

# 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「JG」**

**オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」**

Olopatadine Hydrochloride Tablets

剤形	錠剤（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 5.0mg 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 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：日本ジェネリック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 受付時間：9時～18時（土、日、祝日を除く） TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172 医療関係者向けホームページ： <a href="http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html">http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html</a>

本 IF は 2016 年 11 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、(独)医薬品医療機器総合機構(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

# IF 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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

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

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

更に 10 年が経過し、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。この変更に合わせて、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(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>) 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 PMDA 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・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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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 PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」で確認する。

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

### 4. 利用に際しての留意点

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

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

(2013 年 4 月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	11. 力価	12
1. 開発の経緯	1	12. 混入する可能性のある夾雑物	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	13
II. 名称に関する項目	2	14. その他	13
1. 販売名	2	V. 治療に関する項目	14
(1)和名	2	1. 効能又は効果	14
(2)洋名	2	2. 用法及び用量	14
(3)名称の由来	2	3. 臨床成績	14
2. 一般名	2	(1)臨床データパッケージ	14
(1)和名(命名法)	2	(2)臨床効果	14
(2)洋名(命名法)	2	(3)臨床薬理試験	14
(3)ステム	2	(4)探索的試験	14
3. 構造式又は示性式	2	(5)検証的試験	14
4. 分子式及び分子量	2	1)無作為化並行用量反応試験	14
5. 化学名(命名法)	2	2)比較試験	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	3)安全性試験	14
7. CAS登録番号	3	4)患者・病態別試験	14
III. 有効成分に関する項目	4	(6)治療の使用	14
1. 物理化学的性質	4	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)	14
(1)外観・性状	4	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	14
(2)溶解性	4	VI. 薬効薬理に関する項目	15
(3)吸湿性	4	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	4	2. 薬理作用	15
(5)酸塩基解離定数	4	(1)作用部位・作用機序	15
(6)分配係数	4	(2)薬効を裏付ける試験成績	15
(7)その他の主な示性値	4	(3)作用発現時間・持続時間	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	VII. 薬物動態に関する項目	16
3. 有効成分の確認試験法	4	1. 血中濃度の推移・測定法	16
4. 有効成分の定量法	4	(1)治療上有効な血中濃度	16
IV. 製剤に関する項目	5	(2)最高血中濃度到達時間	16
1. 剤形	5	(3)臨床試験で確認された血中濃度	16
(1)剤形の区別、外観及び性状	5	(4)中毒域	17
(2)製剤の物性	5	(5)食事・併用薬の影響	17
(3)識別コード	5	(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	17
(4)pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	5	2. 薬物速度論的パラメータ	17
2. 製剤の組成	5	(1)解析方法	17
(1)有効成分(活性成分)の含量	5	(2)吸収速度定数	17
(2)添加物	5	(3)バイオアベイラビリティ	17
(3)その他	5	(4)消失速度定数	17
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	(5)クリアランス	17
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	(6)分布容積	17
5. 調製法及び溶解後の安定性	8	(7)血漿蛋白結合率	17
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	8	3. 吸収	18
7. 溶出性	8		
8. 生物学的試験法	12		
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12		
10. 製剤中の有効成分の定量法	12		

4. 分布	18	IX. 非臨床試験に関する項目	22
(1)血液-脳関門通過性	18	1. 薬理試験	22
(2)血液-胎盤関門通過性	18	(1)薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)	22
(3)乳汁への移行性	18	(2)副次的薬理試験	22
(4)髄液への移行性	18	(3)安全性薬理試験	22
(5)その他の組織への移行性	18	(4)その他の薬理試験	22
5. 代謝	18	2. 毒性試験	22
(1)代謝部位及び代謝経路	18	(1)単回投与毒性試験	22
(2)代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種	18	(2)反復投与毒性試験	22
(3)初回通過効果の有無及びその割合	18	(3)生殖発生毒性試験	22
(4)代謝物の活性の有無及び比率	18	(4)その他の特殊毒性	22
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	18	X. 管理的事項に関する項目	23
6. 排泄	18	1. 規制区分	23
(1)排泄部位及び経路	18	2. 有効期間又は使用期限	23
(2)排泄率	18	3. 貯法・保存条件	23
(3)排泄速度	18	4. 薬剤取扱い上の注意点	23
7. トランスポーターに関する情報	18	(1)薬局での取扱い上の留意点について	23
8. 透析等による除去率	18	(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)	23
		(3)調剤時の留意点について	23
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	19	5. 承認条件等	23
1. 警告内容とその理由	19	6. 包装	23
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	19	7. 容器の材質	23
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	19	8. 同一成分・同効薬	24
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	19	9. 国際誕生年月日	24
5. 慎重投与内容とその理由	19	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	24
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	19	11. 薬価基準収載年月日	24
7. 相互作用	19	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	24
(1)併用禁忌とその理由	19	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	24
(2)併用注意とその理由	19	14. 再審査期間	24
8. 副作用	20	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	24
(1)副作用の概要	20	16. 各種コード	24
(2)重大な副作用と初期症状	20	17. 保険給付上の注意	24
(3)その他の副作用	20	XI. 文献	25
(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	20	1. 引用文献	25
(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	20	2. その他の参考文献	25
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法	20	XII. 参考資料	26
9. 高齢者への投与	20	1. 主な外国での発売状況	26
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	21	2. 海外における臨床支援情報	26
11. 小児等への投与	21	XIII. 備考	27
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	21	その他の関連資料	27
13. 過量投与	21		
14. 適用上の注意	21		
15. その他の注意	21		
16. その他	21		

# 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 2.5mg「JG」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」は、オロパタジン塩酸塩を含有するアレルギー性疾患治療剤である。

アレルギー症の抑制作用を持つ第二世代抗ヒスタミン薬の一つで、ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗を主作用とし、肥満細胞からのケミカルメディエーターの遊離抑制作用を併せ持ち、国内で開発されたアレルギー性疾患治療薬である。<sup>1)</sup> 本邦では、2001年に発売されている。

本剤は日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成17年3月31日 薬食発第0331015号）」に基づき、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月に製造販売承認を得て、2012年12月に販売開始した。

2015年1月には、小児に対する「アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症）に伴う掻痒」に対する効能・効果及び用法・用量が追加された。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 5mg錠は、分割性を考慮した片面割線入りのフィルムコーティング錠である。

(2) 対症療法のためアレルギー自体を完治することは不可能で、劇症肝炎発生の恐れもある。<sup>1)</sup>

(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（全て頻度不明）。

## 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 「JG」
- ・ オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」

#### (2) 洋名

- ・ Olopatadine Hydrochloride Tablets 2.5mg “JG”
- ・ Olopatadine Hydrochloride Tablets 5mg “JG”

#### (3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」 より命名

### 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）

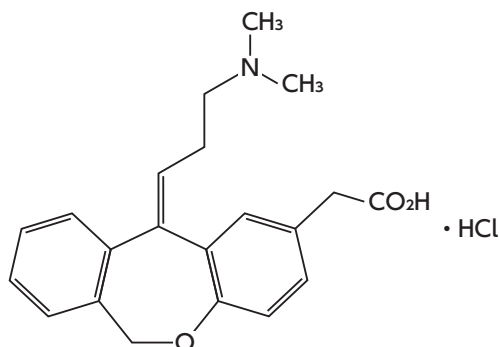
Olopatadine Hydrochloride（JAN）

Olopatadine（INN）

#### (3) ステム

三環系 H<sub>1</sub> 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：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）

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

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：塩酸オロパタジン

## 7. CAS 登録番号

140462-76-6 (Olopatadine Hydrochloride)

113806-05-6 (Olopatadine)



### 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℃（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

日局「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(2)

#### 4. 有効成分の定量法

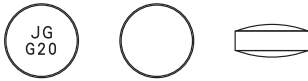

日局「オロパタジン塩酸塩」の定量法による。

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	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「JG」	オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」
色 ・ 剤 形	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色の片面割線入りフィルムコーティング錠
外 形		
大きさ (mm)	直径：6.1                  厚さ：2.7	直径：7.1                  厚さ：2.8
重 量 (mg)	80.0	120.0

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

- ・ オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「JG」  
錠剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG G20
- ・ オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」  
錠剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG G21

#### (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 「JG」  
1 錠中 オロパタジン塩酸塩 2.5mg 含有
- ・ オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」  
1 錠中 オロパタジン塩酸塩 5.0mg 含有

#### (2) 添加物

- ・ オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「JG」 及び オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」  
D-マンニトール、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

#### (3) その他

該当しない

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

##### オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「JG」

###### ◎ 加速試験<sup>2)</sup>

包装形態：PTP 包装

試験条件：40±1℃/75±5%RH

試験期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、溶出試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験	溶出試験	定量試験
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時	適合	適合	適合	100.4%
1 ヶ月後	適合	—	適合	99.0%
3 ヶ月後	適合	—	適合	99.4%
6 ヶ月後	適合	適合	適合	99.0%

(1) 淡黄赤色のフィルムコーティング錠

(2) 波長 295～299nm に吸収の極大を示す

(3) 15 分間、85%以上

(4) 95.0～105.0%

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

###### ◎ 無包装状態での安定性試験<sup>3)</sup>

試験条件：

①温度に対する安定性試験：40℃、3 ヶ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25℃/75%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lux・hr（気密容器）

試験項目：外観、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目	外観	溶出試験	定量試験	硬度
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時	適合	適合	100.1%	48N
①温度	変化なし	変化なし	変化あり（規格内）	変化なし
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
③光	変化なし	変化なし	変化あり（規格内）	変化なし

(1) 淡黄赤色のフィルムコーティング錠

(2) 15 分間、85%以上

(3) 95.0～105.0%

(4) 参考値

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

## オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」

### ◎ 加速試験<sup>4)</sup>

包装形態：①PTP 包装、②バラ包装

試験条件：40±1°C/75±5%RH

試験期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、溶出試験、定量試験

#### ①PTP 包装

試験項目	性状	確認試験	溶出試験	定量試験
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時	適合	適合	適合	98.9%
1 ヶ月後	適合	—	適合	100.1%
3 ヶ月後	適合	—	適合	98.5%
6 ヶ月後	適合	適合	適合	99.8%

#### ②バラ包装

試験項目	性状	確認試験	溶出試験	定量試験
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時	適合	適合	適合	98.9%
1 ヶ月後	適合	—	適合	99.4%
3 ヶ月後	適合	—	適合	99.2%
6 ヶ月後	適合	適合	適合	101.2%

(1) 淡黄赤色の片面割線入りフィルムコーティング錠

(2) 波長 295～299nm に吸収の極大を示す

(3) 15 分間、85%以上

(4) 95.0～105.0%

最終包装製品を用いた加速試験（40°C、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

### ◎ 無包装状態での安定性試験<sup>5)</sup>

試験条件：

①温度に対する安定性試験：40°C、3 ヶ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25°C/75%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lux・hr（気密容器）

試験項目：外観、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目	外観	溶出試験	定量試験	硬度
規格	(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時	適合	適合	100.0%	52N
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり(32N)
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

(1) 淡黄赤色の片面割線入りフィルムコーティング錠

- (2) 15 分間、85%以上
- (3) 95.0~105.0%
- (4) 参考値

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

## 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

【溶出挙動の同等性又は類似性】

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「JG」<sup>6)</sup>

「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 別紙 2 含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）」に従う。

- ・標準製剤：オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」
- ・処方変更水準：B 水準

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
			pH4.0	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
	100rpm	pH4.0	薄めた McIlvaine の緩衝液	
試験液量：900mL 試験回数：12 ベツセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

・判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	(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 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。
	pH4.0	
	pH6.8	
	水	
100	pH4.0	

・試験結果

<p>(50rpm、pH1.2)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「JG」 ● 標準製剤 (オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」)</p>	<p>(50rpm、pH4.0)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「JG」 ● 標準製剤 (オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」)</p>
<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>
<p>(50rpm、pH6.8)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「JG」 ● 標準製剤 (オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」)</p>	<p>(50rpm、水)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「JG」 ● 標準製剤 (オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」)</p>
<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>
<p>(100rpm、pH4.0)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「JG」 ● 標準製剤 (オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」)</p>	
<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	

表 1. 溶出挙動の同等性の判定 (平均溶出率)

回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤	試験製剤	
50	pH1.2	15	100.5	98.4	適合
	pH4.0	15	98.9	100.4	適合
	pH6.8	15	102.0	99.8	適合
	水	15	100.9	99.4	適合
100	pH4.0	15	99.8	100.5	適合

表 2. 溶出挙動の同等性の判定 (個々の溶出率)

回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (min)	個々の溶出率 (%) 最小値～最大値	平均溶出率との差		判定
				±15%超	±25%超	
50	pH1.2	15	96.0～101.6	0 個	0 個	適合
	pH4.0	15	95.6～106.0	0 個	0 個	適合
	pH6.8	15	97.2～101.6	0 個	0 個	適合
	水	15	96.8～104.0	0 個	0 個	適合
100	pH4.0	15	98.8～103.2	0 個	0 個	適合

・ 結論

試験製剤と標準製剤の溶出挙動の同等性を判定したところ、いずれの試験条件においても「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」の判定基準に適合していた。

以上より、両製剤は生物学的に同等とみなされた。

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」<sup>7)</sup>

「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)」に従う。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法 (パドル法)			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
			pH5.0	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
	100rpm	pH5.0	薄めた McIlvaine の緩衝液	
	試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル			
分析法	液体クロマトグラフィー			

・ 判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	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。
	pH5.0	
	pH6.8	
	水	
100	pH5.0	

・試験結果

<p>(50rpm、pH1.2)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」, ● 標準製剤 (錠剤、5mg)</p> <table border="1"> <caption>Dissolution Data (50rpm, pH1.2)</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)</th> <th>標準製剤 (錠剤、5mg) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>88</td><td>78</td></tr> <tr><td>10</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>15</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>20</td><td>100</td><td>100</td></tr> <tr><td>30</td><td>100</td><td>100</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)	0	0	0	5	88	78	10	100	100	15	100	100	20	100	100	30	100	100	<p>(50rpm、pH5.0)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」, ● 標準製剤 (錠剤、5mg)</p> <table border="1"> <caption>Dissolution Data (50rpm, pH5.0)</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)</th> <th>標準製剤 (錠剤、5mg) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>85</td><td>72</td></tr> <tr><td>10</td><td>95</td><td>95</td></tr> <tr><td>15</td><td>98</td><td>98</td></tr> <tr><td>20</td><td>98</td><td>98</td></tr> <tr><td>30</td><td>98</td><td>98</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)	0	0	0	5	85	72	10	95	95	15	98	98	20	98	98	30	98	98
時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)																																									
0	0	0																																									
5	88	78																																									
10	100	100																																									
15	100	100																																									
20	100	100																																									
30	100	100																																									
時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)																																									
0	0	0																																									
5	85	72																																									
10	95	95																																									
15	98	98																																									
20	98	98																																									
30	98	98																																									
<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>																																										
<p>(50rpm、pH6.8)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」, ● 標準製剤 (錠剤、5mg)</p> <table border="1"> <caption>Dissolution Data (50rpm, pH6.8)</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)</th> <th>標準製剤 (錠剤、5mg) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>92</td><td>75</td></tr> <tr><td>10</td><td>100</td><td>95</td></tr> <tr><td>15</td><td>100</td><td>98</td></tr> <tr><td>20</td><td>100</td><td>98</td></tr> <tr><td>30</td><td>100</td><td>98</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)	0	0	0	5	92	75	10	100	95	15	100	98	20	100	98	30	100	98	<p>(50rpm、水)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」, ● 標準製剤 (錠剤、5mg)</p> <table border="1"> <caption>Dissolution Data (50rpm, 水)</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)</th> <th>標準製剤 (錠剤、5mg) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>85</td><td>80</td></tr> <tr><td>10</td><td>95</td><td>95</td></tr> <tr><td>15</td><td>98</td><td>98</td></tr> <tr><td>20</td><td>98</td><td>98</td></tr> <tr><td>30</td><td>98</td><td>98</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)	0	0	0	5	85	80	10	95	95	15	98	98	20	98	98	30	98	98
時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)																																									
0	0	0																																									
5	92	75																																									
10	100	95																																									
15	100	98																																									
20	100	98																																									
30	100	98																																									
時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)																																									
0	0	0																																									
5	85	80																																									
10	95	95																																									
15	98	98																																									
20	98	98																																									
30	98	98																																									
<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>																																										
<p>(100rpm、pH5.0)</p> <p>Legend: ○ オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」, ● 標準製剤 (錠剤、5mg)</p> <table border="1"> <caption>Dissolution Data (100rpm, pH5.0)</caption> <thead> <tr> <th>時間 (分)</th> <th>オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)</th> <th>標準製剤 (錠剤、5mg) (%)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr><td>0</td><td>0</td><td>0</td></tr> <tr><td>5</td><td>95</td><td>95</td></tr> <tr><td>10</td><td>98</td><td>98</td></tr> <tr><td>15</td><td>98</td><td>98</td></tr> </tbody> </table>	時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)	0	0	0	5	95	95	10	98	98	15	98	98																												
時間 (分)	オロパタジン塩酸塩錠5mg「JG」 (%)	標準製剤 (錠剤、5mg) (%)																																									
0	0	0																																									
5	95	95																																									
10	98	98																																									
15	98	98																																									
<p>判定時点である15分において、試験製剤が平均85%以上溶出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>																																											



表 3. 溶出挙動の類似性の判定

回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤(錠剤、5mg)	試験製剤	
50	pH1.2	15	100.0	100.5	適合
	pH5.0	15	97.7	99.6	適合
	pH6.8	15	98.4	102.0	適合
	水	15	98.6	100.9	適合
100	pH5.0	15	99.6	101.0	適合

・ 結論

試験製剤と標準製剤の溶出挙動の類似性を判定したところ、いずれの試験条件においても「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ていた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

【公的溶出規格への適合性】

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

試験方法	日局 一般試験法溶出試験法（パドル法、シンカーを用いる）
試験条件	回転数：50rpm 試験液：水 試験液量：900mL
分析法	液体クロマトグラフィー
溶出規格	15 分間に 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

日局「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（波長 295～299nm に吸収の極大を示す。）

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「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

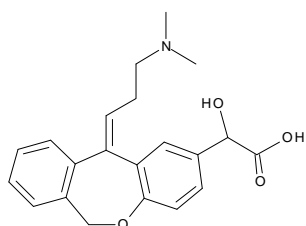
11. 力価

該当しない

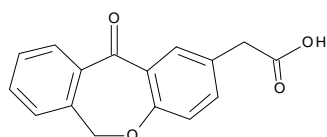
## 12. 混入する可能性のある夾雑物

混入が想定される主たる類縁物質は下記のとおりである。

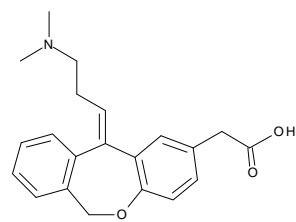
ヒドロキシ酢酸体



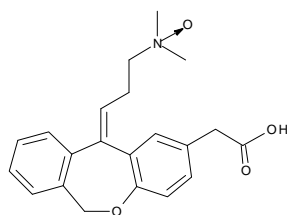
オキソ体



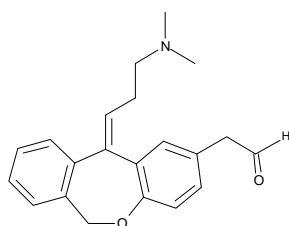
E 体



N-オキシド体



カルバルデヒド体



## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

## 14. 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、蕁麻疹、皮膚疾患に伴う瘙癢（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）に伴う瘙癢

### 2. 用法及び用量

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

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

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

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）

該当資料なし

##### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

---

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗薬：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、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン、レボセチリジン塩酸塩 等

### 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。更に神経伝達物質タキキニン遊離作用も有する。<sup>1)</sup>

#### (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

健康成人男子

薬剤名	投与量	投与方法	Tmax (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」	1錠 (オロパタジン塩酸塩として 5mg)	絶食単回経口投与	0.8±0.4

(Mean±S.D.,n=16)

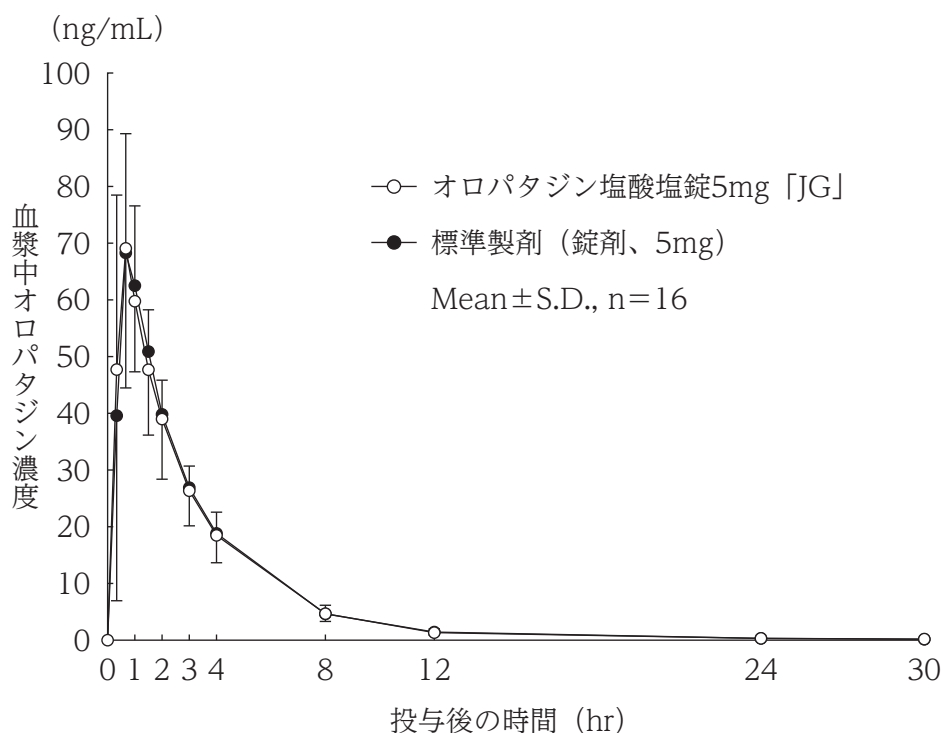
#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

【生物学的同等性試験】

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」<sup>8)</sup>

「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）」に準じる。

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」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。



<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-30</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」	222.17±31.14	76.78±12.19	0.8±0.4	5.0±2.0
標準製剤 (錠剤、5mg)	224.68±31.24	76.95±13.50	0.8±0.4	5.1±1.8

(Mean±S.D.,n=16)

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。

<同等性の判定結果>

	AUC <sub>0-30</sub>	Cmax
90%信頼区間	log(0.9524)~log(1.0267)	log(0.9274)~log(1.0804)

(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

(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

健康成人絶食単回投与

薬剤名	投与量	kel (hr <sup>-1</sup> )
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「JG」	1 錠 (オロパタジン塩酸塩として 5mg)	0.1587±0.0526

(Mean±S.D.,n=16)

(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

投与 2 時間後、12 時間後の血漿タンパク結合率は、それぞれ 67.9%、65.6%であった。<sup>1)</sup>

### 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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

#### (3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、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. 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）

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

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

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

#### 重要な基本的注意

- (1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。
- (2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (3) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、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

#### 重大な副作用（頻度不明）

#### 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸

劇症肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP、LDH、ALP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 <sup>注)</sup>	紅斑等の発疹、浮腫（顔面・四肢等）、痒痒、呼吸困難
精神神経系	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）、 $\gamma$ -GTP、LDH、ALP、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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 2. 禁忌、-8. 副作用 その他の副作用「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来すので、アレルギー皮内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。

## 13. 過量投与

該当しない

## 14. 適用上の注意

薬剤交付時：

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。（PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている）

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	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「JG」 オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」	該当しない (処方箋医薬品以外の医薬品)
有効成分	オロパタジン塩酸塩	—

### 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

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

該当しない

#### (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）

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目-6. 重要な基本的注意、-14. 適用上の注意」の項参照

・くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

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

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム・アルミニウム箔（PTP）、紙箱  
バラ包装：ポリエチレン（ボトル）、ポリプロピレン（蓋）

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アレロック®錠 2.5/5、アレロック®OD 錠 2.5/5（協和発酵キリン）、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「JG」（日本ジェネリック）

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、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン、レボセチリジン塩酸塩 等

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「JG」	2012年8月15日	22400AMX01158000
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」	2012年8月15日	22400AMX01159000

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

2015年1月14日

効能・効果の内容：小児に対する「アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症）に伴う掻痒」の効能・効果を追加した。

用法・用量の内容：効能・効果追加に伴い、関連の用法・用量を追加した。

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。

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「JG」	122037701	4490025F1066	622203701
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」	122038401	4490025F2062	622203801

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。

# X I . 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-1204 (2016)
- 2) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「JG」の加速試験 (2012)
- 3) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「JG」の無包装状態での安定性試験 (2012)
- 4) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」の加速試験 (2016)
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」の無包装状態での安定性試験 (2012)
- 6) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「JG」の溶出試験 (2012)
- 7) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」の溶出試験 (2012)
- 8) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「JG」の生物学的同等性試験 (2012)

## 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

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XIII. 備考

---

その他の関連資料

該当資料なし



*Memo*

*Memo*

*Memo*



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目9番1号