

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2008 に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「ケミファ」

オロパタジン塩酸塩錠5mg「ケミファ」

日本薬局方 **オロパタジン塩酸塩錠**

Olopatadine

| | |
|-------------------------------|--|
| 剤形 | フィルムコーティング錠 |
| 製剤の規制区分 | 該当しない |
| 規格・含量 | オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」： 1錠中（日局）オロパタジン塩酸塩 2.5 mg オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」： 1錠中（日局）オロパタジン塩酸塩 5.0 mg |
| 一般名 | 和名：オロパタジン塩酸塩（JAN） 洋名：Olopatadine Hydrochloride（JAN、INN） |
| 製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日 | 製造販売承認年月日：2012年8月15日 薬価基準収載年月日：2012年12月14日 発売年月日：2012年12月14日 |
| 開発・製造販売（輸入） ・提携・販売会社名 | 製造販売元：日本ケミファ株式会社 販売元：日本薬品工業株式会社 |
| 医薬情報担当者の 連絡先 | |
| 問い合わせ窓口 | 日本薬品工業株式会社 安全管理課 TEL. 03-5833-5011/FAX. 03-5833-5100 受付時間：9:00～17:00（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.npi-inc.co.jp/medical.html |

本 IF は 2014 年 12 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

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

IF 利用の手引きの概要

— 日本病院薬剤師会 —

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

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

2. IF とは

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

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

[IF の様式]

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

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2008」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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

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

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

4. 利用に際しての留意点

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

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

(2008 年 9 月)

目 次

| | | |
|------------------------------------|----|--|
| I. 概要に関する項目 | | |
| 1. 開発の経緯 | 1 | |
| 2. 製品の治療学的・製剤学的特性 | 1 | |
| II. 名称に関する項目 | | |
| 1. 販売名 | 2 | |
| 2. 一般名 | 2 | |
| 3. 構造式又は示性式 | 2 | |
| 4. 分子式及び分子量 | 2 | |
| 5. 化学名（命名法） | 2 | |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 | 2 | |
| 7. CAS登録番号 | 2 | |
| III. 有効成分に関する項目 | | |
| 1. 物理化学的性質 | 3 | |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 | 3 | |
| 3. 有効成分の確認試験法 | 3 | |
| 4. 有効成分の定量法 | 3 | |
| IV. 製剤に関する項目 | | |
| 1. 剤形 | 4 | |
| 2. 製剤の組成 | 4 | |
| 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に関する注意 | 4 | |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性 | 5 | |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性 | 5 | |
| 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化） | 5 | |
| 7. 溶出性 | 5 | |
| 8. 生物学的試験法 | 7 | |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法 | 7 | |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法 | 8 | |
| 11. 力価 | 8 | |
| 12. 混入する可能性のある夾雑物 | 8 | |
| 13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 | 8 | |
| 14. その他 | 8 | |
| V. 治療に関する項目 | | |
| 1. 効能又は効果 | 9 | |
| 2. 用法及び用量 | 9 | |
| 3. 臨床成績 | 9 | |
| VI. 薬効薬理に関する項目 | | |
| 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 | 10 | |
| 2. 薬理作用 | 10 | |
| VII. 薬物動態に関する項目 | | |
| 1. 血中濃度の推移・測定法 | 11 | |
| 2. 薬物速度論的パラメータ | 13 | |
| 3. 吸収 | 13 | |
| 4. 分布 | 13 | |
| 5. 代謝 | 13 | |
| 6. 排泄 | 13 | |
| 7. 透析等による除去率 | 14 | |
| 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 | 15 | |
| 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） | 15 | |
| 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 | 15 | |
| 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 | 15 | |
| 5. 慎重投与内容とその理由 | 15 | |
| 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 | 15 | |
| 7. 相互作用 | 15 | |
| 8. 副作用 | 16 | |
| 9. 高齢者への投与 | 16 | |
| 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 | 16 | |
| 11. 小児等への投与 | 17 | |
| 12. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 17 | |
| 13. 過量投与 | 17 | |
| 14. 適用上の注意 | 17 | |
| 15. その他の注意 | 17 | |
| 16. その他 | 17 | |
| IX. 非臨床試験に関する項目 | | |
| 1. 薬理試験 | 18 | |
| 2. 毒性試験 | 18 | |
| X. 管理的事項に関する項目 | | |
| 1. 規制区分 | 19 | |
| 2. 有効期間又は使用期限 | 19 | |
| 3. 貯法・保存条件 | 19 | |
| 4. 薬剤取扱い上の注意点 | 19 | |
| 5. 承認条件等 | 19 | |
| 6. 包装 | 19 | |
| 7. 容器の材質 | 19 | |
| 8. 同一成分・同効薬 | 19 | |
| 9. 国際誕生年月日 | 19 | |
| 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 | 19 | |
| 11. 薬価基準収載年月日 | 20 | |
| 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 | 20 | |
| 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 | 20 | |
| 14. 再審査期間 | 20 | |
| 15. 投与期間制限医薬品に関する情報 | 20 | |
| 16. 各種コード | 20 | |
| 17. 保険給付上の注意 | 20 | |
| XI. 文献 | | |
| 1. 引用文献 | 21 | |
| 2. その他の参考文献 | 21 | |
| XII. 参考資料 | | |
| 1. 主な外国での発売状況 | 22 | |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 22 | |
| XIII. 備考 | | |
| その他の関連資料 | 23 | |

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オロパタジン塩酸塩錠は、アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では2001年3月に上市されている。

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「ケミファ」・5mg「ケミファ」は、日本ケミファ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、2012年8月に承認を取得し、2012年12月に上市した。

2013年6月には、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「ケミファ」・5mg「ケミファ」が上市されている。

また、2014年12月に7歳以上の小児に対する効能又は効果、用法及び用量が追加された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 成人のアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、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）、小児のアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒の適応を有している。
- (2) 選択的ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用を主作用とし、抗アレルギー作用を発揮する。
- (3) 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（頻度不明）。

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 「ケミファ」

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」

(2) 洋名

Olopatadine

(3) 名称の由来

「有効成分」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」 より命名した。

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)

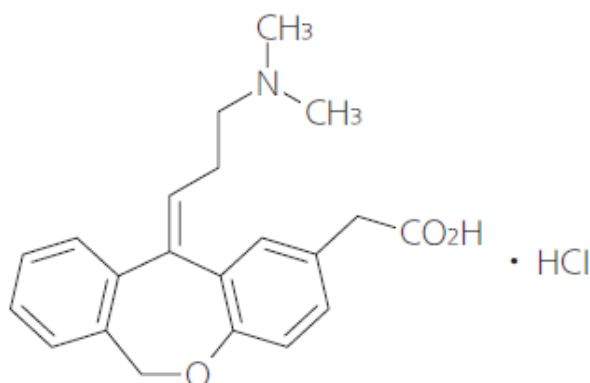
Olopatadine Hydrochloride (JAN、INN)

(3) ステム

-tadine : 三環系 H₁ 受容体拮抗薬

3. 構造式又は示性式

構造式 :



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₂₁H₂₃NO₃ · HCl

分子量 : 373.87

5. 化学名 (命名法)

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

7. CAS 登録番号

140462-76-6

113806-05-6 (フリー体)

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

(2) 溶解性

各種溶媒における溶解度

| 溶媒 | 日局の溶解度表記 |
|--------------|----------|
| ギ酸 | 極めて溶けやすい |
| 水 | やや溶けにくい |
| エタノール (99.5) | 極めて溶けにくい |

本品は 0.01mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 250℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数（室温）

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

pH：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

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」確認試験による

(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

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」定量法による

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」：淡黄赤色のフィルムコーティング錠

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」：淡黄赤色の割線入りのフィルムコーティング錠

| 販売名 | 表面 | 裏面 | 側面 | 色調 |
|--------------------------------|---|---|---|------|
| オロパタジン 塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」 |  |  |  | 淡黄赤色 |
| | 直径：6.6mm、厚さ：3.2mm、重量：103.0mg | | | |
| オロパタジン 塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」 |  |  |  | 淡黄赤色 |
| | 直径：7.1mm、厚さ：3.0mm、重量：124.0mg | | | |

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」：NC OLO

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」：NC OL5

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」：1錠中(日局)オロパタジン塩酸塩 2.5 mg

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

(2) 添加物

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、三酸化鉄、黄色三二酸化鉄

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に関する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾²⁾

(1) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」

| 試験名 | 保存条件 | 保存期間 | 保存形態 | 結果 |
|--------------|--|------|---------|-----------|
| 加速試験 | 40±1℃ 75±5%RH | 6ヵ月 | 最終包装製品 | 規格に適合 |
| 無包装 安定性試験 | 40±1℃ 75±5%RH | 3ヵ月 | 遮光・気密容器 | 規格に適合 |
| | 25±2℃ 75±5%RH | 3ヵ月 | 開放 | 変化あり（規格内） |
| | 曝光量 120万Lux・hr (25±2℃、 45±5%RH) | 20日 | 開放 | 変化あり（規格内） |

試験項目：[加速試験] 性状、確認試験、製剤均一性試験（含量均一性試験）、溶出試験、定量
[無包装安定性試験] 性状、定量試験、硬度、平衡相対湿度、溶出試験

(2) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」

| 試験名 | 保存条件 | 保存期間 | 保存形態 | 結果 |
|--------------|--|------|---------|-----------|
| 加速試験 | 40±1℃ 75±5%RH | 6ヵ月 | 最終包装製品 | 規格に適合 |
| 無包装 安定性試験 | 40±1℃ 75±5%RH | 3ヵ月 | 遮光・気密容器 | 規格に適合 |
| | 25±2℃ 75±5%RH | 3ヵ月 | 開放 | 変化あり（規格内） |
| | 曝光量 120万Lux・hr (25±2℃、 45±5%RH) | 20日 | 開放 | 変化あり（規格内） |

試験項目：[加速試験] 性状、確認試験、製剤均一性試験（含量均一性試験）、溶出試験、定量
[無包装安定性試験] 性状、定量試験、硬度、平衡相対湿度、溶出試験

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

7. 溶出性³⁾

(1) 溶出挙動における類似性

1) オロパタジン塩酸塩錠2.5mg 「ケミファ」

本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成13年5月31日付 医薬審第786号）に準拠。

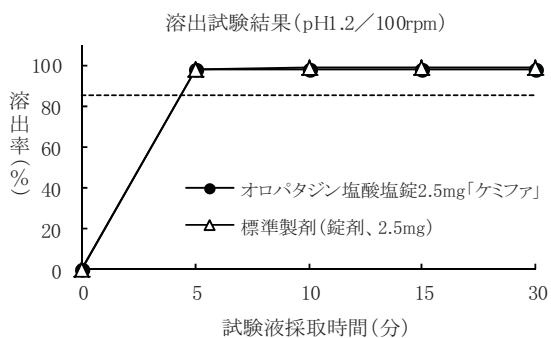
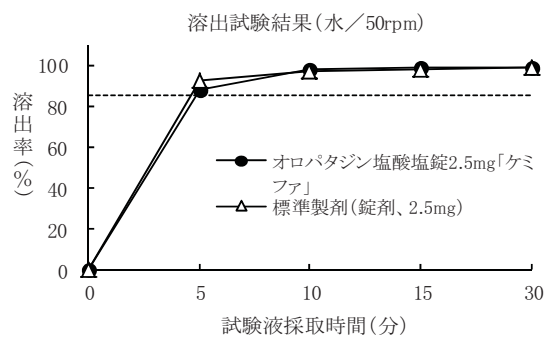
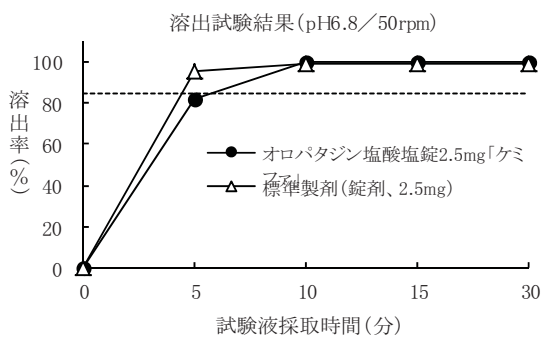
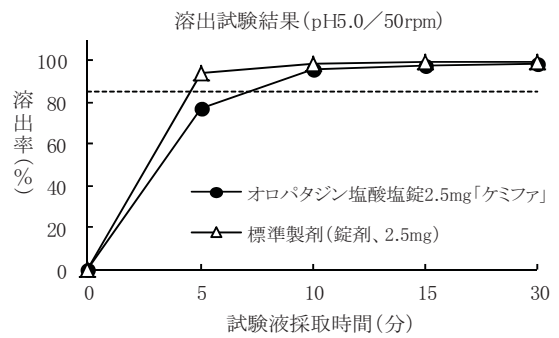
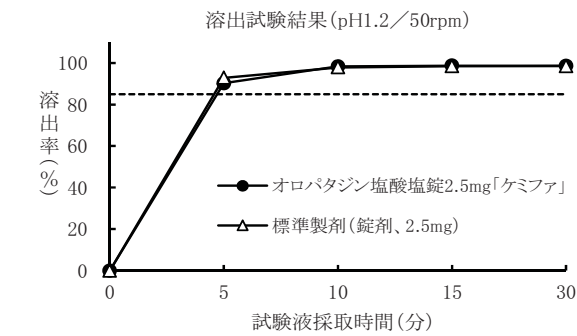
（方法） 日局溶出試験法 パドル法

試験条件： 回転数50rpm、100rpm

試験液： 50rpm pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
100rpm pH1.2

判定基準： 15分以内に平均85%以上を溶出する。

（結果） すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と同等性を有することが確認された。



2) オロパタジン塩酸塩錠5mg「ケミファ」

本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成13年5月31日付 医薬審第786号）に準拠。

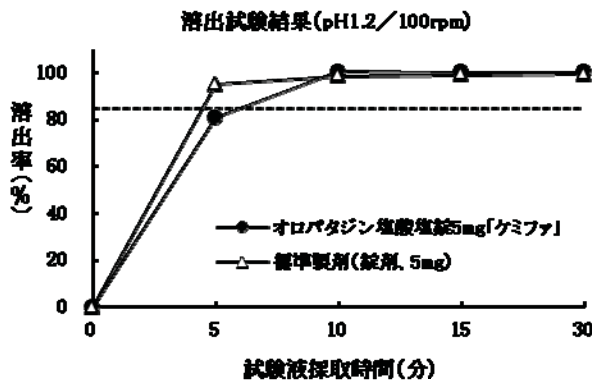
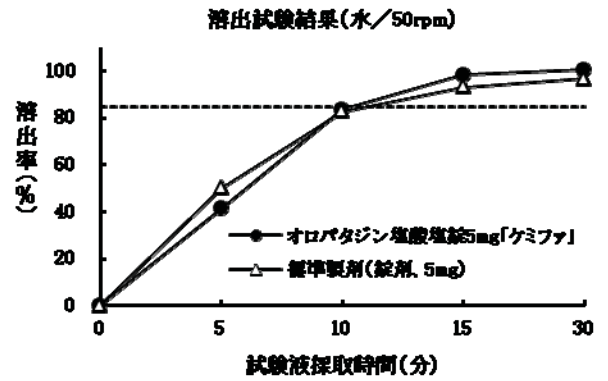
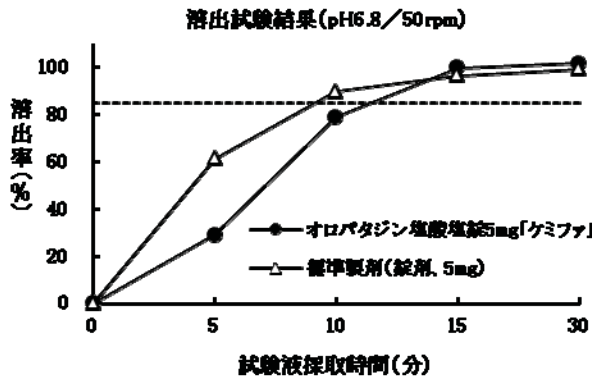
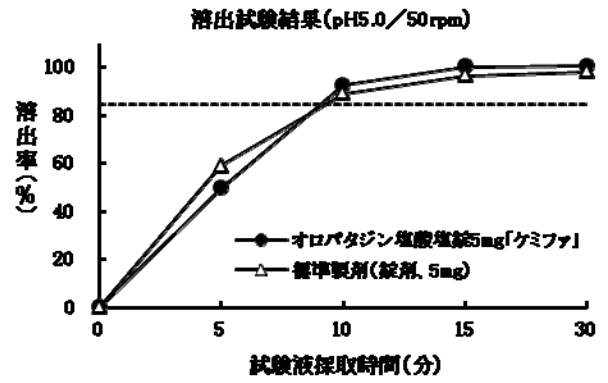
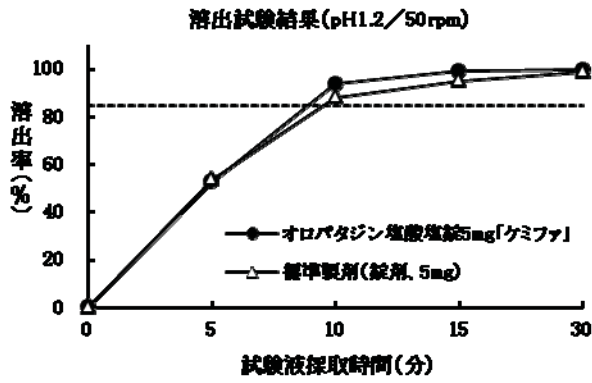
(方法) 日局溶出試験法 パドル法

試験条件：回転数50rpm、100rpm

試験液：50rpm pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
100rpm pH1.2

判定基準：15分以内に平均85%以上を溶出する。

(結果) すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と同等性を有することが確認された。



(2) 公的溶出規格への適合

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたオロパタジン塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

(方法) 溶出試験法 パドル法 (シンカー使用)

条件: 回転数 50rpm

試験液 水

(結果) 15 分間の溶出率が 85%以上

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩錠」確認試験による紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法
日本薬局方「オロパタジン塩酸塩錠」定量法による
液体クロマトグラフィー

11. 力価
該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物
該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報
該当しない

14. その他

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、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

2. 用法及び用量

成人：

通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mgを朝及び就寝前の1日2回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

小児：

通常、7歳以上の小児には1回オロパタジン塩酸塩として5mgを朝及び就寝前の1日2回経口与する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

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

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

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

オキサトミド、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン、レボセチリジン等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁴⁾

抗アレルギー薬。ヒスタミン H₁ 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・遊離抑制作用をあらわす。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間⁵⁾

「VII-1-(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁵⁾

生物学的同等性試験

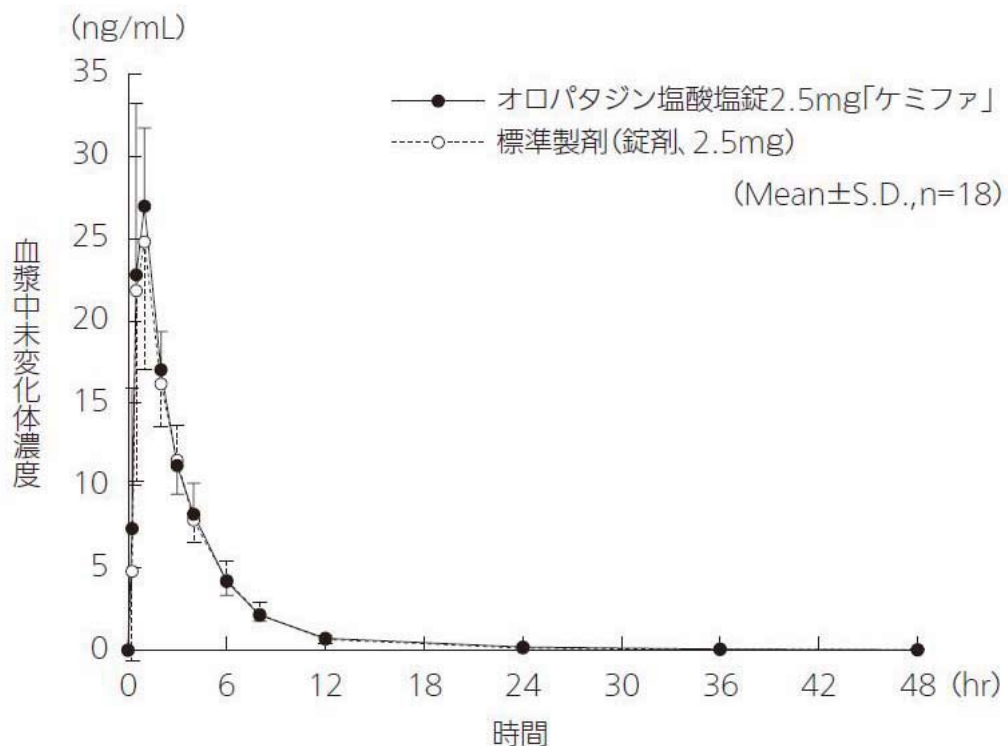
本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成18年11月24日付 医薬審発第1124004号）に準拠。

1) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（オロパタジン塩酸塩として 2.5mg）健康成人男子（n=18）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、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|----------------------------|-----------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
| | AUC _{0→48} (ng·hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | t _{1/2} (hr) |
| オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」 | 95.12±12.35 | 30.07±6.09 | 0.8±0.3 | 9.0±7.1 |
| 標準製剤 (錠剤、2.5mg) | 89.93±11.24 | 28.19±6.22 | 0.9±0.5 | 5.8±5.5 |

(Mean±S.D., n=18)



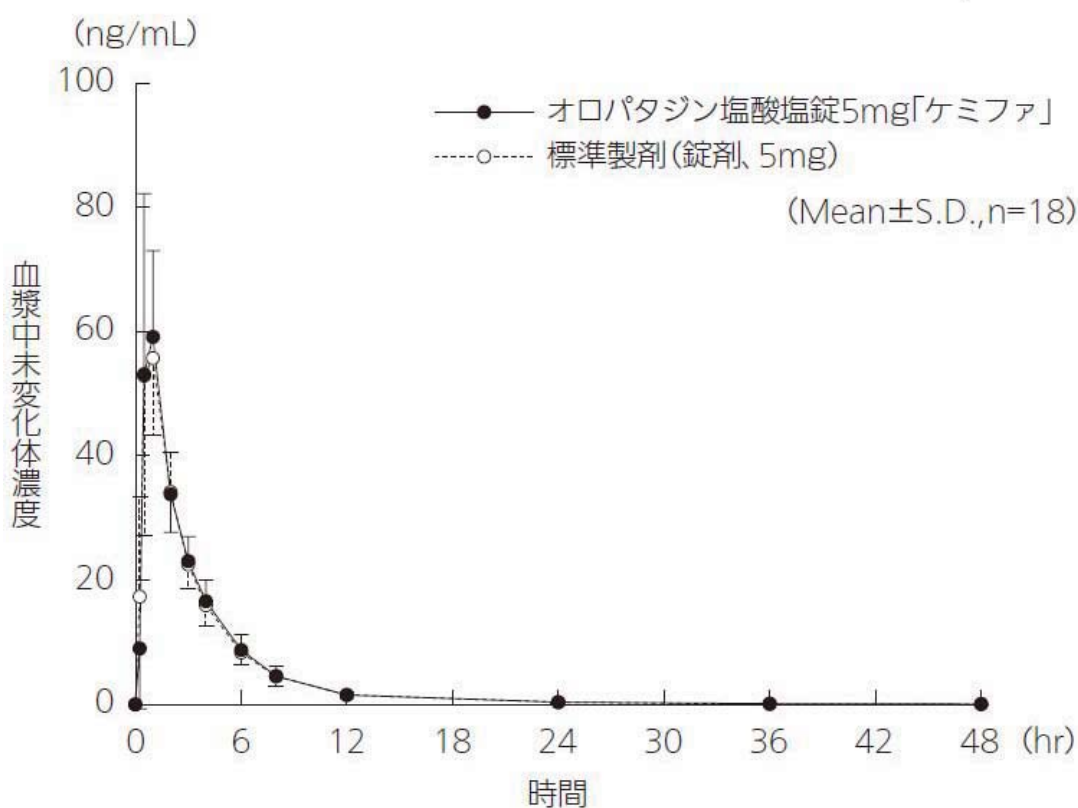
血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2) オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）健康成人男子（n=18）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、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|--------------------------|-----------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
| | AUC _{0→48} (ng·hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | t _{1/2} (hr) |
| オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」 | 197.35 ± 33.79 | 68.46 ± 22.55 | 0.8 ± 0.3 | 8.4 ± 6.1 |
| 標準製剤 (錠剤、5mg) | 194.36 ± 26.38 | 65.85 ± 18.04 | 0.8 ± 0.4 | 8.8 ± 9.3 |

(Mean ± S.D., n=18)



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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) コンパートメントモデル
該当資料なし
- (2) 吸収速度定数
該当資料なし
- (3) バイオアベイラビリティ
該当資料なし
- (4) 消失速度定数
該当資料なし
- (5) クリアランス
該当資料なし
- (6) 分布容積
該当資料なし
- (7) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

- (1) 血液－脳関門通過性
該当資料なし
- (2) 血液－胎盤関門通過性
該当資料なし
- (3) 乳汁への移行性
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。（「VIII-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
- (4) 髄液への移行性
該当資料なし
- (5) その他の組織への移行性
該当資料なし

5. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
該当資料なし
- (2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種
該当資料なし
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
該当資料なし
- (4) 代謝物の活性の有無及び比率
該当資料なし
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
該当資料なし

6. 排泄

- (1) 排泄部位及び経路
該当資料なし
- (2) 排泄率
該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

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

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。
- (2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (3) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
- (4) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

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

(3) その他の副作用

下記のような副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には減量・休薬等の適切な処置を行うこと。

| | 頻度不明 |
|-------------------|--|
| 過敏症 ^{注)} | 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、しびれ感、集中力低下、不随意運動(顔面・四肢等) |
| 消化器 | 腹部不快感、腹痛、下痢、嘔気、便秘、口内炎・口角炎・舌痛、胸やけ、食欲亢進、嘔吐 |
| 肝臓 | 肝機能異常 [AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTP、LDH、Al-P、総ビリルビン上昇] |
| 血液 | 白血球増多・減少、好酸球増多、リンパ球減少、血小板減少 |
| 腎臓・泌尿器 | 尿潜血、BUN上昇、尿蛋白陽性、血中クレアチニン上昇、排尿困難、頻尿 |
| 循環器 | 動悸、血圧上昇 |
| その他 | 血清コレステロール上昇、尿糖陽性、胸部不快感、味覚異常、体重増加、ほてり、月経異常、筋肉痛、関節痛 |

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「VIII-2.禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)」、「VIII-8-(3) その他の副作用の過敏症」の項参照。

9. 高齢者への投与

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

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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

11. 小児等への投与

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

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

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

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

(1) 薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。

[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

(2) 薬剤分割時

分割したときは遮光下に保存すること。

15. その他の注意

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

16. その他

該当しない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）
- (2) 副次的薬理試験
該当資料なし
- (3) 安全性薬理試験
該当資料なし
- (4) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験
該当資料なし
- (3) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
- (4) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤： 規制区分なし
有効成分： 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限： 3 年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

密閉容器（室温保存）

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII-6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法の(1)、(4)」、「VIII-14.適用上の注意」の項参照。

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「ケミファ」 : 100 錠（10 錠×10）
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「ケミファ」 : 100 錠（10 錠×10）、140 錠（14 錠×10）、
500 錠（10 錠×50）

7. 容器の材質

PTP：ポリプロピレン、アルミニウム箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「ケミファ」、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%、パタノール点眼液 0.1%

同 効 薬：オキサトミド、エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、ベポスチンベシル酸塩、ロラタジン、レボセチリジン等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤

9. 国際誕生年月日

1996 年 12 月 18 日（米国での点眼剤としての承認年月日）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

| 販売名 | 製造販売承認年月日 | 承認番号 |
|------------------------|-----------------|------------------|
| オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「ケミファ」 | 2012 年 8 月 15 日 | 22400AMX00954000 |
| オロパタジン塩酸塩錠 5mg「ケミファ」 | 2012 年 8 月 15 日 | 22400AMX00955000 |

11. 薬価基準収載年月日

2012年12月14日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

[効能又は効果、用法及び用量]の追加

2014年12月17日

効能又は効果

小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒
用法及び用量

小児：通常、7歳以上の小児には1回オロパタジン塩酸塩として5mgを朝及び就寝前の1日2回経口投与する。

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

| 販売名 | HOT（9桁）番号 | 厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード | レセプト電算コード |
|--------------------------------|-----------|-----------------------|-----------|
| オロパタジン 塩酸塩錠 2.5mg 「ケミファ」 | 122092602 | 4490025F1163 | 622209201 |
| オロパタジン 塩酸塩錠 5mg 「ケミファ」 | 122093302 | 4490025F2160 | 622209301 |

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 日本ケミファ株式会社：安定性に関する資料（社内資料）
- 2) 日本ケミファ株式会社：無包装状態における安定性に関する資料（社内資料）
- 3) 日本ケミファ株式会社：溶出に関する資料(社内資料)
- 4) 第十六改正日本薬局方第二追補解説書 C-53, 廣川書店, 東京, 2014
- 5) 日本ケミファ株式会社：生物学的同等性に関する資料（社内資料）

2. その他の参考文献

第16改正 日本薬局方 第二追補

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

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
該当しない
2. 海外における臨床支援情報
該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料