

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



販 売 名	オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」	オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」
剤 形	フィルム剤	
製 剤 の 規 制 区 分	該当しない	
規 格 ・ 含 量	1 枚中 日局オロパタジン塩酸塩 2.5mg	1 枚中 日局オロパタジン塩酸塩 5mg
一 般 名	和名：オロパタジン塩酸塩 洋名：Olopatadine Hydrochloride	
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・輸入・発売・ 提携・販売会社名	販 売：マルホ株式会社 製造販売：救急薬品工業株式会社	
医薬情報担当者の連絡先	マルホ株式会社 _____ TEL _____ FAX _____	
問 い 合 わ せ 窓 口	マルホ株式会社 製品情報センター TEL：0120-12-2834 受付時間：9時30分～17時30分(土、日、祝日を除く) 医療関係者向けホームページ http://www.maruho.co.jp/medical/index.html	

本 IF は 2014 年 11 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、医薬品医療機器情報提供ホームページ
<http://www.info.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、I F と略す)の位置付け並びに I F 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 I F 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 I F 記載要領が策定された。

2. I F とは

I F 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 I F 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 I F 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。

【I F 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。
- ② I F 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「I F 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。

【I F の作成】

- ① I F 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。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F 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、「I F 記載要領 2008」と略す)により作成された I F 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。

[I F の発行]

- ① 「 I F 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、「 I F 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 I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「 I F 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、 P D F 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 I T 環境によっては必要に応じて M R 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 I F 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、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、 I F 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、 I F 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、 I F 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」に関する項目等に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

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

X I .文献	22
1.引用文献.....	22
2.その他の参考文献.....	22
X II .参考資料	23
1.主な外国での発売状況.....	23
2.海外における臨床支援情報	23
X III .備考	24

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg「マルホ」・5mg「マルホ」は、オロパタジン塩酸塩を主成分とするアレルギー性疾患治療剤である。

オロパタジン塩酸塩は、主作用である抗ヒスタミン作用に加えて、肥満細胞からのケミカルメディエーター（ヒスタミン、ロイコトリエンなど）の遊離抑制作用がある。本剤は、口腔内崩壊錠の特性を有しつつ、更に剤形を薄いフィルム状とした製剤である。

本剤は、救急薬品工業（株）において開発され、2012年8月に製造販売承認を得て、2012年12月よりマルホ（株）から販売している。

2014年11月に小児への用法・用量が承認された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. オロパタジン塩酸塩を有効成分とするアレルギー性疾患治療剤です。
2. 持ち運びに便利な薄いフィルム状の製剤です。
3. さわやかなメントール味です。
4. 口腔内で速やかに崩壊し、水なしでも服用できます。
5. 嚥下障害のある患者や水分摂取量が制限されている患者、高齢の患者でも服用しやすい製剤です。
6. 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ります。（17 頁参照）

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」
オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」

(2) 洋名

Olopatadine Hydrochloride OD Film

(3) 名称の由来

一般名による。

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

オロパタジン塩酸塩(JAN)

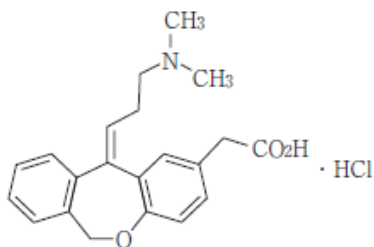
(2) 洋名(命名法)

Olopatadine Hydrochloride(JAN)

(3) ステム

-tadine : histamine- H_1 receptor antagonists, tricyclic compounds
三環系 H_1 受容体拮抗薬

3. 構造式又は示性式



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)

{11-[(1 \mathcal{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

特になし

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。
1.0g を水 100mL に溶かした液の pH は 2.3~3.3 である。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：約 250°C (分解)

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光性は示さない

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

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法
- (3) 塩化物の定性反応



4. 有効成分の定量法

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

販売名	オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」			オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」		
性状	青白色のフィルム剤（口腔内崩壊剤）					
形状	<p style="text-align: center;">上面・下面</p>  <p style="text-align: center;">側面</p>			<p style="text-align: center;">上面・下面</p>  <p style="text-align: center;">側面</p>		
大きさ	長辺(mm)	短辺(mm)	厚み(μm)	長辺(mm)	短辺(mm)	厚み(μm)
	20	14	70~90	20	14	80~100

(2) 製剤の物性

崩壊試験：日局崩壊試験法（試験液：水）により崩壊試験を行った。

崩壊時間

オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」：21~52 秒

オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」：23~60 秒

(3) 識別コード

該当しない

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

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 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」：1 枚中 日局オロパタジン塩酸塩 2.5mg

オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」：1 枚中 日局オロパタジン塩酸塩 5mg

(2) 添加物

ヒドロキシプロピルセルロース、マクロゴール 400、スクラロース、塩化カルシウム水和物、
1-メントール、ヒプロメロース、青色 1 号

(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

該当資料なし

4.製剤の各種条件下における安定性

長期保存試験 (25±2°C 60±5%RH) ¹⁾

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」

保存期間	保存形態	結果
36 箇月	アルミ包装 (市販包装形態)	いずれの試験項目においても経時変化は認められず安定であった。

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性、崩壊性、溶出性、定量法

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」

保存期間	保存形態	結果
36 箇月	アルミ包装 (市販包装形態)	いずれの試験項目においても経時変化は認められず安定であった。

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性、崩壊性、溶出性、定量法

加速試験 (40±1°C 75±5%RH) ¹⁾

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」

保存期間	保存形態	結果
6 箇月	アルミ包装 (市販包装形態)	いずれの試験項目においても経時変化は認められず安定であった。

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性、崩壊性、溶出性、定量法

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」

保存期間	保存形態	結果
6 箇月	アルミ包装 (市販包装形態)	いずれの試験項目においても経時変化は認められず安定であった。

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性、崩壊性、溶出性、定量法

苛酷試験

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」

保存条件	保存期間	保存形態	結果
60°C	30 日	無包装	変化なし
25°C、75%RH	1 箇月		性状変化あり、水分率上昇。
1000lux/hr (25°C、60%RH)	累積 30 万 lux		性状変化あり、含量低下、色差増加、類縁物質の増加、水分率上昇。
4000lux/hr (25°C、60%RH)	累積 120 万 lux	アルミ包装 (市販包装形態)	変化なし

試験項目：性状、溶出性、定量法、純度試験、水分含量、色差

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」

保存条件	保存期間	保存形態	結果
60°C	30 日	無包装	変化なし
25°C、75%RH	1 箇月		性状変化あり、水分率上昇。
1000lux/hr (25°C、60%RH)	累積 30 万 lux		性状変化あり、含量低下、色差増加、類縁物質の増加、水分率上昇。
4000lux/hr (25°C、60%RH)	累積 120 万 lux	アルミ包装 (市販包装形態)	変化なし

試験項目：性状、溶出性、定量法、純度試験、水分含量、色差

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(物理学的変化)

該当しない

7.溶出性

生物学的同等性試験ガイドラインにおける標準製剤との溶出挙動の評価

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」

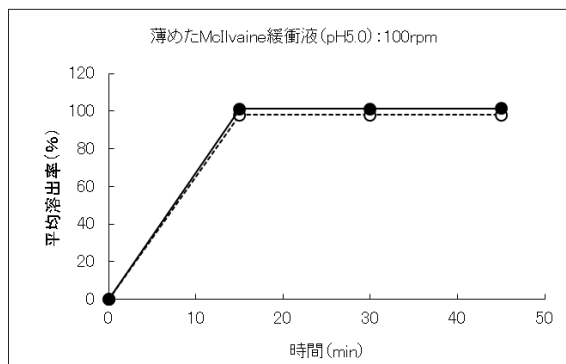
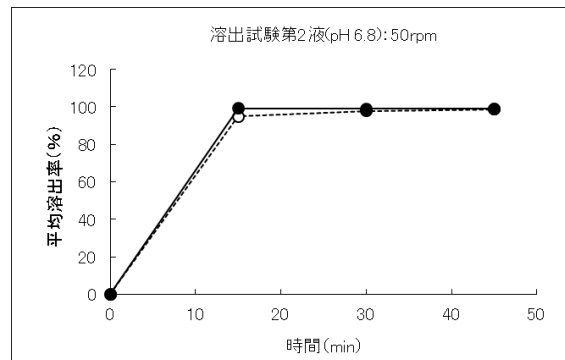
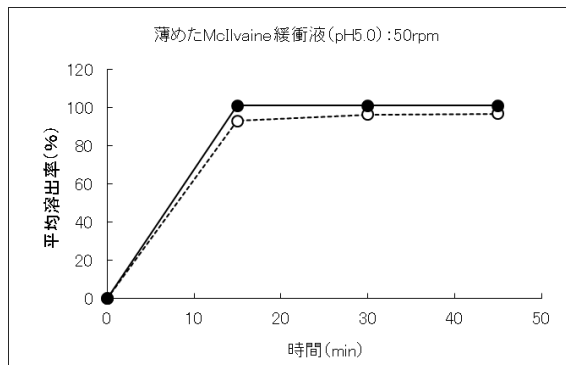
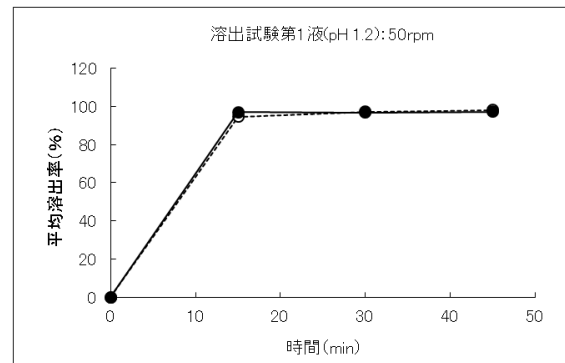
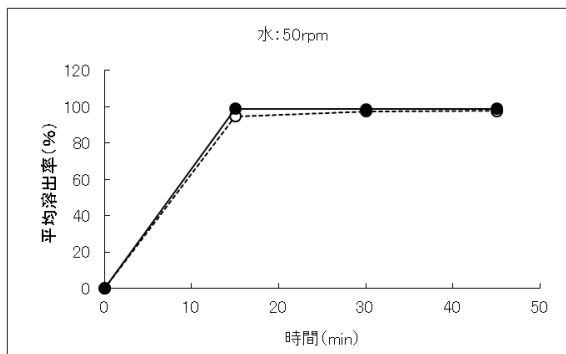
[参考] 後発医薬品の生物学的同等性試験のガイドラインに従い溶出の類似性を検討した。

試験液：水、pH 1.2、pH 5.0、pH 6.8、pH 5.0（毎分 100 回転）

回転数：毎分 50 回転

溶出試験法：日局「溶出試験法パドル法」で試験

分析法：液体クロマトグラフィー



● オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」

--○-- 標準製剤

●オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」

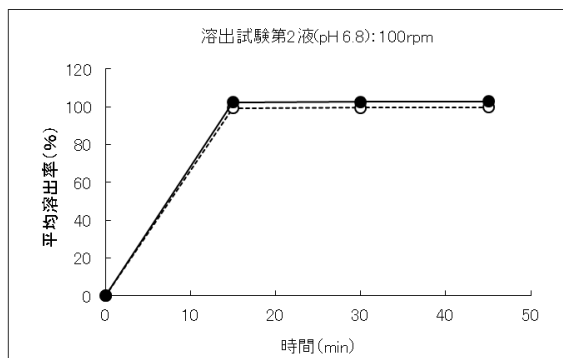
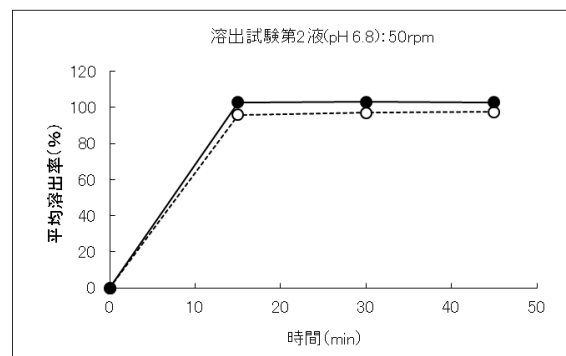
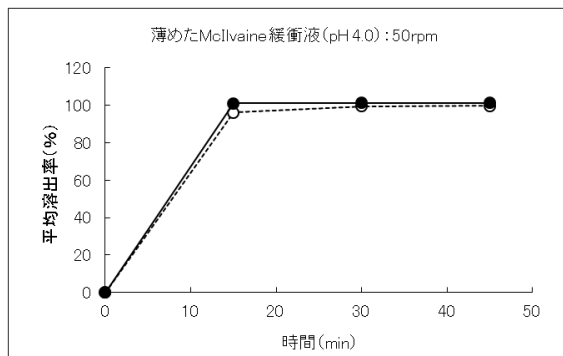
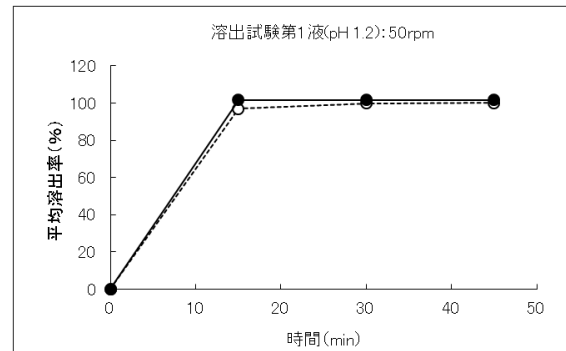
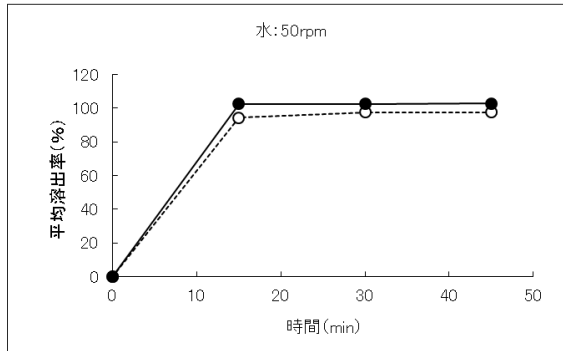
[参考] 後発医薬品の生物学的同等性試験のガイドラインに従い溶出の類似性を検討した。

試験液：水、pH 1.2、pH 4.0、pH 6.8、pH 6.8（毎分 100 回転）

回転数：毎分 50 回転

溶出試験法：日局「溶出試験法パドル法」で試験

分析法：液体クロマトグラフィー



● オロパタジン塩酸塩ODフィルム5mg「マルホ」

--○-- 標準製剤

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

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 薄層クロマトグラフィー

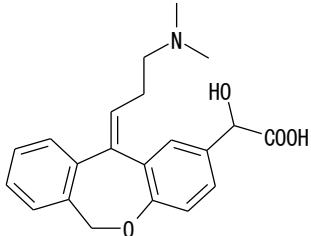
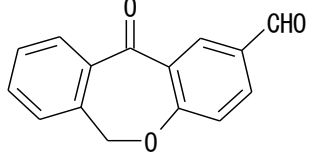
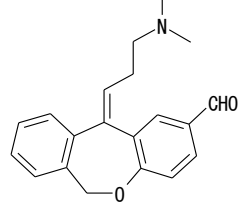
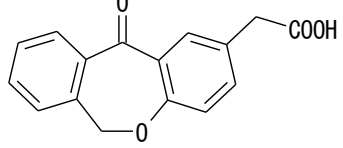
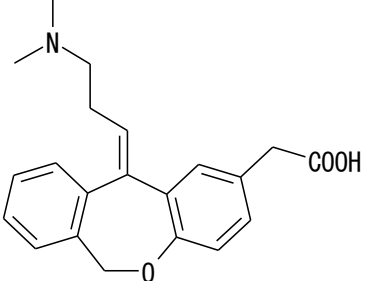
10.製剤中の有効成分の定量法

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

	化学物名	構造式	由来
類縁物質Ⅰ	Hydroxyacetic acid compound		分解生成物
類縁物質Ⅱ	Oxo-carbaldehyde compound		中間体
類縁物質Ⅲ	Amino-carbaldehyde compound		分解生成物
類縁物質Ⅳ	Oxo compound		中間体
類縁物質Ⅴ	E compound		中間体

13.治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

14.その他

該当資料なし

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回経口投与する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

本剤は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜からは吸収されないため、唾液又は水で飲み込むこと。

〔「適用上の注意」の項参照〕

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

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 H_1 受容体拮抗剤

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序²⁾

オロパタジン塩酸塩は、ヒスタミン H_1 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。

(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

「VII. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移・測定法 (3)」参照

(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 OD フィルム 2.5mg、5mg 「マルホ」と各標準製剤（普通錠）を、クロスオーバー法により 1 枚又は 1 錠（オロパタジン塩酸塩として、それぞれ 2.5mg、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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された³⁾。

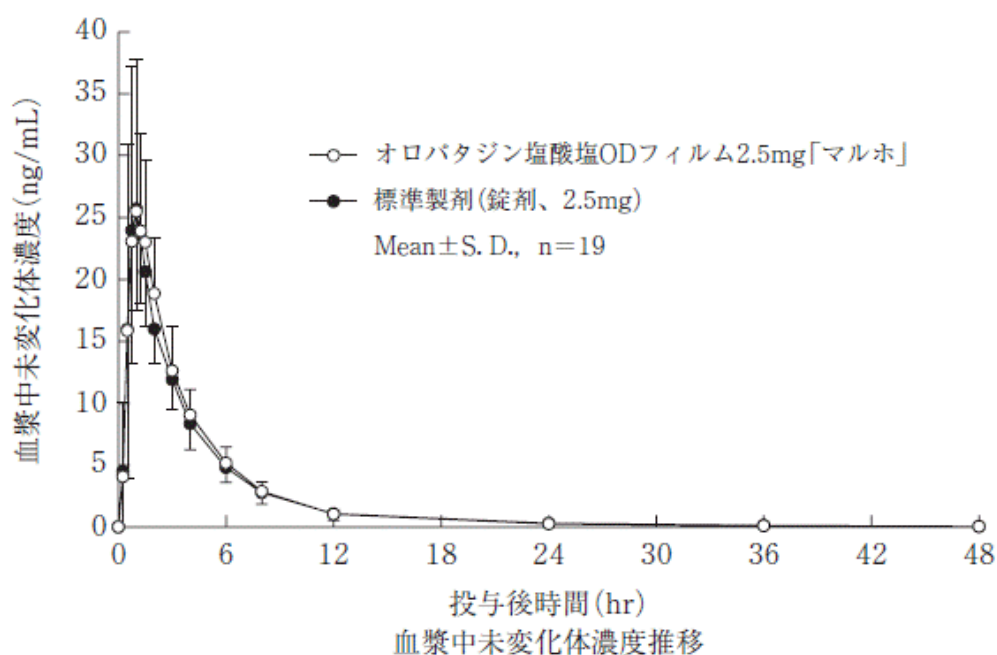
(1) オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」

1) 水なしで服用（標準製剤は水で服用）

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」	19	104 ± 18	32.6 ± 8.8	1.04 ± 0.41	9.37 ± 5.56
標準製剤 (錠剤、2.5mg)	19	99 ± 15	29.7 ± 6.9	0.97 ± 0.41	8.39 ± 3.93

(Mean ± S. D.)

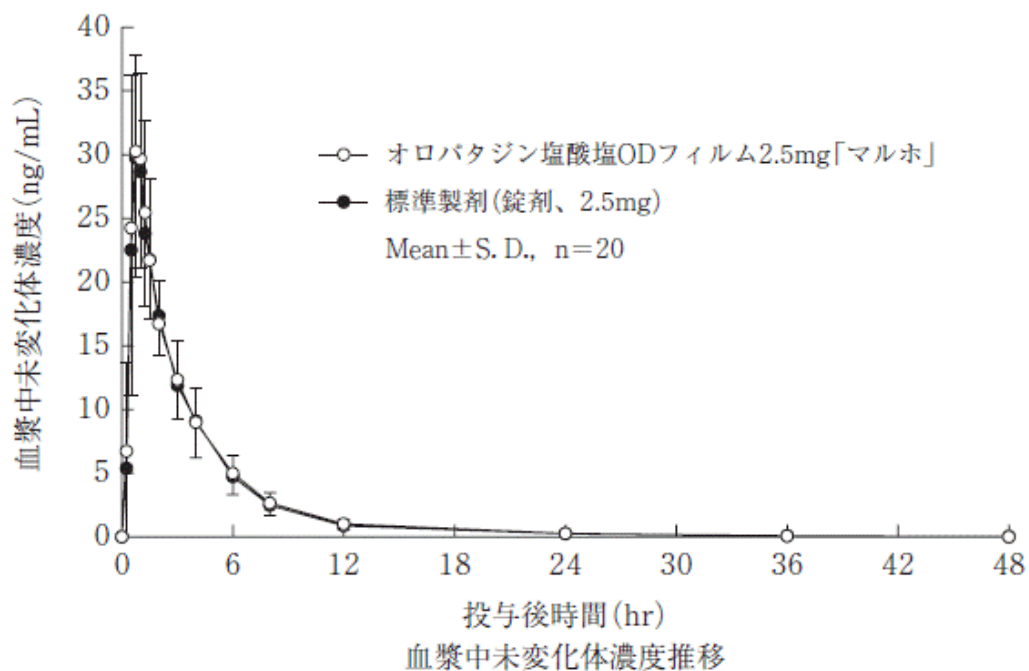


2) 水で服用

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」	20	106 ± 15	34.2 ± 7.4	0.89 ± 0.55	6.71 ± 2.02
標準製剤 (錠剤、2.5mg)	20	102 ± 15	33.6 ± 7.1	0.94 ± 0.75	7.51 ± 4.19

(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。

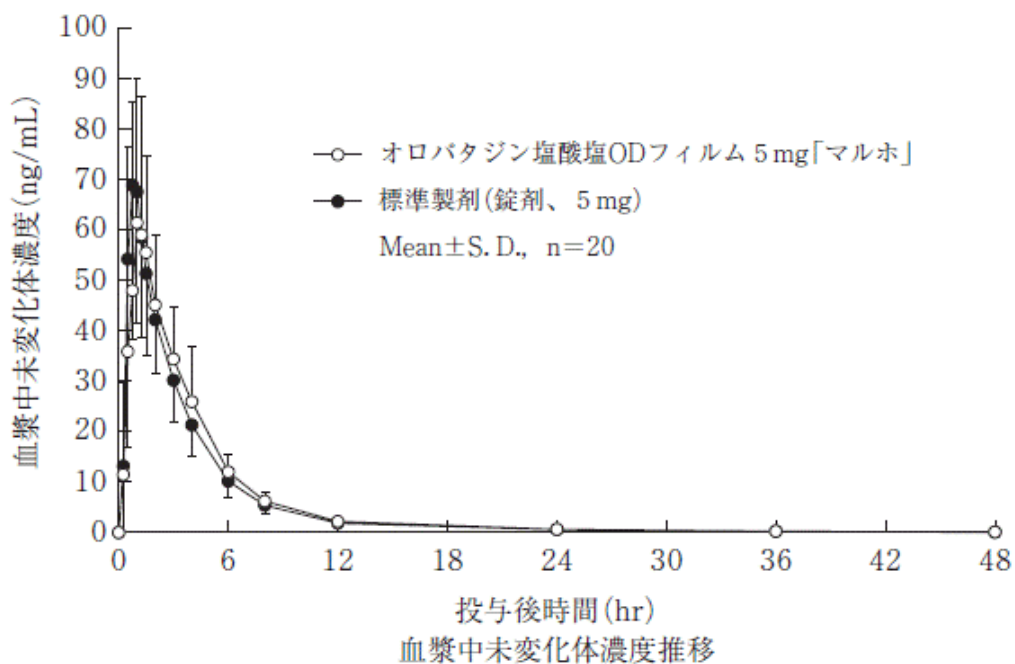
(2) オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」

1) 水なしで服用 (標準製剤は水で服用)

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」	20	253 ± 45	81.4 ± 26.2	1.23 ± 0.75	9.66 ± 3.55
標準製剤 (錠剤、5mg)	20	240 ± 42	86.8 ± 22.0	0.95 ± 0.57	10.26 ± 4.89

(Mean ± S. D.)

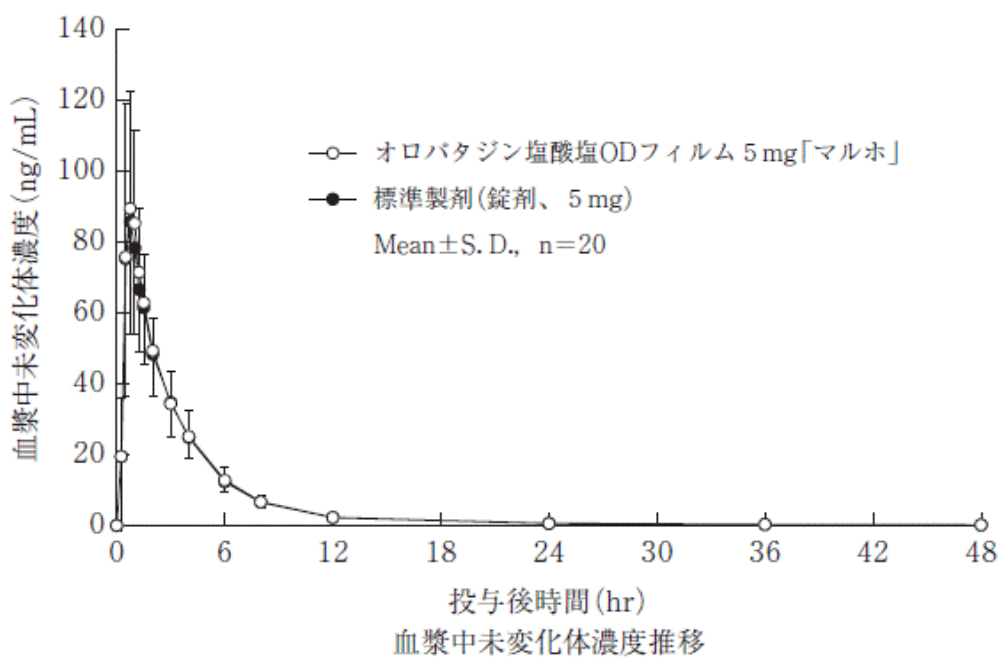


2) 水で服用

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₄₈ (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」	20	291 ± 65	101.0 ± 26.0	0.80 ± 0.35	10.94 ± 5.96
標準製剤 (錠剤、5mg)	20	285 ± 52	95.9 ± 26.5	0.78 ± 0.27	12.11 ± 4.84

(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。

(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

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移・測定法 (3)」参照

(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

該当資料なし

(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

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

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〔「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

特になし

(2) 併用注意とその理由

特になし

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。

(2)重大な副作用と初期症状

重大な副作用

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

〔禁忌〕

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）、そう痒、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。

試験法については該当資料なし。

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

- (1) 薬剤交付時
アルミ包装をめくり、薬剤(フィルム)を取り出して服用するよう指導すること。
- (2) 服用時
 - 1) 本剤はぬれた手で取り出さないこと。
 - 2) 本剤は舌の上へのせ唾液を浸潤させ、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。ただし、寝たままの状態では、水なしで服用しないこと。

15.その他の注意

因果関係は明らかではないが、同一成分薬(普通錠)を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

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：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（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) 薬局での取り扱いについて

「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 14. 適用上の注意」参照

(2) 薬剤交付時の注意(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 14. 適用上の注意」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 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」 アルミ包装：100枚

オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」 アルミ包装：100枚

7. 容器の材質

ポリエチレンテレフタレート／アルミニウム／ポリエチレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アレロック錠・アレロック OD 錠・アレロック顆粒、パタノール点眼液

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、レボセチリジン等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2012年8月15日

承認番号：オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 2.5mg 「マルホ」 22400AMX00998000

オロパタジン塩酸塩 OD フィルム 5mg 「マルホ」 22400AMX00999000

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

追加年月日：2014（平成26）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、皮膚そう痒症）に伴うそう痒

<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、投与期間に関する制限は定められていない。

16.各種コード

	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 ODフィルム2.5mg「マルホ」	122015501	4490025F3085	622201501
オロパタジン塩酸塩 ODフィルム5mg「マルホ」	122016201	4490025F4081	622201601

17.保険給付上の注意

特になし

X I . 文 献

1.引用文献

- 1) 安定性に関する資料（救急薬品工業株 社内資料）
- 2) 第十六改正日本薬局方第二追補解説書 C-50（2014）
- 3) 高野和彦：医学と薬学, 68(2), 291(2012)

2.その他の参考文献

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

外国では発売されていない。

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