-99.69	98.99-99.38
40℃ 75%RH / バラ包装 (プラスチック 瓶/紙箱)	6箇月	性状	淡黄赤色のフィルム コーティング錠	淡黄赤色のフィルム コーティング錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		溶出性(%)	91.3-101.7	96.2-102.5
		定量法(%)	98.96-99.69	99.94-100.21

●オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「タカタ」<sup>4)</sup>

(3ロット)

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
40℃ 75%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー/ 紙箱)	6箇月	性状	黄色の裸錠	黄色の裸錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		崩壊性(秒)	27-33	25-29
		溶出性(%)	97.0-101.1	97.4-101.6
		定量法(%)	99.75-100.08	99.33-99.79
40℃ 75%RH / バラ包装 (プラスチック 瓶/紙箱)	6箇月	性状	黄色の裸錠	黄色の裸錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		崩壊性(秒)	27-33	30-36
		溶出性(%)	97.0-101.1	97.1-101.2
		定量法(%)	99.75-100.08	99.05-100.00

保存条件 / 保存形態	保存期間	試験項目	結果	
			試験開始時	試験終了時
40℃ 75%RH / PTP包装 (PTP/アルミ ピロー/ 紙箱)	6箇月	性状	黄色の裸錠	黄色の裸錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		崩壊性(秒)	34-38	31-34
		溶出性(%)	96.8-102.7	97.8-101.3
		定量法(%)	100.04-100.34	100.07-100.50
40℃ 75%RH / バラ包装 (プラスチック瓶/紙箱)	6箇月	性状	黄色の裸錠	黄色の裸錠
		確認試験	適	適
		製剤均一性	適	適
		崩壊性(秒)	34-38	33-36
		溶出性(%)	96.8-102.7	94.3-101.1
		定量法(%)	100.04-100.34	99.86-100.06

## (3) 苛酷試験（製造販売後の試験結果）

本試験は、苛酷条件における安定性の結果（製造販売後）です。  
最終包装形態以外の保存につきましては、医療機関様にてご判断いただきますよう、お願い致します。

## 評価基準

## 【外観】

分類	評価基準	判定
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	◎
変化あり（規格内）	わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合	○
変化あり（規格外）	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合	△

## 【溶出性】又は【崩壊性】

分類	評価基準	判定
変化なし	規格値内の場合	◎
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

## 【含量】

分類	評価基準	判定
変化なし	含量低下が3%未満の場合	◎
変化あり（規格内）	含量低下が3%以上で、規格値内の場合	○
変化あり（規格外）	規格値外の場合	△

## 【硬度】

分類	評価基準	判定
変化なし	硬度変化が30%未満の場合	◎
変化あり（規格内）	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kg重以上の場合	○
変化あり（規格外）	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kg重未満の場合	△

平成11年8月20日付「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（日本病院薬剤師会）一部改変

無包装状態の安定性試験

●オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」<sup>2)</sup>

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	外観	淡黄赤色の フィルムコー ティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性 (%)	96.5- 98.8	95.6- 99.5	95.9- 100.7	97.4- 100.0
	判定	—	◎	◎	◎
	含量 (%)	99.36	98.45	98.45	98.33
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	6.0	5.6	5.5	5.1
判定	—	◎	◎	◎	
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	淡黄赤色の フィルムコー ティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性 (%)	96.5- 98.8	96.9- 99.0	96.8- 98.7	97.2- 100.5
	判定	—	◎	◎	◎
	含量 (%)	99.36	98.77	98.85	98.75
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	6.0	3.6	3.5	3.6
判定	—	○	○	○	

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

—：実施せず

表 2

(1 ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
1000 lx / 気密	外観	淡黄赤色のフィルム コーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	
	判定	—	◎	
	溶出性(%)	96.5-98.8	94.6-97.3	95.2-97.9
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	99.36	98.37	98.20
	判定	—	◎	◎
	硬度 (kg 重)	6.0	4.3	4.0
	判定	—	◎	○

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

— : 実施せず

●オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」<sup>3)</sup>

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	外観	淡黄赤色の フィルムコー ティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性(%)	99.3- 100.2	97.1- 100.6	96.5- 99.6	97.4- 99.3
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	98.81	98.04	98.61	99.08
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	6.2	6.0	5.6	6.1
判定	—	◎	◎	◎	
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	淡黄赤色の フィルムコー ティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠		
	判定	—	◎		
	溶出性(%)	99.3- 100.2	96.9- 99.2	96.3- 99.3	94.2- 98.1
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	98.81	98.53	98.61	97.83
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	6.2	3.5	3.6	3.6
判定	—	○	○	○	

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

— : 実施せず



表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
1000 lx / 気密	外観	淡黄赤色のフィルム コーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	
	判定	—	◎	
	溶出性(%)	99.3-100.2	96.2-99.0	95.2-98.1
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	98.81	96.98	97.88
	判定	—	◎	◎
	硬度 (kg 重)	6.2	4.4	3.9
	判定	—	◎	○

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

—：実施せず

●オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「タカタ」<sup>4)</sup>

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	外観	黄色の裸錠	黄色の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性(秒)	31	32	32	35
	判定	—	◎	◎	◎
	溶出性(%)	95.6- 100.5	81.5- 96.2	96.3- 100.0	95.8- 101.8
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	100.86	99.56	100.12	99.88
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	3.4	3.3	3.3	3.6
	判定	—	◎	◎	◎
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	黄色の裸錠	黄色の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性(秒)	31	29	29	30
	判定	—	◎	◎	◎
	溶出性(%)	95.6- 100.5	90.0- 97.7	93.2- 97.6	95.6- 100.4
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	100.86	99.40	100.21	99.88
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	3.4	2.2	2.4	2.4
	判定	—	○	◎	◎

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

—：実施せず

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
1000 lx / 気密	外観	黄色の裸錠	黄色の裸錠	
	判定	—	◎	
	崩壊性(秒)	31	29	28
	判定	—	◎	◎
	溶出性(%)	95.6-100.5	84.6-96.8	95.3-99.7
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	100.86	99.97	100.39
	判定	—	◎	◎
	硬度 (kg 重)	3.4	3.0	2.9
	判定	—	◎	◎

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

—：実施せず

●オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「タカタ」<sup>5)</sup>

本剤は、下記の保存条件において全て規格内であった。

表 1

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果			
		試験開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
40℃ 遮光 / 気密	外観	黄色の裸錠	黄色の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性(秒)	39	40	40	43
	判定	—	◎	◎	◎
	溶出性(%)	98.0- 100.2	95.8- 98.0	95.4- 96.4	96.0- 98.2
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	100.20	101.70	101.29	100.68
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	4.0	3.7	3.7	3.8
	判定	—	◎	◎	◎
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	黄色の裸錠	黄色の裸錠		
	判定	—	◎		
	崩壊性(秒)	39	35	35	40
	判定	—	◎	◎	◎
	溶出性(%)	98.0- 100.2	96.1- 99.7	94.1- 97.6	94.9- 100.0
	判定	—	◎	◎	◎
	含量(%)	100.20	101.21	99.32	101.08
	判定	—	◎	◎	◎
	硬度 (kg 重)	4.0	2.3	2.5	2.5
	判定	—	○	○	○

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

—：実施せず

表 2

(1ロット)

保存条件 / 保存形態	測定時期	結果		
		試験開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
1000 lx / 気密	外観	黄色の裸錠	黄色の裸錠	
	判定	—	◎	
	崩壊性(秒)	39	36	38
	判定	—	◎	◎
	溶出性(%)	98.0-100.2	96.7-100.0	95.6-97.5
	判定	—	◎	◎
	含量(%)	100.20	100.46	100.57
	判定	—	◎	◎
	硬度 (kg 重)	4.0	3.3	3.1
	判定	—	◎	◎

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日 日本病院薬剤師会)に準じて判定した。

—：実施せず

## 5. 調整法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

## 7. 溶出性

### (1) 生物学的同等性及び溶出性

#### ●オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」<sup>6)</sup>

本剤はオロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

#### 1. 薬剤

- ・試験製剤：オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」
- ・標準製剤：オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」

#### 2. 試験方法

日局 一般試験法 溶出試験法(パドル法)

#### 3. 試験条件

- ・試験液量：900mL
- ・試験液温：37±0.5℃
- ・試験液：水
  - pH1.2=溶出試験第1液
  - pH5.0=pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液
  - pH6.8=溶出試験第2液

- ・回転数 : 50rpm 及び 100rpm (pH6.8 のみ)
- ・試験回数 : 各 12 ベッセル

#### 4. 試験時間

- ・5、10、15 及び 30 分

#### 5. 分析法

液体クロマトグラフィー

#### 6. 判定基準

ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。

##### I. 平均溶出率

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm$ 10%の範囲にある。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0、pH6.8(50 及び 100rpm)が該当】

##### II. 個々の溶出率

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、以下の基準に適合する。

標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm$ 15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm$ 25%の範囲を超えるものがない。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0、pH6.8(50 及び 100rpm)が該当】

## 7. 結果

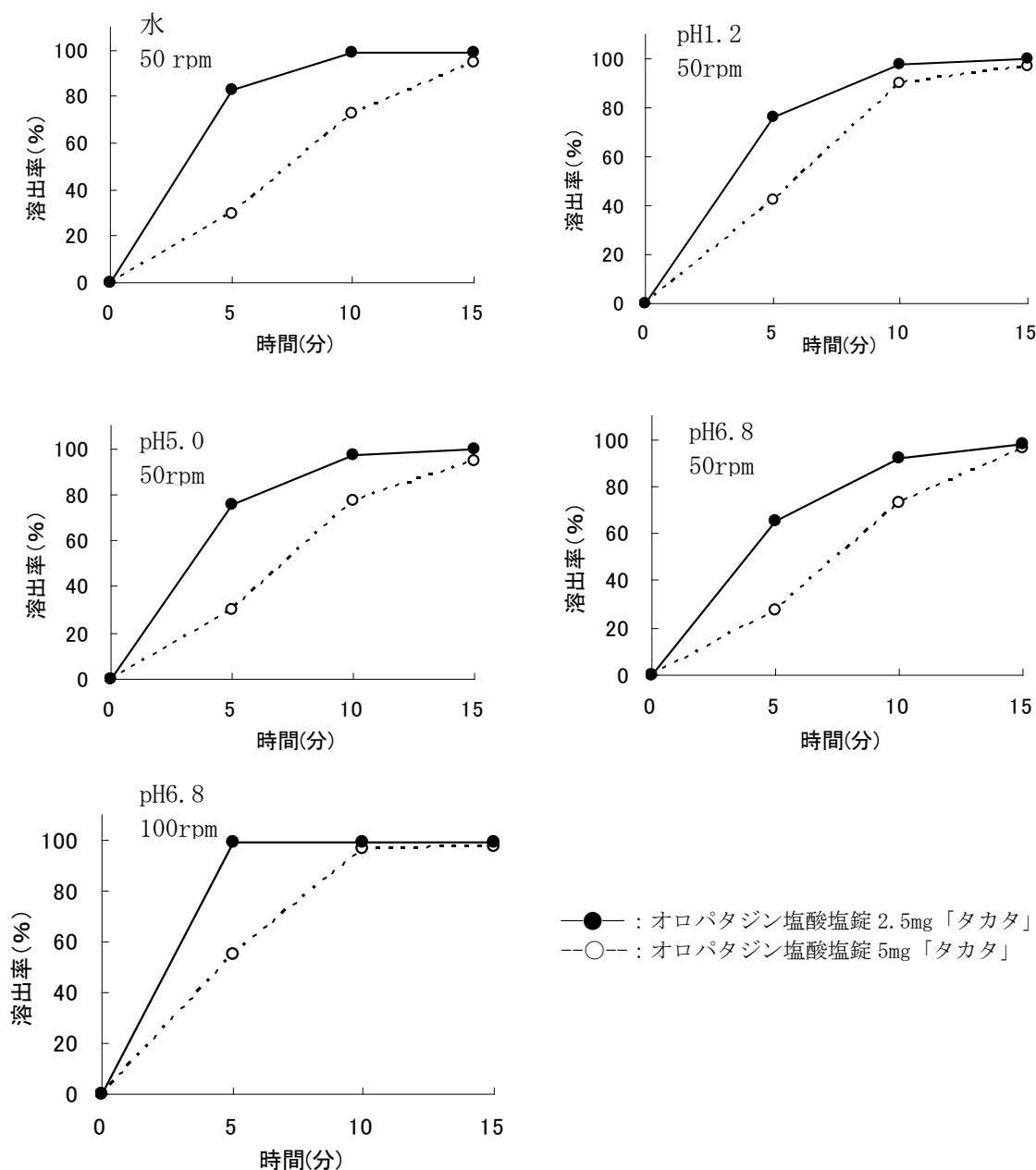


図 オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」とオロパタジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」の平均溶出曲線

表 溶出挙動の同等性の判定結果

試験条件			平均溶出率(%)		判定	
回転数	試験液	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤	平均溶出率	個々の溶出率
50rpm	水	15	95.0	99.2	適	適
	pH1.2	15	97.2	100.2	適	適
	pH5.0	15	94.7	100.1	適	適
	pH6.8	15	96.3	98.3	適	適
100rpm	pH6.8	15	97.3	99.3	適	適

●オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」<sup>7)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインについて」（平成9年12月22日付医薬審第487号）及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」（平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号）に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動の類似性が確認された。溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない。

1. 薬剤

- ・試験製剤：オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」
- ・標準製剤：錠剤、5mg

2. 試験方法

日局 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

3. 試験条件

- ・試験液量：900mL
- ・試験液温：37±0.5℃
- ・試験液：水
  - pH1.2＝溶出試験第1液
  - pH5.0＝pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液
  - pH6.8＝溶出試験第2液
- ・回転数：50rpm及び100rpm（pH6.8のみ）
- ・試験回数：各12ベッセル

4. 試験時間

- ・5、10、15及び30分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー

6. 判定基準

ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない。

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0、pH6.8(50及び100rpm)が該当】



## 7. 結果

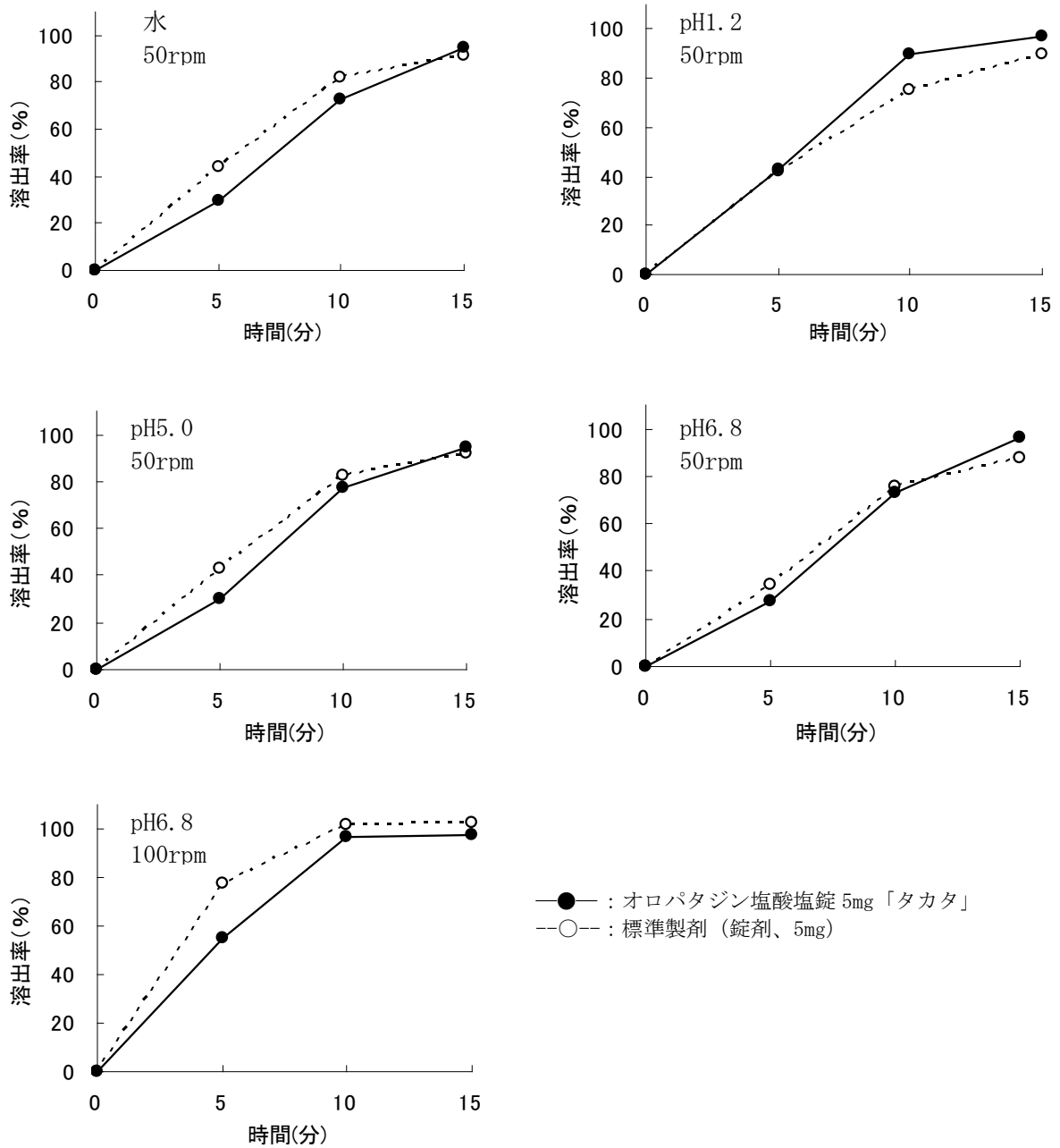


図 オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」と標準製剤の平均溶出曲線

表 溶出挙動の類似性の判定結果

試験条件		判定基準		平均溶出率 (%)		両製剤の差 (%)	判定
回転数	試験液	溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤		
50rpm	水	15分以内に平均85%以上溶出	15	91.1	95.0	-	適
	pH1.2		15	89.5	97.2		適
	pH5.0		15	91.7	94.7		適
	pH6.8		15	87.4	96.3		適
100rpm	pH6.8		15	102.1	97.3		適

●オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「タカタ」<sup>8)</sup>

本剤はオロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

1. 薬剤

- ・試験製剤：オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「タカタ」
- ・標準製剤：オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」

2. 試験方法

日局 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

3. 試験条件

- ・試験液量：900mL
- ・試験液温：37±0.5℃
- ・試験液：水
  - pH1.2＝溶出試験第1液
  - pH5.0＝pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液
  - pH6.8＝溶出試験第2液
- ・回転数：50rpm及び100rpm（pH5.0のみ）
- ・試験回数：各12ベッセル

4. 試験時間

- ・5、10、15及び30分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー

6. 判定基準

ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。

I. 平均溶出率

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0(50及び100rpm)、pH6.8が該当】

II. 個々の溶出率

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、以下の基準に適合する。

標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0(50及び100rpm)、pH6.8が該当】

## 7. 結果

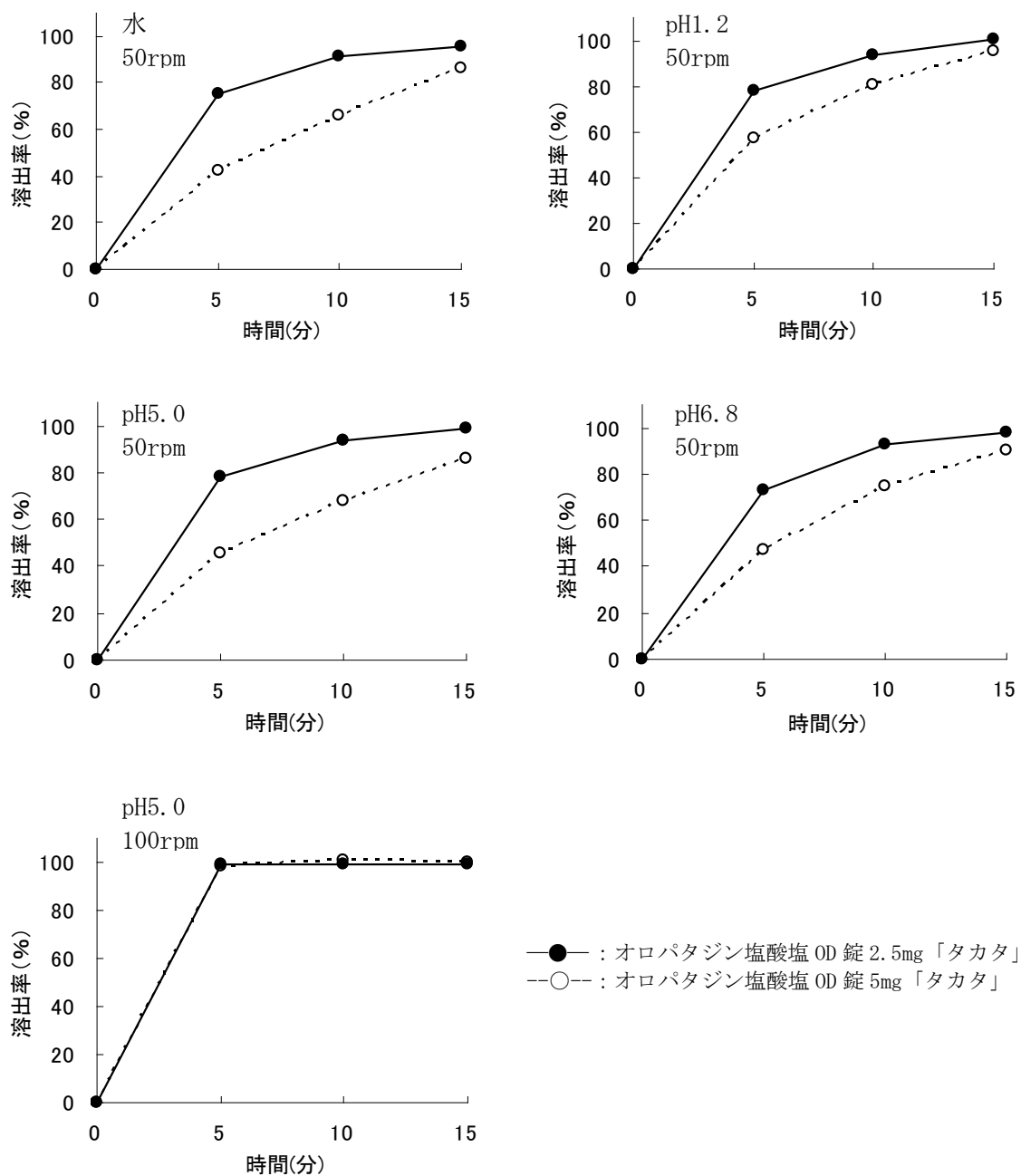


図 オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「タカタ」とオロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「タカタ」の平均溶出曲線

表 溶出挙動の同等性の判定結果

試験条件			平均溶出率 (%)		判定	
回転数	試験液	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤	平均溶出率	個々の溶出率
50rpm	水	15	86.6	96.0	適	適
	pH1.2	15	95.1	100.1	適	適
	pH5.0	15	85.8	98.7	適	適
	pH6.8	15	90.6	98.3	適	適
100rpm	pH5.0	15	100.4	99.3	適	適

●オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」<sup>9)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインについて」（平成9年12月22日付医薬審第487号）及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」（平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号）に従って試験を行ったところ、すべての試験条件においてガイドラインに示された基準に適合し、本剤と標準製剤の溶出挙動の類似性が確認された。溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない。

1. 薬剤

- ・試験製剤：オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」
- ・標準製剤：錠剤、5mg

2. 試験方法

日局 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

3. 試験条件

- ・試験液量：900mL
- ・試験液温：37±0.5℃
- ・試験液：水
  - pH1.2＝溶出試験第1液
  - pH5.0＝pH5.0の薄めたMcIlvaineの緩衝液
  - pH6.8＝溶出試験第2液
- ・回転数：50rpm及び100rpm（pH6.8のみ）
- ・試験回数：各12ベッセル

4. 試験時間

- ・5、10、15及び30分

5. 分析法

液体クロマトグラフィー

6. 判定基準

ガイドラインの判定基準より該当部分を記載。溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない。

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合

試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

【本試験では水、pH1.2、pH5.0、pH6.8(50及び100rpm)が該当】

## 7. 結果

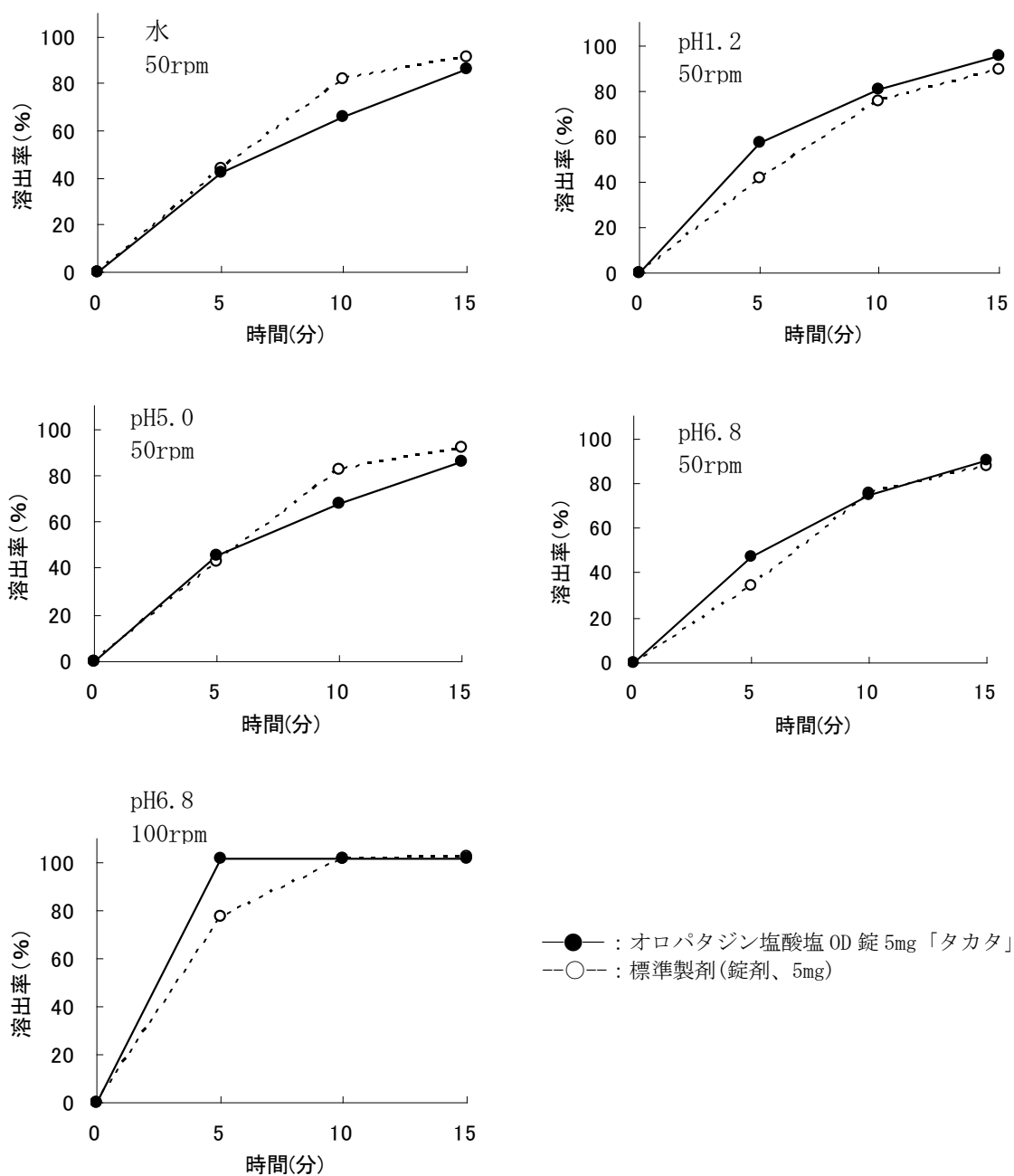


図 オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「タカタ」と標準製剤の平均溶出曲線

表 溶出挙動の類似性の判定結果

試験条件		判定基準		平均溶出率 (%)		両製剤の差 (%)	判定
回転数	試験液	溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤		
50rpm	水	15 分以内に平均 85% 以上溶出	15	91.1	86.6	/	適
	pH1.2		15	89.5	95.1		適
	pH5.0		15	91.7	85.8		適
	pH6.8		15	87.4	90.6		適
100rpm	pH6.8		15	102.1	101.8		適

## (2) 公的溶出規格

- オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「タカタ」  
本剤は、日局「オロパタジン塩酸塩錠」の溶出規格に適合していることが確認されている。

## 8. 生物学的試験法

該当資料なし

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「タカタ」  
日局「オロパタジン塩酸塩錠」の確認試験による。
- オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg・5mg「タカタ」  
紫外可視吸光度測定法

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

- オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「タカタ」  
日局「オロパタジン塩酸塩錠」の定量法による。
- オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg・5mg「タカタ」  
液体クロマトグラフィー

## 11. 力価

該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

## 14. 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

成人：

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹

皮膚疾患に伴う瘙痒(湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑)

小児：

アレルギー性鼻炎

蕁麻疹

皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚瘙癢症)に伴う瘙痒

### 2. 用法及び用量

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。

小児：

通常、7歳以上の小児には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。

(OD錠)

#### <用法・用量に関連する使用上の注意>

本剤は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜からは吸収されないため、唾液又は水で飲み込むこと。

(「Ⅷ. 14. 適用上の注意」の項参照)

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

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)

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

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、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン、レボセチリジン塩酸塩等<sup>10)</sup>

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

オロパタジン塩酸塩は、抗アレルギー薬である。ヒスタミン<sub>H1</sub>受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF等）の産生・遊離抑制作用を現す。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する。<sup>1)</sup>

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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<sup>11, 12)</sup>

	最高血中濃度到達時間(hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	0.8±0.3 (n=20)
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」(水なしで服用)	1.1±0.6 (n=20)
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」(水で服用)	0.7±0.2 (n=19)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

##### <生物学的同等性試験>

##### ●オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」<sup>6)</sup>

本剤はオロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。  
(「Ⅳ. 7. 溶出性」参照)

##### ●オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」<sup>11)</sup>

本剤と標準製剤(錠剤、5mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子 20 名にそれぞれ 1 錠(オロパタジン塩酸塩として 5mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、8 及び 12 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS により測定したオロパタジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は  $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。

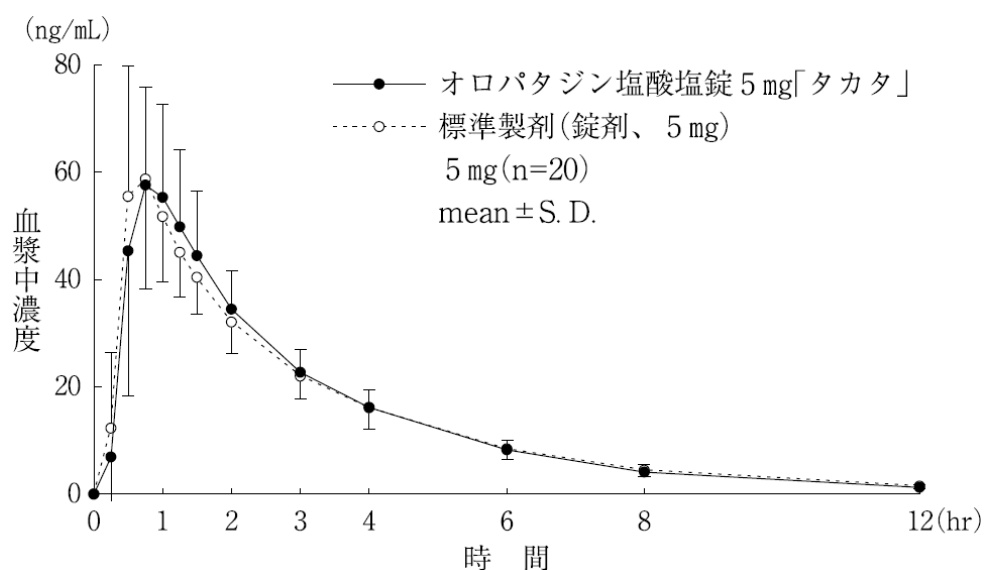


図 オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」と標準製剤の平均血漿中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

製剤	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>t</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	174.35±28.55	66.40±15.50	0.8±0.3	2.3±0.3
標準製剤（錠剤、5mg）	174.04±23.20	66.55±15.11	0.7±0.3	2.4±0.2

(mean±S. D.)

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

●オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「タカタ」<sup>8)</sup>

本剤はオロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。（「IV. 7. 溶出性」参照）

●オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」<sup>12)</sup>

(1) 水なしで服用

本剤と標準製剤（錠剤、5mg）をクロスオーバー法により、健康成人男子 20 名にそれぞれ 1 錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、8 及び 12 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS により測定したオロパタジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は  $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。

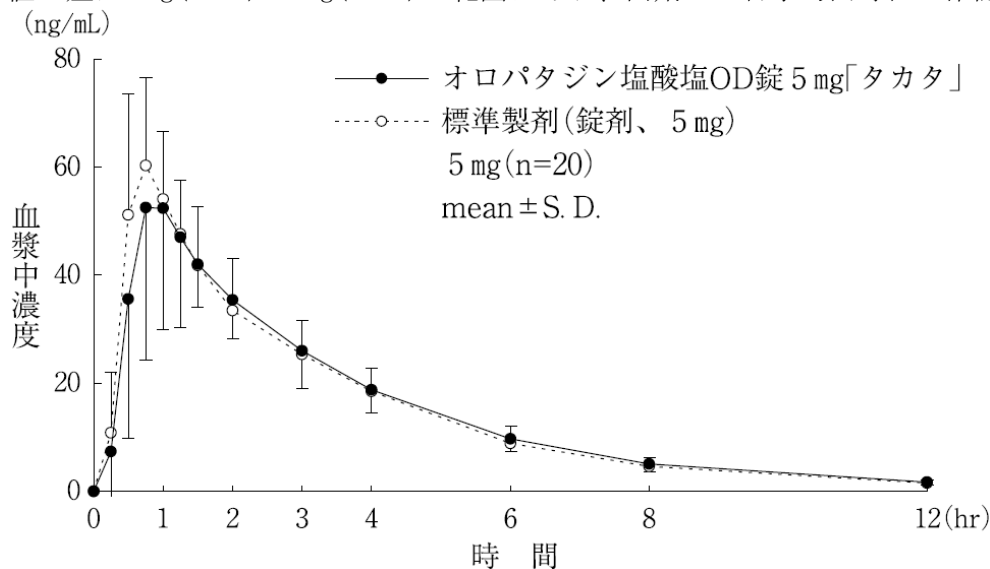


図 オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」と標準製剤の平均血漿中濃度推移（水なしで服用）

表 薬物動態パラメータ

製剤	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>t</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「タカタ」	183.05±25.25	64.19±20.47	1.1±0.6	2.4±0.2
標準製剤（錠剤、5mg）	184.35±24.67	65.12±16.78	0.9±0.5	2.4±0.3

(mean±S. D.)

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

## (2) 水で服用

本剤と標準製剤（錠剤、5mg）をクロスオーバー法により、健康成人男子 19 名にそれぞれ 1 錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後 0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、8 及び 12 時間に前腕静脈から採血した。LC/MS により測定したオロパタジンの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて 90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差は  $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。

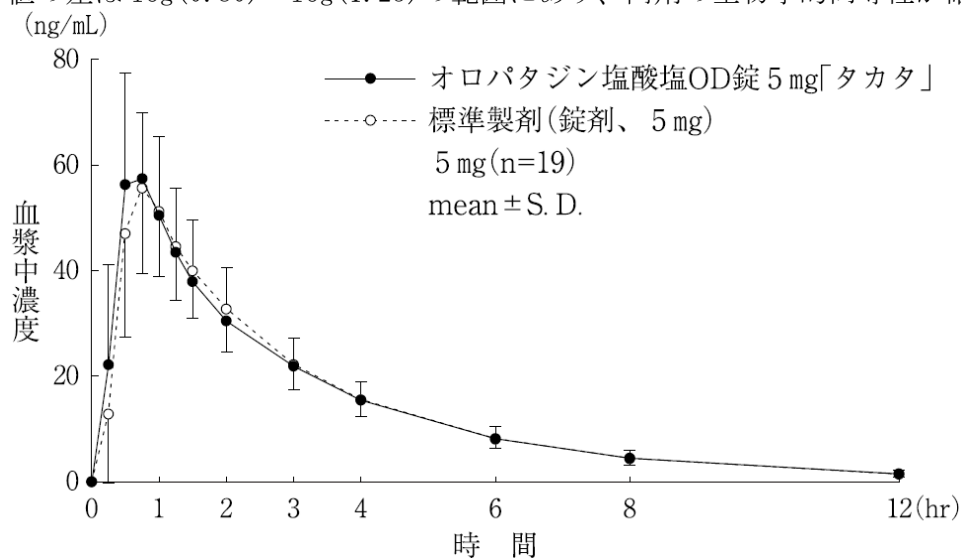


図 オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「タカタ」と標準製剤の平均血漿中濃度推移（水で服用）

表 薬物動態パラメータ

製剤	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>t</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」	172.55±28.99	63.78±16.84	0.7±0.2	2.5±0.3
標準製剤 (錠剤、5mg)	169.82±28.92	61.38±15.29	0.8±0.3	2.5±0.2

(mean±S. D.)

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

(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

健康成人男子 (摂食下) 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 K<sub>a</sub> は 2.95 (hr<sup>-1</sup>)、その時の吸収ラグタイムは 0.24hr であった<sup>1)</sup>。

【本剤の承認された用法及び用量】

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。  
(「V. 2. 用法及び用量」参照)

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数<sup>11, 12)</sup>

	消失速度定数 [kel (hr <sup>-1</sup> )]
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	0.31±0.04 (n=20)
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」(水なしで服用)	0.29±0.02 (n=20)
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」(水で服用)	0.28±0.04 (n=19)

### (5) クリアランス

健康成人男子(摂食下)にオロパタジン塩酸塩 10mg を単回経口投与したとき、クリアランス CL/F は平均で 19.33L/hr と算出された<sup>1)</sup>。

#### 【本剤の承認された用法及び用量】

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。

(「V.2.用法及び用量」参照)

### (6) 分布容積

健康成人男子(摂食下)にオロパタジン塩酸塩 10mg を単回経口投与したとき、分布容積 Vd $\beta$ /F は平均で 305L と算出された<sup>1)</sup>。

#### 【本剤の承認された用法及び用量】

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。

(「V.2.用法及び用量」参照)

### (7) 血漿蛋白結合率

健康成人男子(摂食下)にオロパタジン塩酸塩 10mg を単回経口投与したときの投与2時間後、12時間後の血漿タンパク結合率は、それぞれ 67.9%、65.6%であった<sup>1)</sup>。

#### 【本剤の承認された用法及び用量】

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。

(「V.2.用法及び用量」参照)

## 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) 胎児への移行性

該当資料なし

### (3) 乳汁中への移行性

動物実験(ラット)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。

### (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

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(2) 排泄率

健康成人にオロパタジン塩酸塩 5mg 及び 10mg を単回経口投与した場合の 48 時間までの未変化体の尿中排泄率は、投与量の 63.0～71.8%であった。また、1 回 10mg を 1 日 2 回 6 日間、7 日目に 1 回の計 13 回反復経口投与した時、単回経口投与後の尿中排泄率と同程度であった。<sup>1)</sup>

**【本剤の承認された用法及び用量】**

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。  
（「V. 2. 用法及び用量」参照）

(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

該当資料なし

8. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

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

添付文書に記載なし

### 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

「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照すること。

### 5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 腎機能低下患者[高い血中濃度が持続するおそれがある。]
- (2) 高齢者（「Ⅷ. 9. 高齢者への投与」の項参照）
- (3) 肝機能障害のある患者[肝機能障害が悪化するおそれがある。]

### 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) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には、自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう十分注意すること。
- (2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には、十分な管理下で徐々に行うこと。
- (3) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
- (4) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

添付文書に記載なし

#### (2) 併用注意とその理由

添付文書に記載なし

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### 重大な副作用（頻度不明）

劇症肝炎、肝機能障害、黄疸 劇症肝炎、AST（GOT）、ALT（GPT）、 $\gamma$ -GTP、LDH、Al-Pの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

### (3) その他の副作用

下記のような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、減量・休薬等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過 敏 症 <sup>注)</sup>	紅斑等の発疹、浮腫（顔面・四肢等）、痒痒、呼吸困難
精 神 神 経 系	眠気、倦怠感、口渇、頭痛・頭重感、めまい、集中力低下、しびれ感、不随意運動（顔面・四肢等）
消 化 器	腹部不快感、腹痛、下痢、嘔気、便秘、口内炎・口角炎・舌痛、胸やけ、食欲亢進、嘔吐
肝 臓	肝機能異常（ALT（GPT）上昇、AST（GOT）上昇、LDH 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、Al-P 上昇、総ビリルビン上昇）
血 液	白血球増多、好酸球増多、リンパ球減少、白血球減少、血小板減少
腎 臓・ 泌 尿 器	尿潜血、BUN 上昇、尿蛋白陽性、血中クレアチニン上昇、頻尿、排尿困難
循 環 器	動悸、血圧上昇
そ の 他	血清コレステロール上昇、尿糖陽性、胸部不快感、味覚異常、体重増加、ほてり、月経異常、筋肉痛、関節痛

注) 症状があらわれた場合には、投与を中止すること。（太字）

### (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

「Ⅷ. 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」に以下の記載あり。

**【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

「Ⅷ. 8. (3) その他の副作用」に以下の記載あり。

過敏症<sup>注)</sup>：紅斑等の発疹、浮腫（顔面・四肢等）、痒痒、呼吸困難

注) 症状があらわれた場合には、投与を中止すること。（太字）

## 9. 高齢者への投与

高齢者では、生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすいので、低用量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

## 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)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。(使用経験が少ない。)

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与は、アレルギー皮内反応を抑制し、アレルギーの確認に支障を来すので、アレルギー皮内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。

## 13. 過量投与

該当資料なし

## 14. 適用上の注意

**薬剤交付時:** PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

**薬剤分割時:** 分割したときはしゃ光下に保存すること。(錠)

**服用時:** 本剤は舌の上のにせ、唾液を浸潤させて、唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。(OD錠)

## 15. その他の注意

因果関係は明らかではないが、オロパタジン塩酸塩錠(普通錠)を投与中に心筋梗塞の発症がみられた症例が報告されている。

## 16. その他

該当しない

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）
- (2) 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  
該当資料なし
- (3) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
- (4) その他の特殊毒性  
該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤: オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」: 該当しない  
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」: 該当しない  
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「タカタ」: 該当しない  
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」: 該当しない  
有効成分: オロパタジン塩酸塩: 該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限: 外箱等に表示(3年)

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱いについて

該当しない

#### (2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)

「Ⅷ. 14. 適用上の注意」参照

・くすりのしおり: 有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」	PTP 包装: 100 錠 (10 錠×10)
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「タカタ」	PTP 包装: 100 錠 (10 錠×10) バラ包装: 500 錠 (プラスチック瓶)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	PTP 包装: 100 錠 (10 錠×10) 500 錠 (10 錠×50)
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」	700 錠 (14 錠×50) バラ包装: 500 錠 (プラスチック瓶)

## 7. 容器の材質

表 オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」

PTP 包装	PTP：ポリ塩化ビニリデン・ポリ塩化ビニル複合フィルム、 アルミニウム箔 個装箱：紙
--------	--

表 オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」

PTP 包装	PTP：ポリ塩化ビニリデン・ポリ塩化ビニル複合フィルム、 アルミニウム箔 個装箱：紙
バラ包装	瓶：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン（シリカゲル乾燥剤入り） 個装箱：紙

表 オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg・5mg「タカタ」

PTP 包装	PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔 ピロー：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム（シリカゲル乾燥剤入り） 個装箱：紙
バラ包装	瓶：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン（シリカゲル乾燥剤入り） 個装箱：紙

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレロック錠 2.5・5/OD 錠 2.5・5/顆粒 0.5%、パタノール点眼液 0.1%

同効薬：エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、レボセチリジン塩酸塩等<sup>10)</sup>

## 9. 国際誕生年月日

1996年12月18日

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」	2012年8月15日	22400AMX00974
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	2012年8月15日	22400AMX00975
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「タカタ」	2012年8月15日	22400AMX00976
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」	2012年8月15日	22400AMX00977

**11. 薬価基準収載年月日**

2012年12月14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**

2014年12月10日：7歳以上の小児へのアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎・皮膚掻痒症）に伴う掻痒

**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. 投与期間制限医薬品に関する情報**

該当しない

**16. 各種コード**

販売名	HOTコード(9桁)	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
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」	121901201	4490025F1015	622190101
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」	121902901	4490025F2011	622190201
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「タカタ」	121903601	4490025F3018	622190301
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「タカタ」	121904301	4490025F4014	622190401

**17. 保険給付上の注意**

本剤は保険診療上の後発医薬品である。



## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十七改正 日本薬局方解説書（廣川書店）C-1207, 2016.
- 2) 高田製薬(株)社内資料(錠 2.5mg:安定性)
- 3) 高田製薬(株)社内資料(錠 5mg:安定性)
- 4) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 2.5mg:安定性)
- 5) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 5mg:安定性)
- 6) 高田製薬(株)社内資料(錠 2.5mg:生物学的同等性及び溶出性)
- 7) 高田製薬(株)社内資料(錠 5mg:溶出性)
- 8) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 2.5mg:生物学的同等性及び溶出性)
- 9) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 5mg:溶出性)
- 10) 薬剤分類情報閲覧システム  
<<http://www.iryohoken.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2022/5/23 アクセス)
- 11) 高野和彦他:診療と新薬, 49(10):1243, 2012.
- 12) 松本千恵子他:診療と新薬, 49(10):1255, 2012.
- 13) 高田製薬(株)社内資料(錠 2.5mg/OD 錠 5mg:粉碎後の安定性)
- 14) 高田製薬(株)社内資料(錠 2.5mg・5mg:崩壊・懸濁性及び経管チューブ通過性)
- 15) 高田製薬(株)社内資料(OD 錠 2.5mg・5mg:崩壊・懸濁性及び経管チューブ通過性)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## **XII. 参考資料**

### **1. 主な外国での発売状況**

該当資料なし

### **2. 海外における臨床支援情報**

該当資料なし

### XIII 備考

#### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

##### 情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

##### (1) 粉砕<sup>13)</sup>

##### ●オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」

「25℃、60%RH、遮光、開放」で30日の保存条件では、外観は変化がなかったが、7日及び30日の保存条件では、含量が規格外であり、7日、14日及び30日で水分に変化があった。

「25℃、75%RH、遮光、開放」で30日の保存条件では、外観は変化がなかったが、7日、14日及び30日の保存条件では、含量が規格外であり、7日、14日及び30日で水分に変化があった。

表

(1ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	7日	14日	30日
25℃ 60%RH 遮光 / 開放	外観	白色の粉末に淡黄赤色のフィルム片が混在、 においはない。	白色の粉末に淡黄赤色のフィルム片が混在、 においはない。		
	含量(%)	95.18	94.13 <sup>※1</sup>	95.07	94.25 <sup>※1</sup>
	水分(%)	4.87	5.28	5.37	5.41
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	白色の粉末に淡黄赤色のフィルム片が混在、 においはない。	白色の粉末に淡黄赤色のフィルム片が混在、 においはない。		
	含量(%)	95.18	92.66 <sup>※1</sup>	92.73 <sup>※1</sup>	92.27 <sup>※1</sup>
	水分(%)	4.87	5.36	5.54	5.84

※1 規格外

《参考》

- ・製剤の規格値を用いて判定した項目：含量
- ・規格値を設定していない項目：外観、水分

本剤 OD錠 2.5mg・5mg は、処方成分及び処方比率が同一であるため、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」のみで粉碎後の安定性試験を実施した。

●オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」

「25℃、60%RH、遮光、開放」で30日の保存条件では、含量は規格内であり、外観は変化がなかったが、7日、14日及び30日で水分に変化があった。

「25℃、75%RH、遮光、開放」で30日の保存条件では、含量は規格内であり、外観は変化がなかったが、7日、14日及び30日で水分に変化があった。

表

(1ロット)

保存条件	試験項目	試験開始時	7日	14日	30日
25℃ 60%RH 遮光 / 開放	外観	黄色の粉末で、メントールのにおいがある	黄色の粉末で、メントールのにおいがある		
	含量(%)	97.84	97.66	98.10	97.84
	水分(%)	5.94	6.44	6.19	6.29
25℃ 75%RH 遮光 / 開放	外観	黄色の粉末で、メントールのにおいがある	黄色の粉末で、メントールのにおいがある		
	含量(%)	97.84	97.75	97.62	97.85
	水分(%)	5.94	6.34	6.60	6.59

《参考》

- ・製剤の規格値を用いて判定した項目：含量
- ・規格値を設定していない項目：外観、水分

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性<sup>14, 15)</sup>

### 1. 試験方法

#### (1) 崩壊懸濁試験

本剤（1錠をそのまま又は1回量の粉末製剤）を55℃の温湯20mLを入れたポリエチレン製のビーカーに投入し、直後に外観を観察した。5分後、ガラス棒で3～4回攪拌した後、外観を観察した。更に5分間放置後、同様な操作を行い、外観を観察した。

#### (2) チューブ通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をシリンジ内に吸い取り、経管栄養チューブの注入端より2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは、ベッド上の患者様を想定し、体内挿入端から2/3を水平に、他端（注入端）を30cmの高さにセットした。サイズは8Fr.（フレンチ）を用いて通過性を観察した。8Fr.のチューブ通過性に問題がある場合、チューブのサイズを12、14、16Fr.の順に替えて注入し、通過性を観察することとした。

#### (3) 懸濁液の安定性試験

室温懸濁と55℃で懸濁したときの含量比較を行った。

#### (4) 経管栄養チューブへの原薬吸着性

簡易懸濁時の濃度に相当するように原薬を水で懸濁し、「(2)チューブ通過性試験」の方法に準じて通過性試験を実施し、通過された水溶液を回収した。通過性試験前後の水溶液について、含量測定を行った。

### 2. 試験製剤

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「タカタ」（1錠）

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「タカタ」（1錠）

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「タカタ」（1錠）

オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「タカタ」（1錠）

### 3. 試験時期

2012年11月13日～2012年11月19日

### 4. 試験結果

#### (1) 崩壊懸濁試験

いずれも10分以内に崩壊・懸濁した。

#### (2) チューブ通過性試験

いずれも8Fr.のチューブを通過した。

### (3) 懸濁液の安定性試験

製品名	条件	含量 (%)	室温懸濁との差 (%)
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「タカタ」	室温	97.3	—
	55℃	98.2	0.9
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「タカタ」	室温	99.0	—
	55℃	99.0	0.0
オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg 「タカタ」	室温	99.7	—
	55℃	99.7	0.0
オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg 「タカタ」	室温	99.7	—
	55℃	101.8	2.1

### (4) 経管栄養チューブへの原薬吸着性

濃度	条件	含量 (%)	通過前後の差 (%)
オロパタジン塩酸塩 2.5mg/20mL	通過前	99.8	—
	通過後	100.6	0.8

## 2. その他の関連資料

該当資料なし

MEMO

製造販売

**高田製薬株式会社**

さいたま市西区宮前町203番地1