

## 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2008に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤

日本薬局方 オロパタジン塩酸塩錠

**オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「NPI」**

**オロパタジン塩酸塩錠5mg「NPI」**

**Olopatadine**

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「NPI」：1錠中(日局)オロパタジン塩酸塩 2.5mg オロパタジン塩酸塩錠 5mg「NPI」：1錠中(日局)オロパタジン塩酸塩 5.0mg
一般名	和名：オロパタジン塩酸塩 (JAN) 洋名：Olopatadine Hydrochloride (JAN)
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：2013年8月15日 薬価基準収載年月日：2017年10月1日 発売年月日：2017年10月1日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本薬品工業株式会社 安全管理課 TEL. 03-5833-5011/FAX. 03-5833-5100 受付時間：9:00～17:00（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.npi-inc.co.jp/medical.html">http://www.npi-inc.co.jp/medical.html</a>

本IFは2017年10月改訂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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://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 ー日本病院薬剤師会ー

### 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新たな IF 記載要領が策定された。

### 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 2008」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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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。

(2008 年 9 月)

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	化合物群	11
1. 開発の経緯	1	2. 薬理作用	11
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	VII. 薬物動態に関する項目	12
II. 名称に関する項目	2	1. 血中濃度の推移・測定法	12
1. 販売名	2	2. 薬物速度論的パラメータ	13
2. 一般名	2	3. 吸収	13
3. 構造式又は示性式	2	4. 分布	13
4. 分子式及び分子量	2	5. 代謝	14
5. 化学名（命名法）	2	6. 排泄	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	7. 透析等による除去率	14
7. CAS登録番号	2	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	15
III. 有効成分に関する項目	3	1. 警告内容とその理由	15
1. 物理化学的性質	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	15
3. 有効成分の確認試験法	3	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	15
4. 有効成分の定量法	3	5. 慎重投与内容とその理由	15
IV. 製剤に関する項目	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
1. 剤形	4	7. 相互作用	15
2. 製剤の組成	4	8. 副作用	15
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	9. 高齢者への投与	16
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	11. 小児等への投与	17
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
7. 溶出性	5	13. 過量投与	17
8. 生物学的試験法	8	14. 適用上の注意	17
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	15. その他の注意	17
10. 製剤中の有効成分の定量法	8	16. その他	17
11. 力価	8	IX. 非臨床試験に関する項目	18
12. 混入する可能性のある夾雑物	8	1. 薬理試験	18
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	8	2. 毒性試験	18
14. その他	9	X. 管理的事項に関する項目	19
V. 治療に関する項目	10	1. 規制区分	19
1. 効能又は効果	10	2. 有効期間又は使用期限	19
2. 用法及び用量	10	3. 貯法・保存条件	19
3. 臨床成績	10	4. 薬剤取扱い上の注意点	19
VI. 薬効薬理に関する項目	11		
1. 薬理学的に関連ある化合物又は			

5. 承認条件等 .....	19
6. 包装 .....	19
7. 容器の材質 .....	19
8. 同一成分・同効薬 .....	19
9. 国際誕生年月日 .....	19
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 ..	20
11. 薬価基準収載年月日 .....	20
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 ..	20
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容 .....	20
14. 再審査期間 .....	20
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 ..	20
16. 各種コード .....	20
17. 保険給付上の注意 .....	20
<b>XI. 文献</b> .....	21
1. 引用文献 .....	21
2. その他の参考文献 .....	21
<b>XII. 参考資料</b> .....	22
1. 主な外国での発売状況 .....	22
2. 海外における臨床支援情報 .....	22
<b>XIII. 備考</b> .....	23
その他の関連資料 .....	23

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

オロパタジン塩酸塩錠は、アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では 2001 年に上市されている。オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「NPI」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「NPI」は、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「KOG」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「KOG」として、興和株式会社により後発医薬品として開発が企画され、薬食発第 0331015 号（2005 年 3 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2013 年 8 月に承認され、2013 年 12 月より興和ジェネリック株式会社（2015 年 4 月、興和創薬株式会社に吸収合併）より販売された。

その後、「小児に対するアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症）に伴う掻痒」の効能又は効果が 2014 年 11 月に追加承認された。

2017 年 10 月に日本薬品工業株式会社が製造販売承認を承継し、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「NPI」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「NPI」へ名称変更し、販売された。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) オロパタジン塩酸塩錠 5mg「NPI」は、健康成人男子を対象に、薬物動態パラメータ（AUC 及び  $C_{max}$ ）を評価した試験により、オロパタジン塩酸塩標準剤との生物学的同等性が確認された後発医薬品である。

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「NPI」は、「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、5mg 錠を標準剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた後発医薬品である。 (12 頁参照)

- (2) 成人は、アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴う掻痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚掻痒症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑）に適応を有する。

小児は、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）に伴う掻痒に適応を有する。 (10 頁参照)

- (3) 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。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。 (16 頁参照)

## 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 「NPI」

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」

## (2) 洋名

Olopatadine

## (3) 名称の由来

一般名（オロパタジン塩酸塩）＋剤形（錠）＋規格・含量（2.5mg、5mg）＋屋号（「NPI」）

注）NPI：日本薬品工業株式会社の屋号

## 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）

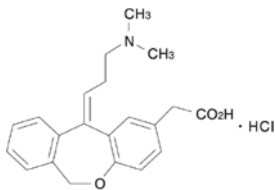
Olopatadine Hydrochloride（JAN）

olopatadine（INN）

## (3) ステム

histamine- $H_1$  receptor antagonists, tricyclic compounds（ヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗剤、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

別名：塩酸オロパタジン

## 7. CAS 登録番号

140462-76-6

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

### 1. 物理化学的性質

#### (1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

#### (2) 溶解性

溶媒	日本薬局方の表現
ギ酸	極めて溶けやすい
水	やや溶けにくい
エタノール (99.5)	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）

#### (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

pH：2.3～3.3（1.0g を水 100mL に溶かした液）

### 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

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」の確認試験法による。

### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方「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、規格及び性状

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」：フィルムコーティング錠

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」：片面割線入りフィルムコーティング錠

販売名	色調	外観	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」	淡黄 赤色		6.1	2.7	80.0
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」	淡黄 赤色		7.1	2.8	120.0

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」：NPI 157

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」：NPI 158

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

### 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 「NPI」：1錠中(日局)オロパタジン塩酸塩 2.5mg

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」：1錠中(日局)オロパタジン塩酸塩 5.0mg

#### (2) 添加物

##### オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」

D-マンニトール、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース（置換度タイプ：2910）、マクロゴール 6000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

##### オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」

D-マンニトール、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース（置換度タイプ：2910）、マクロゴール 6000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

#### (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

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」<sup>1)</sup>

試験	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
加速試験	40°C、75%RH	6 ヶ月	PTP シート+紙箱	規格範囲内

測定項目：性状、確認試験、純度試験、溶出性、定量法

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」<sup>2)</sup>

試験	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
加速試験	40°C、75%RH	6 ヶ月	PTP シート+紙箱	規格範囲内

測定項目：性状、確認試験、純度試験、溶出性、定量法

「使用期限」、「貯法・保存条件」については「X. 管理的事項に関する項目」参照

## 5. 調製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

## 溶出挙動における類似性

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」<sup>4)</sup>

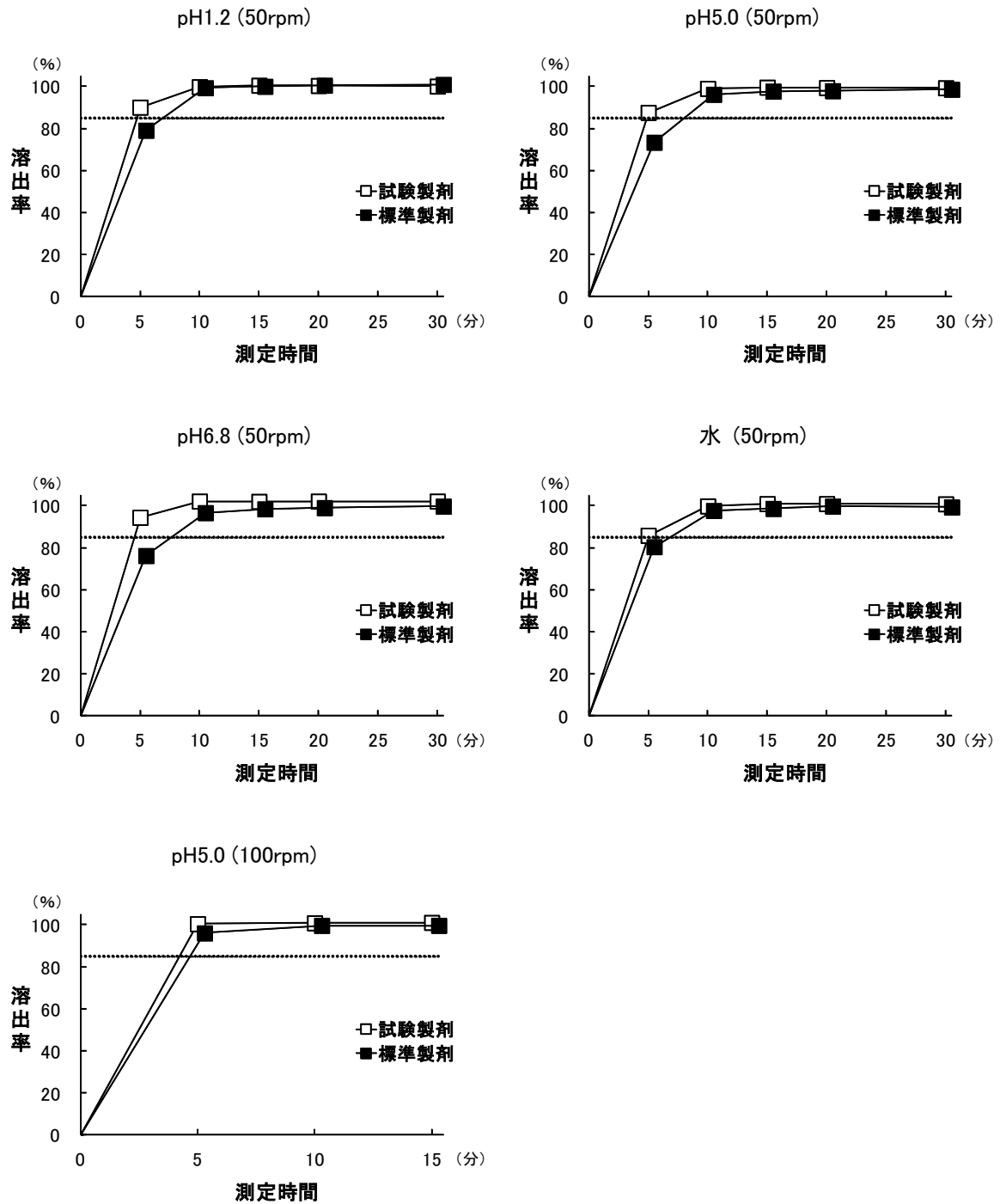
標準製剤との溶出挙動を比較するため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従って溶出試験を行った結果、全ての溶出試験条件において判定基準に適合しており、両製剤の溶出挙動は類似していると判定された。

## 試験条件

装置	パドル法
試験液の量	900mL
試験液の温度	37±0.5°C
試験液 (回転数 (rpm))	pH1.2 溶出試験第 1 液 (50)、pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液 (50、100)、 pH6.8 溶出試験第 2 液 (50)、水 (50)

## 平均溶出率

試験液	回転数 (rpm)	判定時点 (分)	平均溶出率 (%)			判定基準	判定
			標準製剤	試験製剤	差		
pH1.2	50	15	100.0	100.5	+0.5	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。	適合
pH5.0	50	15	97.7	99.6	+1.9		適合
pH6.8	50	15	98.4	102.0	+3.6		適合
水	50	15	98.6	100.9	+2.3		適合
pH5.0	100	15	99.6	101.0	+1.4		適合



### 溶出挙動における同等性

#### オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」<sup>3)</sup>

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」とオロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」(標準製剤)との生物学的同等性を検討するため、「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(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)」に従い、B水準により処方設定した試験製剤(オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」)と標準製剤(オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」)の溶出挙動の同等性を判定した。その結果、全ての試験条件において、試験製剤が溶出挙動の同等性の判定基準(平均溶出率及び個々の溶出率)に適合したため、試験製剤と標準製剤の溶出挙動は同等と判定された。

## 試験条件

装置	パドル法
試験液の量	900mL
試験液の温度	37±0.5℃
試験液 (回転数 (rpm))	pH1.2 溶出試験第1液 (50)、pH4.0 薄めた McIlvaine の緩衝液 (50、100)、 pH6.8 溶出試験第2液 (50)、水 (50)

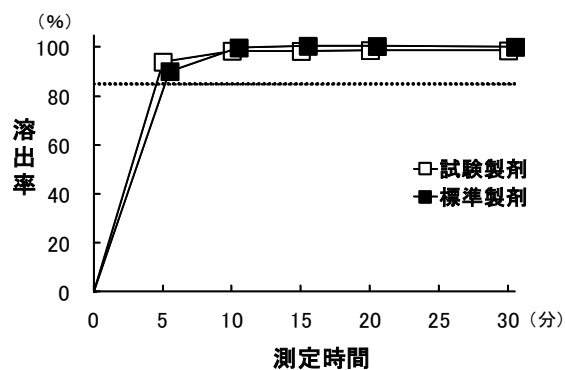
## 平均溶出率

試験液	回転数 (rpm)	判定時点 (分)	平均溶出率 (%)			判定基準	判定
			標準製剤	試験製剤	差		
pH1.2	50	15	100.5	98.4	-2.1	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。	適合
pH4.0	50	15	98.9	100.4	+1.5		適合
pH6.8	50	15	102.0	99.8	-2.2		適合
水	50	15	100.9	99.4	-1.5		適合
pH4.0	100	15	99.8	100.5	+0.7		適合

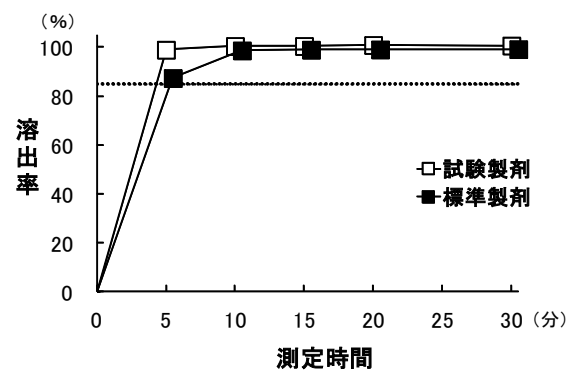
## 個々の溶出率

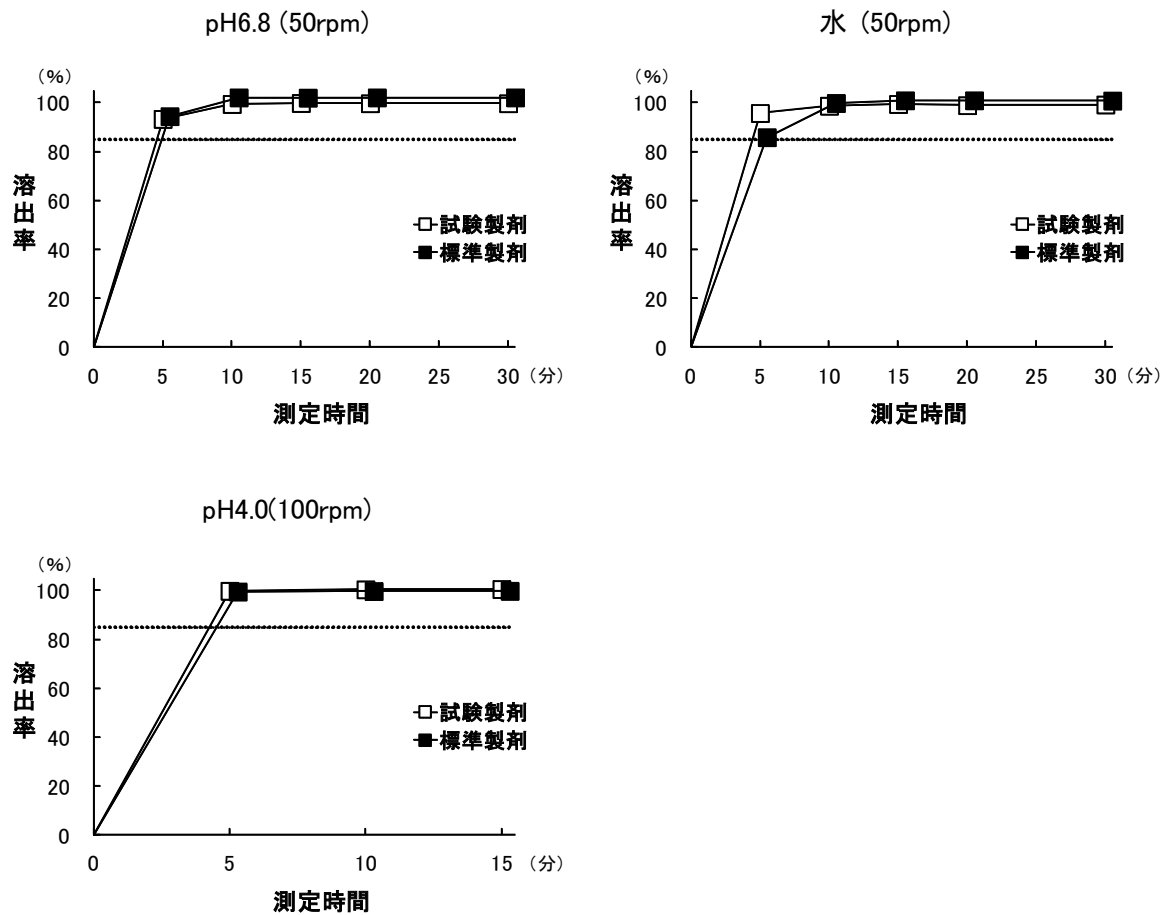
試験液	回転数 (rpm)	判定時点 (分)	試験製剤		判定基準	判定
			平均溶出率 (%)	個々の溶出率 (%) 最小値～最大値		
pH1.2	50	15	98.4	96.0～101.6	標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、最 終比較時点における試験 製剤の個々の溶出率につ いて、試験製剤の平均溶 出率±15%の範囲を超える ものが 12 個中 1 個以下 で、±25%の範囲を超える ものがない。	適合
pH4.0	50	15	100.4	95.6～106.0		適合
pH6.8	50	15	99.8	97.2～101.6		適合
水	50	15	99.4	96.8～104.0		適合
pH4.0	100	15	100.5	98.8～103.2		適合

pH1.2 (50rpm)



pH4.0 (50rpm)





#### 公的溶出試験への適合性<sup>3)4)</sup>

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「NPI」、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「NPI」は、日本薬局方医薬品各条に定められた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。

方法：日局溶出試験法（パドル法、シンカー使用）

回転数：50rpm

試験液：水（900mL）

結果：2.5mg 錠、5mg 錠の 15 分間の溶出率はいずれも 85%以上であった。

#### 8. 生物学的試験法

該当しない

#### 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」の確認試験法による。

#### 10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」の定量法による。

#### 11. 力価

該当しない

#### 12. 混入する可能性のある夾雑物

不純物として  $\alpha$ -hydroxy 体及び *E*-体が知られている。

#### 13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験：用量反応探索試験

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、メキタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、エメダスチンフマル酸塩、ロラタジン等のヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗剤

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

抗アレルギー薬。ヒスタミン  $H_1$  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。

#### (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

「VII. 1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

## (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 「NPI」<sup>3)</sup>

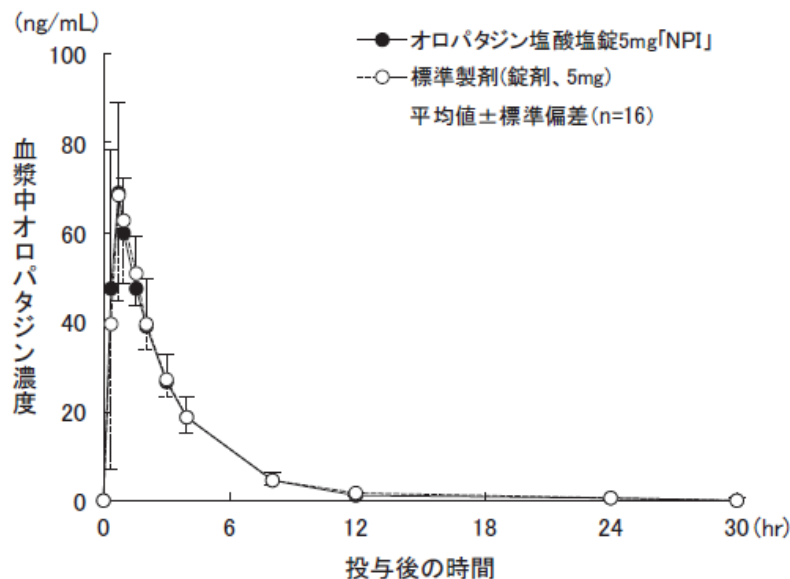
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）」に基づき、オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。（「IV.7. 溶出性」の項参照）

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」<sup>5)</sup>

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）を健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 $C_{max}$ ）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→30</sub> (ng・hr/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$T_{max}$ (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」	222.2±31.1	76.8±12.2	0.80±0.44	4.96±1.98
標準製剤（錠剤、5mg）	224.7±31.2	77.0±13.5	0.80±0.44	5.11±1.83
対数値の平均値の差の 90% 信頼区間	$\log(0.9524)$ ～ $\log(1.0267)$	$\log(0.9274)$ ～ $\log(1.0804)$	—	—

(平均値±標準偏差、n=16)



血漿中濃度並びに AUC、 $C_{\max}$ 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) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(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

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

「VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 (2)」の項参照

## (4) 髄液への移行性

該当資料なし

## (5) その他の組織への移行性

該当資料なし

## 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

該当資料なし

## (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 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

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（「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は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。

(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

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

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

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、しびれ感、集中力低下、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〔AST（GOT）、ALT（GPT）、 $\gamma$ -GTP、LDH、Al-P、総ビリルビン上昇〕
血 液	白血球増多・減少、好酸球増多、リンパ球減少、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、排尿困難、頻尿
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) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

## (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

その他の副作用

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（頻度不明）

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

## 9. 高齢者への投与

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

## 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

## 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

## 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

該当しない

## 14. 適用上の注意

## 適用上の注意

- (1) 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、更には穿孔をお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。〕
- (2) 薬剤分割時：分割したときは遮光下に保存すること。

## 15. その他の注意

## その他の注意

因果関係は明らかではないが、本剤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・5mg 「NPI」）

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：外箱に表示（期限内に使用すること。）（3年）

### 3. 貯法・保存条件

密閉容器、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

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法（1）」、「VIII. 14. 適用上の注意」の項参照

### 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 「NPI」	PTP：100錠（10錠×10）
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」	PTP：100錠（10錠×10）、500錠（10錠×50）

### 7. 容器の材質

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」	PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔紙箱
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」	PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔紙箱

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレロック錠 2.5、アレロック錠 5

同効薬：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、メキタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、エメダスチンフマル酸塩、ロラタジン

### 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

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」

製造販売承認年月日：2013年8月15日（販売名変更による）

承認番号：22500AMX01562000

（旧販売名） オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「KOG」 承認年月日：2013年8月15日

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」

製造販売承認年月日：2013年8月15日（販売名変更による）

承認番号：22500AMX01563000

（旧販売名） オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「KOG」 承認年月日：2013年8月15日

## 11. 薬価基準収載年月日

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」（新販売名） 2017年10月1日

（旧販売名） オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「KOG」 2013年12月13日

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」（新販売名） 2017年10月1日

（旧販売名） オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「KOG」 2013年12月13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

## 効能又は効果追加

2014年11月14日

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）に伴う瘙癢

## 用法及び用量追加

2014年11月14日

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。

## 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、投与期間に関する制限は定められていない。

## 16. 各種コード

販売名	HOT（9桁）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
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」	122770302	4490025F1309	622277002
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」	122771002	4490025F2305	622277102

## 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) 日本薬品工業株式会社：オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」安定性試験（社内資料）
- 2) 日本薬品工業株式会社：オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」安定性試験（社内資料）
- 3) 日本薬品工業株式会社：オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「NPI」生物学的同等性試験（溶出試験）（社内資料）
- 4) 日本薬品工業株式会社：オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」溶出試験（社内資料）
- 5) 日本薬品工業株式会社：オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「NPI」生物学的同等性試験（社内資料）

### 2. その他の参考文献

名称・製剤・薬効薬理についての参考文献

第十七改正日本薬局方解説書（廣川書店）（2016）

The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names (INN) for pharmaceutical substances, 2013

---

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし

