

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤

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「EE」**オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」****Olopatadine Hydrochloride tab. 2.5mg / 5mg「EE」**

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	錠 2.5mg 1錠中 オロパタジン塩酸塩 2.5mg 含有
	錠 5mg 1錠中 オロパタジン塩酸塩 5mg 含有
一般名	和名：オロパタジン塩酸塩（JAN） 洋名：Olopatadine Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日：2012年8月15日
薬価基準収載 ・発売年月日	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：エルメッド株式会社 販売元：日医工株式会社
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 TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ http://www.nichiiko.co.jp/

本IFは2019年4月改訂（第7版）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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）^{注1）} から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

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

ただし、薬事法^{注2）}・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

【IF の様式】

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

【IF の作成】

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

〔IF の発行〕

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページ^{注1)}に掲載場所が設定されている。

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

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

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法^{注2)}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、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法^{注2)}上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

注 1) 現 (独) 医薬品医療機器総合機構ホームページ (<http://www.pmda.go.jp/>)

注 2) 現 医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律

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
(1) 和名	2
(2) 洋名	2
(3) 名称の由来	2
2. 一般名	2
(1) 和名 (命名法)	2
(2) 洋名 (命名法)	2
(3) ステム (stem)	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
(1) 外観・性状	3
(2) 溶解性	3
(3) 吸湿性	3
(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点	3
(5) 酸塩基解離定数	3
(6) 分配係数	3
(7) その他の主な示性値	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
(1) 剤形の区別、外観及び性状	4
(2) 製剤の物性	4
(3) 識別コード	4
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨 及び安定な pH 域等	4
2. 製剤の組成	4
(1) 有効成分 (活性成分) の含量	4
(2) 添加物	4
(3) その他	4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	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	7
6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)	7
7. 溶出性	7
(1) 公的溶出規格への適合性	7
(2) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」と 標準製剤の溶出挙動	7
(3) オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」と 標準製剤の溶出挙動	9
8. 生物学的試験法	10
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	10
10. 製剤中の有効成分の定量法	10
11. 力価	11
12. 混入する可能性のある夾雑物	11
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する 情報	11
14. その他	11
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	12
2. 用法及び用量	12
3. 臨床成績	12
(1) 臨床データパッケージ	12
(2) 臨床効果	12
(3) 臨床薬理試験	12
(4) 探索的試験	12
(5) 検証的試験	12
(6) 治療の使用	12
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	13
2. 薬理作用	13
(1) 作用部位・作用機序	13
(2) 薬効を裏付ける試験成績	13
(3) 作用発現時間・持続時間	13
VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	14
(1) 治療上有効な血中濃度	14
(2) 最高血中濃度到達時間	14
(3) 臨床試験で確認された血中濃度	14
(4) 中毒域	14
(5) 食事・併用薬の影響	14
(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	14
2. 薬物速度論的パラメータ	14
(1) 解析方法	14
(2) 吸収速度定数	14
(3) バイオアベイラビリティ	15
(4) 消失速度定数	15
(5) クリアランス	15
(6) 分布容積	15
(7) 血漿蛋白結合率	15
3. 吸収	15
4. 分布	15

(1) 血液－脳関門通過性	15	(3) 安全性薬理試験	20
(2) 血液－胎盤関門通過性	15	(4) その他の薬理試験	20
(3) 乳汁への移行性	15	2. 毒性試験	20
(4) 髄液への移行性	15	(1) 単回投与毒性試験	20
(5) その他の組織への移行性	15	(2) 反復投与毒性試験	20
5. 代謝	15	(3) 生殖発生毒性試験	20
(1) 代謝部位及び代謝経路	15	(4) その他の特殊毒性	20
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種	15	X. 管理的事項に関する項目	
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	15	1. 規制区分	21
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	15	2. 有効期間又は使用期限	21
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	16	3. 貯法・保存条件	21
6. 排泄	16	4. 薬剤取扱い上の注意点	21
(1) 排泄部位及び経路	16	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	21
(2) 排泄率	16	(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）	21
(3) 排泄速度	16	(3) 調剤時の留意点について	21
7. トランスポーターに関する情報	16	5. 承認条件等	21
8. 透析等による除去率	16	6. 包装	21
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目		7. 容器の材質	21
1. 警告内容とその理由	17	8. 同一成分・同効薬	22
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17	9. 国際誕生年月日	22
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	17	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	22
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17	11. 薬価基準収載年月日	22
5. 慎重投与内容とその理由	17	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	22
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	22
7. 相互作用	17	14. 再審査期間	22
(1) 併用禁忌とその理由	17	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	22
(2) 併用注意とその理由	17	16. 各種コード	23
8. 副作用	17	17. 保険給付上の注意	23
(1) 副作用の概要	17	XI. 文献	
(2) 重大な副作用と初期症状	18	1. 引用文献	24
(3) その他の副作用	18	2. その他の参考文献	24
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	18	XII. 参考資料	
(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	18	1. 主な外国での発売状況	25
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	18	2. 海外における臨床支援情報	25
9. 高齢者への投与	18	XIII. 備考	
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19	その他の関連資料	26
11. 小児等への投与	19		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19		
13. 過量投与	19		
14. 適用上の注意	19		
15. その他の注意	19		
16. その他	19		
IX. 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	20		
(1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）	20		
(2) 副次的薬理試験	20		

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、アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では2001年に上市された。

エルメッド エーザイ株式会社は、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」を後発医薬品として、薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験及び生物学的同等性試験を実施し、2012年8月に承認を得て、2012年12月に発売に至った。

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」及び「用法・用量」の一部変更承認を取得した。

2019年4月1日にエルメッド エーザイ株式会社からエルメッド株式会社に社名変更され、日医工株式会社が販売することとなった。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 治療学的特性

オロパタジン塩酸塩は抗アレルギー薬である。ヒスタミン 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・遊離抑制作用を現す。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する。 (1)

(2) 製剤学的特性

2.5mg 錠、5mg 錠ともに淡黄赤色のフィルムコーティング錠で、5mg 錠は割線を有する。錠剤表面に成分名及び含量を印字している。

(3) 重大な副作用

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「EE」

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」

(2) 洋名

Olopatadine Hydrochloride tab. 2.5mg「EE」

Olopatadine Hydrochloride tab. 5mg「EE」

(3) 名称の由来

成分名を名称の一部とした。

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）

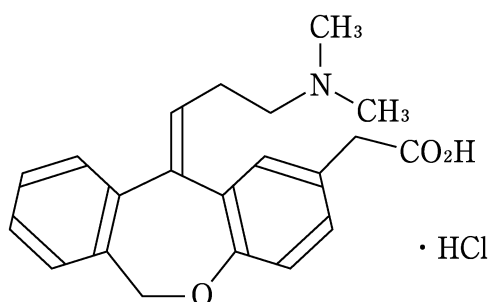
Olopatadine Hydrochloride（JAN）

olopatadine（INN）

(3) ステム（stem）

三環系 H₁ 受容体拮抗薬：-tadine

3. 構造式又は示性式



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-[(1*Z*)-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

なし

7. CAS 登録番号

オロパタジン塩酸塩：140462-76-6

オロパタジン：113806-05-6

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

各種溶媒に対する溶解性

溶 媒	日本薬局方の溶解度表記
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

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

約 250℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

本品は 0.01mol/mL 塩酸試液に溶ける。

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の確認試験による。

(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の定量法による。

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	性状・剤形	外形		
		表	裏	側面
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」	淡黄赤色のフィルム コーティング錠			
		直径 (mm)・質量 (mg)・厚さ (mm) 6.1 80 2.9		
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」	淡黄赤色の割線入りの フィルムコーティング錠			
		直径 (mm)・質量 (mg)・厚さ (mm) 7.1 120 2.9		

(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「EE」 : オロパタジン 2.5/EE

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」 : オロパタジン 5/EE

(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「EE」 : 1錠中にオロパタジン塩酸塩として 2.5mg を含有する

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」 : 1錠中にオロパタジン塩酸塩として 5mg を含有する

(2) 添加物

黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ、結晶セルロース、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸マグネシウム、タルク、デンプングリコール酸ナトリウム、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール 6000

(3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

IV. 製剤に関する項目

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃・75%RH、6 ヶ月）の結果、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

苛酷試験（熱（40℃）、光（3000lx）、湿度（25℃・75%RH））の結果、すべての項目は規格値内であった。 (2)

試験方法	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	試験結果		
					試験開始時	試験終了時	
加速試験	40℃・75%RH	PTP 包装品 (PTP シート入れた状態)	6 ヶ月	性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	
				確認試験 (極大吸収波長：nm)	297	297	
				純度試験 (類縁物質*：%)	① LOQ ② LOQ	① 0.09 ② 0.33~0.36	
				製剤均一性	適合	適合	
				溶出性 (%)	95.1~104.1	96.7~102.5	
				含量 (%)	98.9~100.4	98.3~ 99.1	
苛酷試験	熱に対する安定性	褐色ガラス瓶に入れ、蓋をした状態	3 ヶ月	性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	
				純度試験 (類縁物質*：%)	① LOQ ② LOQ	① LOQ ② LOQ	
				溶出性 (%)	98.6	99.5	
				含量 (残存率：%)	100.0	100.1	
				硬度 (kgf)	7.5	7.1	
	光に対する安定性	3000lx (120 万 lx・hr)	シャーレに入れ開放状態	400 時間	性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠
					純度試験 (類縁物質*：%)	① LOQ ② LOQ	① LOQ ② LOQ
					溶出性 (%)	98.6	100.0
					含量 (残存率：%)	100.0	99.6
					硬度 (kgf)	7.5	6.2
	湿度に対する安定性	25℃・75%RH	褐色ガラス瓶に入れ、蓋を開けた状態	3 ヶ月	性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠
					純度試験 (類縁物質*：%)	① LOQ ② LOQ	① LOQ ② LOQ
溶出性 (%)					98.6	99.6	
含量 (残存率：%)					100.0	99.6	
硬度 (kgf)					7.5	6.1	

* ① 個々の類縁物質の最大値 ② 総類縁物質 LOQ：定量限界 (0.05%) 未満

IV. 製剤に関する項目

(2) オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃・75%RH、6ヵ月）の結果、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

苛酷試験（熱（40℃）、光（3000lx）、湿度（25℃・75%RH））の結果、すべての項目は規格値内であった。 (2)

試験方法	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	試験結果						
					試験開始時	試験終了時					
加速試験	40℃・75%RH	PTP包装品 (PTPシート入れた状態)	6ヵ月	性状	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠					
				確認試験 (極大吸収波長: nm)	297	297					
				純度試験 (類縁物質*: %)	① LOQ ② LOQ	① 0.07~0.08 ② 0.22~0.29					
				製剤均一性	適合	適合					
				溶出性 (%)	94.2~102.6	95.4~102.1					
				含量 (%)	98.6~99.8	98.5~99.8					
				性状	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠					
		バラ包装品 (ポリエチレン容器に入れた状態)	6ヵ月	確認試験 (極大吸収波長: nm)	297	297					
				純度試験 (類縁物質*: %)	① LOQ ② LOQ	① 0.06~0.07 ② 0.11~0.23					
				製剤均一性	適合	適合					
				溶出性 (%)	94.2~102.6	90.2~101.9					
				含量 (%)	98.6~99.8	98.5~99.6					
				苛酷試験	熱に対する安定性	40℃	褐色ガラス瓶に入れ、蓋をした状態	3ヵ月	性状	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠
									純度試験 (類縁物質*: %)	① LOQ ② LOQ	① LOQ ② LOQ
溶出性 (%)	98.6	100.0									
含量 (残存率: %)	100.0	98.8									
光に対する安定性	3000lx (120万lx・hr)	シャーレに入れ開放状態	400時間		性状	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠				
					純度試験 (類縁物質*: %)	① LOQ ② LOQ	① LOQ ② LOQ				
					溶出性 (%)	98.6	98.6				
湿度に対する安定性	25℃・75%RH	褐色ガラス瓶に入れ、蓋を開けた状態	3ヵ月	性状	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠	割線入りの淡黄赤色のフィルムコーティング錠					
				純度試験 (類縁物質*: %)	① LOQ ② LOQ	① LOQ ② LOQ					
				溶出性 (%)	98.6	100.7					
				含量 (残存率: %)	100.0	98.9					
硬度 (kgf)	10.3	6.6									

* ① 個々の類縁物質の最大値 ② 総類縁物質 LOQ: 定量限界 (0.05%) 未満

IV. 製剤に関する項目

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性

(1) 公的溶出規格への適合性

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」は、日本薬局方オロパタジン塩酸塩錠に従い試験するとき、15 分間の溶出率が 85%以上であった（回転数：50rpm、試験液：水）。

(2) オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」と標準製剤（オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」）の溶出挙動 (3)

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 日付薬食審査発第 1124004 号 別紙 2）に従って実施した。

1) 試験方法

日本薬局方（JP15）一般試験法 溶出試験法第 2 法

2) 試験条件

- ・試験回数：12 ベッセル
- ・装置：パドル法
- ・試験液量：900mL
- ・試験液温度：37±0.5℃
- ・試験液：pH1.2 日本薬局方 溶出試験第 1 液
pH3.0 薄めた McIlvaine の緩衝液
pH6.8 日本薬局方 溶出試験第 2 液
水 日本薬局方 精製水
- ・回転数及び判定時点

50rpm	pH1.2	15 分
	pH3.0	15 分
	pH6.8	15 分
	水	15 分
100rpm	pH6.8	15 分

3) 判定基準

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

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

試験製剤の個々の溶出率は、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。

IV. 製剤に関する項目

4) 結果

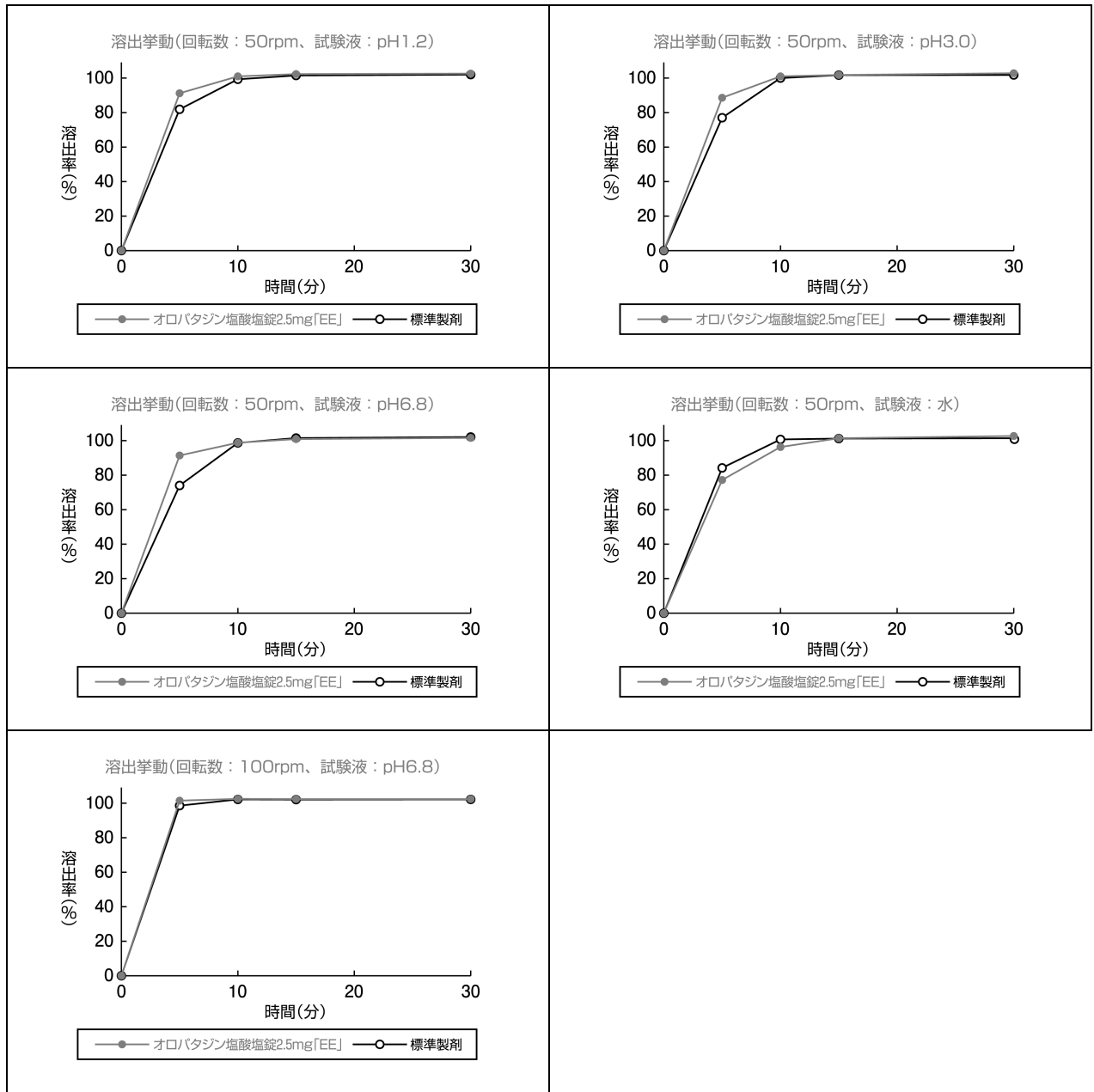


表 オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」の溶出挙動における同等性 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

方法	試験条件			平均溶出率 (%)		判定
	回転数	試験液	溶出時間 (判定時点)	試験製剤	標準製剤	
溶出試験法 (パドル法)	50rpm	pH1.2	15分	102.3	101.5	適合
		pH3.0	15分	102.6	101.7	適合
		pH6.8	15分	100.9	101.5	適合
		水	15分	101.4	101.2	適合
	100rpm	pH6.8	15分	102.4	102.1	適合

以上より、試験製剤と標準製剤の溶出挙動は同等と判定され、生物学的に同等であると判断された。

IV. 製剤に関する項目

- (3) オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」と標準製剤の溶出挙動 (2)
 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 日付薬食審査発第 1124004 号 別紙 1）に従って実施した。

1) 試験方法

日本薬局方（JP15）一般試験法 溶出試験法第 2 法

2) 試験条件

- ・試験回数：12 ベッセル
- ・装置：パドル法
- ・試験液量：900mL
- ・試験液温度：37±0.5℃
- ・試験液：pH1.2 日本薬局方 溶出試験第 1 液
 pH3.0 薄めた McIlvaine の緩衝液
 pH6.8 日本薬局方 溶出試験第 2 液
 水 日本薬局方 精製水
- ・回転数及び判定時点

50rpm	pH1.2	15 分
	pH3.0	15 分
	pH6.8	15 分
	水	15 分
100rpm	pH6.8	15 分

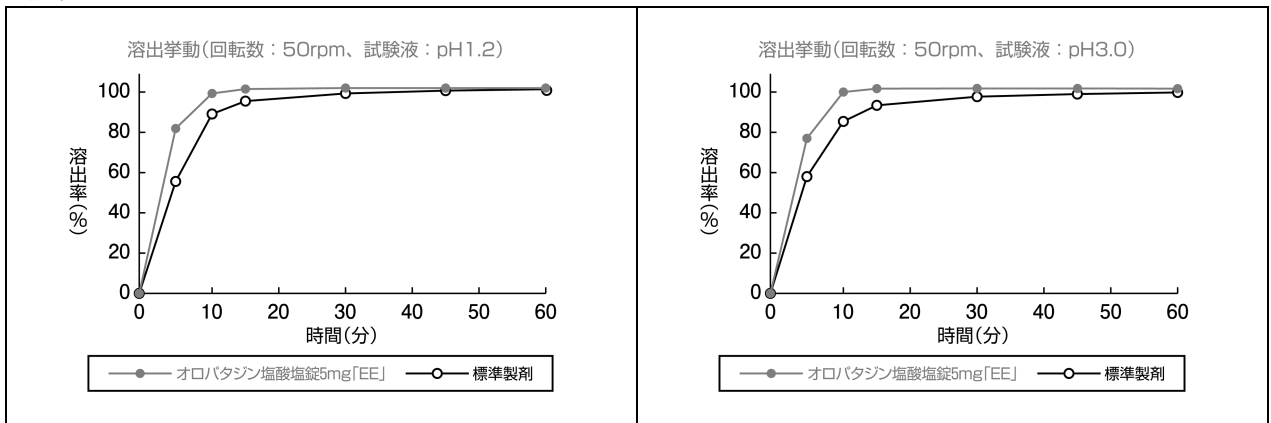
3) 判定基準

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合

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

試験製剤の個々の溶出率は、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。

4) 結果



IV. 製剤に関する項目

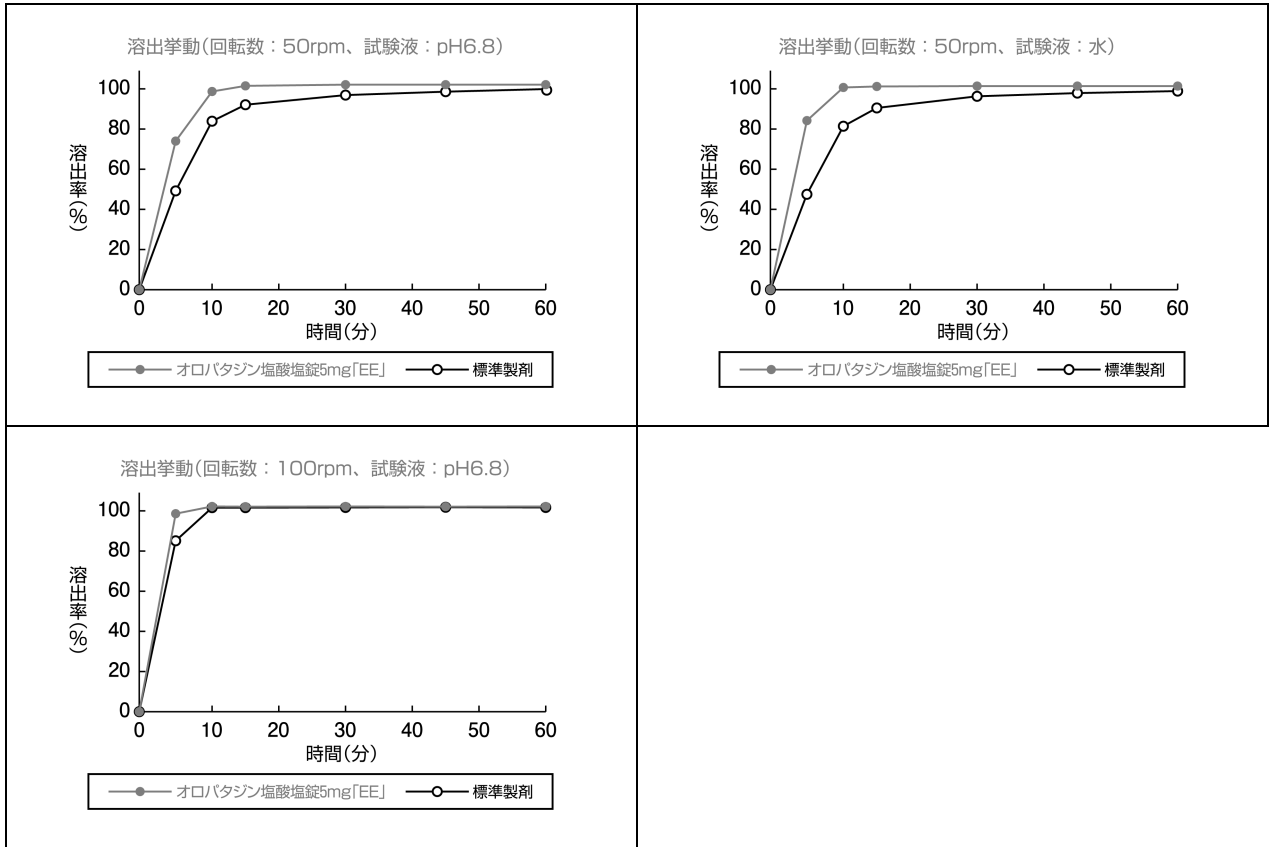


表 オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」の溶出挙動における類似性 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				平均溶出率 (%)		判定
方法	回転数	試験液	溶出時間 (判定時点)	試験製剤	標準製剤	
溶出試験法 (パドル法)	50rpm	pH1.2	15分	101.5	95.5	適合
		pH3.0	15分	101.7	93.4	適合
		pH6.8	15分	101.5	92.1	適合
		水	15分	101.2	90.5	適合
	100rpm	pH6.8	15分	102.1	101.6	適合

以上より、試験製剤と標準製剤の溶出挙動が類似していることが確認された。

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方 オロパタジン塩酸塩錠の確認試験による。
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の定量法による。
液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

11. カ価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

分解物：カルバルデヒド体、ジエン体

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

成人：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑）

小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚瘙癢症）に伴う瘙痒

2. 用法及び用量

成人：通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5 mg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5 mgを朝及び就寝前の1日2回経口投与する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

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

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤（オキサトミド、エバスタチン、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）

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

オロパタジン塩酸塩は抗アレルギー薬である。ヒスタミン 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・遊離抑制作用を現す。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する。 (1)

(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

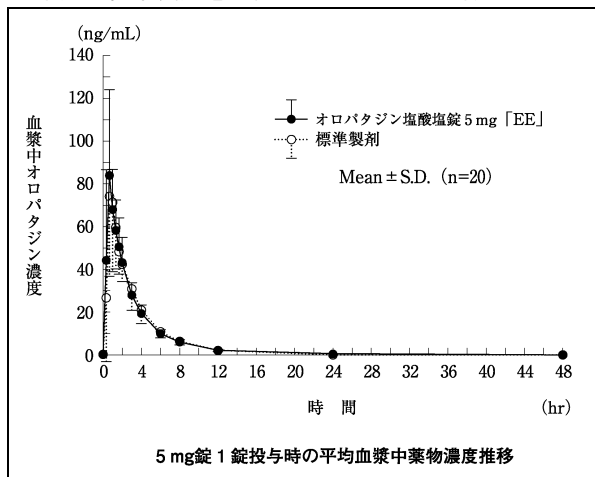
(3)

販売名	対象	投与量	投与方法	最高血漿中濃度到達時間
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」	健康成人男性 20名	1錠 (オロパタジン塩酸塩として 5mg)	絶食下单回経口投与	0.33~1.67時間

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

「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 日付薬食審査発第 1124004 号 別紙 1)」に従って、健康成人男性 20 名にクロスオーバー法にて本剤と標準製剤 (同一成分含有錠剤) を 1 錠 (オロパタジン塩酸塩として 5mg) 絶食下单回経口投与した。その結果、生物学的同等性の判定パラメータである AUC_{0-48hr} 及び C_{max} の対数値の平均値の差の 90% 信頼区間は、いずれも「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の基準である $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲にあり、両製剤は生物学的に同等と判断された。(3)

●本剤と標準製剤を 1 錠 (オロパタジン塩酸塩として 5mg) 投与時の平均血漿中濃度推移



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-48hr} (ng · hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
本 剤	236.37 ± 35.60	100.37 ± 21.02	0.8 ± 0.3	2.5 ± 0.6
標準製剤	236.38 ± 29.61	93.83 ± 28.76	1.1 ± 0.9	2.3 ± 0.3

(Mean ± S.D., n=20)

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

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

- (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
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」 : 0.2837hr^{-1}
- (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
＜参考＞
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

VII. 薬物動態に関する項目

- (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. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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）

次の患者には投与しないこと
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
(1) 腎機能低下患者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。〕
(2) 高齢者〔「VIII.-9. 高齢者への投与」の項参照〕
(3) 肝機能障害のある患者〔肝機能障害が悪化するおそれがある。〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当資料なし

(2) 併用注意とその理由

該当資料なし

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

劇症肝炎、肝機能障害、黄疸 劇症肝炎、AST (GOT)、ALT (GPT)、 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）、痒痒、呼吸困難
精神神経系	不随意運動（顔面・四肢等）、眠気、倦怠感、口渇、頭痛・頭重感、めまい、しびれ感、集中力低下
消化器	嘔吐、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
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	月経異常、筋肉痛、関節痛、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

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	紅斑等の発疹、浮腫（顔面・四肢等）、痒痒、呼吸困難

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

9. 高齢者への投与

高齢者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。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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

11. 小児等への投与

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

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

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

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

- (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

特になし

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）
該当資料なし
- (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：該当しない
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年間（安定性試験結果に基づく。「IV.-4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

くすりのしおり：有り

「VIII.-6. 重要な基本的注意」の項（1）及び「VIII.-14. 適用上の注意」の項参照

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

なし

6. 包装

販 売 名	PTP 包装	バラ包装
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」	100 錠	
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」	100 錠、140 錠、500 錠	500 錠

7. 容器の材質

(1) PTP 包装

PTP シート	バンディング	箱
ポリプロピレン アルミニウム	ポリプロピレン	紙

(2) バラ包装

ボトル	キャップ	詰め物	箱
ポリエチレン	ポリプロピレン	ポリエチレン	紙

X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アレロック（協和発酵キリン）

同効薬：[オキサトミド製剤]

[エバスチン製剤]

[アゼラスチン塩酸塩製剤]

[エピナスチン塩酸塩製剤]

[フェキソフェナジン塩酸塩製剤]

[ケトチフェンフマル酸塩製剤]

[セチリジン塩酸塩製剤]

[ベポタスチンベシル酸塩製剤]

[ロラタジン製剤]

[レボセチリジン製剤]

セルテクト（協和発酵キリン）

オキサトミド錠「EMEC」（サンノーバ＝エルメッド エーザイ）

エバステル（大日本住友＝MeijiSeika ファルマ）

アゼプチン（エーザイ）

アレジオン（日本ベーリンガー）

アレグラ（サノフィ）

フェキソフェナジン塩酸塩錠／OD錠「EE」（エルメッド エーザイ）

ザジテン（ノバルティス）

フマル酸ケトチフェン錠「EMEC」（サンノーバ＝エルメッド エーザイ）

ジルテック（UCB＝GSK＝第一三共）

タリオン（田辺三菱）

クラリチン（バイエル＝塩野義）

ロラタジン錠／OD錠「EE」（エルメッド エーザイ）

ザイザル（GSK）

9. 国際誕生年月日

該当しない

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「EE」	2012年8月15日	22400AMX00978000
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」	2012年8月15日	22400AMX00979000

11. 薬価基準収載年月日

2012年12月14日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

2014年11月20日 【効能・効果】小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚瘙癢症）に伴う瘙癢
【用法・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. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

X. 管理的事項に関する項目

16. 各種コード

販売名	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	HOT(9桁)番号
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「EE」	4490025F1058	622192401	121924102
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「EE」	4490025F2054	622192501	121925802

17. 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 第十七改正日本薬局方解説書（廣川書店） C-1207（2016）
- ② 安定性に関する資料（エルメッド株式会社 社内資料）
- ③ 生物学的同等性に関する資料（エルメッド株式会社 社内資料）

2. その他の参考文献

なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

本剤は外国で発売されていない（オロパタジン塩酸塩製剤としては、海外で販売されている）。

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XII. 備考

その他の関連資料

なし