

**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

**アレルギー性疾患治療剤**  
**オロパタジン塩酸塩口腔内崩壊錠**  
**オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「NIG」**  
**オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「NIG」**  
**Olopatadine Hydrochloride OD Tablets**

|                             |   |
|-----------------------------|---|
| 剤形                          | 口腔内崩壊錠  |
| 製剤の規制区分                     | なし  |
| 規格・含量                       | 2.5mg：1 錠中オロパタジン塩酸塩 2.5mg 含有<br>5mg：1 錠中オロパタジン塩酸塩 5.0mg 含有  |
| 一般名                         | 和名：オロパタジン塩酸塩<br>洋名：Olopatadine Hydrochloride  |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・販売開始年月日 | 製造販売承認：2012 年 8 月 15 日<br>薬価基準収載：2022 年 12 月 9 日<br>販売開始：2012 年 12 月 14 日   |
| 開発・製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名    | 販売：武田薬品工業株式会社<br>発売元：日医工株式会社<br>製造販売元：日医工岐阜工場株式会社   |
| 医薬情報担当者の連絡先                 |   |
| 問い合わせ窓口                     | 日医工株式会社 お客様サポートセンター<br>TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948<br>医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a> |

本 IF は 2023 年 9 月改訂（第 1 版）の添付文書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。

# 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て、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

|                              |           |                                       |           |
|------------------------------|-----------|---------------------------------------|-----------|
| <b>I. 概要に関する項目</b> .....     | <b>1</b>  | <b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....           | <b>15</b> |
| 1. 開発の経緯.....                | 1         | 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ...              | 15        |
| 2. 製品の治療学的特性.....            | 1         | 2. 薬理作用.....                          | 15        |
| 3. 製品の製剤学的特性.....            | 1         | <b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....          | <b>16</b> |
| 4. 適正使用に関して周知すべき特性.....      | 1         | 1. 血中濃度の推移.....                       | 16        |
| 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....    | 1         | 2. 薬物速度論的パラメータ.....                   | 18        |
| 6. RMP の概要.....              | 1         | 3. 母集団（ポピュレーション）解析.....               | 18        |
| <b>II. 名称に関する項目</b> .....    | <b>2</b>  | 4. 吸収.....                            | 19        |
| 1. 販売名.....                  | 2         | 5. 分布.....                            | 19        |
| 2. 一般名.....                  | 2         | 6. 代謝.....                            | 19        |
| 3. 構造式又は示性式.....             | 2         | 7. 排泄.....                            | 20        |
| 4. 分子式及び分子量.....             | 2         | 8. トランスポーターに関する情報.....                | 20        |
| 5. 化学名（命名法）又は本質.....         | 2         | 9. 透析等による除去率.....                     | 20        |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....       | 2         | 10. 特定の背景を有する患者.....                  | 20        |
| <b>III. 有効成分に関する項目</b> ..... | <b>3</b>  | 11. その他.....                          | 20        |
| 1. 物理化学的性質.....              | 3         | <b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> ..... | <b>21</b> |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性.....    | 3         | 1. 警告内容とその理由.....                     | 21        |
| 3. 有効成分の確認試験法、定量法.....       | 3         | 2. 禁忌内容とその理由.....                     | 21        |
| <b>IV. 製剤に関する項目</b> .....    | <b>4</b>  | 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...             | 21        |
| 1. 剤形.....                   | 4         | 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...             | 21        |
| 2. 製剤の組成.....                | 4         | 5. 重要な基本的注意とその理由.....                 | 21        |
| 3. 添付溶解液の組成及び容量.....         | 5         | 6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....             | 21        |
| 4. 力価.....                   | 5         | 7. 相互作用.....                          | 23        |
| 5. 混入する可能性のある夾雑物.....        | 5         | 8. 副作用.....                           | 23        |
| 6. 製剤の各種条件下における安定性.....      | 5         | 9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....                  | 24        |
| 7. 調製法及び溶解後の安定性.....         | 8         | 10. 過量投与.....                         | 24        |
| 8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....    | 8         | 11. 適用上の注意.....                       | 24        |
| 9. 溶出性.....                  | 8         | 12. その他の注意.....                       | 25        |
| 10. 容器・包装.....               | 10        | <b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....          | <b>26</b> |
| 11. 別途提供される資材類.....          | 10        | 1. 薬理試験.....                          | 26        |
| 12. その他.....                 | 10        | 2. 毒性試験.....                          | 26        |
| <b>V. 治療に関する項目</b> .....     | <b>11</b> | <b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....           | <b>27</b> |
| 1. 効能又は効果.....               | 11        | 1. 規制区分.....                          | 27        |
| 2. 効能又は効果に関連する注意.....        | 11        | 2. 有効期間.....                          | 27        |
| 3. 用法及び用量.....               | 11        | 3. 包装状態での貯法.....                      | 27        |
| 4. 用法及び用量に関連する注意.....        | 11        | 4. 取扱い上の注意点.....                      | 27        |
| 5. 臨床成績.....                 | 11        | 5. 患者向け資材.....                        | 27        |

## 略語表

|               |  |           |
|---------------|--|-----------|
| 6.            | 同一成分・同効薬.....                              | 27        |
| 7.            | 国際誕生年月日 .....                              | 27        |
| 8.            | 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準<br>収載年月日、販売開始年月日..... | 27        |
| 9.            | 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等<br>の年月日及びその内容.....    | 28        |
| 10.           | 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその<br>内容.....            | 28        |
| 11.           | 再審査期間 .....                                | 28        |
| 12.           | 投薬期間制限に関する情報.....                          | 28        |
| 13.           | 各種コード .....                                | 28        |
| 14.           | 保険給付上の注意 .....                             | 28        |
| <b>X I.</b>   | <b>文献.....</b>                             | <b>29</b> |
| 1.            | 引用文献 .....                                 | 29        |
| 2.            | その他の参考文献.....                              | 30        |
| <b>X II.</b>  | <b>参考資料.....</b>                           | <b>31</b> |
| 1.            | 主な外国での発売状況.....                            | 31        |
| 2.            | 海外における臨床支援情報 .....                         | 31        |
| <b>X III.</b> | <b>備考.....</b>                             | <b>32</b> |
| 1.            | 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ<br>たっての参考情報.....      | 32        |
| 2.            | その他の関連資料.....                              | 34        |

| 略語               | 略語内容          |
|------------------|---------------|
| HPLC             | 高速液体クロマトグラフィー |
| AUC              | 血中濃度-時間曲線下面積  |
| Cmax             | 最高血中濃度        |
| tmax             | 最高血中濃度到達時間    |
| t <sub>1/2</sub> | 消失半減期         |
| S.D.             | 標準偏差          |
| IC <sub>30</sub> | 30%阻害濃度       |
| CCr              | クレアチニン・クリアランス |

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、オロパタジン塩酸塩を有効成分とするアレルギー性疾患治療剤である。

「オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「テバ」」及び「オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「テバ」」は、武田テバ薬品株式会社（旧大正薬品工業株式会社）が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2012年8月15日に承認を取得、2012年12月14日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

2015年1月14日、小児の効能又は効果、用法及び用量が追加された。

2022年12月1日、「オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「テバ」」及び「オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「テバ」」は、武田テバ薬品株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「テバ」から「NIG」に変更した。

2022年12月9日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、オロパタジン塩酸塩を有効成分とするアレルギー性疾患治療剤である。
- (2) 重大な副作用として、劇症肝炎、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）

### 3. 製品の製剤学的特性

- (1) PTPシートはピッチコントロールを行い、1錠ごとに成分名・含量を表示した。
- (2) PTPシートの両面に「アレルギー用薬」を表記した。
- (3) 個装箱は、販売名、使用期限、製造番号、GS1 データバーを記載した切り取りタグ付きである。

### 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料、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料  | 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  |          |

### 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

## 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 OD 錠 2.5mg 「NIG」

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「NIG」

#### (2) 洋名

Olopatadine Hydrochloride OD Tablets

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 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)

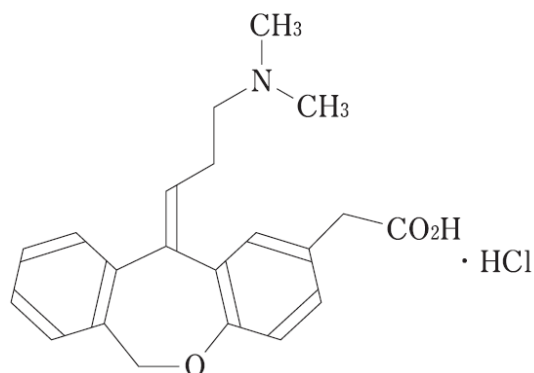
Olopatadine Hydrochloride (JAN)

#### (3) ステム (stem)

三環系ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗薬 : -tadine

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式 :



### 4. 分子式及び分子量

分子式 : C<sub>21</sub>H<sub>23</sub>NO<sub>3</sub> · HCl

分子量 : 373.87

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

{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

特になし

### 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 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°C (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、定量法

##### (1) 確認試験法

###### 1) 紫外可視吸光度測定法

本品の塩酸試液溶液につき吸収スペクトルを測定し、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長のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 2) 赤外吸収スペクトル測定法

塩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。

###### 3) 定性反応

本品の水溶液に希硝酸を加えた液は塩化物の定性反応 (2) を呈する。

##### (2) 定量法

###### 電位差滴定法

本品をギ酸に溶かし、無水酢酸、酢酸混液を加え、過塩素酸で滴定する。





#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

口腔内崩壊錠

###### (2) 製剤の外観及び性状

| 販売名   | オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 2.5mg 「NIG」  | オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 5mg 「NIG」  |
|-------|---|---|
| 色・剤形  | ごくうすい黄色の口腔内崩壊錠  | ごくうすい黄色の割線入り口腔内崩壊錠  |
| 外形    |  |  |
| 直径    | 6.5mm   | 8.0mm   |
| 厚さ    | 2.3mm   | 3.1mm   |
| 質量    | 約 100mg   | 約 200mg   |
| 識別コード | KT OPD・2.5  | KT OPD・5  |

###### (3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

###### (4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (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  | オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 2.5mg 「NIG」   | オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 5mg 「NIG」 |
|------|--|----------------------------|
| 有効成分 | 1錠中：<br>オロパタジン塩酸塩 2.5mg  | 1錠中：<br>オロパタジン塩酸塩 5.0mg    |
| 添加剤  | 乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルスターチ、デンプングリコール酸ナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、スクラロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、黄色三二酸化鉄 |                            |

###### (2) 電解質等の濃度

該当資料なし

###### (3) 熱量

該当資料なし

### 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

該当資料なし

### 6. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

(1) 加速試験

試験実施期間：2010/12/6～2011/6/14

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態 (PTP包装)]

| 試験項目<br>＜規格＞                            | ロット<br>番号                     | 保存期間  |  |   |   |
|---|-------------------------------|---|--|---|---|
|   |                               | 開始時   | 1ヵ月  | 3ヵ月   | 6ヵ月   |
| 性状 n=3<br>＜ごくうすい黄色の口腔内<br>崩壊錠＞          | 5820R11<br>5820R21<br>5820R31 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合  |
| 確認試験 n=3<br>(紫外可視吸光度測定法)                | 5820R11<br>5820R21<br>5820R31 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合  |
| 製剤均一性 (%) n=3<br>(含量均一性試験)<br>＜15.0%以下＞ | 5820R11<br>5820R21<br>5820R31 | 5.35～6.40<br>2.24～5.12<br>2.86～5.17         | —  | —   | 3.23～5.55<br>5.43～7.56<br>4.51～6.15           |
| 崩壊性 (秒) n=18<br>＜2分以内＞                  | 5820R11<br>5820R21<br>5820R31 | 21～29<br>23～29<br>27～35                     | 29～33<br>30～38<br>31～37                        | 26～34<br>28～36<br>28～37                     | 25～31<br>27～39<br>15～38                       |
| 溶出性 (%) n=18<br>＜15分、85%以上＞             | 5820R11<br>5820R21<br>5820R31 | 94.7～102.2<br>99.0～105.4<br>98.8～104.3      | 96.7～101.7<br>95.8～103.7<br>96.0～103.0         | 96.4～103.4<br>97.1～104.8<br>96.3～104.3      | 91.1～105.5<br>94.4～104.4<br>98.2～102.4        |
| 含量 (%) ※ n=3<br>＜95.0～105.0%＞           | 5820R11<br>5820R21<br>5820R31 | 98.76～99.41<br>99.27～99.94<br>100.20～101.05 | 99.10～101.18<br>100.06～101.52<br>100.14～101.22 | 98.16～99.45<br>99.34～100.02<br>99.36～100.96 | 99.55～100.20<br>99.83～101.10<br>100.49～101.75 |

※：表示量に対する含有率 (%)

試験実施期間：2010/12/7～2011/6/15

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態 (PTP包装)]

| 試験項目<br><規格>                            | ロット<br>番号                     | 保存期間   |  |  |  |
|---|-------------------------------|--|--|--|--|
|   |                               | 開始時  | 1ヵ月  | 3ヵ月  | 6ヵ月  |
| 性状 n=3<br><ごくうすい黄色の割線入り<br>口腔内崩壊錠>      | 5830R11<br>5830R21<br>5830R31 | 適合   | 適合   | 適合   | 適合   |
| 確認試験 n=3<br>(紫外可視吸光度測定法)                | 5830R11<br>5830R21<br>5830R31 | 適合   | 適合   | 適合   | 適合   |
| 製剤均一性 (%) n=3<br>(含量均一性試験)<br><15.0%以下> | 5830R11<br>5830R21<br>5830R31 | 3.81～4.05<br>1.34～2.51<br>3.46～3.86          | —  | —  | 2.06～4.05<br>3.06～6.74<br>3.14～3.88          |
| 崩壊性 (秒) n=18<br><2分以内>                  | 5830R11<br>5830R21<br>5830R31 | 24～31<br>27～34<br>28～39                      | 30～40<br>33～39<br>32～40                      | 33～41<br>34～40<br>36～43                      | 33～38<br>32～51<br>34～41                      |
| 溶出性 (%) n=18<br><15分、85%以上>             | 5830R11<br>5830R21<br>5830R31 | 96.9～103.1<br>96.5～103.1<br>95.5～103.0       | 96.1～102.6<br>94.9～101.2<br>93.8～99.5        | 94.7～103.0<br>94.4～100.6<br>95.6～102.8       | 95.1～101.9<br>94.7～101.0<br>89.5～104.1       |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95.0～105.0%>           | 5830R11<br>5830R21<br>5830R31 | 99.61～100.18<br>99.84～100.52<br>99.38～100.62 | 99.11～100.52<br>99.96～100.83<br>99.48～100.53 | 99.41～100.67<br>99.21～100.00<br>99.58～101.04 | 98.02～100.06<br>99.06～100.62<br>99.71～100.61 |

※：表示量に対する含有率 (%)

(2) 無包装状態の安定性

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」 無包装 50℃ [遮光、気密容器]

| 試験項目<br><規格>                   | ロット<br>番号 | 保存期間               |                    |
|--------------------------------|-----------|--------------------|--------------------|
|                                |           | 開始時                | 1ヵ月                |
| 性状 n=3<br><ごくうすい黄色の口腔内<br>崩壊錠> | 5820R3    | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 |
| 崩壊性 (秒) n=18<br><2分以内>         | 5820R3    | 27～35              | 39～51              |
| 溶出性 (%) n=18<br><15分、85%以上>    | 5820R3    | 98.8～104.3         | 93.5～103.0         |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95.0～105.0%>  | 5820R3    | 100.20～101.05      | 98.39～100.09       |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」 無包装 30℃・75%RH [遮光、開放]

| 試験項目<br><規格>                   | ロット<br>番号 | 保存期間               |                    |                    |                    |
|--------------------------------|-----------|--------------------|--------------------|--------------------|--------------------|
|                                |           | 開始時                | 1ヵ月                | 2ヵ月                | 3ヵ月                |
| 性状 n=3<br><ごくうすい黄色の口腔内<br>崩壊錠> | 5820R3    | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 |
| 崩壊性 (秒) n=18<br><2分以内>         | 5820R3    | 27～35              | 21～25              | 19～32              | 15～61              |
| 溶出性 (%) n=18<br><15分、85%以上>    | 5820R3    | 98.8～104.3         | 97.0～104.5         | 93.8～103.9         | 85.2～105.8         |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95.0～105.0%>  | 5820R3    | 100.20～101.05      | 100.42～101.19      | 98.78～100.01       | 99.80～100.62       |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」 無包装 曝光 [2000Lx]

| 試験項目<br><規格>                   | ロット<br>番号 | 総曝光量               |                    |                    |
|--------------------------------|-----------|--------------------|--------------------|--------------------|
|                                |           | 開始時                | 60万 Lx・hr          | 120万 Lx・hr         |
| 性状 n=3<br><ごくうすい黄色の口腔内<br>崩壊錠> | 5820R3    | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の<br>口腔内崩壊錠 |
| 崩壊性 (秒) n=18<br><2分以内>         | 5820R3    | 27~35              | 26~35              | 31~37              |
| 溶出性 (%) n=18<br><15分、85%以上>    | 5820R3    | 98.8~104.3         | 95.4~103.9         | 95.7~102.4         |
| 含量 (%) * n=3<br><95.0~105.0%>  | 5820R3    | 100.20~101.05      | 98.99~101.01       | 98.36~104.50       |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」 無包装 50℃ [遮光、気密容器]

| 試験項目<br><規格>                       | ロット<br>番号 | 保存期間                   |                        |
|------------------------------------|-----------|------------------------|------------------------|
|                                    |           | 開始時                    | 1ヵ月                    |
| 性状 n=3<br><ごくうすい黄色の割線入<br>り口腔内崩壊錠> | 5830R1    | ごくうすい黄色の割線入り<br>口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の割線入り<br>口腔内崩壊錠 |
| 崩壊性 (秒) n=18<br><2分以内>             | 5830R1    | 24~31                  | 37~45                  |
| 溶出性 (%) n=18<br><15分、85%以上>        | 5830R1    | 96.9~103.1             | 93.0~101.1             |
| 含量 (%) * n=3<br><95.0~105.0%>      | 5830R1    | 99.61~100.18           | 98.77~100.12           |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」 無包装 30℃・75%RH [遮光、開放]

| 試験項目<br><規格>                       | ロット<br>番号 | 保存期間                       |                            |                            |                            |
|------------------------------------|-----------|----------------------------|----------------------------|----------------------------|----------------------------|
|                                    |           | 開始時                        | 1ヵ月                        | 2ヵ月                        | 3ヵ月                        |
| 性状 n=3<br><ごくうすい黄色の割線入<br>り口腔内崩壊錠> | 5830R1    | ごくうすい黄色<br>の割線入り口腔<br>内崩壊錠 | ごくうすい黄色<br>の割線入り口腔<br>内崩壊錠 | ごくうすい黄色<br>の割線入り口腔<br>内崩壊錠 | ごくうすい黄色<br>の割線入り口腔<br>内崩壊錠 |
| 崩壊性 (秒) n=18<br><2分以内>             | 5830R1    | 24~31                      | 25~29                      | 22~32                      | 21~61                      |
| 溶出性 (%) n=18<br><15分、85%以上>        | 5830R1    | 96.9~103.1                 | 93.9~102.6                 | 92.8~99.5                  | 88.4~99.5                  |
| 含量 (%) * n=3<br><95.0~105.0%>      | 5830R1    | 99.61~100.18               | 98.65~100.95               | 98.05~101.54               | 99.06~100.52               |

※：表示量に対する含有率 (%)

◇オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」 無包装 曝光 [2000Lx]

| 試験項目<br><規格>                       | ロット<br>番号 | 総曝光量                   |                        |                        |
|------------------------------------|-----------|------------------------|------------------------|------------------------|
|                                    |           | 開始時                    | 60万 Lx・hr              | 120万 Lx・hr             |
| 性状 n=3<br><ごくうすい黄色の割線入り<br>口腔内崩壊錠> | 5830R1    | ごくうすい黄色の割線<br>入り口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の割線<br>入り口腔内崩壊錠 | ごくうすい黄色の割線<br>入り口腔内崩壊錠 |
| 崩壊性 (秒) n=18<br><2分以内>             | 5830R1    | 24~31                  | 24~34                  | 29~34                  |
| 溶出性 (%) n=18<br><15分、85%以上>        | 5830R1    | 96.9~103.1             | 94.3~100.1             | 92.1~100.3             |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95.0~105.0%>      | 5830R1    | 99.61~100.18           | 98.99~100.82           | 98.85~101.11           |

※：表示量に対する含有率 (%)

## 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 (物理化学的变化)

該当しない

## 9. 溶出性

### (1) 溶出試験<sup>2)</sup>

<オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」>

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 薬食  
審査発第1124004号)

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

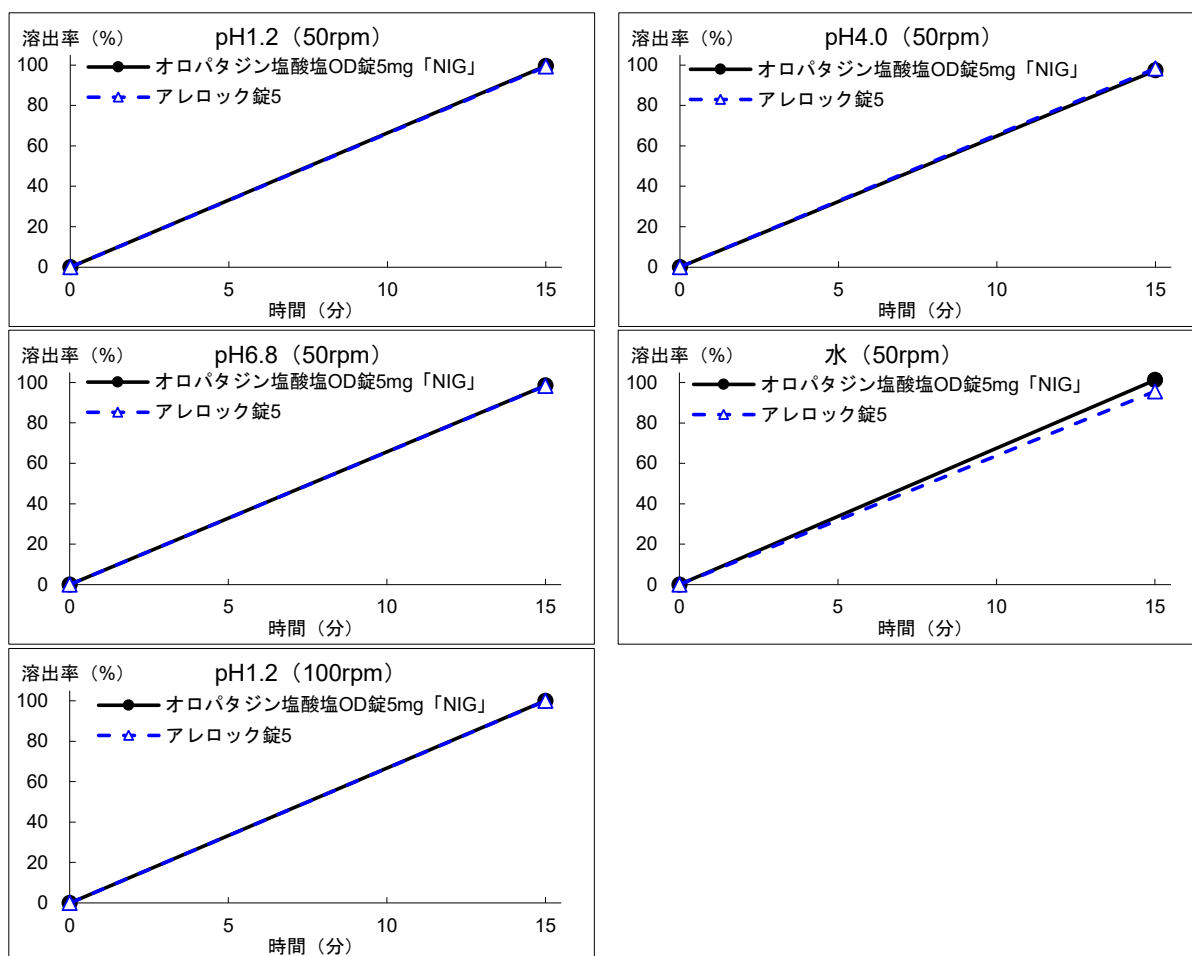
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)、100rpm (pH1.2)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH1.2 (100rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤 (アレロック錠 5) と比較した結果、全ての試験液において「後発  
医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

(2) 含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験<sup>3)</sup>

<オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」>

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」は、「含量が異なる経口固形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 号通知)」に基づき、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」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。

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

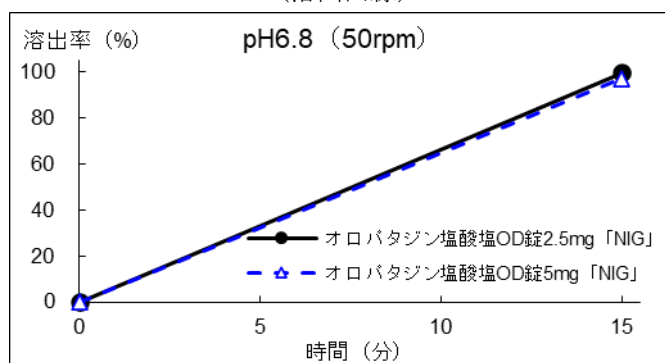
回転数及び試験液：50rpm (pH6.8)

[判定]

- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。  
また、最終比較時点 (15 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±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かった。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤 (オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」) と比較した結果、上記の条件において「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

## 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

#### 〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「NIG」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]

#### 〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「NIG」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]、

500 錠 [10 錠 (PTP) × 50、乾燥剤入り]

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

PTP : ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン・ポリエチレン多層フィルム、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

乾燥剤: 塩化カルシウム

## 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

## 12. その他

該当記載事項なし

## 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、皮膚疾患に伴う痒痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚痒痒症、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、皮膚痒痒症）に伴う痒痒

### 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

#### （1）用法及び用量の解説

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。

#### （2）用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 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

該当資料なし

#### （2）臨床薬理試験

該当資料なし

#### （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

##### 〈アレルギー性鼻炎〉

##### 17.1.1 国内第Ⅲ相比較試験（成人）

通年性アレルギー性鼻炎患者（211例）を対象に、オキサトミドを対照薬とした二重盲検比較試験を実施した。オロパタジン塩酸塩（5mg錠又はプラセボ錠）及びオキサトミド（30mg錠又はプラセボ錠）を1日2回4週間反復経口投与した結果、最終全般改善度の改善率（「改善」以上）はオロパタジン塩酸塩62.4%（53/85例）、オキサトミド56.6%（47/83例）であった。10%上乘せ方式による同等性の検証の結果、同等性が確認された（ $p=0.018$ ）。概括安全度の安全率（「安全性に問題なし」）はオロパタジン塩酸塩68.0%（70/103例）、オキサトミド61.4%（62/101例）であった。両群間に有意差は認められなかった（ $p=0.301$ ；U検定、 $p=0.403$ ； $\chi^2$ 検定<sup>4)</sup>。

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩群29.1%（30/103例）、オキサトミド群30.7%（31/101例）であった。オロパタジン塩酸塩群の主な副作用は、眠気25.2%（26/103例）であった。



## 〈蕁麻疹〉

### 17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験（成人）

慢性蕁麻疹患者（256例）を対象に、ケトチフェンを対照薬とした二重盲検比較試験を実施した。オロパタジン塩酸塩（5mg錠又はプラセボ錠）及びケトチフェンフマル酸塩（1mgカプセル又はプラセボカプセル）を1日2回2週間反復経口投与した結果、最終全般改善度の改善率（「改善」以上）はオロパタジン塩酸塩77.7%（87/112例）、ケトチフェンフマル酸塩66.9%（81/121例）であった。主たる検定であるU検定において、オロパタジン塩酸塩はケトチフェンフマル酸塩と比べ有意な改善を示した（ $p=0.019$ ；U検定、 $p=0.093$ ； $\chi^2$ 検定）。概括安全度の安全率（「安全性に問題なし」）はオロパタジン塩酸塩77.2%（95/123例）、ケトチフェンフマル酸塩53.9%（69/128例）であった。オロパタジン塩酸塩はケトチフェンフマル酸塩と比べ有意に概括安全度が高かった（ $p=0.0001$ ；U検定、 $p=0.0001$ ； $\chi^2$ 検定）<sup>5)</sup>。

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩群21.1%（26/123例）、ケトチフェン群41.4%（53/128例）であった。オロパタジン塩酸塩群の主な副作用は、眠気19.5%（24/123例）であった。

## 〈皮膚疾患に伴う痒疹（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚痒痒症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑）〉

### 17.1.3 国内第Ⅲ相一般試験（成人）

皮膚疾患に伴う痒疹の患者（湿疹・皮膚炎152例、痒疹72例、皮膚痒痒症80例、尋常性乾癬70例及び多形滲出性紅斑24例、計398例）を対象に、オロパタジン塩酸塩10mg/日（1回5mg、1日2回）を2週間反復投与した。各皮膚疾患に対する有効率は、湿疹・皮膚炎74.6%（91/122例）、痒疹50.8%（31/61例）、皮膚痒痒症49.3%（33/67例）、尋常性乾癬52.8%（28/53例）、多形滲出性紅斑83.3%（15/18例）であり、全体での有効率は61.7%（198/321例）であった<sup>6)</sup>。

副作用発現頻度は19.0%（74/390例）であった。主な副作用は、眠気11.3%（44/390例）であった。

## 〈アレルギー性鼻炎〉

### 17.1.5 国内二重盲検比較試験（小児）

小児通年性アレルギー性鼻炎患者（7～16歳）を対象に、オロパタジン塩酸塩（1回2.5mg、1日2回、もしくは1回5mg、1日2回）<sup>註)</sup>あるいは、対照薬としてプラセボを2週間投与した。主要評価項目である「鼻の3主徴（くしゃみ、鼻汁、鼻閉）合計スコアの観察期からの変化量」について共分散分析を行った結果、オロパタジン塩酸塩5mg群はプラセボ群に対し有意な改善を示した<sup>7)</sup>。

小児通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした比較試験成績

| 投与群                    | 症例数 | 投与前<br>(mean±S.D.) | 変化量<br>(mean±S.D.) | 解析結果<br>(共分散分析 <sup>a)</sup> )   |
|------------------------|-----|--------------------|--------------------|--|
| オロパタジン<br>塩酸塩<br>5mg/回 | 100 | 6.14±1.44          | -1.41±1.99         | 最小二乗平均の差<br>(プラセボ群-5mg群)：0.51<br>95%信頼区間：0.04～0.98<br>p値：0.019 <sup>b)</sup> |
| プラセボ                   | 97  | 5.99±1.17          | -0.84±1.58         | —  |

a) 投与群を要因、観察期の鼻の3主徴合計スコアを共変量とした共分散分析

b) 各投与群の最小二乗平均に対するWilliams検定の結果

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩2.5mg群12.6%（13/103例）<sup>註)</sup>、5mg群16.0%（16/100例）、プラセボ群8.2%（8/98例）であった。オロパタジン塩酸塩5mg群で発現した主な副作用は、ALT増加6.0%（6/100例）、白血球数増加4.0%（4/100例）であった<sup>8)</sup>。

注) 7歳以上の小児における本剤の承認用量は1回5mg、1日2回である。

### 17.1.6 国内非盲検試験（小児）

小児通年性アレルギー性鼻炎患者（7～16歳、30kg以上、33例）を対象に、オロパタジン塩酸塩 1回 5mg を 1日 2回 12週間投与した結果、鼻の3主徴（くしゃみ、鼻汁、鼻閉）合計スコアの観察期からの変化量（mean±S.D.）は投与2週後-2.08±1.73、投与12週後-2.41±2.09であり、効果は投与終了時まで減弱することなく安定していた<sup>9)</sup>。

副作用発現頻度は15.2%（5/33例）であった。主な副作用は、傾眠9.1%（3/33例）であった。

#### 〈アトピー性皮膚炎〉

### 17.1.7 国内二重盲検比較試験（小児）

小児アトピー性皮膚炎患者（7～16歳）を対象に、オロパタジン塩酸塩（1回 5mg、1日 2回）あるいは、対照薬としてケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ（1回 1g、1日 2回）を2週間投与した。主要評価項目である「痒痒スコアの治験薬投与前からの変化量」について共分散分析を行った結果、ケトチフェンフマル酸塩ドライシロップに対するオロパタジン塩酸塩の非劣性が検証された（95%信頼区間の上限が0.4以下）<sup>10)</sup>。

小児アトピー性皮膚炎患者を対象とした比較試験成績

| 投与群                    | 症例数 | 投与前<br>(mean±S.D.) | 変化量<br>(mean±S.D.) | 解析結果（共分散分析 <sup>a)</sup> ）  |
|------------------------|-----|--------------------|--------------------|---|
| オロパタジン塩酸塩              | 152 | 2.36±0.46          | -0.78±0.84         | 最小二乗平均の差<br>（オロパタジン塩酸塩群－ケトチフェンフマル酸塩群）：-0.08<br>95%信頼区間：-0.25～0.09 |
| ケトチフェンフマル酸塩<br>ドライシロップ | 153 | 2.38±0.44          | -0.71±0.76         |   |

a) 投与群を要因、治験薬投与前の痒痒スコアを共変量とした共分散分析

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩群11.8%（18/152例）、ケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ群6.5%（10/153例）であった。オロパタジン塩酸塩群で発現した主な副作用は、傾眠5.9%（9/152例）、ALT増加4.6%（7/152例）及びAST増加2.6%（4/152例）であった。

## 2) 安全性試験

該当資料なし

## (5) 患者・病態別試験

### 17.1.4 高齢者（65歳以上）における臨床成績

承認時までの高齢者（65歳以上）への使用経験191例（気管支喘息57例、アレルギー性鼻炎3例、蕁麻疹31例、痒痒性皮膚疾患100例）における副作用発現率は22.5%（43/191例）であり、主な副作用は眠気23件（12.0%）、倦怠感7件（3.7%）、腹痛4件（2.1%）、顔面・四肢等の浮腫3件（1.6%）、頭痛・頭重感3件（1.6%）、めまい2件（1.0%）、下痢2件（1.0%）、胸部不快感2件（1.0%）等であった。高齢者における副作用発現率は65歳未満15.3%（238/1,555例）に比べ高かった。また、高齢者に対する有効率は気管支喘息25.5%（12/47例）、アレルギー性鼻炎100%（2/2例）、蕁麻疹80.6%（25/31例）、皮膚疾患に伴う痒痒全体で58.3%（49/84例）であった<sup>11)、12)</sup>。[9.8 参照]

## (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

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調査・試験の概要

該当しない

**(7) その他**

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

ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

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。さらに、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する<sup>13)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 薬理作用

###### 18.2.1 抗ヒスタミン作用

受容体結合実験において、ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体に強い拮抗作用（K<sub>i</sub> 値：16nmol/L）を有するが、ムスカリン M<sub>1</sub> 受容体にはほとんど親和性を示さず、その作用は選択的であった<sup>14)</sup>。また、モルモットにおけるヒスタミン誘発気道収縮反応にも抑制作用を示すことが確認された<sup>15)</sup>。

###### 18.2.2 実験的抗アレルギー作用

実験的アレルギー性鼻炎モデル（モルモット、ラット）において、抗原誘発による血管透過性亢進や鼻閉を抑制した<sup>16) - 18)</sup>。

ラット、モルモットにおける受身皮膚アナフィラキシーやアナフィラキシー性気道収縮を強力に抑制した<sup>19)、20)</sup>。

能動感作モルモットにおける遅発型気道収縮と炎症細胞の浸潤を抑制した<sup>21)</sup>。

また、モルモットにおいて、血小板活性化因子（PAF）による気道過敏性亢進を抑制した<sup>22)</sup>。

###### 18.2.3 化学伝達物質の産生・遊離過程に及ぼす影響

ラット腹腔肥満細胞からのヒスタミンの遊離を抑制（IC<sub>30</sub> 値；72 μmol/L：卵白アルブミン刺激、110 μmol/L：ジニトロフェニル化ウシ血清アルブミン刺激、26 μmol/L：A-23187 刺激、270 μmol/L：コンパウンド 48/80 刺激）するとともに、アラキドン酸代謝系に作用して、ヒト好中球からのロイコトリエン（IC<sub>30</sub> 値；1.8 μmol/L）、トロンボキサン（IC<sub>30</sub> 値；0.77 μmol/L）、PAF（産生：10 μmol/L で 52.8%抑制、遊離：10 μmol/L で 26.7%抑制）等脂質メディエーターの産生あるいは遊離を抑制することが確認された<sup>23) - 26)</sup>。

###### 18.2.4 タキキニン遊離抑制作用

知覚神経終末から遊離する神経伝達物質タキキニンは、アレルギー性疾患の発症・増悪に関与することが知られている。

オロパタジン塩酸塩は、モルモットの主気管支筋標本において、フィールド電気刺激時のタキキニン関与の収縮反応を抑制（IC<sub>30</sub> 値；5.0 μmol/L）した。その作用はカリウムチャネル（SKCa チャネル：small conductance Ca<sup>2+</sup>-activated K<sup>+</sup>チャネル）の活性化を介したタキキニン遊離抑制作用によると考えられた<sup>27)、28)</sup>。

#### (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

#### (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

##### 16.1.1 単回投与

###### 1) 成人

健康成人男性にオロパタジン塩酸塩錠 5mg 及び 10mg を絶食下单回経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった<sup>29)</sup>。

健康成人男性に単回経口投与したときの薬物動態パラメータ

| 投与量            | t <sub>max</sub><br>(h) | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | AUC <sub>0-∞</sub><br>(ng・h/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(h) |
|----------------|-------------------------|-----------------------------|---------------------------------|-------------------------|
| 5mg<br>(n=6)   | 1.00±0.32               | 107.66±22.01                | 326±63 <sup>a)</sup>            | 8.75±4.63 <sup>a)</sup> |
| 10mg<br>(n=12) | 0.92±0.47               | 191.78±42.99                | 638±136 <sup>b)</sup>           | 7.13±2.21 <sup>b)</sup> |

a) n=4, b) n=10

mean±S.D.

###### 2) 小児

小児アレルギー患者 (10~16 歳、40~57kg) にオロパタジン塩酸塩錠 5mg を単回経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった<sup>30)</sup>。

小児アレルギー患者に単回経口投与したときの薬物動態パラメータ

| 投与量          | t <sub>max</sub><br>(h) | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | AUC <sub>0-12</sub><br>(ng・h/mL) |
|--------------|-------------------------|-----------------------------|----------------------------------|
| 5mg<br>(n=6) | 1.33±0.52               | 81.57±9.91                  | 228±20                           |

mean±S.D.

##### 16.1.2 反復投与

健康成人男性 (8 例) にオロパタジン塩酸塩錠 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とき、4 日目までに血漿中濃度は定常状態に達し、C<sub>max</sub> は単回経口投与時の 1.14 倍であった<sup>29)</sup>。

### 16.1.3 生物学的同等性試験

#### 〈オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「NIG」〉

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」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 号通知）」に基づき、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」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<sup>3)</sup>。

#### 〈オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「NIG」〉

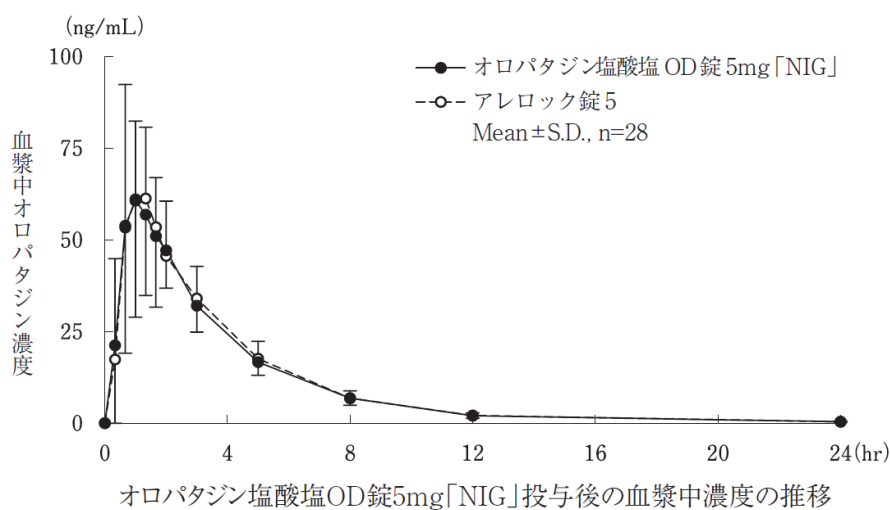
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）

オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「NIG」とアレロック錠 5 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）を健康成人男子に空腹時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、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>31)</sup>。

#### ・水なしで服用

|                            | 判定パラメータ                           |                 | 参考パラメータ      |                          |
|----------------------------|-----------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
|                            | AUC <sub>0-24</sub><br>(ng・hr/mL) | Cmax<br>(ng/mL) | tmax<br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 5mg 「NIG」 | 244.66±37.29                      | 79.47±25.15     | 1.14±0.59    | 3.91±0.80                |
| アレロック錠 5                   | 250.28±39.56                      | 78.35±21.04     | 1.14±0.64    | 3.97±0.78                |

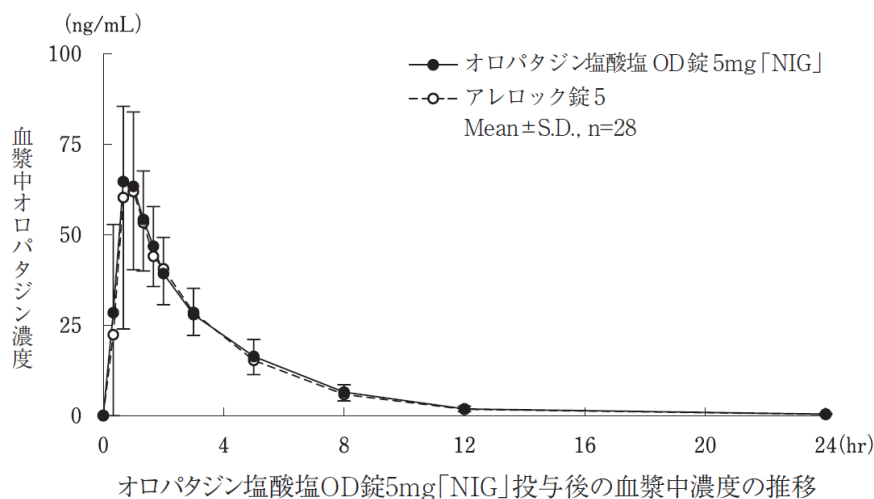
(Mean±S.D., n=28)



・水で服用

|                          | 判定パラメータ                           |                             | 参考パラメータ                  |                          |
|--------------------------|-----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
|                          | AUC <sub>0-24</sub><br>(ng・hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | t <sub>max</sub><br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| オロパタジン塩酸塩<br>OD錠5mg「NIG」 | 234.17±40.58                      | 73.18±19.86                 | 0.82±0.33                | 3.65±0.59                |
| アレロック錠5                  | 224.57±30.01                      | 79.13±20.41                 | 0.91±0.44                | 3.89±0.48                |

(Mean±S.D., n=18)



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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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

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

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(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

該当資料なし

## 5. 分布

### (1) 血液-脳関門通過性

#### 16.3.2 血液-脳関門通過性

ラットに  $^{14}\text{C}$ -オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、脳内放射能濃度は測定した組織中で最も低く、その  $C_{\text{max}}$  は血漿中放射能濃度の  $C_{\text{max}}$  の約 1/25 であった<sup>32)</sup>。

### (2) 血液-胎盤関門通過性

#### 16.3.3 血液-胎盤関門通過性

妊娠ラットに  $^{14}\text{C}$ -オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、胎児血漿中及び組織内の放射能濃度は、母体血漿中放射能濃度の 0.07~0.38 倍であった<sup>33)</sup>。

(「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照)

### (3) 乳汁への移行性

#### 16.3.4 母乳中への移行性

授乳期のラットに  $^{14}\text{C}$ -オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、乳汁中放射能濃度の  $\text{AUC}_{0-\infty}$  は、血漿中放射能濃度の  $\text{AUC}_{0-\infty}$  の約 1.5 倍であった<sup>33)</sup>。

(「VIII. 6. (6) 授乳婦」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

#### 16.3.1 体組織への分布

ラットに  $^{14}\text{C}$ -オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、大部分の組織で投与後 30 分に最も高い放射能濃度を示した。消化管のほか、肝臓、腎臓及び膀胱の放射能濃度は、血漿中放射能濃度より高かった<sup>32)</sup>。

### (6) 血漿蛋白結合率

#### 16.3.5 蛋白結合率

ヒト血清蛋白結合率は以下のとおりであった<sup>34)</sup> (*in vitro*)。

| 添加濃度 (ng/mL) | 0.1      | 10       | 1000     |
|--------------|----------|----------|----------|
| 血清蛋白結合率 (%)  | 54.7±1.7 | 55.2±0.8 | 54.7±5.5 |

限外ろ過法による

mean±S.D. (n=3)

## 6. 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 (CYP 等) の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

健康成人（6例）にオロパタジン塩酸塩錠 80mg を単回経口投与したときの血漿中代謝物は、N-酸化体約 7%、N-モノ脱メチル体約 1%（未変化体との AUC 比）であり、尿中代謝物は、各々約 3%、約 1%（48 時間までの累積尿中排泄率）であった<sup>29)、35)</sup>。

### 7. 排泄

#### 16.5.1 成人

健康成人にオロパタジン塩酸塩錠 5mg（6例）及び 10mg（12例）を単回経口投与したときの 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、健康成人（8例）にオロパタジン塩酸塩錠 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ときの尿中排泄率は、単回経口投与後と同程度であった<sup>29)</sup>。

#### 16.5.2 小児

小児アレルギー患者（10～16歳、40～57kg、6例）にオロパタジン塩酸塩錠 5mg を単回投与したときの 12 時間までの未変化体の尿中排泄率は、投与量の 61.8%であった<sup>30)</sup>。

### 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

### 9. 透析等による除去率

該当資料なし

### 10. 特定の背景を有する患者

#### 16.6.1 腎機能低下患者（血液透析導入前）

クレアチニンクリアランスが 2.3～34.4mL/min の腎機能低下患者及び健康成人（各 6例）にオロパタジン塩酸塩錠 10mg を朝食後単回経口投与したとき、健康成人と比較して、腎機能低下患者の  $C_{max}$  は 2.3 倍、AUC は約 8 倍であった<sup>36)、37)</sup>。[9.2.1 参照]

#### 16.6.2 高齢者

高齢者（70 歳以上）及び健康成人（各 6例）にオロパタジン塩酸塩錠 10mg を単回経口投与したとき、高齢者の血漿中濃度は健康成人に比べ高く推移し、 $C_{max}$  は約 1.3 倍、AUC は約 1.8 倍であった。 $t_{1/2}$  は両者とも 10～11 時間と同様であった<sup>37)</sup>。[9.8 参照]

### 11. その他

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

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）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

薬剤に対する過敏症は医療用医薬品に共通の注意事項である。

本剤の成分（有効成分、添加物）に過敏症の既往のある患者には投与を避けること。

### 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 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に十分注意すること。

8.2 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。

##### 〈アレルギー性鼻炎〉

8.3 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。

（解説）

8.2 本剤の効果が認められない場合は、長期にわたり漫然と投与せず、他の治療方法を考慮すること。

8.3 鼻アレルギー診療ガイドラインには、季節性アレルギー性鼻炎に対する治療として、花粉飛散1～2週間前より遊離抑制薬または第2世代抗ヒスタミン薬で治療を開始し（季節前投与、予防投与、初期療法、早期治療などとよばれている）、季節終了まで続けることが記載されている。治療の目安として考慮すること。

### 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

##### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1.1 長期ステロイド療法を受けている患者

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。

（解説）

9.1.1 ステロイド治療を受けている患者では、ステロイドを減量することにより、症状のリバウンドや副作用症状があらわれることがあるため注意すること。

## (2) 腎機能障害患者

### 9.2 腎機能障害患者

#### 9.2.1 腎機能低下患者（クレアチニンクリアランス 30mL/min 未満）

高い血中濃度が持続するおそれがある。[16.6.1 参照]

(解説)

9.2.1 本剤は主に腎排泄によって血中から消失する薬剤である。従って、腎機能低下患者においては高い血中濃度が持続するおそれがあり、残腎機能、患者の状態等を考慮の上、低用量から投与を開始するなど慎重な投与をすること。

(ア) 健康成人を対象とした薬物動態試験で本剤を 5mg～80mg 単回投与した場合の投与後 48 時間目までの未変化体の平均尿中累積排泄率は投与量の 58.7%～73.4% (5mg の場合は 68.4%) であり、大部分が肝臓での代謝を受けず、未変化体のまま腎臓において排泄されることが示唆される<sup>29)</sup>。

(イ) 腎機能低下患者 (CCr : 2.3～34.4mL/min) に本剤 10mg を単回投与した場合、健康成人と比較して最高血中濃度 (Cmax) の上昇 (2.3 倍)、血中濃度半減期 ( $t_{1/2}$ ) の延長 (1.3 倍)、血中濃度曲線下面積 (AUC) の増加 (8 倍) が認められている<sup>36)</sup>。

(ウ) 血液透析患者の透析日\*及び非透析日に本剤 10mg を単回投与した場合、血漿中濃度に大きな差は認められなかった。しかし、血液透析患者では健康成人と比較して最高血中濃度 (Cmax) の上昇 (2.5 倍)、血中濃度曲線下面積 (AUC) の増加 (約 10 倍) が認められている<sup>36)</sup>。

\*透析日：本剤投与直前から投与後 4 時間までの透析を実施

## (3) 肝機能障害患者

### 9.3 肝機能障害患者

肝機能障害が悪化するおそれがある。

(解説)

肝機能異常を有する患者では、医薬品の副作用が発現しやすいため、患者の状態を観察しながら慎重な投与をすること。

## (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、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。

(解説)

(ア) ラットにおける妊娠前及び妊娠初期の投与試験では、オロパタジン塩酸塩 400mg/kg 投与群で母動物の一般状態の悪化が原因と考えられる受胎率の低下傾向が認められている。胎児においては 400mg/kg 投与群でも影響は認められなかった<sup>38)</sup>。

(イ) ラットにおける胎児の器官形成期投与試験ではオロパタジン塩酸塩 600mg/kg 投与群において、対照群に比べ胎児体重の低下が認められている。また、内臓異常の頻度は 200mg/kg 以上投与した群で対照群と比較して上昇傾向がみられたものの、自然発生頻度の範囲内であった<sup>39)</sup>。ウサギにおける同様の試験ではオロパタジン塩酸塩 400mg/kg 投与群においても、胎児の発育に影響はみられず、催奇形性も認められなかった<sup>40)</sup>。

## (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。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。

(解説)

授乳期のラットにオロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与後の乳汁中及び血漿中濃度を測定したところ、乳汁中未変化体濃度は、投与後 24 時間では血漿中未変化体濃度の 1.97 倍であり、乳汁中未変化体の AUC<sub>0-24</sub> は (844.6ng・h/mL) で血漿中未変化体の AUC<sub>0-24</sub> (817.2ng・h/mL) とほぼ等しく、比較的高い乳汁移行性を示した<sup>33)</sup>。

## (7) 小児等

### 9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

## (8) 高齢者

### 9.8 高齢者

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。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。[16.6.2、17.1.4 参照]

(解説)

高齢者では腎機能等の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な投与をすること。

(ア) 高齢者（年齢 70～77 歳、Ccr：平均 5.3L/h (88.3mL/min)）における薬物動態を健康成人と比較したところ、オロパタジン塩酸塩 10mg 単回投与において、高齢者では最高血中濃度 (C<sub>max</sub>) の上昇 (1.3 倍)、血中濃度曲線下面積 (AUC) の増加 (1.8 倍) が認められている<sup>37)</sup>。

## 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

設定されていない

## 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 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

劇症肝炎、AST、ALT、 $\gamma$ -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。

(2) その他の副作用

| 11.2 その他の副作用 |      |  |   |                   |
|--------------|------|--|---|-------------------|
|              | 5%以上 | 0.1～5%未満                                       | 0.1%未満                                      | 頻度不明              |
| 過敏症          |      | 紅斑等の発疹   | 浮腫(顔面・四肢等)、<br>痒痒、呼吸困難                      |                   |
| 精神神経系        | 眠気   | 倦怠感、口渇、頭痛・頭重感、<br>めまい                          | 集中力低下、しびれ<br>感                              | 不随意運動(顔<br>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<br>炎・舌痛、胸やけ、<br>食欲亢進              | 嘔吐                |
| 肝臓           |      | 肝機能異常(ALT,AST,LDH,<br>γ-GTP,Al-P,総ビリルビン上<br>昇) |   |                   |
| 血液           |      | 白血球増多、好酸球増多、リン<br>パ球減少                         | 白血球減少、血小板<br>減少                             |                   |
| 腎臓・泌尿器       |      | 尿潜血  | BUN 上昇、尿蛋白陽<br>性、血中クレアチニ<br>ン上昇、頻尿、排尿<br>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<br>感、味覚異常、体重<br>増加、ほてり            | 月経異常、筋肉<br>痛、関節痛  |

注) 発現頻度はアレロック錠における成人の使用成績調査及び特別調査、アレロック錠、OD 錠及び顆粒における小児の特定使用成績調査を含む。

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

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

(解説)

本剤はアレルギー反応を抑制するので、アレルゲンの確認に支障を来すおそれがある。

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14.適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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。

14.1.2 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

#### 15.1 臨床使用に基づく情報

因果関係は明らかではないが、オロパタジン塩酸塩錠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。

(解説)

成人における癢痒性皮膚疾患に対する一般臨床試験〔先発医薬品（普通錠）〕において、因果関係が完全には否定できない心筋梗塞症例が報告されたため設定した<sup>6)</sup>。

### (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

該当資料なし

#### (3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

#### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

#### (7) 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 OD 錠 2.5mg「NIG」<br>オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「NIG」 | なし |
| 有効成分 | オロパタジン塩酸塩   | なし |

### 2. 有効期間

3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意点

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：アレロック錠 2.5、アレロック錠 5、アレロック OD 錠 2.5、アレロック OD 錠 5

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 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

#### 〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「NIG」〉

| 履歴       | 販売名                          | 製造販売承認<br>年月日  | 承認番号          | 薬価基準収載<br>年月日   | 販売開始<br>年月日     |
|----------|------------------------------|----------------|---------------|-----------------|-----------------|
| 販売<br>開始 | オロパタジン塩酸塩<br>OD 錠 2.5mg「テバ」  | 2012年<br>8月15日 | 22400AMX01020 | 2012年<br>12月14日 | 2012年<br>12月14日 |
| 承継       | オロパタジン塩酸塩<br>OD 錠 2.5mg「NIG」 | 〃              | 〃             | 2022年<br>12月9日  | 2022年<br>12月9日  |

#### 〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「NIG」〉

| 履歴       | 販売名                        | 製造販売承認<br>年月日  | 承認番号          | 薬価基準収載<br>年月日   | 販売開始<br>年月日     |
|----------|----------------------------|----------------|---------------|-----------------|-----------------|
| 販売<br>開始 | オロパタジン塩酸塩<br>OD 錠 5mg「テバ」  | 2012年<br>8月15日 | 22400AMX01019 | 2012年<br>12月14日 | 2012年<br>12月14日 |
| 承継       | オロパタジン塩酸塩<br>OD 錠 5mg「NIG」 | 〃              | 〃             | 2022年<br>12月9日  | 2022年<br>12月9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

<効能又は効果、用法及び用量追加>

効能又は効果、用法及び用量追加年月日：2015年1月14日

販売名：オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「テバ」、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「テバ」

内容：

|        | 新   | 旧  |
|--------|---|--|
| 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）<br>小児：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                     | 成人：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）         |
| 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。<br>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。 | 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。 |

(    ：効能又は効果、用法及び用量追加に伴う変更箇所)

## 10. 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

## 11. 再審査期間

該当しない

## 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

## 13. 各種コード

| 販売名                         | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | 個別医薬品コード<br>(YJコード) | HOT (9桁) 番号 | レセプト電算処理<br>システム用コード |
|-----------------------------|-----------------------|---------------------|-------------|----------------------|
| オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 2.5mg「NIG」 | 4490025F3018          | 4490025F3204        | 121958603   | 622195803            |
| オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 5mg「NIG」   | 4490025F4014          | 4490025F4200        | 121959303   | 622195903            |

## 14. 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) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験（5mg）
- 3) 社内資料：生物学的同等性試験（2.5mg）
- 4) 通年性アレルギー性鼻炎に対する臨床評価-Oxatomide を対照薬とした二重盲検比較試験（アレロック錠；2000年12月22日承認、申請資料概要ト-I-2-3）
- 5) 西山茂夫ほか：臨床医薬. 2001；17：237-264
- 6) 西山茂夫ほか：臨床医薬. 1996；12：1615-1640
- 7) Okubo K, et al. : Curr Med Res Opin. 2010；26：1657-1665 [PMID：20443650]
- 8) 小児通年性アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（アレロック錠・OD錠；2010年7月23日承認、CTD2.7.6.2）
- 9) 大久保公裕：アレルギー・免疫. 2011；18：108-116
- 10) 川島眞ほか：西日皮膚. 2011；73：278-289
- 11) 臨床試験における高齢者（65歳以上）の安全性と有効性のまとめ（アレロック錠；2000年12月22日承認、申請資料概要ト-I-5-2）
- 12) 安全性のまとめ（アレロック錠；2000年12月22日承認、申請資料概要ト-II-2）
- 13) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店；2021：C-1276-C-1280
- 14) 野中裕美ほか：薬理と臨床. 1995；5：1817-1824
- 15) 佐々木康夫ほか：薬理と臨床. 1995；5：1825-1835
- 16) 貝瀬俊彦ほか：アレルギー. 1995；44：1229-1233
- 17) Kamei C, et al. : Arzneim-Forsch/Drug Res. 1995；45：1005-1008 [PMID：7488300]
- 18) Kaise T, et al. : Jpn J Pharmacol. 1995；69：435-438 [PMID：8786648]
- 19) 石井秀衛ほか：日薬理誌. 1995；106：289-298
- 20) 石井秀衛ほか：基礎と臨床. 1995；29：3543-3559
- 21) Ohmori K, et al. : Int Arch Allergy Immunol. 1996；110：64-72 [PMID：8645980]
- 22) 佐々木康夫ほか：日薬理誌. 1995；106：347-357
- 23) 佐々木康夫ほか：薬理と臨床. 1995；5：1837-1850
- 24) Ikemura T, et al. : Int Arch Allergy Immunol. 1996；110：57-63 [PMID：8645979]
- 25) 池村俊秀ほか：アレルギー. 1994；43：1087
- 26) 化学伝達物質の産生・遊離に及ぼす影響（アレロック錠；2000年12月22日承認、申請資料概要ホ-II-2 3）
- 27) Ikemura T, et al. : Br J Pharmacol. 1996；117：967-973 [PMID：8851519]
- 28) タキキニンの遊離に及ぼす影響（アレロック錠；2000年12月22日承認、申請資料概要ホ-II-3）
- 29) 角尾道夫ほか：基礎と臨床. 1995；29：4129-4147
- 30) 小児における薬物動態試験（アレロック錠・OD錠；2010年7月23日承認、CTD2.7.6.1）
- 31) 社内資料：生物学的同等性試験（5mg）
- 32) 大石孝義ほか：薬物動態. 1995；10：651-668
- 33) 大石孝義ほか：薬物動態. 1995；10：707-721
- 34) 血清蛋白結合率（*in vitro*）（アレロック錠；2000年12月22日承認、申請資料概要へ-II-2 5.）
- 35) 国内第I相単回投与試験における代謝物の検討（アレロック錠；2000年12月22日承認、申請資料概要へ-III-1 1.）
- 36) 越川昭三ほか：腎と透析. 1997；42：107-114
- 37) 小林真一ほか：臨床薬理. 1996；27：673-681

- 38) 納屋聖人ほか：基礎と臨床. 1995; 29: 4803-4814
- 39) 納屋聖人ほか：基礎と臨床. 1995; 29: 4815-4839
- 40) 納屋聖人ほか：基礎と臨床. 1995; 29: 4841-4852

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

なし

### 2. 海外における臨床支援情報

#### 妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

（「VIII. 6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

|            | Drug Name   | Category |
|------------|-------------|----------|
| オーストラリアの分類 | olopatadine | B1       |

(2021年4月検索)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category B1：

Drugs which have been taken 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.

### 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

##### 本項の情報に関する注意

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

##### 粉砕物の安定性試験

##### オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「NIG」

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「NIG」の粉砕物安定性を 25℃・75%RH、曝光下の保存条件で検討した結果、性状はごくうすい黄色の粉末であった。

##### ● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光、開放]

| 試験項目        | 保存期間       |            |
|-------------|------------|------------|
|             | 開始時        | 4週         |
| 性状 n=3      | ごくうすい黄色の粉末 | ごくうすい黄色の粉末 |
| 残存率 (%) n=3 | 100        | 100        |

##### ● 粉砕物 25℃・曝光量 60万 Lx・hr [気密容器]

| 試験項目        | 総曝光量       |            |
|-------------|------------|------------|
|             | 開始時        | 60万 Lx・hr  |
| 性状 n=3      | ごくうすい黄色の粉末 | ごくうすい黄色の粉末 |
| 残存率 (%) n=3 | 100        | 98         |

##### オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「NIG」

オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「NIG」の粉砕物安定性を 25℃・75%RH、曝光下の保存条件で検討した結果、性状はごくうすい黄色の粉末であり、含量は規格内であった。

##### ● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光・開放]

| 試験項目<br><規格>                  | 保存期間       |            |
|-------------------------------|------------|------------|
|                               | 開始時        | 4週         |
| 性状 n=3                        | ごくうすい黄色の粉末 | ごくうすい黄色の粉末 |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95.0~105.0%> | 101.0      | 99.6       |

※表示量に対する含有率 (%)

##### ● 粉砕物 25℃・曝光量 60万 Lx・hr [気密容器]

| 試験項目<br><規格>                  | 総曝光量       |            |
|-------------------------------|------------|------------|
|                               | 開始時        | 60万 Lx・hr  |
| 性状 n=3                        | ごくうすい黄色の粉末 | ごくうすい黄色の粉末 |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95.0~105.0%> | 101.0      | 97.2       |

※表示量に対する含有率 (%)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「NIG」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体1個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約55℃の温湯20mLを吸い取った。ディスペンサーに蓋をして5分間放置後、ディスペンサーを手で15往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に5分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体1個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約3分の2を水平にし、注入端をその約30cm上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

#### 2) 試験結果

|                             | 崩壊懸濁試験        | 通過性試験          |
|-----------------------------|---------------|----------------|
| オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 2.5mg「NIG」 | 5分以内に崩壊・懸濁した。 | 8Fr.チューブを通過した。 |

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施した。

## オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「日医工」

### 1) 試験方法

#### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体1個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約55°Cの温湯20mLを吸い取った。ディスペンサーに蓋をして5分間放置後、ディスペンサーを手で15往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に5分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体1個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

#### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約3分の2を水平にし、注入端をその約30cm上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

### 2) 試験結果

|                           | 崩壊懸濁試験        | 通過性試験          |
|---------------------------|---------------|----------------|
| オロパタジン塩酸塩<br>OD錠 5mg「NIG」 | 5分以内に崩壊・懸濁した。 | 8Fr.チューブを通過した。 |

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施した。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし