

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/5mg「トーフ」

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーフ」

《オロパタジン塩酸塩口腔内崩壊錠》

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE TABLETS 2.5mg “TOWA” /
TABLETS 5mg “TOWA”

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS 2.5mg “TOWA” /
OD TABLETS 5mg “TOWA”

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」

《オロパタジン塩酸塩顆粒》

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE GRANULES 0.5% “TOWA”

製 品 名	オロパタジン 塩酸塩錠 2.5mg「トーフ」	オロパタジン 塩酸塩錠 5mg「トーフ」	オロパタジン 塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーフ」	オロパタジン 塩酸塩 OD 錠 5mg「トーフ」	オロパタジン 塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」
剤 形	フィルムコーティング錠		口腔内崩壊錠		顆粒剤
製 剤 の 規 制 区 分	該当しない				
規 格 ・ 含 量	1錠中 日局 オロパタジン塩 酸塩 2.5mg 含有	1錠中 日局 オロパタジン塩 酸塩 5mg 含有	1錠中 日局 オロパタジン塩 酸塩 2.5mg 含有	1錠中 日局 オロパタジン塩 酸塩 5mg 含有	1g 中 日局 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	2012 年 8 月 15 日		2014 年 2 月 14 日		2014年8月15日
薬 価 基 準 収 載 年 月 日	2012 年 12 月 14 日		2014 年 6 月 20 日		2014年12月12日
発 売 年 月 日	2012 年 12 月 14 日		2014 年 6 月 20 日		2014年12月12日
開 発 ・ 製 造 販 売 (輸 入) ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元：東和薬品株式会社				
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	電話番号： FAX：				
問 い 合 わ せ 窓 口	東和薬品株式会社 学術部 DI センター(24 時間受付対応)  0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797 http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff				

本 IF は 2014 年 11 月改訂〔第 4 版(普通錠)、効能・効果及び用法・用量の変更等に伴う改訂〕及び 2014 年 11 月改訂〔第 3 版(OD 錠)、効能・効果及び用法・用量の変更等に伴う改訂〕、2016 年 3 月改訂〔第 4 版(顆粒)、組成・性状の項等〕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.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.pmda.go.jp/>)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 が添付文書を保管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、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、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、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。

(2013 年 4 月)

目 次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	41
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	41
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	41
II. 名称に関する項目	3	3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	41
1. 販売名	3	4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	41
2. 一般名	3	5. 慎重投与内容とその理由	41
3. 構造式又は示性式	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	41
4. 分子式及び分子量	4	7. 相互作用	42
5. 化学名(命名法)	4	8. 副作用	42
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	9. 高齢者への投与	43
7. CAS登録番号	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	43
III. 有効成分に関する項目	5	11. 小児等への投与	43
1. 物理化学的性質	5	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	44
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	13. 過量投与	44
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	44
4. 有効成分の定量法	6	15. その他の注意	44
IV. 製剤に関する項目	7	16. その他	44
1. 剤形	7	IX. 非臨床試験に関する項目	45
2. 製剤の組成	8	1. 薬理試験	45
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	9	2. 毒性試験	45
4. 製剤の各種条件下における安定性	10	X. 管理的事項に関する項目	46
5. 調製法及び溶解後の安定性	15	1. 規制区分	46
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	16	2. 有効期間又は使用期限	46
7. 溶出性	19	3. 貯法・保存条件	46
8. 生物学的試験法	29	4. 薬剤取扱い上の注意点	46
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	29	5. 承認条件等	46
10. 製剤中の有効成分の定量法	29	6. 包装	47
11. 力価	29	7. 容器の材質	47
12. 混入する可能性のある夾雑物	30	8. 同一成分・同効薬	47
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	30	9. 国際誕生年月日	47
14. その他	30	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	48
V. 治療に関する項目	31	11. 薬価基準収載年月日	48
1. 効能・効果	31	12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	49
2. 用法・用量	31	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	51
3. 臨床成績	31	14. 再審査期間	51
VI. 薬効薬理に関する項目	33	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	51
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	33	16. 各種コード	52
2. 薬理作用	33	17. 保険給付上の注意	52
VII. 薬物動態に関する項目	34	XI. 文 献	53
1. 血中濃度の推移・測定法	34	1. 引用文献	53
2. 薬物速度論的パラメータ	38	2. その他の参考文献	53
3. 吸収	39	XII. 参考資料	54
4. 分布	39	1. 主な外国での発売状況	54
5. 代謝	39	2. 海外における臨床支援情報	54
6. 排泄	39	XIII. 備 考	54
7. トランスポーターに関する情報	40	その他の関連資料	54
8. 透析等による除去率	40		

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、オロパタジン塩酸塩口腔内崩壊錠及びオロパタジン塩酸塩顆粒はアレルギー性疾患治療剤であり、本邦では2001年(普通錠)、2010年(口腔内崩壊錠)、2011年(顆粒剤)に上市されている。東和薬品株式会社が後発医薬品として、オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩錠5mg「トーワ」の開発を企画し、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、生物学的同等性試験を実施し、2012年8月にそれぞれ承認を取得、2012年12月に発売した。

また、オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩OD錠5mg「トーワ」の開発を企画し、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、生物学的同等性試験を実施し、2014年2月にそれぞれ承認を取得、2014年6月に発売した。

また、オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」の開発を企画し、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、生物学的同等性試験を実施し、2014年8月に承認を取得、2014年12月に発売した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

臨床的特性

有用性：

<成人>

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「トーワ」、オロパタジン塩酸塩錠5mg「トーワ」、オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩OD錠5mg「トーワ」は、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)に対して、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回経口投与することにより、有用性が認められている。

オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」は、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)に対して、通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mg(顆粒剤として1g)を朝及び就寝前の1日2回経口投与することにより、有用性が認められている。

<小児>

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「トーワ」、オロパタジン塩酸塩錠5mg「トーワ」、オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩OD錠5mg「トーワ」は、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)に伴うそう痒に対して、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回経口投与することにより、有用性が認められている。

オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」は、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)に伴うそう痒に対して、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(顆粒剤として1g)を朝及び就寝前の1日2回経口投与、通常、2歳以上7歳未満の小児には1回オロパタジン塩酸塩として2.5mg(顆粒剤として0.5g)を朝及び就寝前の1日2回経口投与することにより、有用性が認められている。

安全性：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。

副作用として、眠気等が報告されている。〔Ⅷ. 8. (3) その他の副作用の項を参照〕

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. (2) 重大な副作用と初期症状の項を参照〕

製剤的特性

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーフ」

- ・ 5mg錠は分割しやすさを考慮した形状の割線あり。
- ・ 製品名・含量をPTPシートへ1錠ごとに両面に表示し、含量は大きく表示。また、独自のデザインで他製品との識別性を向上させるなど、包装デザインを工夫。患者さんが一目で何の薬かわかるよう「アレルギー性疾患の薬」と表示。更に、シート上部にGS1コードを表示。
- ・ 販売包装単位の個装箱に可変情報(使用期限・製造番号)を含むGS1コードを表示。

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」

- ・ 甘味のある顆粒剤。
- ・ プラスチックボトル入りのバラ包装のラベルに、必要時に切り取ってキャップに貼付できる“キャップ貼付ラベル”を採用。
- ・ 生物学的同等性試験に関する論文を提供可能。
- ・ 服薬指導資料としてQRコード入り患者用指導箋、花粉症患者へお渡しできる患者用冊子を用意。

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 「トーワ」
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「トーワ」
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「トーワ」
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「トーワ」
オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5% 「トーワ」

(2) 洋名

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE TABLETS 2.5mg “TOWA”
OLOPATADINE HYDROCHLORIDE TABLETS 5mg “TOWA”
OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS 2.5mg “TOWA”
OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS 5mg “TOWA”
OLOPATADINE HYDROCHLORIDE GRANULES 0.5% “TOWA”

(3) 名称の由来

一般名+剤形+規格(含量)+「トーワ」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づく〕

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)

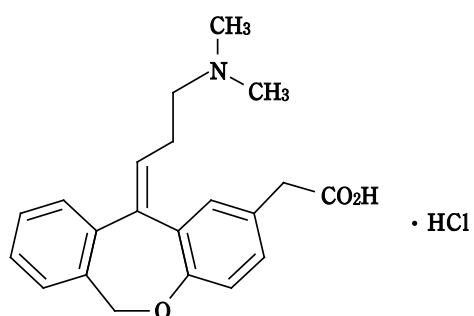
Olopatadine Hydrochloride (JAN)

olopatadine (INN)

(3) ステム

-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：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 (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

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

溶 媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	溶 解 性
ギ酸	1mL 未満	極めて溶けやすい
水	30mL 以上 100mL 未満	やや溶けにくい
エタノール(99.5)	1000mL 以上 10000mL 未満	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°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

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

日局「オロパタジン塩酸塩」の確認試験による

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

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーワ」

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーワ」

製品名		オロパタジン 塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」	オロパタジン 塩酸塩錠 5mg「トーワ」	オロパタジン 塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」	オロパタジン 塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」
剤形の区別		フィルムコーティング錠		口腔内崩壊錠	
性状		淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色の割線入りのフィルムコーティング錠	ごくうすい黄色の口腔内崩壊錠	ごくうすい黄色の割線入りの口腔内崩壊錠
識別コード	本体	Tw756	Tw757	/	/
	包装				
本体表示	表	/	/	オロパタジン OD2.5 トーワ	オロパタ 5
	裏				オロパタジン OD5 トーワ
外形	表				
	裏				
	側面				
錠径(mm)		5.6	7.1	6.0	8.0
厚さ(mm)		2.6	3.2	3.0	3.5
質量(mg)		71	140	90	180

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」

剤形の区別：顆粒剤

性状：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤である。また、分包品もある。

(2) 製剤の物性

製品名	オロパタジン 塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」	オロパタジン 塩酸塩錠 5mg「トーワ」	オロパタジン 塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」	オロパタジン 塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」
硬度	60.9N(6.2kg 重)	85.7N(8.7kg 重)	57N(5.8kg 重)	63N(6.4kg 重)
摩損度	/		0.00%	0.04%

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」

試験条件：3ロット (n=10)

試験項目	平均含量(%)
日局製剤均一性 (含量均一性試験)	99.8~100.6

製剤均一性(分包品)：製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合した。

(3) 識別コード

(1) 剤形の区別、外観及び性状の項を参照

(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「トーフ」

1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩 2.5mg を含有する。

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーフ」

1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩 5mg を含有する。

オロパタジン塩酸塩 0D 錠 2.5mg「トーフ」

1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩 2.5mg を含有する。

オロパタジン塩酸塩 0D 錠 5mg「トーフ」

1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩 5mg を含有する。

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」

1g 中 日局 オロパタジン塩酸塩 5mg を含有する。

(2) 添加物

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーフ」

使用目的	添加物
賦形剤	乳糖水和物、結晶セルロース
崩壊剤	デンプングリコール酸 Na
滑沢剤	ステアリン酸 Mg
コーティング剤	ヒプロメロース、マクロゴール 6000、タルク

その他 3 成分

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg/5mg「トーワ」

使用目的	添加物
賦形剤	D-マンニトール
崩壊剤	低置換度ヒドロキシプロピルセルロース
滑沢剤	軽質無水ケイ酸、ステアリン酸 Mg
コーティング剤	メタクリル酸コポリマーLD、ポリソルベート 80、ラウリル硫酸 Na、 アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマー分散液、ポリオキシ エチレンノニルフェニルエーテル
流動化剤	タルク
可塑剤	クエン酸トリエチル
着色剤	黄色三二酸化鉄
矯味剤	l-メントール
甘味剤	アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)
香料	香料

その他 5成分

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」

使用目的	添加物
賦形剤	D-マンニトール、D-マンニトール球状顆粒
コーティング剤	メタクリル酸コポリマーLD、ポリソルベート 80、ラウリル硫酸 Na
可塑剤	クエン酸トリエチル
結合剤	ヒドロキシプロピルセルロース
流動化剤	軽質無水ケイ酸

その他 2成分

(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

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

オロパタ ジン塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」¹⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 ヶ月
性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	97.5~103.3	95.6~103.5
含量(%)	98.8~100.4	97.6~98.9

オロパタ ジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」²⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 ヶ月
性状	淡黄赤色の割線入りのフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	99.6~103.1	95.2~104.8
含量(%)	98.7~99.5	97.7~98.7

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 ヶ月
性状	淡黄赤色の割線入りのフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	99.6~103.1	96.5~101.0
含量(%)	98.7~99.5	98.4~99.4

オロパタ ジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「トーフ」³⁾

包装形態：PTP包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6ヵ月
性状	ごくうすい黄色の 口腔内崩壊錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
崩壊時間(秒)	18~27	13~19
溶出率(%)	86.2~92.0	83.7~89.8
含量(%)	100.4~102.3	99.5~101.0

オロパタ ジン塩酸塩 OD錠 5mg「トーフ」⁴⁾

包装形態：PTP包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6ヵ月
性状	ごくうすい黄色の割線入 りの口腔内崩壊錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
崩壊時間(秒)	18~24	14~19
溶出率(%)	86.1~91.3	85.6~90.7
含量(%)	100.4~101.3	99.1~100.8

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6ヵ月
性状	ごくうすい黄色の割線入 りの口腔内崩壊錠	同左
確認試験	適合	同左
製剤均一性	適合	同左
崩壊時間(秒)	18~24	15~21
溶出率(%)	86.1~91.3	85.1~89.8
含量(%)	100.4~101.3	99.4~101.0

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」⁵⁾

包装形態：分包包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 ヶ月
性状	白色の粒を含む 帯赤褐色の顆粒剤	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	92.6~98.0	91.4~96.3
含量(%)	99.9~103.1	98.3~102.8

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 ヶ月
性状	白色の粒を含む 帯赤褐色の顆粒剤	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
溶出率(%)	94.5~104.1	97.8~106.6
含量(%)	101.3~104.8	99.1~103.7

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「トーフ」、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーフ」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーフ」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーフ」及びオロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」は通常の市場流通下においてそれぞれ3年間安定であることが推測された。

(2) 無包装状態における安定性

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「トーフ」⁶⁾

試験項目	外観	含量	硬度	溶出性
温度 (40℃、3ヵ月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 (25℃、75%RH、3ヵ月)	変化なし	変化なし	変化あり (規格内)*	変化なし
光 (60万 lux・hr)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

*：60.9N(6.2kg重)→35.1N(3.6kg重、1ヵ月)、31.6N(3.2kg重、3ヵ月)に低下するが、取扱い上問題とならない程度の変化であった。

注) 評価は「(社)日本病院薬剤師会：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」の評価基準による。

<参考> 日本病院薬剤師会の評価基準

【硬度】

変化なし	硬度変化が 30%未満
変化あり（規格内）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重以上
変化あり（規格外）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重未満

硬度 2.0kg 重を下回ると、割れ・欠けが起こりやすくなり、取扱いに注意が必要になると考えられる。

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」⁷⁾

試験項目	外観	含量	硬度	溶出性
温度 (40℃、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 (25℃、75%RH、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化あり (規格内)*	変化なし
光 (60 万 lux・hr)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

* : 85.7N(8.7kg 重)→40.5N(4.1kg 重、1 ヶ月)、34.9N(3.6kg 重、3 ヶ月)に低下するが、取扱い上問題とならない程度の変化であった。

注) 評価は「(社)日本病院薬剤師会：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」の評価基準による。

<参考> 日本病院薬剤師会の評価基準

【硬度】

変化なし	硬度変化が 30%未満
変化あり（規格内）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重以上
変化あり（規格外）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重未満

硬度 2.0kg 重を下回ると、割れ・欠けが起こりやすくなり、取扱いに注意が必要になると考えられる。

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」⁸⁾

試験項目	外観	含量	硬度	崩壊性	溶出性
温度 (40℃、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 (25℃、75%RH、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化あり (規格内)*	変化なし	変化なし
光 (60 万 lux・hr)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

* : 57N(5.8kg 重)→28N(2.9kg 重、1 ヶ月)、25N(2.6kg 重、3 ヶ月)に低下するが、取扱い上問題とならない程度の変化であった。

注) 評価は「(社)日本病院薬剤師会：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」の評価基準による。

<参考> 日本病院薬剤師会の評価基準

【硬度】

変化なし	硬度変化が 30%未満
変化あり（規格内）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重以上
変化あり（規格外）	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重未満

硬度 2.0kg 重を下回ると、割れ・欠けが起こりやすくなり、取扱いに注意が必要になると考えられる。

オロパタ ジン塩酸塩 OD錠 5mg「トーワ」⁹⁾

試験項目	外観	含量	硬度	崩壊性	溶出性
温度 (40℃、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 (25℃、75%RH、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化あり (規格内)*	変化なし	変化なし
光 (60 万 lux・hr)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

* : 63N(6.4kg 重)→31N(3.2kg 重、1 ヶ月)、31N(3.2 kg 重、3 ヶ月)に低下するが、取扱い上問題とならない程度の変化であった。

注) 評価は「(社)日本病院薬剤師会：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」の評価基準による。

<参考> 日本病院薬剤師会の評価基準

【硬度】

変化なし	硬度変化が 30%未満
変化あり (規格内)	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重以上
変化あり (規格外)	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kg 重未満

硬度 2.0kg 重を下回ると、割れ・欠けが起こりやすくなり、取扱いに注意が必要になると考えられる。

オロパタ ジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」¹⁰⁾

試験項目	外観	含量	溶出性
温度 (40℃、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 (25℃、75%RH、3 ヶ月)	変化なし	変化なし	変化なし
光 (60 万 lux・hr)	変化なし	変化なし	変化なし

注) 評価は「(社)日本病院薬剤師会：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」の評価基準による。

(3) 分割後の安定性

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」¹¹⁾

包装形態：開放プラスチックシャーレ

試験条件：25℃、60%RH、遮光保存、1ロット(n=3)

試験項目		開始時	分割直後	1 ヶ月	3 ヶ月
性状	表面	淡黄赤色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)*		97.6~101.4	92.5~103.1	93.9~103.7	95.2~101.6
含量(%)		101.1	99.9	98.9	99.5

*：n=1 で実施した試験

包装形態：開放プラスチックシャーレ

試験条件：25℃、75%RH、遮光保存、1ロット(n=3)

試験項目		開始時	分割直後	1 ヶ月
性状	表面	淡黄赤色	同左	同左
	分割面	—	白色	同左
溶出率(%)*		97.6~101.4	92.5~103.1	98.0~103.3
含量(%)		101.1	99.9	99.7

*：n=1 で実施した試験

包装形態：ラップで蓋をした開放プラスチックシャーレ

試験条件：25℃、60%RH、3000lux 散光下、1ロット(n=3)

試験項目		開始時	分割直後	60 万 lux・hr	120 万 lux・hr
性状	表面	淡黄赤色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)*		97.6~101.4	92.5~103.1	96.2~102.8	93.6~101.9
含量(%)		101.1	99.9	99.5	100.5

*：n=1 で実施した試験

分割後の安定性試験(25℃、60%RH、遮光保存、3 ヶ月、25℃、75%RH、遮光保存、1 ヶ月、25℃、60%RH、3000lux 散光下、120 万 lux・hr)の結果、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」はそれぞれの試験項目で、ほとんど変化を認めなかった。

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)

■目的

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」と服薬補助ゼリーの配合時における安定性を確認するため、配合変化試験を実施した。

■方法

(1) 試験概要

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」と服薬補助ゼリーを配合した検体を指定した以下の条件下で保存した後、各試験項目について、配合直後からの変化の有無を確認した。

(2) 保存条件

保存条件：室内散光下、成り行き温湿度下

保存容器：ガラス栓をした透明ガラス製容器

(3) 試験項目

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」：外観・におい・定量

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」：外観・におい・定量

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」：外観・におい・pH・定量

(4) 試験方法

1) 外観：目視にて確認（色調、形状、懸濁、沈殿の有無等）

2) におい：においを確認

3) pH 測定：日本薬局方に準じ、配合検体の pH を測定

4) 定量：液体クロマトグラフィー

(5) 測定時点

配合直後、3 時間後

(6) 測定回数

各試験 1 回(n=1)とした（定量のみ 1 回(n=3)）。

(7) 配合割合

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」：1 錠

らくらく服薬ゼリー：大さじ 1（およそ 15mL）

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「トーフ」 : 1 錠

服薬補助ゼリー : 大きじ 1 (およそ 15mL)

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5% 「トーフ」 : 1 g

服薬補助ゼリー : 大きじ 1 (およそ 15mL)

■結果

試験製剤	服薬補助 ゼリー (メーカー名)	測定項目	測定時点		
			配合前	配合直後	3 時間後
オロパタジン 塩酸塩錠 5mg 「トーフ」	らくらく服薬 ゼリー (龍角散)	外観	試験製剤 : 淡黄赤色の割線入りの フィルムコーティング 錠であった。	微黄白色のゼリーに 淡黄赤色のフィルム コーティング錠が包 まれていた。錠剤は 一部崩壊及び膨潤し ていた。	微黄白色のゼリーに 淡黄赤色のフィルム コーティング錠が包 まれていた。錠剤は 崩壊及び膨潤してい た。
		におい	試験製剤 : 無臭であ った。	レモン様のおい であった。	レモン様のおい であった。
		含量 (%)	試験製剤 : 101.3	102.8	101.2
		残存率 (%)		100.0	98.4
オロパタジン 塩酸塩 OD 錠 5mg 「トーフ」	らくらく服薬 ゼリー (龍角散)	外観	試験製剤 : ごくうすい黄色の割線 入りの口腔内崩壊錠 であった。	ごくうすい黄色の割 線入りの口腔内崩壊 錠が微黄白色のゼリ ー剤に包まれてい た。	膨潤したごくうすい 黄色の割線入りの口 腔内崩壊錠が微黄白 色のゼリー剤に包ま れていた。
		におい	試験製剤 : なし。	レモン様のおい であった。	同左
		含量 (%)	試験製剤 : 101.3	102.2	101.4
		残存率 (%)		100.0	99.2
	おくすり 飲めたね いちご味 (龍角散)	外観	試験製剤 : ごくうすい黄色の割線 入りの口腔内崩壊錠 であった。	ごくうすい黄色の割 線入りの口腔内崩壊 錠が紫みの赤色を帯 びたゼリー剤に包ま れていた。	膨潤したごくうすい 黄色の割線入りの口 腔内崩壊錠が紫みの 赤色を帯びたゼリー 剤に包まれていた。
		におい	試験製剤 : なし。	いちご様のおい であった。	同左
		含量 (%)	試験製剤 : 101.3	98.6	97.2
		残存率 (%)		100.0	98.6
	おくすり 飲めたね チョコレート 味 (龍角散)	外観	試験製剤 : ごくうすい黄色の割線 入りの口腔内崩壊錠 であった。	口腔内崩壊錠が濃褐 色のゼリー剤に包ま れていた。	膨潤した口腔内崩壊 錠が濃褐色のゼリー 剤に包まれていた。
		におい	試験製剤 : なし。	チョコレート様 のおいであった。	同左
		含量 (%)	試験製剤 : 101.3	97.7	96.3
		残存率 (%)		100.0	98.6

試験製剤	服薬補助ゼリー (メーカー名)	測定項目	測定時点		
			配合前	配合直後	3時間後
オロパタジン 塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」	らくらく服薬 ゼリー (龍角散)	外観	試験製剤： 白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤であった。	帯赤褐色と微黄白色のゼリー剤の混合物であった。	同左
		におい	試験製剤：なし。	レモン様のにおいであった。	同左
		pH		3.78	3.78
		含量 (%)	試験製剤：103.3	103.7	103.2
		残存率 (%)		100.0	99.5
	おくすり 飲めたね いちご味 (龍角散)	外観	試験製剤： 白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤であった。	帯赤褐色と紫みの赤色を帯びたゼリー剤の混合物であった。	同左
		におい	試験製剤：なし。	いちご様のにおいであった。	同左
		pH		3.71	3.70
		含量 (%)	試験製剤：103.3	100.9	98.8
		残存率 (%)		100.0	97.9
	おくすり 飲めたね チョコレート 味 (龍角散)	外観	試験製剤： 白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤であった。	赤褐色と濃褐色のゼリー剤の混合物であった。	同左
		におい	試験製剤：なし。	チョコレート様のにおいであった。	同左
		pH		6.16	6.16
		含量 (%)	試験製剤：103.3	98.7	96.1
		残存率 (%)		100.0	97.4

※各薬剤・飲食物との配合変化試験成績は巻末を参照

7. 溶出性

(1) 規格及び試験方法

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーワ」^{12) 13)}

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」は、日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法、ただしシンカーを用いる)

試験液：水 900mL

回転数：50rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：15 分間の溶出率が 85%以上のときは適合とする。

〔出典：日本薬局方医薬品各条〕

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーワ」^{14) 15)}

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」は、設定された溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：水 900mL

回転数：50rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：15 分間の溶出率が 75%以上のときは適合とする。

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」¹⁶⁾

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：水 900mL

回転数：50rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：15 分間の溶出率が 85%以上のときは適合とする。

(2) 生物学的同等性試験

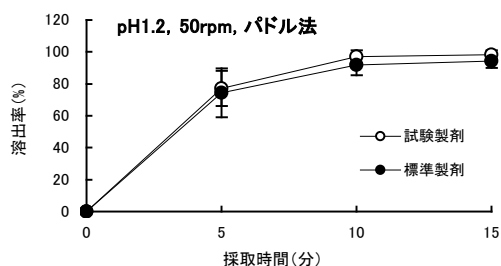
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」¹⁷⁾

「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 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)(以下、ガイドライン)に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたオロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」を標準剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験剤の処方変更水準は、ガイドラインにより B 水準に該当した。

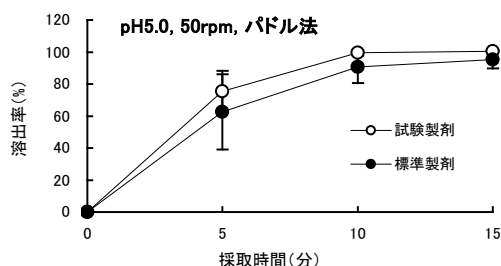
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
 回転数 : 50rpm、100rpm
 試験剤 : オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「トーワ」

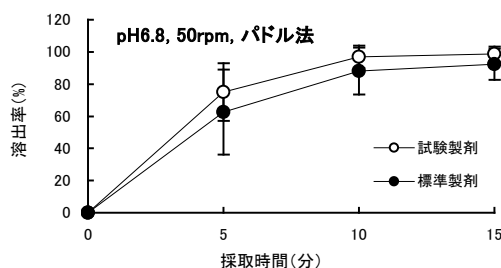
検体数 : n=12
 試験法 : バドル法
 標準剤 : オロパタジン塩酸塩錠5mg「トーワ」



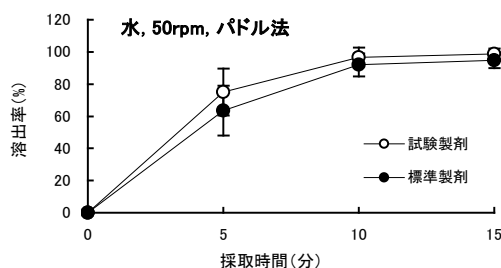
時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	77.2	97.0	98.4
標準偏差	0	11.1	4.0	2.5
標準剤	0	74.4	91.7	94.3
標準偏差	0	15.3	6.2	4.3



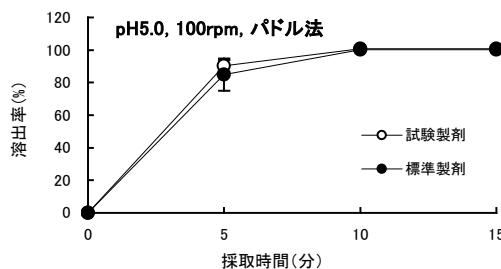
時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	75.3	99.4	100.6
標準偏差	0	12.8	1.6	0.9
標準剤	0	62.6	90.7	95.2
標準偏差	0	23.5	10.0	5.5



時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	75.0	96.8	98.7
標準偏差	0	18.0	7.0	4.7
標準剤	0	62.5	88.1	92.3
標準偏差	0	26.4	14.6	9.8



時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	75.0	96.7	98.6
標準偏差	0	14.6	6.0	3.6
標準剤	0	63.5	91.9	94.9
標準偏差	0	15.6	7.2	4.9



時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	90.2	100.7	100.7
標準偏差	0	3.6	0.6	0.5
標準剤	0	84.9	100.3	100.3
標準偏差	0	9.9	0.7	0.6

①試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	同等性の判定基準	判定
回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH1.2	15	98.4	94.3	4.1	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出又は標準製剤の平均溶出率の±10%以内	適
	pH5.0		100.6	95.2	5.4		適
	pH6.8		98.7	92.3	6.4		適
	水		98.6	94.9	3.7		適
100	pH5.0		100.7	100.3	0.4		適

(n=12)

②最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率(パドル法)

試験条件			(a) 最小値～ 最大値(%)	(b) 平均溶出率 ±15%の範囲 (%)	(a)が (b)を 超えた 数	同等性の判定基準	判定
回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)					
50	pH1.2	15	91.3 ~ 100.1	83.4 ~ 113.4	0	最終比較時点における個々の溶出率について、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	適
	pH5.0		99.5 ~ 102.1	85.6 ~ 115.6	0		適
	pH6.8		84.5 ~ 101.9	83.7 ~ 113.7	0		適
	水		88.4 ~ 101.2	83.6 ~ 113.6	0		適
100	pH5.0		99.7 ~ 101.3	85.7 ~ 115.7	0		適

(n=12)

①②の結果より、試験条件それぞれについて、溶出挙動が同等と判定された。

従って、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」と、標準製剤(オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」)は、生物学的に同等であるとみなされた。

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」¹⁸⁾

「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 薬食審査発第 1124004 号)(以下、ガイドライン)に従い、溶出試験を行った。

<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水

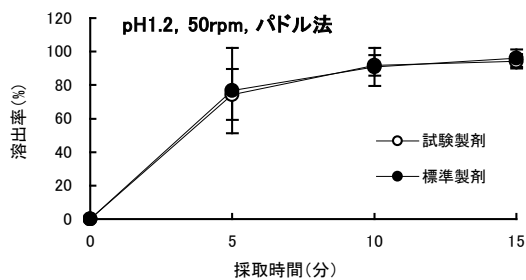
回転数 : 50rpm、100rpm

試験製剤 : オロパタジン塩酸塩錠5mg「トーワ」

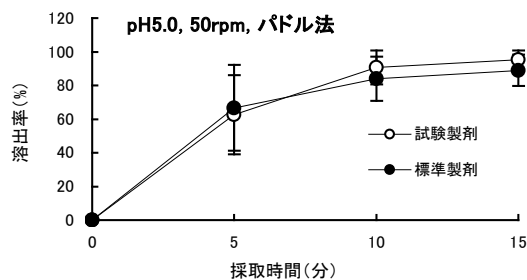
検体数 : n=12

試験法 : バドル法

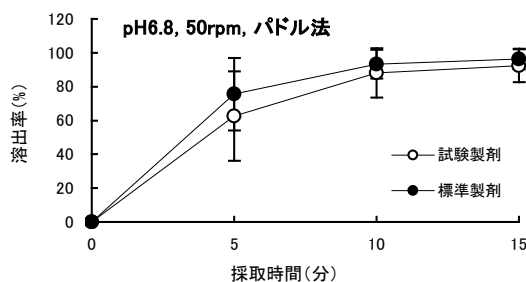
標準製剤 : 錠剤、5mg



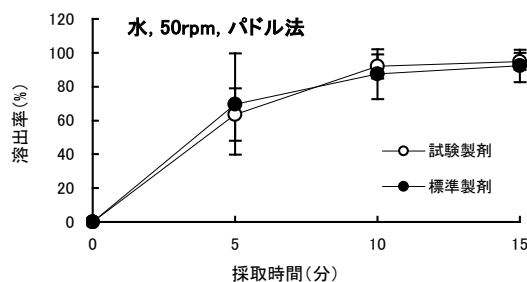
時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	74.4	91.7	94.3
標準偏差	0	15.3	6.2	4.3
標準製剤	0	76.7	90.8	96.0
標準偏差	0	25.4	11.4	5.3



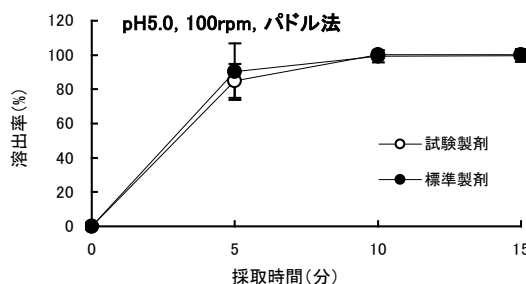
時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	62.6	90.7	95.2
標準偏差	0	23.5	10.0	5.5
標準製剤	0	66.7	84.0	89.0
標準偏差	0	25.5	13.2	9.4



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	62.5	88.1	92.3
標準偏差	0	26.4	14.6	9.8
標準製剤	0	75.5	93.3	96.3
標準偏差	0	21.3	8.6	6.1



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	63.5	91.9	94.9
標準偏差	0	15.6	7.2	4.9
標準製剤	0	69.7	87.4	92.3
標準偏差	0	30.0	14.8	9.6



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	84.9	100.3	100.3
標準偏差	0	9.9	0.7	0.6
標準製剤	0	90.4	99.3	99.7
標準偏差	0	16.5	3.6	3.7

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH1.2	15	94.3	96.0	-1.7	15分以内に平均85%以上溶出又は、標準製剤の平均溶出率の±15%以内	適
	pH5.0		95.2	89.0	6.2		適
	pH6.8		92.3	96.3	-4.0		適
	水		94.9	92.3	2.6		適
100	pH5.0		100.3	99.7	0.6		適

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

従って、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」と、標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

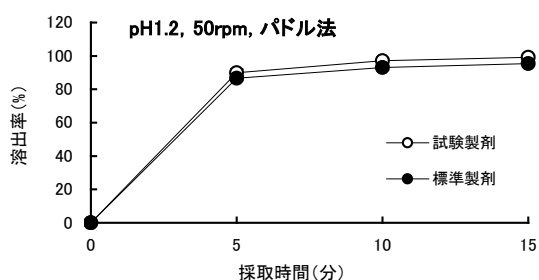
オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「トーワ」¹⁹⁾

「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24年2月29日 薬食審査発0229第10号)(以下、ガイドライン)に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたオロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「トーワ」を標準剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験剤の処方変更水準は、ガイドラインにより A 水準に該当した。

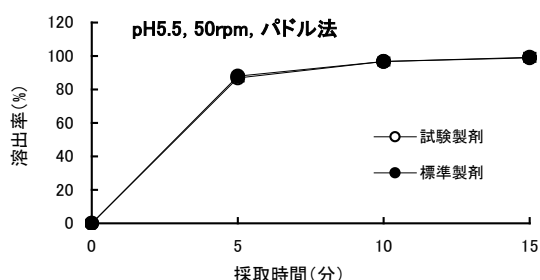
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.5、pH6.8、水
 回転数 : 50rpm
 試験剤 : オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「トーワ」

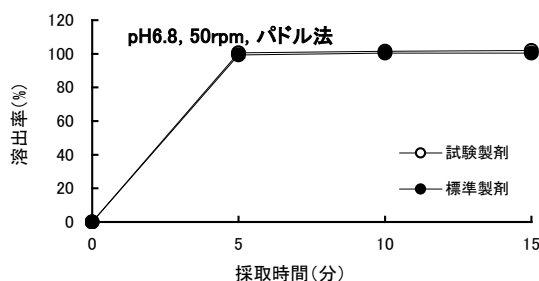
検体数 : n=12
 試験法 : バドル法
 標準剤 : オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「トーワ」



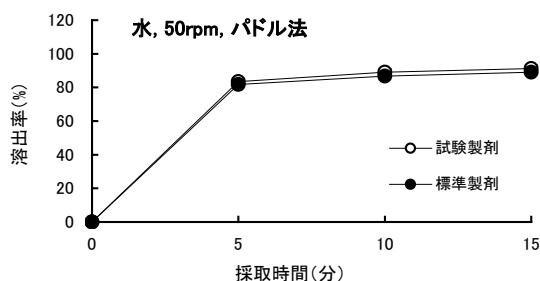
時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	90.0	97.2	99.2
標準偏差	0	1.9	1.4	1.4
標準剤	0	86.6	93.1	95.4
標準偏差	0	1.2	1.4	0.9



時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	86.8	96.7	99.2
標準偏差	0	2.0	2.4	2.6
標準剤	0	87.9	96.7	98.9
標準偏差	0	1.1	1.0	1.0



時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	100.5	101.5	101.9
標準偏差	0	1.1	1.3	1.2
標準剤	0	99.3	100.4	100.4
標準偏差	0	1.5	0.9	1.2



時間(分)	0	5	10	15
試験剤	0	83.5	89.0	91.3
標準偏差	0	1.7	1.7	1.7
標準剤	0	81.7	86.8	89.0
標準偏差	0	0.6	0.4	0.5

①試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	同等性の判定基準	判定
回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH1.2	15	99.2	95.4	3.8	15分以内に平均85%以上溶出	適
	pH5.5		99.2	98.9	0.3		適
	pH6.8		101.9	100.4	1.5		適
	水		91.3	89.0	2.3		適

(n=12)

②最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率(パドル法)

試験条件			(a) 最小値～ 最大値(%)	(b) 平均溶出率 ±15%の範囲 (%)	(a)が (b)を 超えた 数	同等性の判定基準	判定
回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)					
50	pH1.2	15	96.4 ~ 101.1	84.2 ~ 114.2	0	最終比較時点における個々の溶出率について、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	適
	pH5.5		94.1 ~ 103.7	84.2 ~ 114.2	0		
	pH6.8		99.8 ~ 103.7	86.9 ~ 116.9	0		
	水		87.1 ~ 92.9	76.3 ~ 106.3	0		

(n=12)

①②の結果より、試験条件それぞれについて、溶出挙動が同等と判定された。

従って、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」と、標準製剤(オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」)は、生物学的に同等であるとみなされた。

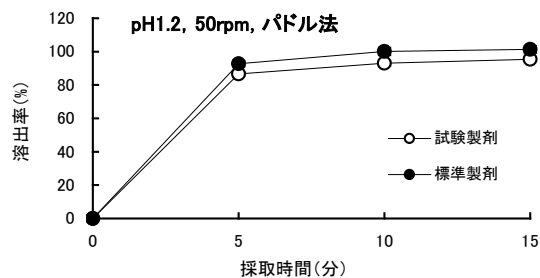
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「トーワ」²⁰⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号)(以下、ガイドライン)に従い溶出試験を行った。

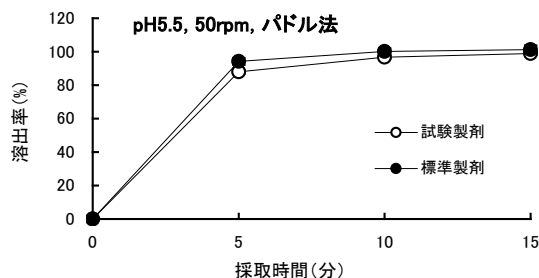
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.5、pH7.5、水
 回転数 : 50rpm
 試験製剤 : オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「トーワ」

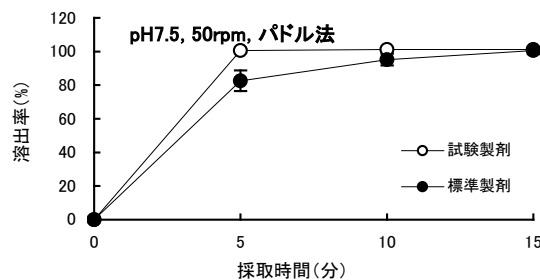
検体数 : n=12
 試験法 : パドル法
 標準製剤 : OD錠、5mg



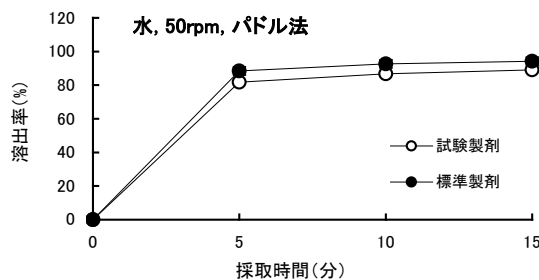
時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	86.6	93.1	95.4
標準偏差	0	1.2	1.4	0.9
標準製剤	0	92.8	100.1	101.3
標準偏差	0	1.7	2.2	2.0



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	87.9	96.7	98.9
標準偏差	0	1.1	1.0	1.0
標準製剤	0	94.2	100.1	101.2
標準偏差	0	2.0	2.0	2.5



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	100.5	101.2	101.2
標準偏差	0	1.2	1.2	1.2
標準製剤	0	82.6	95.2	100.6
標準偏差	0	6.2	3.5	2.2



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	81.7	86.8	89.0
標準偏差	0	0.6	0.4	0.5
標準製剤	0	88.4	92.6	94.2
標準偏差	0	2.3	2.3	2.4

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH1.2	15	95.4	101.3	-5.9	15分以内に平均85%以上溶出	適
	pH5.5		98.9	101.2	-2.3		適
	pH7.5		101.2	100.6	0.6		適
	水		89.0	94.2	-5.2		適

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

従って、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

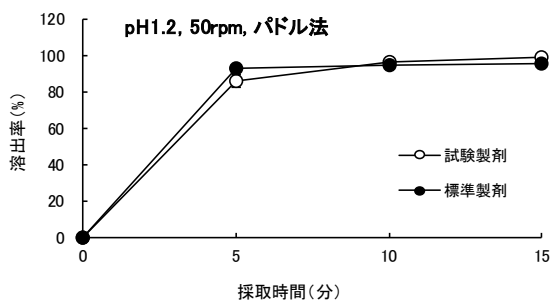
オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」²¹⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)(以下、ガイドライン)に従い溶出試験を行った。

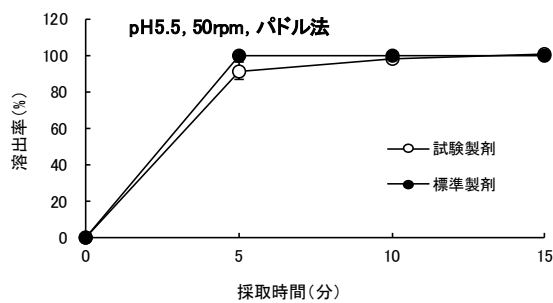
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.5、pH6.8、水
 回転数 : 50rpm
 試験製剤 : オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」

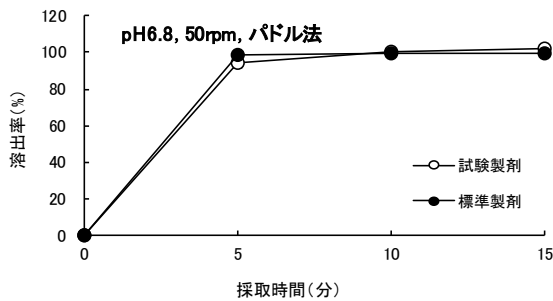
検体数 : n=12
 試験法 : パドル法
 標準製剤 : 顆粒剤、0.5%



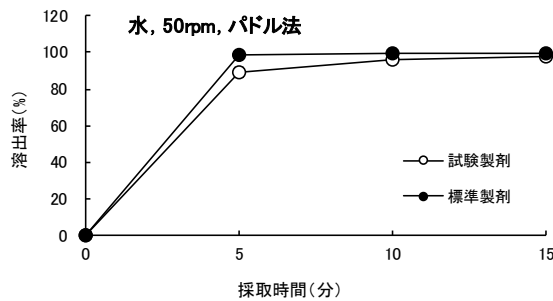
時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	86.2	96.7	99.4
標準偏差	0	3.8	2.1	1.2
標準製剤	0	92.8	94.8	95.7
標準偏差	0	1.1	0.9	1.0



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	91.9	98.9	101.3
標準偏差	0	4.9	2.4	1.1
標準製剤	0	99.8	99.9	100.1
標準偏差	0	0.8	1.0	1.0



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	94.6	100.5	102.2
標準偏差	0	3.0	2.0	1.2
標準製剤	0	98.6	99.4	99.7
標準偏差	0	0.9	1.0	0.9



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	89.0	95.8	97.5
標準偏差	0	2.6	1.1	0.5
標準製剤	0	98.6	99.1	99.3
標準偏差	0	1.0	1.1	1.1

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH 1.2	15	99.4	95.7	3.7	15分以内に平均85%以上溶出又は、標準製剤の平均溶出率の±15%以内	適
	pH 5.5		101.3	100.1	1.2		適
	pH 6.8		102.2	99.7	2.5		適
	水		97.5	99.3	-1.8		適

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

従って、オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

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

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーワ」

日局「オロパタジン塩酸塩錠」の確認試験による

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg

紫外可視吸光度測定法

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーワ」

日局「オロパタジン塩酸塩錠」の定量法による

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーワ」

液体クロマトグラフィー

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」

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

E 体、ヒドロキシ酢酸体、オキソ体、アミノカルバルデヒド体、オキソカルバルデヒド体、N-オキサイド体

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能・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・用量

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーフ」

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーフ」

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。

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーフ」のみ

【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）

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」

成人：

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

通常、2歳以上7歳未満の小児には1回オロパタジン塩酸塩として2.5mg（顆粒剤として0.5g）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

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

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。

(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

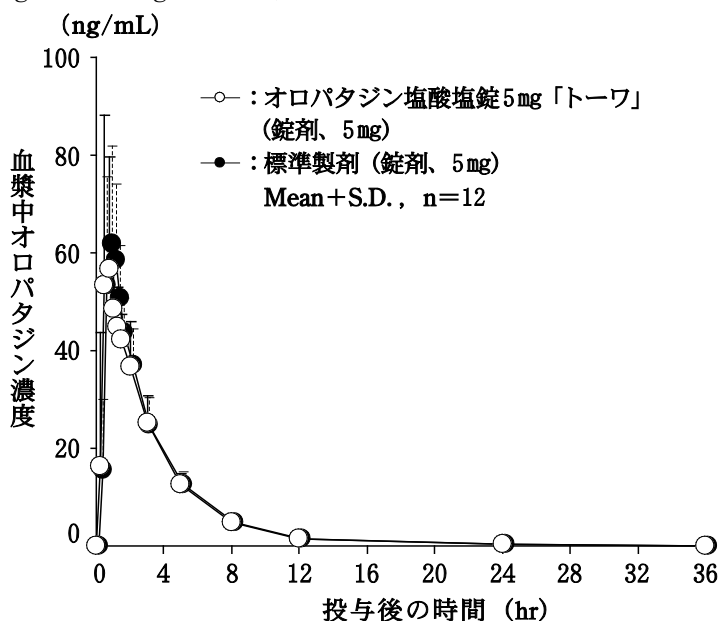
(3) 臨床試験で確認された血中濃度の項を参照

(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錠 5mg「トーワ」²²⁾

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」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=12)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 ₀₋₆ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」 (錠剤、5mg)	198.9 ± 25.6	69.079 ± 21.210	0.875 ± 0.459	5.38 ± 2.34
標準製剤 (錠剤、5mg)	204.3 ± 19.7	69.942 ± 17.109	0.938 ± 0.478	5.40 ± 1.58

(Mean ± S.D., n=12)

両剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

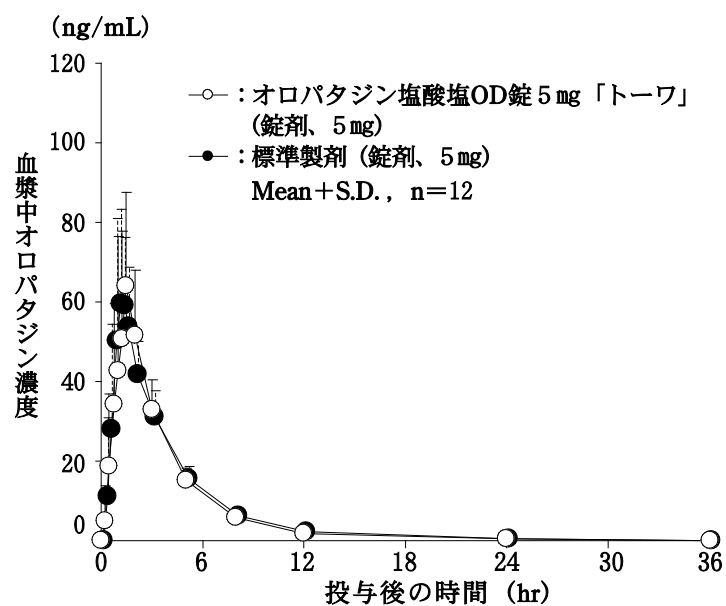
パラメータ	AUC ₃₆	C _{max}
平均値の差	log(0.9707)	log(0.9755)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9180)～log(1.0264)	log(0.8644)～log(1.1009)

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。

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「トーワ」²³⁾

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「トーワ」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(水なしで服用(n=12)及び水で服用(n=12))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、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。

(1) 水なしで服用



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₃₆ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「トーワ」 (錠剤、5mg)	231.7±32.9	76.329±20.112	1.208±0.463	6.87±2.92
標準製剤 (錠剤、5mg)	235.1±25.5	73.226±17.111	1.146±0.686	5.84±2.37

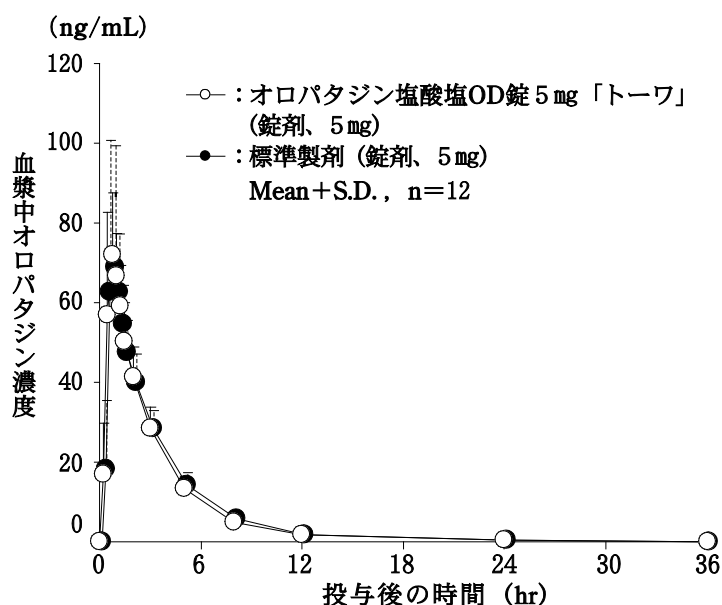
(Mean±S.D., n=12)

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

パラメータ	AUC ₃₆	Cmax
平均値の差	log(0.9818)	log(1.0326)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9551)～log(1.0092)	log(0.9032)～log(1.1804)

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) 水で服用



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₃₆ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパジン塩酸塩OD錠 5mg「トーフ」 (錠剤、5mg)	228.5±32.4	75.532±17.377	0.833±0.163	5.57±2.21
標準製剤 (錠剤、5mg)	231.2±35.2	81.088±23.189	0.833±0.431	5.90±2.99

(Mean±S.D., n=12)

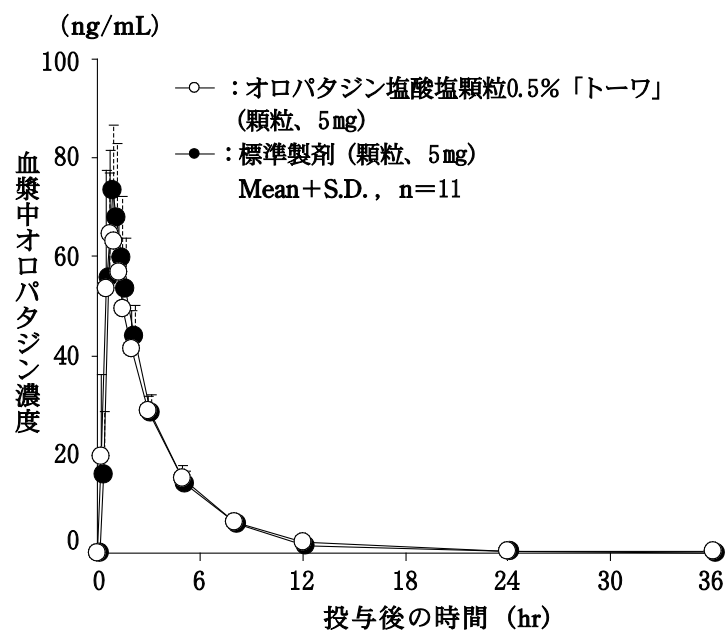
両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

パラメータ	AUC ₃₆	Cmax
平均値の差	log(0.9899)	log(0.9488)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.9494)～log(1.0320)	log(0.8460)～log(1.0640)

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顆粒 0.5%「トーワ」²⁴⁾

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1g (オロパタジン塩酸塩として 5mg) 健康成人男子 (n=11) に絶食単回経口投与して血漿中オロパタジン濃度を測定し、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。



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₃₆ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩 顆粒0.5%「トーワ」 (顆粒、5mg)	240.1 ± 27.8	72.009 ± 11.308	0.841 ± 0.257	6.85 ± 2.11
標準製剤 (顆粒、5mg)	235.9 ± 25.9	77.983 ± 11.964	0.773 ± 0.175	5.77 ± 2.07

(Mean ± S.D., n=11)

両剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	AUC ₃₆	Cmax
平均値の差	log(1.0179)	log(0.9263)
平均値の差の 90%信頼区間	log(0.9933) ~ log(1.0432)	log(0.8520) ~ log(1.0070)

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) 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

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」²²⁾

kel : $0.1525 \pm 0.0614 \text{ hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食経口投与)

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」²³⁾

1) 水なしで服用

kel : $0.1167 \pm 0.0445 \text{ hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食経口投与)

2) 水ありで服用

kel : $0.1400 \pm 0.0448 \text{ hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食経口投与)

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」²⁴⁾

kel : $0.1111 \pm 0.0371 \text{ hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食経口投与)

(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

VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 2)を参照

(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・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・用量に関連する使用上の注意とその理由

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーワ」

該当しない

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーワ」

【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)

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」

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)、 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

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、けん怠感、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)上昇、ALT(GPT)上昇、 γ -GTP上昇、LDH上昇、Al-P上昇、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

添付文書より抜粋

【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)、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。

9. 高齢者への投与

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

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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- 2) 授乳中の女性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

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーワ」

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg/5mg「トーワ」

小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の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)

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」

小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は2歳未満の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

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

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーフ」

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。]

オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg/5mg「トーフ」

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。]

2) 服用時：

- (1) 本剤は舌の上へのせ、唾液を浸潤させて、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。
- (2) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

15. その他の注意

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（普通錠）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。

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

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

該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(外箱、ラベルに記載)

3. 貯法・保存条件

貯法：室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

(2) 薬剤交付時の取扱いについて

患者向け医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：有

(3) 調剤時の留意点について

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

製品名	包装形態	内容量(重量、容量又は個数等)
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「トーワ」	PTP 包装	100 錠 140 錠(14 錠×10)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「トーワ」	PTP 包装	100 錠、500 錠、1000 錠 140 錠(14 錠×10)
	バラ包装	300 錠
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」	PTP 包装	100 錠
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	PTP 包装	100 錠、500 錠 140 錠(14 錠×10)
	バラ包装	100 錠
オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」	分包包装	0.5g×200 包
	バラ包装	100g

7. 容器の材質

製品名	包装形態	材質
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリプロピレン、アルミ箔
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリプロピレン、アルミ箔
	バラ包装	瓶、蓋 : ポリエチレン
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリプロピレン、アルミ箔 ピロー : アルミ・ポリエチレンラミネート
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリプロピレン、アルミ箔 ピロー : アルミ・ポリエチレンラミネート
	バラ包装	瓶、蓋 : ポリエチレン
オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」	分包包装	分包 : セロファン・ポリエチレン・アル ミニウムラミネート
	バラ包装	瓶、蓋 : ポリエチレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アレロック錠 2.5、アレロック錠 5、アレロック OD 錠 2.5、アレロック OD 錠 5、アレ
ロック顆粒 0.5%

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

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

製品名	製造販売承認年月日	承認番号	備考
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」	2012年8月15日	22400AMX00969000	
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」	2012年8月15日	22400AMX00970000	
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」	2014年2月14日	22600AMX00413000	
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	2014年2月14日	22600AMX00324000	
オロパタジン塩酸塩 顆粒 0.5%「トーワ」	2014年8月15日	22600AMX01078000	

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日	備考
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「トーワ」	2012年12月14日	
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」	2012年12月14日	
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」	2014年6月20日	
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	2014年6月20日	
オロパタジン塩酸塩 顆粒 0.5%「トーワ」	2014年12月12日	

12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg/5mg「トーワ」

オロパタジン塩酸塩 0D 錠 2.5mg/5mg「トーワ」

効能・効果、用法・用量追加年月日：2014年11月20日

内容：以下の下線部分を追加した。

	旧	新
効能・効果	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）	<u>成人：</u> 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） <u>小児：</u> <u>アレルギー性鼻炎</u> <u>蕁麻疹</u> <u>皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）に伴うそう痒</u>
用法・用量	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。	<u>成人：</u> 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。 <u>小児：</u> <u>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。</u>

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」

効能・効果、用法・用量追加年月日：2014年12月10日

内容：以下の下線部分を追加した。

	旧	新
効能・効果	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）	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
用法・用量	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。	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（顆粒剤として1g）を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーフ」

用法・用量追加年月日：2015年11月4日

内容：以下の下線部分を追加した。

	旧	新
用法・用量	<p>成人： 通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mg(顆粒剤として1g)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。</p> <p>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(顆粒剤として1g)を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。</p>	<p>成人： 通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mg(顆粒剤として1g)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。</p> <p>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(顆粒剤として1g)を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。 <u>通常、2歳以上7歳未満の小児には1回オロパタジン塩酸塩として2.5mg(顆粒剤として0.5g)を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。</u></p>

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

製品名	HOT 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「トーワ」	121951701	4490025F1236	622195101
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「トーワ」	121952401	4490025F2232	622195201
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「トーワ」	123383401	4490025F3140	622338301
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「トーワ」	123384101	4490025F4146	622338401
オロパタジン塩酸塩 顆粒 0.5% 「トーワ」	123717701	4490025D1030	622371701

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) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(錠 2.5mg)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(錠 5mg)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(OD 錠 2.5mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(OD 錠 5mg)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(顆粒 0.5%)
- 6) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(錠 2.5mg)
- 7) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(錠 5mg)
- 8) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(OD 錠 2.5mg)
- 9) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(OD 錠 5mg)
- 10) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(顆粒 0.5%)
- 11) 東和薬品株式会社 社内資料：分割後の安定性試験(錠 5mg)
- 12) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(錠 2.5mg)
- 13) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(錠 5mg)
- 14) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(OD 錠 2.5mg)
- 15) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(OD 錠 5mg)
- 16) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(顆粒 0.5%)
- 17) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(錠 2.5mg)
- 18) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(錠 5mg)
- 19) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(OD 錠 2.5mg)
- 20) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(OD 錠 5mg)
- 21) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(顆粒 0.5%)
- 22) 上村 康二ほか：新薬と臨牀, 61(9), 196, 2012
- 23) 陶 易王ほか：新薬と臨牀, 63(3), 128, 2014
- 24) 陶 易王ほか：医学と薬学, 71(10), 1861, 2014
- 25) 東和薬品株式会社 社内資料：自動分包機落下試験(湯山製作所製)(OD 錠 2.5mg/5mg)
- 26) 東和薬品株式会社 社内資料：自動分包機落下試験(タカゾノ製)(OD 錠 2.5mg/5mg)

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

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

東和薬品株式会社 製品情報ホームページ

<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/product/index.php>

自動分包機落下試験

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg/5mg「トーワ」

1) 湯山製作所製 全自動錠剤分包機(YS-TR-260FDS II) 20)

検 体：オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「トーワ」及びオロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「トーワ」を Initial(開封直後)及び加湿条件(25℃75%RH、7日間)下で保存したもの

試験方法：各検体について、ローターカセットで一番負荷がかかると考えられる最上段(5段目)及び負荷のかかりにくいと考えられる最下段(1段目)に装着した。

判 定：目視による割れ・欠けの有無

結 果：

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「トーワ」	1包あたり1錠包装		1包あたり5錠包装	
	1段目	5段目	1段目	5段目
Initial	0/50包	0/50包	0/50包	0/50包
25℃75%RH・7日間	0/50包	0/50包	0/50包	0/50包
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「トーワ」	1包あたり1錠包装		1包あたり5錠包装	
	1段目	5段目	1段目	5段目
Initial	0/50包	0/50包	0/50包	0/50包
25℃75%RH・7日間	0/50包	0/50包	0/50包	0/50包

(1包中割れ・欠けが目視で認められた錠剤数/分包数)

加湿の有無に関わらず、全ての条件で割れ・欠けを認める検体はなかった。

ただし、ローターカセット内部に目視で確認できる程度の粉の付着が認められた。

2) タカゾノ製 全自動錠剤分包機 ESER 128HS GP (HP-J128HS)²¹⁾

検 体：オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「トーフ」及びオロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg
「トーフ」を Initial(開封直後)及び加湿条件(25℃75%RH、7日間)下で保存したもの

試験方法：

- ① 排出試験；錠剤カセットからの錠剤の排出状況と錠剤品質への影響を確認するため、錠剤カセットの動作確認用の自動排出装置を用い、各検体を 5000 錠連続で錠剤カセットから排出した。
- ② 分包試験；分包機で自動分包を実施することによる錠剤品質への影響及び分包機内の状況を確認するため、各検体を充填した錠剤カセット分包機の最上段(8 段目)に装着し、1 包あたり 1 錠または 5 錠で分包した(各 50 包)。分包速度は標準(約 50 包/分)とした。

判 定：目視による割れ・欠けの有無

結 果：

- ① 排出試験；5000 錠連続排出テストにおいて、全ての検体が錠剤カセットから良好に排出され、錠剤の品質に影響を及ぼす割れ・欠けは確認されなかった。
- ② 分包試験；最上段(8 段目)からの試験において、全ての検体で品質に影響を及ぼす錠剤の割れ・欠けは確認されなかった。

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「トーフ」	1 包あたり 1 錠包装	1 包あたり 5 錠包装
	8 段目	8 段目
Initial	0 / 50 包	0 / 50 包
25℃75%RH・7 日間	0 / 50 包	0 / 50 包
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「トーフ」	1 包あたり 1 錠包装	1 包あたり 5 錠包装
	8 段目	8 段目
Initial	0 / 50 包	0 / 50 包
25℃75%RH・7 日間	0 / 50 包	0 / 50 包

(1 包中割れ・欠けが目視で認められた錠剤数/分包数)

自動分包機における留意事項：

口腔内崩壊錠についてはわずかではあるが粉立ちが避けられない。定期的なローターカセット内外の清掃が必要と考えられ、落下の衝撃を少なくするためにも、ローターカセット位置は下段を使用することが望ましい。

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」 配合変化試験成績

配合変化試験

■目的

オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」の薬剤及び飲食物との配合時における安定性を確認するため、配合変化試験を実施した。

■方法

(1) 配合方法

本剤に薬剤または飲食物を加えて混合し、検体とした。

(2) 保存条件

1) 薬剤

1000lux 散光下・25℃、60%RH 保存

ただし、小児用ムコソルバン DS1.5%及びニポラジン小児用細粒 0.6%は遮光保存（アルミ箔を覆う）とした。

2) 飲食物

室内散光下・室温(成り行き温度及び湿度)及び遮光・5℃保存

(3) 試験方法

1) 外観

目視にて外観(色調、混濁、沈殿の有無等)の確認。

2) 流動性(固体製剤のみ)

目視にて流動性を判断。

3) 残存率

液体クロマトグラフィー

(4) 測定時点

1) 薬剤

配合直後、7日後、14日後及び30日後

2) 飲食物

配合直後及び1日後

(5) 測定回数

各試験 n=1 とした。

■結果

(1) 薬剤との配合

試験日：2014年10月

分類	配合薬		オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーフ」 色調：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤 含量：99.5(%)					
	品名 (メーカー名)	配合量	試験項目	配合前* (配合薬)	配合直後	7日後	14日後	30日後
気管支喘息治療剤 ロイコトリエン受容体拮抗剤	برانلکاست DS10%「トーフ」 (東和薬品)	本剤：1g 配合薬：4.5g	外観	白色～微黄色の顆粒	白色顆粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	98.2	97.1	97.6
抗アレルギー剤	ペリアクチン散1% (日医工)	本剤：1g 配合薬：1.2g	外観	白色の粉末	白色顆粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	100.4	98.5	99.8
気管支拡張剤	メブチンドライシロップ0.005% (大塚製薬)	本剤：1g 配合薬：2g	外観	白色の粒又は粉末	白色顆粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	101.0	98.7	99.1
気道粘液調整剤 粘膜正常化剤	ムコダインDS50% (杏林)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	白色の微粒状	白色顆粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	102.0	99.3	101.5
気道潤滑去痰剤	ムコサルドライシロップ1.5% (ペーリンガー)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	白色～微黄色の粒状または粉末	白色顆粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	101.1	100.2	101.3
鎮咳剤	アスベリン散10% (田辺三菱)	本剤：1g 配合薬：0.6g	外観	だいたい色の微粒状の散剤	橙色顆粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	101.3	100.4	100.5
鎮咳剤	アスベリンドライシロップ2% (田辺三菱)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	だいたい色の微粒状の散剤	橙色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	101.5	99.1	100.2
ニューキノロン系 経口抗菌剤	オゼックス細粒小児用15% (富山化学)	本剤：1g 配合薬：2.4g	外観	淡赤色の細粒	淡赤色細粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	101.2	100.4	100.0

*：製品の添付文書情報より記載

分類	配合薬		オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」 色調：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤 含量：99.5(%)					
	品名 (メーカー名)	配合量	試験項目	配合前* (配合薬)	配合直後	7日後	14日後	30日後
マクロライド系 生物質製剤	クラリスロマイシンDS 小児用10%「トーワ」 (東和薬品)	本剤：1g 配合薬：4g	外観	白色～帯黄白色の粉末	白色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	100.2	98.6	98.3
15員環マクロライド系 生物質製剤	ジスロマック細粒 小児用10% (ファイザー)	本剤：1g 配合薬：5g	外観	淡いだいだい色の細粒	淡橙色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	101.5	99.3	101.3
合成ペニシリン製剤	パセトシン細粒10% (協和発酵キリン)	本剤：1g 配合薬：10g	外観	だいだい色の細粒	橙色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	102.6	99.9	102.2
経口用セフェム系 生物質製剤	セフニール細粒 小児用10% (東和薬品)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	淡赤白色の細粒	淡赤白色顆粒と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	100.6	99.4	100.4
	セフカベンピボキシル塩酸塩細粒小児用10% 「トーワ」 (東和薬品)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	白色の粒を含む赤白色の細粒	赤白色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	99.8	99.9	100.2
	セフジトレンピボキシル細粒小児用10% 「トーワ」 (東和薬品)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	だいだい色の細粒	橙色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	102.5	101.1	97.0
耐整腸乳酸菌	ピオフェルミンR散 (武田薬品)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	白色～わずかに淡黄褐色の粉末状の散剤	白色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	101.4	99.2	100.6
解熱鎮痛剤	サールツー細粒20% (東和薬品)	本剤：1g 配合薬：7.5g	外観	淡橙色の細粒	淡橙色粉末と帯赤褐色顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	—	良	同左	同左
			残存率(%)	—	100.0	102.8	100.2	102.1

*：製品の添付文書情報より記載

試験日：2017年12月

分類	配合薬		オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」 色調：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤 含量：101.8 (%)				
	品名 (メーカー)	配合量	試験項目	配合直後	7日後	14日後	30日後
気道潤滑去痰剤	小児用ムコソルバン DS1.5% (帝人ファーマ)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	ヨーグルト様 のにおいのある 白色の粒と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	100.6	100.5	101.5	102.9
			残存率 (%)	100.0	99.9	100.9	102.3
抗 プ ラ ス ミ ン 剤	トランサミン散 50% (第一三共)	本剤：1g 配合薬：4g	外観	白色の散剤と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	100.7	100.6	101.6	101.3
			残存率 (%)	100.0	99.9	100.9	100.6
生 菌 製 剤	ミヤ BM 細粒 (ミヤリサン製薬)	本剤：1g 配合薬：1.5g	外観	白色の細粒剤 と帯赤褐色の 顆粒剤の混合 物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	102.0	102.0	100.9	100.2
			残存率 (%)	100.0	100.0	98.9	98.2
乳 酸 菌 整 腸 剤	ビオフェルミン 配合散 (武田薬品工業)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	白色の粉末と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	101.9	101.6	101.0	101.5
			残存率 (%)	100.0	99.7	99.1	99.6
抗 ヒ ス タ ミ ン 剤 持 続 性	テルギンG ドライシ ロップ0.1% (高田製薬)	本剤：1g 配合薬：1.3g	外観	白色の細粒と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	101.4	101.6	101.5	100.4
			残存率 (%)	100.0	100.2	100.1	99.0

分類	配合薬		オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5%「トーワ」 色調：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤 含量：101.8 (%)				
	品名 (メーカー)	配合量	試験 項目	配合直後	7日後	14日後	30日後
経口用カルバペネム系 抗生物質製剤	オラペネム小児用 細粒 10% (Meiji Seika ファルマ)	本剤：1g 配合薬：6.7g	外観	芳香のある帯 黄淡赤色の細 粒と帯赤褐色 の顆粒剤の混 合物	同左	同左	わずかに芳香 のある帯黄淡 赤色の細粒と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	100.5	101.5	101.0	100.8
			残存率 (%)	100.0	101.0	100.5	100.3
整腸剤	ラックビー微粒 N (興和創薬)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	白色の散剤と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	101.8	102.6	101.1	100.7
			残存率 (%)	100.0	100.8	99.3	98.9
抗インフルエンザ ウイルス剤	タミフル ドライシロップ 3% (中外製薬)	本剤：1g 配合薬：5g	外観	芳香のある塊 のある白色の 顆粒と帯赤褐 色の顆粒剤の 混合物	同左	同左	わずかに芳香 のある塊のあ る白色の顆粒 と帯赤褐色の 顆粒剤の混合 物
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	101.8	101.3	100.2	101.2
			残存率 (%)	100.0	99.5	98.4	99.4
抗生物質・化学療法 剤耐性乳酸菌製剤	レベニン散 (わかもと製薬)	本剤：1g 配合薬：3g	外観	白色の散剤と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	102.0	103.0	101.0	100.7
			残存率 (%)	100.0	101.0	99.0	98.7
持続性選択 H ₁ 受容体拮抗・ アレルギー性疾患治療剤	ジルテックドライ シロップ 1.25% (グラクソ・ スミスクライン)	本剤：1g 配合薬：0.8g	外観	芳香のある白 色のドライシ ロップ剤と帯 赤褐色の顆粒 剤の混合物	同左	同左	白色のドライ シロップ剤と 帯赤褐色の顆 粒剤の混合物
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	101.3	101.5	101.1	101.3
			残存率 (%)	100.0	100.2	99.8	100.0

分類	配合薬		オロパタジン塩酸塩顆粒 0.5% 「トーワ」 色調：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤 含量：101.8 (%)				
	品名 (メーカー)	配合量	試験項目	配合直後	7日後	14日後	30日後
アレルギー性疾患 治療剤	ニボラジン小児用 細粒 0.6% (アルフレッサ ファーマ)	本剤：1g 配合薬：2g	外観	芳香のある白色の細粒と帯赤褐色の顆粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	102.0	101.4	102.6	100.5
			残存率 (%)	100.0	99.4	100.6	98.5
閉塞性気道疾患 患者用剤	ホクナリンドライ シロップ 0.1% 小児用 (マイラン EPD 合同会社)	本剤：1g 配合薬：2g	外観	白色顆粒状シロップと帯赤褐色の顆粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	102.4	101.9	101.6	101.0
			残存率 (%)	100.0	99.5	99.2	98.6
閉塞性気道疾患 患者用剤	ツロブテロール塩 酸塩 DS 小児用 0.1% 「トーワ」 (東和薬品)	本剤：1g 配合薬：2g	外観	白色の顆粒と帯赤褐色の顆粒剤の混合物	同左	同左	同左
			流動性	良好	変化なし	同左	同左
			含量 (%)	101.5	101.3	100.7	100.2
			残存率 (%)	100.0	99.8	99.2	98.7

(2) 飲食物との配合

分類	配合薬		オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーワ」 色調：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤 含量：99.5(%)			
	品名 (メーカー名)	配合量	試験項目	配合直後	1日後 (室温)	1日後 (5℃)
飲 料	Suntory 天然水 (サントリーフーズ)	本剤：0.5g 飲料：5mL	外観	赤橙色の懸濁液	赤橙色の懸濁液で、 赤褐色の沈殿あり	赤橙白色の 懸濁液
			残存率(%)	100.0	100.3	98.6
	健康ミネラル麦茶 (伊藤園)		外観	赤橙色の懸濁液	帯黄赤橙白色の懸濁液 で、赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	98.6	99.2
	サントリー烏龍茶 (サントリーフーズ)		外観	わずかに褐色を 帯びた赤橙色の 懸濁液	帯褐赤橙白色の懸濁液 で、赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	100.1	99.0
	カルピスウォーター (カルピス)		外観	わずかに白色を 帯びた赤橙色の 懸濁液	帯赤橙白色の懸濁液 で、赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	99.1	100.3
	バンホーテンココア (明治)		外観	帯白赤褐色の 懸濁液	褐色の懸濁液で、 赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	99.2	99.4
	アケリアス (日本コカ・コーラ)		外観	赤橙色の懸濁液	赤橙白色の懸濁液で、 赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	99.5	99.6
	ヤクルト (ヤクルト)		外観	帯白赤橙色の 懸濁液	帯赤橙白色の懸濁液で、 赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	99.6	100.0
	なっちゃんアップル (サントリーフーズ)		外観	赤橙色の懸濁液	赤橙白色の懸濁液で、 赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	99.7	99.5
	なっちゃんオレンジ (サントリーフーズ)		外観	赤橙色の懸濁液	帯黄赤橙白色の懸濁液 で、赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	100.2	100.0
	明治 おいしい牛乳 (明治)		外観	帯褐赤白色の 懸濁液	帯赤白色の懸濁液で、 赤褐色の沈殿あり	同左
			残存率(%)	100.0	97.8	100.2

分類	配合薬		オロパタジン塩酸塩顆粒0.5%「トーフ」 色調：白色の粒を含む帯赤褐色の顆粒剤 含量：99.5(%)			
	品名 (メーカー名)	配合量	試験項目	配合直後	1日後 (室温)	1日後 (5℃)
食 品	プッチンプリン (グリコ)	本剤：0.5g 食品：小さじ1杯	外観	帯白赤褐色と 帯黄白色の 半固形物	同左	同左
			残存率(%)	100.0	99.5	99.2
	ハーゲンダッツ バニラ (ハーゲンダッツジャパン)		外観	帯褐赤白色の 懸濁液	同左	同左
			残存率(%)	100.0	98.3	98.2
	十勝ヨーグルト (明治)		外観	帯褐赤白色の 半固形物	同左	同左
			残存率(%)	100.0	96.3	99.6
	おくすり飲めたね (いちご味) (龍角散)		外観	わずかに褐色を 帯びた半固形物	同左	同左
			残存率(%)	100.0	99.1	99.7



製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号