

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

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「明治」**オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」**

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「明治」**オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「明治」****OLOPATADINE HYDROCHLORIDE Tablets, OD Tablets「MEIJI」**

剤形	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「明治」：錠剤（フィルムコーティング錠） オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg・5mg「明治」：錠剤（口腔内崩壊錠）			
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「明治」、オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg「明治」 ：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「明治」、オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「明治」 ：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）、Olopatadine（INN）			
製造販売承認年月日		製造販売承認年月日	薬価基準収載年月日	発売年月日
薬価基準収載・ 発売年月日	錠 2.5mg・5mg「明治」	2012年8月15日	2012年12月14日	2012年12月14日
	OD錠 2.5mg・5mg「明治」	2012年8月15日	2012年12月14日	2012年12月14日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元： Meiji Seika ファルマ株式会社 販売元： Me ファルマ株式会社			
医薬情報担当者の 連絡先				
問い合わせ窓口	Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室 （Me ファルマ株式会社専用ダイヤル） TEL：(0120)261-158、FAX：(03)3272-2438 受付時間9時～17時（土・日・祝日及び当社休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.meiji-seika-pharma.co.jp/me-pharma/medical/			

本 IF は 2023 年 7 月改訂（第 1 版）の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

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（<http://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

たつては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	6. 製剤の各種条件下における安定性.....	6
1. 開発の経緯	1	7. 調製法及び溶解後の安定性.....	8
2. 製品の治療学的特性	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）....	8
3. 製品の製剤学的特性	1	9. 溶出性.....	8
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	2	10. 容器・包装.....	15
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項....	2	(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.....	15
(1) 承認条件	2	(2) 包装.....	15
(2) 流通・使用上の制限事項.....	2	(3) 予備容量.....	15
6. RMPの概要	2	(4) 容器の材質.....	15
II. 名称に関する項目	3	11. 別途提供される資材類.....	15
1. 販売名	3	12. その他.....	15
(1) 和名	3	V. 治療に関する項目	16
(2) 洋名	3	1. 効能又は効果.....	16
(3) 名称の由来	3	2. 効能又は効果に関連する注意.....	16
2. 一般名	3	3. 用法及び用量.....	16
(1) 和名（命名法）	3	(1) 用法及び用量の解説.....	16
(2) 洋名（命名法）	3	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠.....	16
(3) ステム（stem）	3	4. 用法及び用量に関連する注意.....	16
3. 構造式又は示性式	3	5. 臨床成績.....	16
4. 分子式及び分子量	3	(1) 臨床データパッケージ.....	16
5. 化学名（命名法）又は本質.....	3	(2) 臨床薬理試験.....	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	(3) 用量反応探索試験.....	16
III. 有効成分に関する項目	4	(4) 検証的試験.....	16
1. 物理化学的性質	4	(5) 患者・病態別試験.....	18
(1) 外観・性状	4	(6) 治療的使用.....	18
(2) 溶解性	4	(7) その他.....	18
(3) 吸湿性	4	VI. 薬効薬理に関する項目	19
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点.....	4	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群.....	19
(5) 酸塩基解離定数	4	2. 薬理作用.....	19
(6) 分配係数	4	(1) 作用部位・作用機序.....	19
(7) その他の主な示性値	4	(2) 薬効を裏付ける試験成績.....	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性....	4	(3) 作用発現時間・持続時間.....	19
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	4	VII. 薬物動態に関する項目	20
IV. 製剤に関する項目	5	1. 血中濃度の推移.....	20
1. 剤形	5	(1) 治療上有効な血中濃度.....	20
(1) 剤形の区別	5	(2) 臨床試験で確認された血中濃度.....	20
(2) 製剤の外観及び性状	5	(3) 中毒域.....	23
(3) 識別コード	5	(4) 食事・併用薬の影響.....	23
(4) 製剤の物性	5	2. 薬物速度論的パラメータ.....	23
(5) その他	5	(1) 解析方法.....	23
2. 製剤の組成	6	(2) 吸収速度定数.....	23
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添 加剤	6	(3) 消失速度定数.....	24
(2) 電解質等の濃度	6	(4) クリアランス.....	24
(3) 熱量	6	(5) 分布容積.....	24
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	6	(6) その他.....	24
4. 力価	6	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	24
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	6	(1) 解析方法.....	24
		(2) パラメータ変動要因.....	24

4. 吸収	24	2. 毒性試験	31
5. 分布	24	(1) 単回投与毒性試験	31
(1) 血液-脳関門通過性	24	(2) 反復投与毒性試験	31
(2) 血液-胎盤関門通過性	24	(3) 遺伝毒性試験	31
(3) 乳汁への移行性	24	(4) がん原性試験	31
(4) 髄液への移行性	25	(5) 生殖発生毒性試験	31
(5) その他の組織への移行性	25	(6) 局所刺激性試験	31
(6) 血漿蛋白結合率	25	(7) その他の特殊毒性	31
6. 代謝	25	X. 管理的事項に関する項目	32
(1) 代謝部位及び代謝経路	25	1. 規制区分	32
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分 子種、寄与率	25	2. 有効期間	32
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	25	3. 包装状態での貯法	32
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存 在比率	25	4. 取扱い上の注意	32
7. 排泄	25	5. 患者向け資材	32
8. トランスポーターに関する情報	26	6. 同一成分・同効薬	32
9. 透析等による除去率	26	7. 国際誕生年月日	32
10. 特定の背景を有する患者	26	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	33
11. その他	27	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	33
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目	28	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ の内容	33
1. 警告内容とその理由	28	11. 再審査期間	33
2. 禁忌内容とその理由	28	12. 投薬期間制限に関する情報	33
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	28	13. 各種コード	33
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	28	14. 保険給付上の注意	34
5. 重要な基本的注意とその理由	28	XI. 文献	35
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	28	1. 引用文献	35
(1) 合併症・既往歴等のある患者	28	2. その他の参考文献	35
(2) 腎機能障害患者	28	XII. 参考資料	36
(3) 肝機能障害患者	28	1. 主な外国での発売状況	36
(4) 生殖能を有する者	28	2. 海外における臨床支援情報	36
(5) 妊婦	28	XIII. 備考	37
(6) 授乳婦	29	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	37
(7) 小児等	29	(1) 粉碎	37
(8) 高齢者	29	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ の通過性	37
7. 相互作用	29	2. その他の関連資料	37
(1) 併用禁忌とその理由	29		
(2) 併用注意とその理由	29		
8. 副作用	29		
(1) 重大な副作用と初期症状	29		
(2) その他の副作用	29		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	30		
10. 過量投与	30		
11. 適用上の注意	30		
12. その他の注意	30		
(1) 臨床使用に基づく情報	30		
(2) 非臨床試験に基づく情報	30		
IX. 非臨床試験に関する項目	31		
1. 薬理試験	31		
(1) 薬効薬理試験	31		
(2) 安全性薬理試験	31		
(3) その他の薬理試験	31		

略語表

略語	略語内容
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
Al-P	アルカリホスファターゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血漿中濃度-時間曲線下面積
BUN	血液尿素窒素
Cmax	最高血漿中濃度
LDH	乳酸脱水素酵素
$T_{1/2}$, $t_{1/2}$	消失半減期
Tmax	最高血漿中濃度到達時間
γ -GTP	γ -グルタミルトランスペプチダーゼ

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、allergic disease の抑制作用を持つ第2世代抗ヒスタミン薬の一つである。ヒスタミン H₁ 受容体拮抗を主作用とし、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・遊離抑制作用を併せ持つ、国内で開発された allergic disease 治療薬である¹⁾。

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「明治」及びオロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「明治」は、Meiji Seika ファルマ(株)が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日付)に基づき、規格及び試験方法の設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2012 年(平成 24 年)8 月に承認を取得、同年 12 月に薬価基準収載され、発売に至った。

その後、2014 年 11 月に「小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症）に伴う癢痒」の効能・効果追加及び用法・用量追加の一部変更承認を取得した。

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」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。

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「明治」及びオロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「明治」は、2023 年 7 月に Meiji Seika ファルマ株式会社から Me ファルマ株式会社へ販売が移管された。

2. 製品の治療学的特性

①アレルギー性鼻炎、じん麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒(湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑)(以上成人)、ならびにアレルギー性鼻炎、じん麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒)に伴うそう痒(以上小児)に適応を有する。(「V. 1. 効能又は効果」の項参照)

②副作用

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. (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

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」・オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」:

- ・錠剤裏面に含量規格「2.5」及び「5」を刻印している。(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)
- ・5mg 錠は分割しやすい形状である。(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)
- ・PTP 包装はシートの材質に環状ポリオレフィン(COC)を用いて、防湿性を高めている。(「IV. 10. (4) 容器の材質」の項参照)

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「明治」・オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「明治」:

- ・錠剤裏面に含量規格「2.5」及び「5」を刻印している。(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)
- ・錠剤の色調を変えて、普通錠との識別性を高めている。(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)
- ・水なしで飲めるメントール風味の口腔内崩壊錠(OD 錠)である。(「IV. 2. (1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤」の項参照)
- ・OD5mg 錠は分割しやすい形状である。(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)
- ・PTP 包装はシートの材質に環状ポリオレフィン(COC)を用いて、防湿性を高めている。(「IV. 10. (4) 容器の材質」の項参照)
- ・バラ包装の小包装(100 錠)がある。(オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「明治」)(「IV. 10. (2) 包装」の項参照)

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2023年7月現在)

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錠 2.5mg 「明治」
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「明治」
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」

(2) 洋名

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE Tablets 2.5mg 「MEIJI」
OLOPATADINE HYDROCHLORIDE Tablets 5mg 「MEIJI」
OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD Tablets 2.5mg 「MEIJI」
OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD Tablets 5mg 「MEIJI」

(3) 名称の由来

一般名 + 剤形 + 規格 (含量) + 「明治」

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)

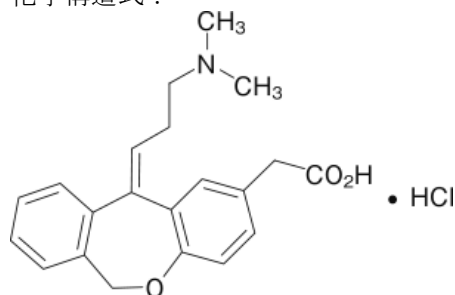
Olopatadine Hydrochloride (JAN)
Olopatadine (INN)

(3) ステム (stem)

-tadine : tricyclic histamine- H_1 receptor antagonists, tricyclic compounds²⁾

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 : $C_{21}H_{23}NO_3 \cdot HCl$
分子量 : 373.87

5. 化学名 (命名法) 又は本質

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

性状：オロパタジン塩酸塩は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

本品は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。
本品は0.01mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

25℃、32.8～93%RHにおいて重量増加率を測定した結果、吸湿性は示さなかった³⁾。

(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

$pK_a'_1=4.18$ （カルボキシル基）、 $pK_a'_2=9.79$ （3級アミノ基）³⁾

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

本品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

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⁾

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）

(3) 塩化物の定性反応(2)

定量法：（日局「オロパタジン塩酸塩」の定量法による。）⁴⁾

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg 「明治」：錠剤（フィルムコーティング錠）

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg・5mg 「明治」：錠剤（口腔内崩壊錠）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	剤形	色	外形		
			表	裏	側面
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」	フィルムコーティング錠	淡黄赤色			
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
			6.1	2.9	80
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」	割線入りフィルムコーティング錠	淡黄赤色			
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
			7.1	2.9	120
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「明治」	口腔内崩壊錠	ごくうすい黄色			
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
			6.1	2.6	85
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」	割線入り口腔内崩壊錠	ごくうすい黄色			
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
			7.1	3.1	120

(3) 識別コード

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」 : MS043

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」 : MS044

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「明治」 : MS045

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」 : MS046

識別コードの表示位置：製剤本体、PTP シート

(4) 製剤の物性

溶出性：「IV. 9. 溶出性」の項参照

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「明治」・オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」：

崩壊性：日本薬局方一般試験法 崩壊試験(1)即放性製剤の項に適合する。

(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	有効成分（1錠中）	添加剤
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」	日局オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg	D-マンニトール、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、塩化ナトリウム、黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール・アクリル酸・メタクリル酸メチル共重合体、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 6000、タルク、カルナウバロウ
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」	日局オロパタジン塩酸塩錠 5.0mg	
オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg 「明治」	日局オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg	D-マンニトール、結晶セルロース、カルメロース、カルメロースカルシウム、エチルセルロース、含水二酸化ケイ素、タルク、スクラロース、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、黄色三二酸化鉄、フマル酸ステアリルナトリウム
オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg 「明治」	日局オロパタジン塩酸塩OD錠 5.0mg	香料、I-メントール

(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

オロパタジン錠・OD錠について類縁物質の規定はないが、日本薬局方医薬品各条で有効成分オロパタジン塩酸塩の類縁物質として、 α -hydroxy 体及び E-体が知られている（限度値 0.1%）¹⁾。

6. 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 「明治」

① 加速試験⁵⁾

保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装製品)	6ヵ月	規格内

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性(含量均一性試験)、溶出試験、含量
本剤の承認時の規格及び試験方法に従って実施した。

② 苛酷試験⁶⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
温度	40℃	無包装	3ヵ月	判定基準の範囲内
	60℃		1ヵ月	
湿度	25℃/75%RH		3ヵ月	
温度・湿度	50℃/90%RH		1ヵ月	
光	1000lux		120万lux・hr	

試験項目：性状、溶出性、含量

オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」

①加速試験⁷⁾

保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装製品)	6ヵ月	規格内

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性(含量均一性試験)、溶出試験、含量
本剤の承認時の規格及び試験方法に従って実施した。

②苛酷試験⁸⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
温度	40℃	無包装	3ヵ月	判定基準の範囲内
	60℃		1ヵ月	
湿度	25℃/75%RH		3ヵ月	
温度・湿度	50℃/90%RH		1ヵ月	
光	1000lux		120万lux・hr	

試験項目：性状、溶出性、含量

③分割時の安定性⁹⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
温度	40℃	無包装	30日	判定基準の範囲内
湿度	25℃/75%RH			
光	1000lux		120万lux・hr	

試験項目：性状、含量

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「明治」

①加速試験¹⁰⁾

保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装製品)	6ヵ月	規格内

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性(含量均一性試験)、崩壊試験、溶出試験、含量
本剤の承認時の規格及び試験方法に従って実施した。

②苛酷試験¹¹⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
温度	40℃	無包装	3ヵ月	判定基準の範囲内
	60℃		1ヵ月	
湿度	25℃/75%RH		3ヵ月	
温度・湿度	50℃/90%RH		1ヵ月	
光	1000lux		120万lux・hr	

試験項目：性状、崩壊試験、溶出性、含量

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「明治」

①加速試験¹²⁾

保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	PTP包装品 (最終包装製品)	6ヵ月	規格内
	バラ包装品 (最終包装製品)		

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性(含量均一性試験)、崩壊試験、溶出試験、含量
本剤の承認時の規格及び試験方法に従って実施した。

② 苛酷試験¹³⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
温度	40℃	無包装	3ヵ月	判定基準の範囲内
	60℃		1ヵ月	
湿度	25℃/75%RH		3ヵ月	
温度・湿度	50℃/90%RH		1ヵ月	
光	1000lux		120万lux・hr	

試験項目：性状、崩壊試験、溶出性、含量

③ 分割時の安定性¹⁴⁾

保存条件		保存形態	保存期間	試験結果
温度	40℃	無包装	30日	判定基準の範囲内
湿度	25℃/75%RH			
光	1000lux		120万lux・hr	

試験項目：性状、含量

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）

該当資料なし

9. 溶出性

< 溶出挙動における同等性 >

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「明治」¹⁵⁾：

（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ついて 医薬審第64号（平成12年2月14日付）、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 薬食審査発第1124004号（平成18年11月24日付））

試験条件

試験方法：日本薬局方(JP15)一般試験法 溶出試験法（パドル法）

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2（日局溶出試験 第1液）

②pH3.0（薄めたMcIlvaineの緩衝液）

③pH6.8（日局溶出試験 第2液）

④水

回転数：毎分50回転 試験液①～④

毎分100回転 試験液③

判定基準

(1) 平均溶出率

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。

(2) 個々の溶出率

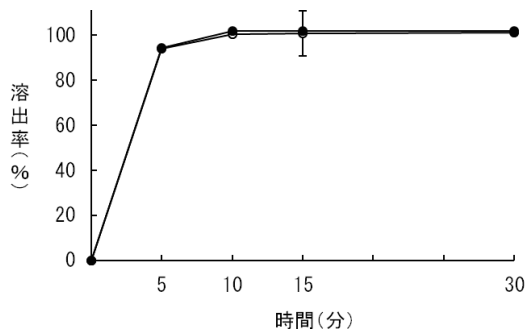
最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

試験結果

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「明治」は、オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、両剤は生物学的に同等とみなされた。

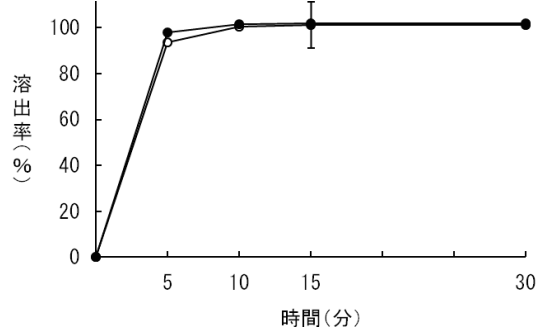
試験液①：pH1.2

毎分 50 回転



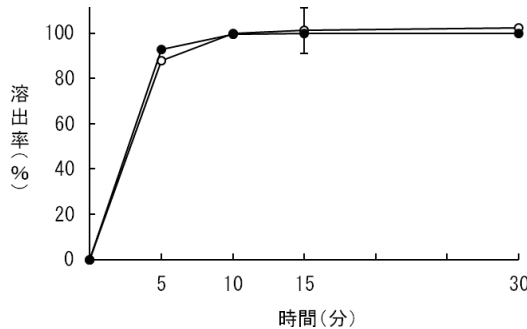
試験液②：pH3.0

毎分 50 回転



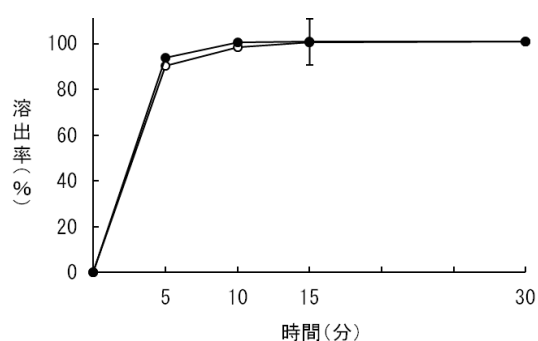
試験液③：pH6.8

毎分 50 回転



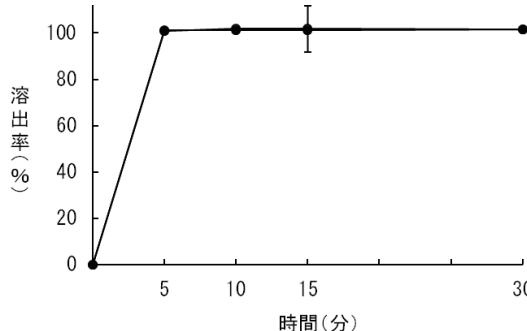
試験液④：水

毎分 50 回転



試験液③：pH6.8

毎分 100 回転



●：試験剤 (オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」)
○：標準剤 (オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」)
○：判定時点における同等性判定基準範囲
n=12

図 オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「明治」の溶出挙動における同等性 (試験剤及び標準剤の平均溶出率の比較)

表 オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「明治」の溶出挙動における同等性 (試験剤及び標準剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験剤 (オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「明治」)	標準剤 (オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
溶出試験法 (パドル法)	毎分50回転	①pH1.2	15分	101.8	100.8	適合
		②pH3.0		101.8	101.1	適合
		③pH6.8		99.8	101.2	適合
		④水		100.9	100.7	適合
	毎分100回転	③pH6.8		101.3	101.9	適合

(n=12)

(試験剤の個々の溶出率)

試験条件				オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「明治」		判定
方法	回転数	試験液	判定時点	個々の溶出率(%)	平均溶出率(%)±S.D.	
溶出試験法 (パドル法)	毎分50回転	①pH1.2	15分	102.3、102.7、100.9、103.5、100.4、102.1、 102.2、100.9、100.7、102.4、102.5、101.1	101.8±0.97	適合
		②pH3.0		101.2、104.3、103.1、103.1、99.7、102.1、 103.6、99.4、101.2、101.3、102.1、100.2	101.8±1.56	適合
		③pH6.8		97.5、98.0、98.9、100.7、101.0、99.4、 100.7、98.7、98.7、101.2、101.3、102.0	99.8±1.48	適合
		④水		102.0、100.4、100.5、101.1、99.9、101.8、 101.6、101.5、100.6、100.4、99.3、101.3	100.9±0.82	適合
	毎分100回転	③pH6.8		101.7、99.7、102.0、101.7、102.1、99.4、 102.1、101.7、102.2、99.4、102.1、101.9	101.3±1.12	適合

(n=12)

オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」¹⁶⁾：

(後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第487号(平成9年12月22日付)、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 薬食審査発第1124004号(平成18年11月24日付))

試験条件

試験方法：日本薬局方(JP15)一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 (日局溶出試験 第1液)

②pH5.0 (薄めた McIlvaine の緩衝液)

③pH6.8 (日局溶出試験 第2液)

④水

回転数：毎分 50 回転 試験液①～④

毎分 100 回転 試験液③

判定基準

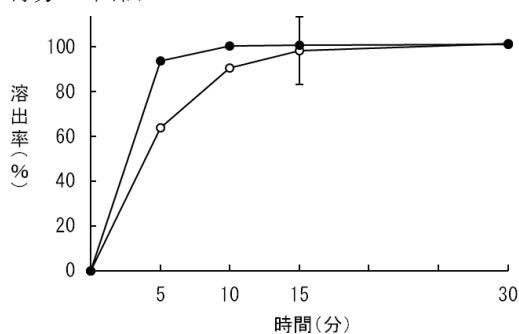
試験剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

試験結果

オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」の溶出挙動は、各試験液において標準剤と類似していることが確認された。

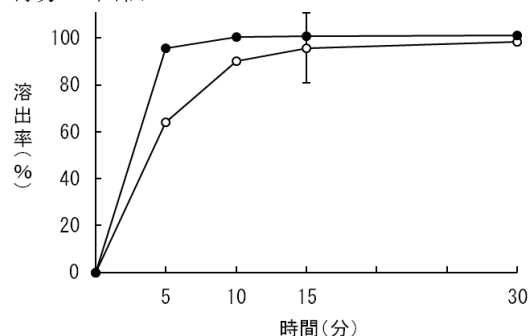
試験液①：pH1.2

毎分 50 回転



試験液②：pH5.0

毎分 50 回転



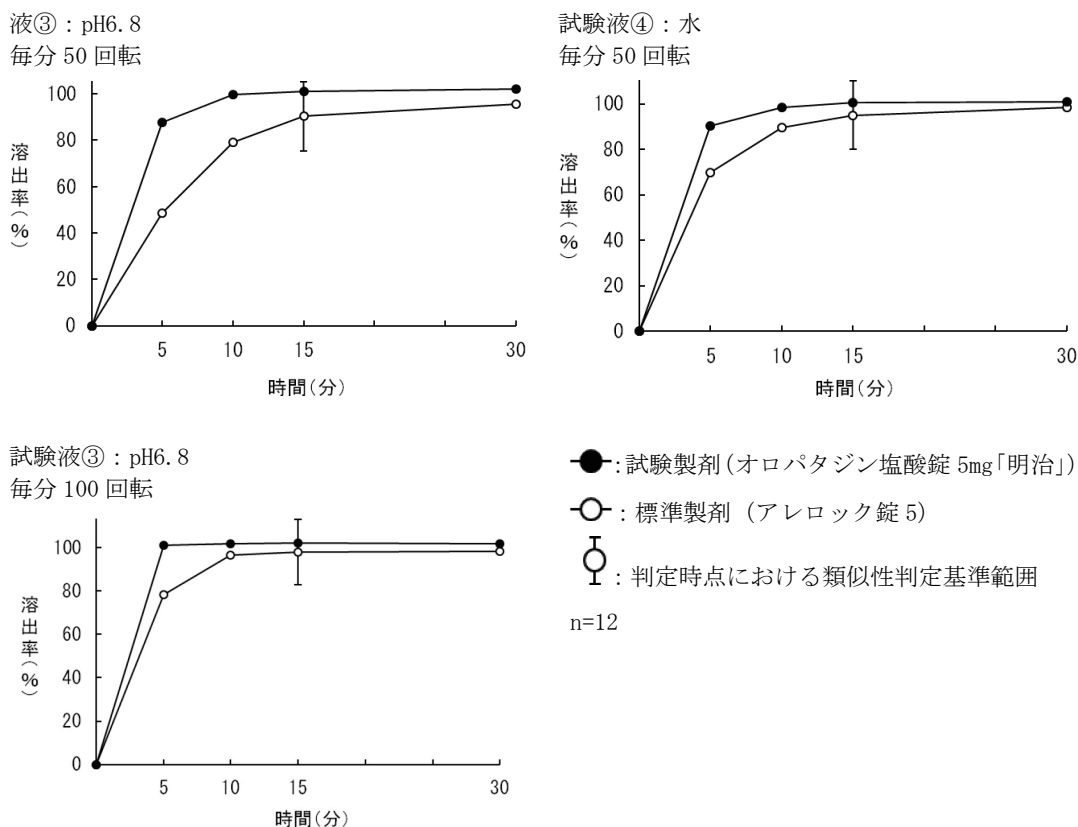


図 オロパタジン塩酸錠5mg「明治」の溶出挙動における類似性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

表 オロパタジン塩酸錠5mg「明治」の溶出挙動における類似性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (オロパタジン塩酸錠5mg「明治」)	標準製剤 (アレロック錠5)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率(%)	平均溶出率(%)	
溶出試験法 (パドル法)	毎分50回転	①pH1.2	15分	100.8	98.2	適合
		②pH5.0		100.9	95.8	適合
		③pH6.8		101.2	90.3	適合
		④水		100.7	95.1	適合
	毎分100回転	③pH6.8		101.9	97.8	適合

(n=12)

オロパタジン塩酸錠0.5mg「明治」¹⁷⁾：

(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ついて 医薬審第64号(平成12年2月14日付)、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 薬食審査発第1124004号(平成18年11月24日付))

試験条件

試験方法：日本薬局方(JP15)一般試験法 溶出試験法 (パドル法)

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 (日局溶出試験 第1液)

②pH4.0 (薄めたMcIlvaineの緩衝液)

③pH6.8 (日局溶出試験 第2液)

④水

回転数：毎分50回転 試験液①～④

毎分100回転 試験液①

判定基準

(1) 平均溶出率

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。

(2) 個々の溶出率

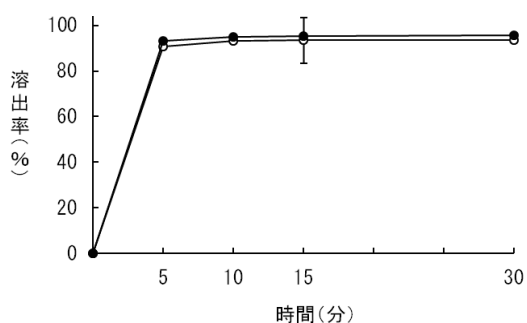
最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがない。

試験結果

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「明治」は、オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「明治」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、両剤は生物学的に同等とみなされた。

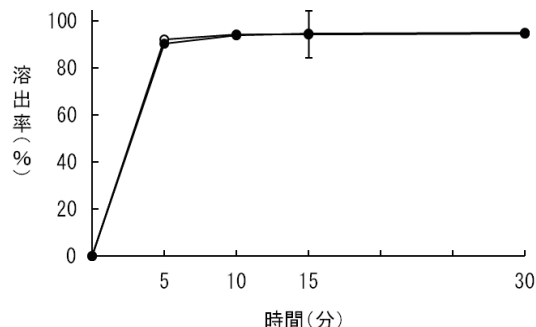
試験液①：pH1.2

毎分 50 回転



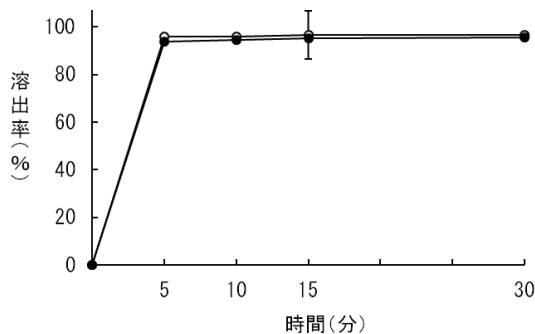
試験液②：pH4.0

毎分 50 回転



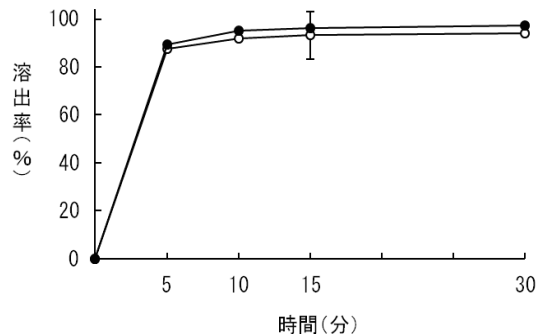
試験液③：pH6.8

毎分 50 回転



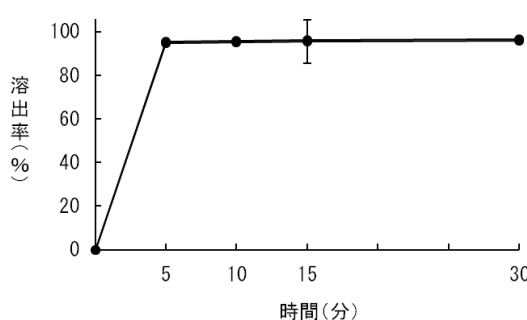
試験液④：水

毎分 50 回転



試験液①：pH1.2

毎分 100 回転



●：試験製剤 (オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「明治」)

○：標準製剤 (オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「明治」)

⊕：判定時点における同等性判定基準範囲

n=12

図 オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「明治」の溶出挙動における同等性 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

表 オロパタジン塩酸塩0D錠2.5mg「明治」の溶出挙動における同等性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (オロパタジン塩酸塩0D錠2.5mg「明治」)	標準製剤 (オロパタジン塩酸塩0D錠5mg「明治」)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率(%)	平均溶出率(%)	
溶出試験法 (パドル法)	毎分50回転	①pH1.2	15分	95.2	93.4	適合
		②pH4.0		94.5	94.3	適合
		③pH6.8		95.0	96.5	適合
		④水		96.4	93.2	適合
	毎分100回転	①pH1.2		96.2	95.4	適合

(n=12)

(試験製剤の個々の溶出率)

試験条件				オロパタジン塩酸塩0D錠2.5mg「明治」		判定
方法	回転数	試験液	判定時点	個々の溶出率(%)	平均溶出率(%)±S.D.	
溶出試験法 (パドル法)	毎分50回転	①pH1.2	15分	95.4、95.7、95.8、95.3、96.0、96.3、 95.5、93.8、94.0、95.2、95.4、94.5	95.2±0.77	適合
		②pH4.0		93.5、96.1、92.7、93.7、95.3、94.1、 94.6、96.1、92.0、95.6、95.5、94.5	94.5±1.32	適合
		③pH6.8		94.4、94.3、95.3、95.8、94.6、95.1、 93.6、93.5、94.9、95.7、96.1、97.0	95.0±1.03	適合
		④水		99.4、95.9、96.3、94.3、98.8、95.7、 97.4、96.8、95.4、95.5、96.5、95.2	96.4±1.49	適合
	毎分100回転	①pH1.2		95.4、96.0、96.4、95.2、96.3、98.4、 96.9、95.4、95.8、95.7、96.2、97.1	96.2±0.90	適合

(n=12)

オロパタジン塩酸塩0D錠5mg「明治」¹⁸⁾：

(後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン 医薬審第487号(平成9年12月22日付)、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 薬食審査発第1124004号(平成18年11月24日付))

試験条件

試験方法：日本薬局方(JP15)一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験液量：900mL

温度：37±0.5℃

試験液：①pH1.2 (日局溶出試験 第1液)

②pH4.0 (薄めた McIlvaine の緩衝液)

③pH6.8 (日局溶出試験 第2液)

④水

回転数：毎分50回転 試験液①～④

毎分100回転 試験液②

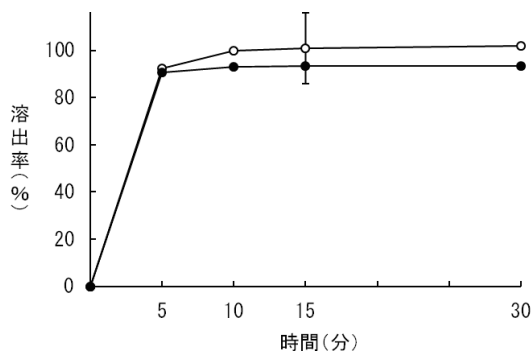
判定基準

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。

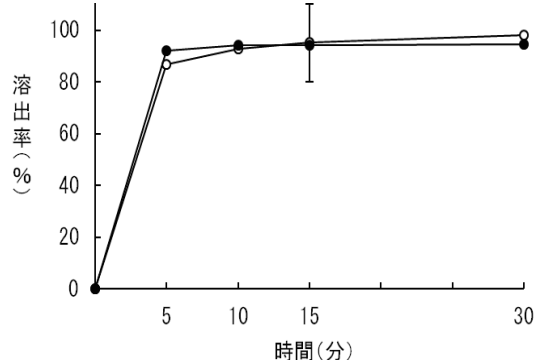
試験結果

オロパタジン塩酸塩0D錠5mg「明治」の溶出挙動は、各試験液において標準製剤と類似していることが確認された。

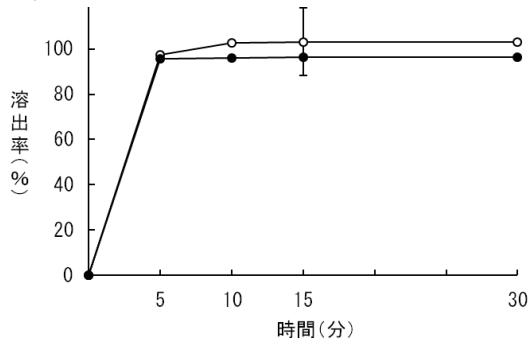
試験液①：pH1.2
毎分 50 回転



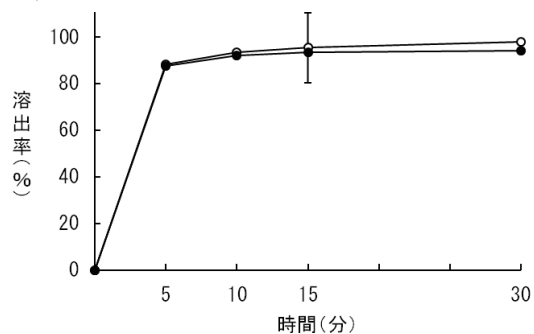
試験液②：pH4.0
毎分 50 回転



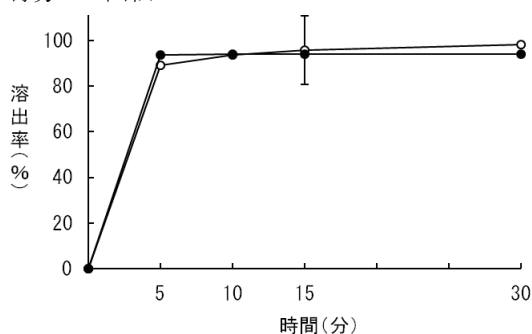
試験液③：pH6.8
毎分 50 回転



試験液④：水
毎分 50 回転



試験液②：pH4.0
毎分 100 回転



●：試験製剤 (オロパジン塩酸塩 OD錠 5mg 「明治」)
○：標準製剤 (アレロック OD錠 5)
○：判定時点における類似性判定基準範囲
n=12

図 オロパジン塩酸塩OD錠5mg「明治」の溶出挙動における類似性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

表 オロパジン塩酸塩OD錠5mg「明治」の溶出挙動における類似性
(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				試験製剤 (オロパジン塩酸塩 OD錠5mg「明治」)	標準製剤 (アレロックOD錠5)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率(%)	平均溶出率(%)	
溶出試験法 (パドル法)	毎分50回転	①pH1.2	15分	93.4	101.0	適合
		②pH4.0		94.3	95.2	適合
		③pH6.8		96.5	103.1	適合
		④水		93.2	95.3	適合
	毎分100回転	②pH4.0		93.9	95.9	適合

(n=12)

<日局溶出規格への適合性>^{19),20)}

オロパジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」及びオロパジン塩酸塩錠 5mg「明治」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。

試験条件

試験方法：日本薬局方 溶出試験法（パドル法、シンカー使用）

試験液：水、900mL

回転数：毎分 50 回転

溶出規格

15 分間の溶出率は 85%以上である。

試験結果

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」の溶出率は 99.6%～101.9%、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」の溶出率は 90.2%～100.7%であり、いずれの製剤も溶出規格に適合していることが確認された。

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錠 2.5mg「明治」〉

PTP 包装 100 錠 (10 錠×10)

〈オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」〉

PTP 包装 100 錠 (10 錠×10) 500 錠 (10 錠×50)

〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「明治」〉

PTP 包装 (乾燥剤入) 100 錠 (10 錠×10)

〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「明治」〉

PTP 包装 (乾燥剤入) 100 錠 (10 錠×10) 500 錠 (10 錠×50)

バラ包装 (ボトル入、乾燥剤入) 100 錠

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「明治」・5mg「明治」:

PTP 包装

シート：環状ポリオレフィン(COC)、アルミ箔(金属)

ピロー：ポリエチレン(PE)、ポリプロピレン(PP)

箱：紙

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「明治」・5mg「明治」:

PTP 包装 (乾燥剤入)

シート：環状ポリオレフィン(COC)、アルミ箔(金属)

ピロー：ポリエチレン(PE)、アルミ箔(金属)

箱：紙

バラ包装 (乾燥剤入、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「明治」)

キャップ：ポリプロピレン(PP)

パッキン：ポリエチレン(PE)

ボトル：ポリエチレン(PE)

詰め物：ポリエチレン(PE)

ラベル：ポリプロピレン(PP)

箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

成人：アレルギー性鼻炎、じん麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑）

小児：アレルギー性鼻炎、じん麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

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〉

国内第Ⅲ相比較試験（成人、オロパタジン塩酸塩錠）

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%上乗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、 $p=0.403$ ； χ^2 検定²¹⁾。

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²¹⁾。

<電子添文17.1.1より転記>

〈じん麻疹〉

国内第Ⅲ相比較試験（成人、オロパタジン塩酸塩錠）

慢性じん麻疹患者（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、 $p=0.093$ ； χ^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、 $p=0.0001$ ； χ^2 検定）²²⁾。

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²²⁾。

＜電子添文17.1.2より転記＞

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

国内第Ⅲ相一般試験（成人、オロパタジン塩酸塩錠）

皮膚疾患に伴うそう痒の患者（湿疹・皮膚炎152例、痒疹72例、皮膚そう痒症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）、皮膚そう痒症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²²⁾。

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²²⁾。

＜電子添文17.1.3より転記＞

〈アレルギー性鼻炎〉

国内二重盲検比較試験（小児、オロパタジン塩酸塩錠）

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）^{注)}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²³⁾。

表 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 (mean±S. D.)	変化量 (mean±S. D.)	解析結果 (共分散分析 ^{a)})
オロパタジン塩酸塩 5mg/回	100	6.14±1.44	-1.41±1.99	最小二乗平均の差 (プラセボ群-5mg群) : 0.51 95%信頼区間 : 0.04~0.98 p値 : 0.019 ^{b)}
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）^{注)}、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²³⁾。

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。

＜電子添文17.1.5より転記＞

〈アトピー性皮膚炎〉

国内二重盲検比較試験（小児、オロパタジン塩酸塩錠）

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「そう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）²³⁾。

表 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 (mean±S. D.)	変化量 (mean±S. D.)	解析結果 (共分散分析 ^{a)})
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 (オロパタジン塩酸塩群-ケトチフェンフマル酸塩群) : -0.08 95%信頼区間 : -0.25~0.09
ケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ	153	2.38±0.44	-0.71±0.76	

a) 投与群を要因、治験薬投与前のそう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²³⁾。

<電子添文 17.1.7 より転記>

2) 安全性試験

<アレルギー性鼻炎>

国内非盲検試験 (小児、オロパタジン塩酸塩錠)

小児通年性アレルギー性鼻炎患者 (7~16 歳、30 kg 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²³⁾。

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²³⁾。

<電子添文 17.1.6 より転記>

(5) 患者・病態別試験

高齢者 (65 歳以上) における臨床成績 (オロパタジン塩酸塩錠)

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、じん麻疹 31 例、そう痒性皮膚疾患 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)、じん麻疹 80.6% (25/31 例)、皮膚疾患に伴うそう痒全体で 58.3% (49/84 例) であった²⁴⁾。

<電子添文 17.1.4 より転記>

(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

該当しない

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

該当資料なし

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²⁵⁾

抗ヒスタミン作用を有するアレルギー用薬：

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ホモクロルシクリジン塩酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩
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

オロパタジン塩酸塩は、選択的ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用を主作用とし、更に化学伝達物質（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF 等）の産生・遊離抑制作用を有し、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

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 H₁ 受容体に強い拮抗作用 (K_i 値：16nmol/L) を有するが、ムスカリン M₁ 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。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²⁶⁾。

<電子添文 18.2.1 より転記>

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²⁷⁾。

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²⁸⁾。

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²⁸⁾。

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²⁹⁾。

<電子添文 18.2.2 より転記>

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 (IC₃₀ 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 (IC₃₀ 値；1.8 μmol/L)、トロンボキサン (IC₃₀ 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³⁰⁾。

<電子添文 18.2.3 より転記>

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 (IC₃₀ 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 Ca²⁺-activated K⁺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³¹⁾。

<電子添文 18.2.4 より転記>

(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

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血漿中濃度推移及び薬物動態パラメータは以下のとおりであった³²⁾。

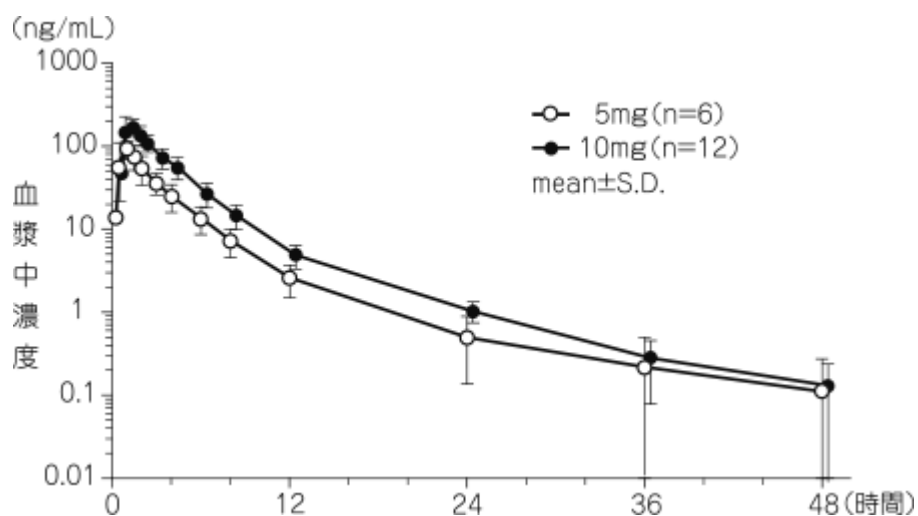


図 健康成人男性に単回経口投与したときの血漿中濃度推移

表 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_{max} (h)	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng · h/mL)	$t_{1/2}$ (h)
5mg (n=6)	1.00 ±0.32	107.66 ±22.01	326 ±63 ^{a)}	8.75 ±4.63 ^{a)}
10mg (n=12)	0.92 ±0.47	191.78 ±42.99	638 ±136 ^{b)}	7.13 ±2.21 ^{b)}

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血漿中濃度推移及び薬物動態パラメータは以下のとおりであった³³⁾。

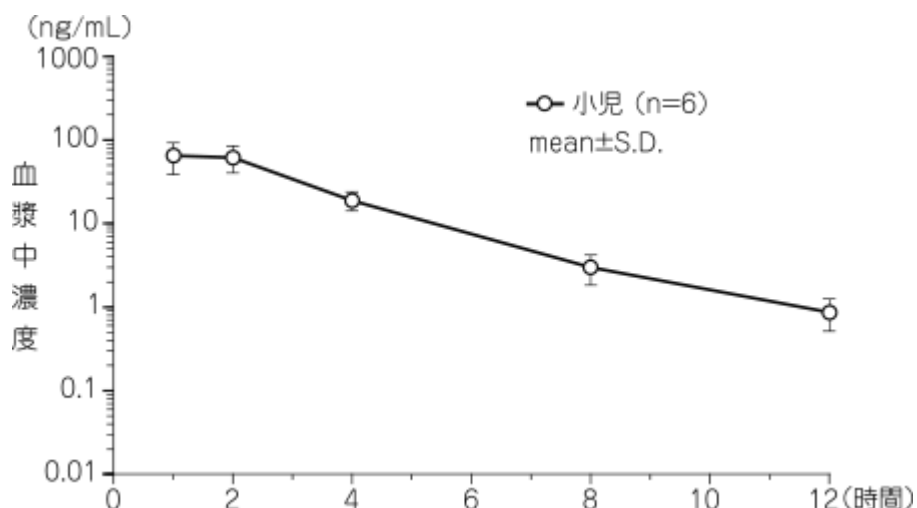


図 小児アレルギー患者に単回経口投与したときの血漿中濃度推移

表 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_{max} (h)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{0-12} (ng · h/mL)
5mg (n=6)	1.33 ± 0.52	81.57 ± 9.91	228 ± 20

mean ± S. D.

<電子添文 16. 1. 1 より転記>

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_{max} は単回経口投与時の1.14倍であった³²⁾。

<電子添文 16. 1. 2 より転記>

3) 生物学的同等性試験

オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」、オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「明治」：^{34, 35)}

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成9年12月22日付医薬審第487号）、「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）

オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」とアレロック錠5又はオロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「明治」とアレロック OD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）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、いずれも $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、それぞれ両剤の生物学的同等性が確認された。

なお、オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「明治」は、水あり及び水なしで投与した。

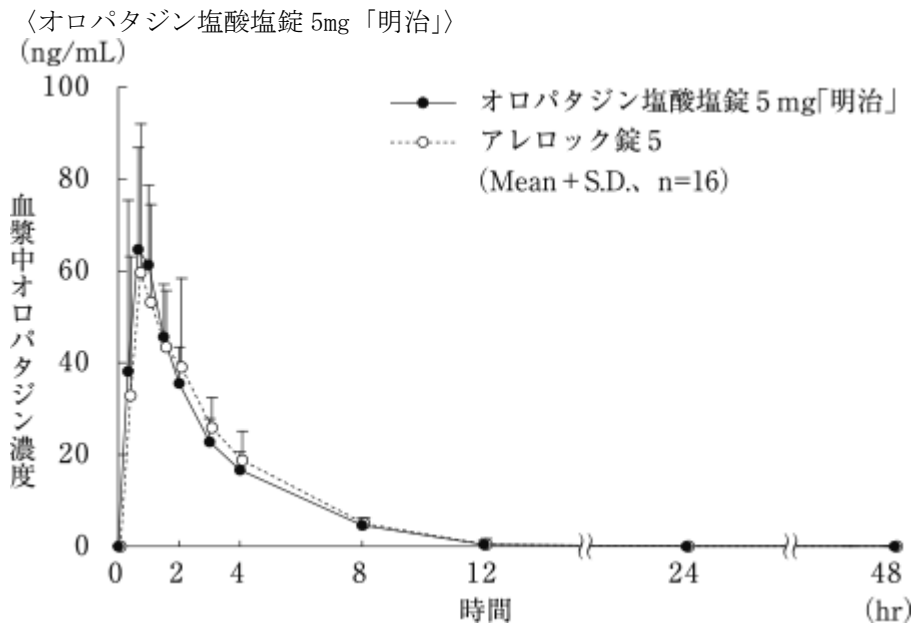


図 5mg 錠投与時の血漿中オロパタジン濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	被験者数	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」	16	197.05 ± 27.20	79.47 ± 16.83	0.8 ± 0.4	2.2 ± 0.2
アレロック錠 5	16	200.02 ± 27.68	73.06 ± 18.65	1.1 ± 0.7	2.1 ± 0.3

Mean ± S. D.

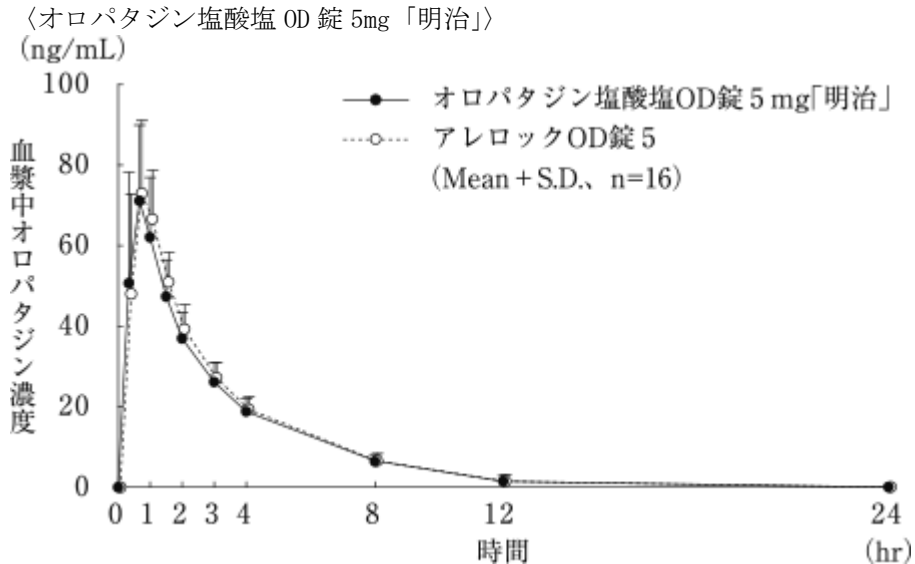


図 5mgOD 錠投与時の血漿中オロパタジン濃度推移 (水あり服用)

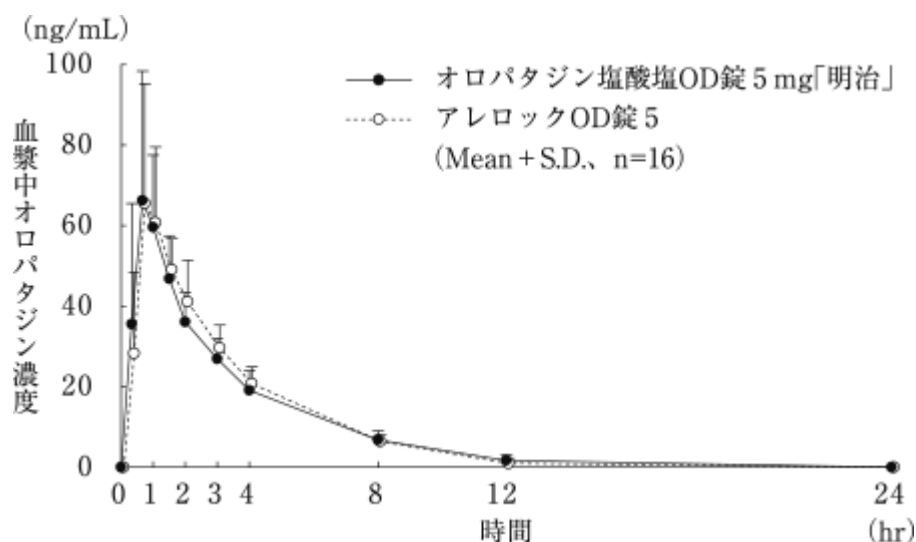


図 5mgOD 錠投与時の血漿中オロパタジン濃度推移（水なし服用）

表 薬物動態パラメータ

	被験者数	判定パラメータ		参考パラメータ		
		AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	
服用 水あり	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」	16	228.24±29.03	77.91±16.15	0.7±0.3	2.5±0.4
	アレロック OD 錠 5	16	236.71±32.13	78.02±13.59	0.7±0.2	2.5±0.4
服用 水なし	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」	16	224.65±42.41	74.58±23.74	0.8±0.4	2.5±0.4
	アレロック OD 錠 5	16	227.32±35.02	74.38±18.90	0.9±0.4	2.3±0.2

Mean±S. D.

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 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錠 2.5mg 「明治」、オロパタジン塩酸塩錠 OD 錠 2.5mg 「明治」：^{15,17)}

「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 12 年 2 月 14 日付医薬審第 64）、「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）に基づき、それぞれオロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」及びオロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」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.9 溶出性」の項参照）

(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

モーメント法

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数^{34, 35)}

販売名	Ke1 (hr ⁻¹)
オロパタジン塩酸塩錠5mg「明治」	0.3169±0.03302
オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「明治」	0.2850±0.04134 (水あり)
	0.2823±0.04748 (水なし)

(Mean±S. D.、n=16)

(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

以下の報告がある³⁶⁾。

<参考>

雄性ラットにオロパタジン塩酸塩 1 mg/kg を経口投与した際の主な吸収部位は十二指腸－空回腸中部と考えられた。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

<参考>

ラットに¹⁴C-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_{max}は血漿中放射能濃度のC_{max}の約1/25であった³⁷⁾。

<電子添文 16. 3. 2 より転記>

(2) 血液－胎盤関門通過性

<参考>

妊娠ラットに¹⁴C-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³⁷⁾。

<電子添文 16. 3. 3 より転記>

(3) 乳汁への移行性

<参考>

授乳期のラットに¹⁴C-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AUC_{0-∞}は、血漿中放射能濃度のAUC_{0-∞}の約1.5倍であった³⁷⁾。

<電子添文 16. 3. 4 より転記>

(「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

<参考>

体組織への分布

ラットに ^{14}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³⁷⁾。
<電子添文 16.3.1 より転記>

(6) 血漿蛋白結合率

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³⁷⁾ (*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)

<電子添文 16.3.5 より転記>

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

以下の報告がある。

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¹⁾。

注) 本剤の承認された用法・用量は「成人：通常、成人には 1 回オロパタジン塩酸塩として 5mg を朝及び就寝前の 1 日 2 回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

(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³²⁾。
<電子添文 16.4 より転記>

注) 本剤の承認された用法・用量は「成人：通常、成人には 1 回オロパタジン塩酸塩として 5mg を朝及び就寝前の 1 日 2 回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

7. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

以下の報告がある³⁶⁾。

排泄部位：主に尿中ならびに糞中

(2) 排泄率

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³²⁾。

<電子添文16.5.1より転記>

注) 本剤の承認された用法・用量は「成人：通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mgを朝及び就寝前の1日2回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

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³³⁾。

<電子添文16.5.2より転記>

(2) 排泄速度

該当資料なし

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

以下の報告がある³⁶⁾。

血液透析：血液透析患者6例を対象とした経口投与試験（オロパタジン塩酸塩錠10mgを朝食後単回経口投与）は透析日と非透析日の2回行った。透析日試験の場合には投与直後から投与後4時間まで透析を行った。透析日の投与後24時間値の血漿中濃度は非透析日に比べて有意に低かったが、その他の時点ではおおむね同値であった。透析日では投与後1～4時間に、非透析日では2～8時間にC_{max}を示し、以後、一相性に消失した。透析日及び非透析日のAUC_{0-∞}は透析日の方が0.87倍と有意に小さかった。オロパタジン塩酸塩には透析性が認められるが、透析日と非透析日の薬物動態に大きな差は認められず、健常成人に比べ、C_{max}は約2倍、AUCは約10倍を示すので、透析患者においては慎重に投与する必要がある。

注) 本剤の承認された用法・用量は「成人：通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mgを朝及び就寝前の1日2回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

10. 特定の背景を有する患者

(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の血漿中濃度推移は以下のとおりであった。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³⁸⁾。

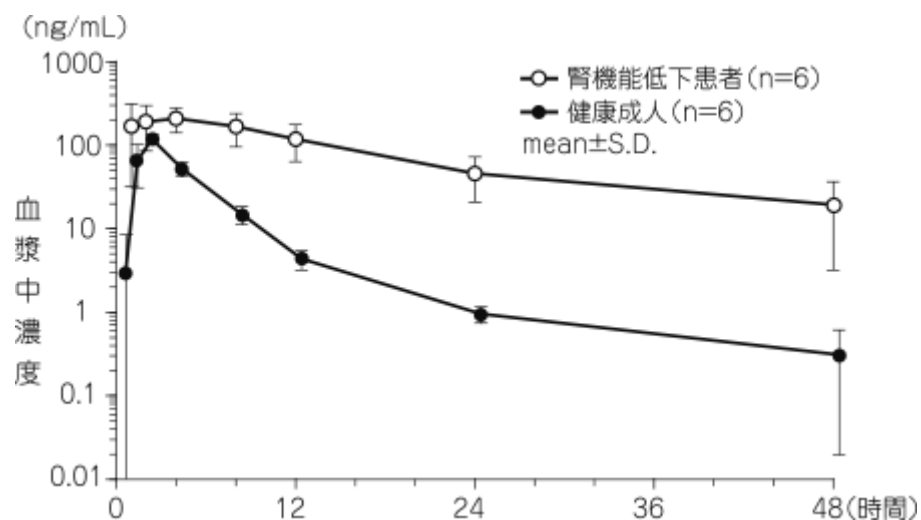


図 腎機能低下患者及び健康成人に単回経口投与したときの血漿中濃度推移

<電子添文 16. 6. 1 より転記>

(2) 高齢者

高齢者（70 歳以上）及び健康成人にオロパタジン塩酸塩錠 10mg を単回経口投与したときの血漿中濃度推移は以下のとおりであった。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³⁹⁾。

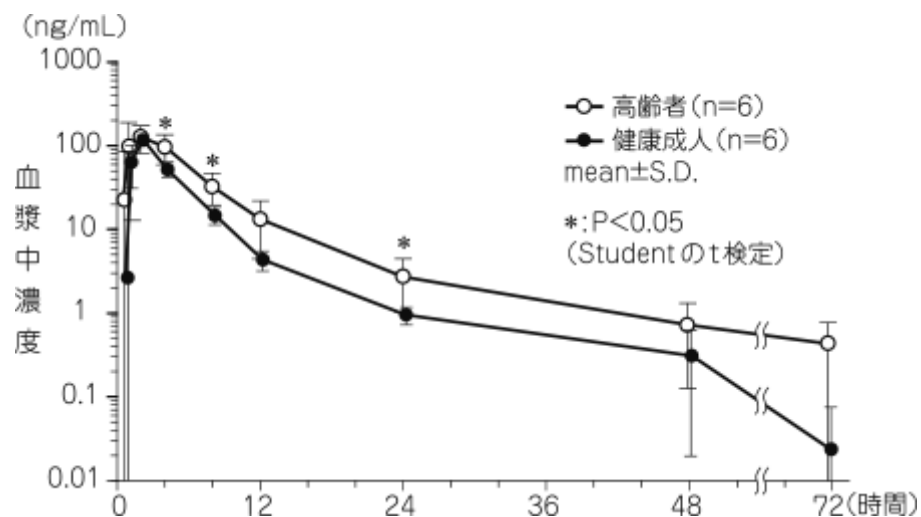


図 高齢者及び健康成人に単回経口投与したときの血漿中濃度推移

<電子添文 16. 6. 2 より転記>

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

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。

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。

(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]

(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。

(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。

(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。

(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]

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、 γ -GTP、LDH、A1-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

種類\頻度	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）、 そう痒、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, AST, LDH, γ -GTP, Al-P, 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) 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。

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

〈製剤共通〉

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 分割したときは遮光下に保存すること。

〈OD 錠〉

14.1.3 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。

(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⁴⁰⁾

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「明治」を、オロパタジン塩酸塩として20mg/kgの用量（臨床投与量の約100倍に相当）で雄性ラット（n=3）に単回経口投与し、急性毒性を評価した。その結果、投与7日後の剖検日まで、死亡は認められず、一般状態にも変化は認められなかった。また、体重推移及び剖検でも異常は認められなかった。

(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錠 2.5mg「明治」 該当しない
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「明治」 該当しない
オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「明治」 該当しない
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「明治」 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

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

〈OD錠〉

本剤の錠剤表面に斑点が認められることがあるが、これは使用色素によるものであり、品質に影響はない。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り
くすりのしおり：有り
その他の患者向け資材：無し

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレロック錠 2.5・5、アレロック OD錠 2.5・5、アレロック顆粒 0.5%
同効薬：ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ホモクロルシクリジン塩酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩

7. 国際誕生年月日

1996年12月³⁾

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」	2012年8月15日	22400AMX01114000	2012年12月14日	2012年12月14日
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」	2012年8月15日	22400AMX01117000	2012年12月14日	2012年12月14日
オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg 「明治」	2012年8月15日	22400AMX01115000	2012年12月14日	2012年12月14日
オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg 「明治」	2012年8月15日	22400AMX01116000	2012年12月14日	2012年12月14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・効果追加]

小児：アレルギー性鼻炎、じん麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

[用法・用量追加]

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。

（製造販売一部変更承認年月日：2014年11月14日）

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

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」

統一名（告示名）	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（統一名）
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 錠	121796402	4490025F1015	622690900
販売名		個別医薬品コード（YJコード）	レセプト電算コード（個別）
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」		4490025F1279	622179601

令和4年3月4日付 厚生労働省告示第57号「使用薬剤の薬価（薬価基準）の一部を改正する件」による変更

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」

統一名（告示名）	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（統一名）
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 錠	121797102	4490025F2011	622475900
販売名		個別医薬品コード（YJコード）	レセプト電算コード（個別）
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」		4490025F2275	622179701

令和5年3月3日付 厚生労働省告示第58号「使用薬剤の薬価（薬価基準）の一部を改正する件」による変更

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「明治」

統一名(告示名)	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 (統一名)
オロパタジン塩酸塩 2.5mg 口腔内崩壊錠	121798802	4490025F3018	622847500
販売名		個別医薬品コード (YJコード)	レセプト電算コード (個別)
オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「明治」		4490025F3077	622179801

令和4年3月4日付 厚生労働省告示第57号「使用薬剤の薬価(薬価基準)の一部を改正する件」による変更

オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「明治」

統一名(告示名)	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 (統一名)
オロパタジン塩酸塩 5mg 口腔内崩壊錠	121799502	4490025F4014	622645600
販売名		個別医薬品コード (YJコード)	レセプト電算コード (個別)
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「明治」		4490025F4073	622179901

令和5年3月3日付 厚生労働省告示第58号「使用薬剤の薬価(薬価基準)の一部を改正する件」による変更

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。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 第十八改正日本薬局方解説書
- 2) The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names (INN) for pharmaceutical substances 2018 (World Health Organization)
- 3) (公財) 日本薬剤師研修センター編：日本薬局方医薬品情報 2021 (JPDI)
- 4) 第十八改正日本薬局方
- 5) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」の安定性に関する資料 (加速試験) (社内資料)
- 6) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」の無包装状態における安定性に関する資料 (社内資料)
- 7) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」の安定性に関する資料 (加速試験) (社内資料)
- 8) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」の無包装状態における安定性に関する資料 (社内資料)
- 9) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」の分割時安定性に関する資料 (社内資料)
- 10) オロパタジン塩酸塩錠 OD 2.5mg 「明治」の安定性に関する資料 (加速試験) (社内資料)
- 11) オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「明治」の無包装状態における安定性に関する資料 (社内資料)
- 12) オロパタジン塩酸塩錠 OD 5mg 「明治」の安定性に関する資料 (加速試験) (社内資料)
- 13) オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」の無包装状態における安定性に関する資料 (社内資料)
- 14) オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」の分割時安定性に関する資料 (社内資料)
- 15) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」の溶出試験に関する資料 (社内資料)
- 16) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」の溶出試験に関する資料 (社内資料)
- 17) オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「明治」の溶出試験に関する資料 (社内資料)
- 18) オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」の溶出試験に関する資料 (社内資料)
- 19) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「明治」の溶出性 (公的溶出試験) に関する資料 (社内資料)
- 20) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」の溶出性 (公的溶出試験) に関する資料 (社内資料)
- 21) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ト-I-2
- 22) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ト-I-3
- 23) アロロック錠、OD錠：2010年7月23日承認、CTD2.7.6
- 24) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ト-I-5
- 25) 薬剤分類情報閲覧システム <<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2023/06/28 アクセス)
- 26) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ホ-II-1
- 27) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ホ-I-1
- 28) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ホ-I-3
- 29) 佐々木康夫ほか：日薬理誌. 1995；106：347-357
- 30) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ホ-II-2
- 31) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要ホ-II-3
- 32) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要へ-III-1
- 33) アロロック錠、OD錠：2010年7月23日承認、CTD2.7.2
- 34) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「明治」の生物学的同等性に関する資料 (社内資料)
- 35) オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」の生物学的同等性に関する資料 (社内資料)
- 36) 日本薬剤師研修センター編：医薬品服薬指導情報集 [薬効別] 追補版 2、p676-689.
- 37) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要へ-II-2
- 38) アロロック錠：2000年12月22日承認、申請資料概要へ-III-3
- 39) 小林真一ほか：臨床薬理. 1996；27：673-681
- 40) オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「明治」のラットを用いた単回経口投与毒性試験 (社内資料)

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

米国及び英国では、オロパタジン塩酸塩経口剤は発売されていない。

米国では点眼剤及び点鼻薬（OTC あるいは処方薬）が、英国では点眼剤がそれぞれ発売されている。

2. 海外における臨床支援情報

米国及びオーストラリアではオロパタジン塩酸塩経口剤は発売されていない。

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

個別に照会すること。

問い合わせ先：Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

(Me ファルマ株式会社専用ダイヤル)

TEL：(0120)261-158、FAX：(03)3272-2438

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること。

問い合わせ先：Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

(Me ファルマ株式会社専用ダイヤル)

TEL：(0120)261-158、FAX：(03)3272-2438

2. その他の関連資料

製造販売元

Meiji Seika ファルマ株式会社

東京都中央区京橋 2 - 4 - 16

販売元

Me ファルマ株式会社

東京都中央区京橋 2-4-16

Manufactured by
THAI MEIJI PHARMACEUTICAL CO., LTD.
Thailand

IFOL014812