

## 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

**オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「杏林」****オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「杏林」**

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD Tablets

(オロパタジン塩酸塩口腔内崩壊錠)

剤形	素錠（口腔内崩壊錠）
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「杏林」： 1 錠中、日局オロパタジン塩酸塩 2.5mg 含有 オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「杏林」： 1 錠中、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 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2013年 2月15日 薬価基準収載年月日：2020年 8月26日（承継・販売名変更による） 発売年月日：2013年 6月21日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：8時～22時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.kyorin-rmd.co.jp/">https://www.kyorin-rmd.co.jp/</a>

本 IF は 2020 年 7 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

# I F 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、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、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 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F 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-I F）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-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）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-I F 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-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F 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、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 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 A 4 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、添付文書で赤字・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 2013」（以下、「 I F 記載要領 2013」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（ P D F ）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 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、「 I F 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 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 2013」においては、 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ある。

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 M R 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、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	VII. 薬物動態に関する項目	13
1. 開発の経緯	1	1. 血中濃度の推移・測定法	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬物速度論的パラメータ	15
II. 名称に関する項目	2	3. 吸収	15
1. 販売名	2	4. 分布	15
2. 一般名	2	5. 代謝	16
3. 構造式又は示性式	2	6. 排泄	16
4. 分子式及び分子量	2	7. トランスポーターに関する情報	16
5. 化学名(命名法)	2	8. 透析等による除去率	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	17
7. CAS登録番号	2	1. 警告内容とその理由	17
III. 有効成分に関する項目	3	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	17
1. 物理化学的性質	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17
3. 有効成分の確認試験法	3	5. 慎重投与内容とその理由	17
4. 有効成分の定量法	3	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17
IV. 製剤に関する項目	4	7. 相互作用	17
1. 剤形	4	8. 副作用	18
2. 製剤の組成	4	9. 高齢者への投与	19
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	11. 小児等への投与	19
5. 調製法及び溶解後の安定性	6	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	13. 過量投与	19
7. 溶出性	7	14. 適用上の注意	20
8. 生物学的試験法	9	15. その他の注意	20
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	9	16. その他	20
10. 製剤中の有効成分の定量法	9	IX. 非臨床試験に関する項目	21
11. 力価	9	1. 薬理試験	21
12. 混入する可能性のある夾雑物	9	2. 毒性試験	21
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	9	X. 管理的事項に関する項目	22
14. その他	9	1. 規制区分	22
V. 治療に関する項目	10	2. 有効期間又は使用期限	22
1. 効能又は効果	10	3. 貯法・保存条件	22
2. 用法及び用量	10	4. 薬剤取扱い上の注意点	22
3. 臨床成績	10	5. 承認条件等	22
VI. 薬効薬理に関する項目	12	6. 包装	22
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12	7. 容器の材質	22
2. 薬理作用	12	8. 同一成分・同効薬	23
		9. 国際誕生年月日	23
		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
		11. 薬価基準収載年月日	23

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	23
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	23
14. 再審査期間	23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
16. 各種コード	24
17. 保険給付上の注意	24
<b>XI. 文献</b>	<b>25</b>
1. 引用文献	25
2. その他の参考文献	25
<b>XII. 参考資料</b>	<b>26</b>
1. 主な外国での発売状況	26
2. 海外における臨床支援情報	26
<b>XIII. 備考</b>	<b>27</b>
1. その他の関連資料	27

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

共和薬品工業株式会社が後発医薬品として薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2013 年 2 月に承認を取得、2013 年 6 月に「オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「アメル」」及び「オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「アメル」」として薬価収載し、販売を開始した。

2020 年 1 月にキョーリンリメディオ株式会社が共和薬品工業株式会社より販売を移管され、販売を開始した。

2020 年 7 月に共和薬品工業株式会社からキョーリンリメディオ株式会社に製造販売承認を承継し、承継に際し販売名(屋号)を「オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「杏林」」及び「オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」」に変更し、2020 年 8 月薬価収載した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1)抗アレルギー薬。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。

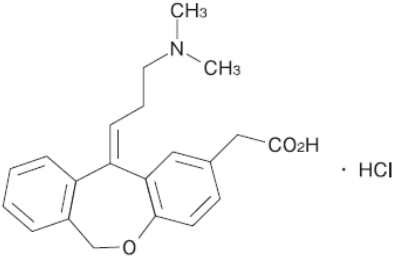
1)

(2)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。

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。

(VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目、8. 副作用(2)重大な副作用と初期症状の項を参照)

## 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 錠 2.5mg 「杏林」 オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「杏林」
(2) 洋名	OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD Tablets 2.5mg “KYORIN” OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD Tablets 5mg “KYORIN”
(3) 名称の由来	一般名＋剤形＋規格(含量)＋「杏林」
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-[(1Z)-3-(Dimethylamino)propylidene]-6,11-dihydrodibenzo[ <i>b, e</i> ]oxepin-2-yl}acetic acid monohydrochloride (IUPAC)
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 (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。0.1mol/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	pH：1.0g を水 100mL に溶かした液の pH は 2.3～3.3 である。
2. 有効成分の各種条件下における安定性	該当資料なし
3. 有効成分の確認試験法	日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」の確認試験による。 (1) 紫外可視吸光度測定法 (2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法） (3) 塩化物の定性反応(2)
4. 有効成分の定量法	日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」の定量法による。 電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸で滴定）



## 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 OD 錠 2.5mg「杏林」	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」
剤形	素錠	割線入り素錠
色調	ごくうすい黄色	
外観		
直径(mm)	6.5	8.0
厚さ(mm)	2.7	3.6
質量(mg)	100	200

#### (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 OD 錠 2.5mg「杏林」：KRM287  
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」：KRM288

#### (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 錠 2.5mg「杏林」：  
1錠中、日局オロパタジン塩酸塩 2.5mg 含有  
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」：  
1錠中、日局オロパタジン塩酸塩 5mg 含有

#### (2) 添加物

D-マンニトール、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、精製ステビア抽出物、スクラロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、黄色三二酸化鉄、香料、バニリン

#### (3) その他

特になし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## IV. 製剤に関する項目

### 4. 製剤の各種条件下における安定性

#### 【加速試験】<sup>2)</sup>

##### 〔オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「杏林」〕

PTP 包装品 [保存条件：40℃、75%RH、6ヶ月間] (3ロット、各ロット n=3)

試験項目	規格値	開始時	6ヶ月
性状	ごくうすい黄色の円形の素錠	ごくうすい黄色の円形の素錠	変化なし
確認試験	紫外可視吸光度測定法	適	適
製剤均一性試験	日局 含量均一性試験	適	適
崩壊試験	日局 崩壊試験法 (1)即放性製剤	適	適
溶出試験	15分間 85%以上	適	適
定量試験	95.0~105.0%	101.3%	101.7%

##### 〔オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「杏林」〕

PTP 包装品 [保存条件：40℃、75%RH、6ヶ月間] (3ロット、各ロット n=3)

試験項目	規格値	開始時	6ヶ月
性状	ごくうすい黄色の円形の割線入り素錠	ごくうすい黄色の円形の割線入り素錠	変化なし
確認試験	紫外可視吸光度測定法	適	適
製剤均一性試験	日局 含量均一性試験	適	適
崩壊試験	日局 崩壊試験法 (1)即放性製剤	適	適
溶出試験	15分間 85%以上	適	適
定量試験	95.0~105.0%	101.3%	101.2%

#### 【無包装状態での安定性】

##### 〔オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「杏林」〕<sup>3)</sup>

保存条件	結果				
	性状	純度試験	溶出性	含量	硬度
温度 [40℃、75%RH、90日間、遮光・気密容器]	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、90日間、遮光・開放]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格外) <sup>※1</sup>
光 [曝光量 120万 lx・hr、25℃、45%RH、開放]	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※2</sup>	変化なし

[規格] 性状：ごくうすい黄色の円形の素錠、純度試験：総類縁物質 1.0%以下、溶出性：15分間 85%以上、含量：95.0~105.0%、硬度：2.0kg 以上

※1 2.8kg(開始時)→1.6kg(30日目)、1.6kg(60日目)、1.5kg(90日目)

※2 100.1%(開始時)→99.6%(30万 lx・hr)、98.1%(60万 lx・hr)、96.6%(120万 lx・hr)

## IV. 製剤に関する項目

[オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「杏林」]<sup>4)</sup>

保存条件	結果				
	性状	純度試験	溶出性	含量	硬度
温度 [40℃、75%RH、90 日間、遮光・気密 容器]	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、90 日間、遮光・開放]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※1</sup>
光 [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 45%RH、開放]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：ごくうすい黄色の円形の割線入り素錠、純度試験：総類縁物質 1.0%以下、溶出性：15 分間 85%以上、含量：95.0～105.0%、硬度：2.0kg 以上

※1 3.1kg(開始時)→2.0kg(30 日目)、2.1kg(60 日目)、2.2kg(90 日目)

<参考>評価基準

分類	外観 (性状)	純度試験 溶出性	含量	硬度
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	規格値内 の場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化 (退色等)等を認め るが、品質上、問題 とならない程度の変 化であり、規格を満 たしている場合		含量低下が3% 以上で、規格値 内の場合	硬度変化が 30%以上で、 硬度が2.0kg 重 以上の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色 調変化等を認め、規 格を逸脱している場 合	規格値外 の場合	規格値外 の場合	硬度変化が30% 以上で、 硬度が2.0kg 重 未満の場合

平成 11 年 8 月 20 日付「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)」(日本病院薬剤師会)一部改変

本資料は本剤の安定性に関する資料であり、無包装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施していません。

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)

該当しない

## IV. 製剤に関する項目

### 7. 溶出性

#### 【溶出挙動における同等性】<sup>5)</sup>

##### [オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「杏林」]

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(薬食審査発第 1124004 号平成 18 年 11 月 24 日)に従い、標準製剤との溶出挙動の比較を行った。

#### <試験方法>

試験法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法

試験液：水 900mL

試験液の温度：37±0.5℃

回転数：50 回転/分

#### (1) 平均溶出率

#### <判定基準>

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する。

#### <結果>

試験条件	判定 時点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率(%)		判定 結果
		オロパタジン 塩酸塩 OD錠 2.5mg「杏林」	標準製剤 (オロパタジン塩酸 塩 OD錠 5mg「杏林」)	
水/50rpm	15	101.0	102.2	適合

#### (2) 個々の溶出率

#### <判定基準>

個々の溶出率が±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。

#### <結果>

試験条件	判定 時点 (分)	12 ベッセルの溶出率(%)		判定 結果
		平均値	範囲 (最小値～最大値)	
水/50rpm	15	101.0	99.2 ~ 102.5	適合

#### 【溶出挙動における類似性】<sup>5)</sup>

##### [オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「杏林」]

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(薬食審査発第 1124004 号平成 18 年 11 月 24 日)に従い、標準製剤との溶出挙動の比較を行った。

#### <試験方法>

試験法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験液：以下の試験液 900mL

試験液の温度：37±0.5℃

## IV. 製剤に関する項目

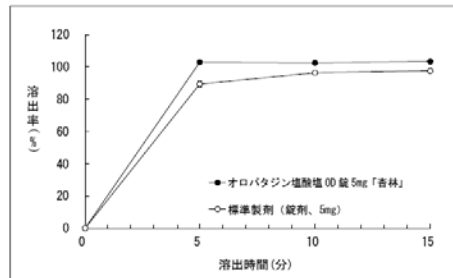
### <判定基準>

回転数	試験液	判定
50	pH1.2	試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。
	pH5.0	
	pH6.8	
	水	
100	pH1.2	

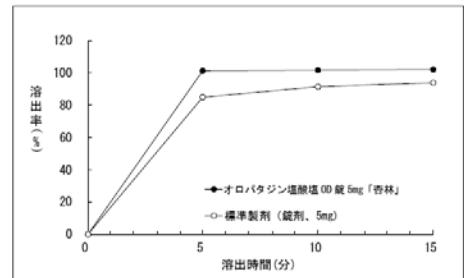
### <結果>

試験条件	判定時間(分)	平均溶出率(%)		判定結果
		オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「杏林」	標準製剤 (OD錠, 5mg)	
pH1.2/50rpm	15	103.2	97.4	適合
pH5.0/50rpm	15	102.2	94.1	適合
pH6.8/50rpm	15	103.2	97.1	適合
水/50rpm	15	102.2	94.9	適合
pH1.2/100rpm	15	102.3	95.1	適合

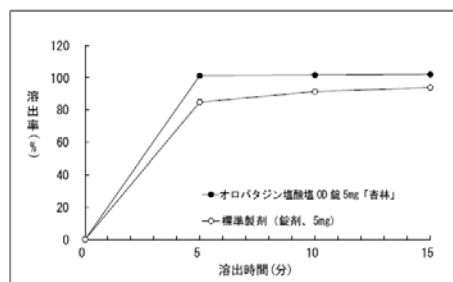
50rpm[pH1.2]



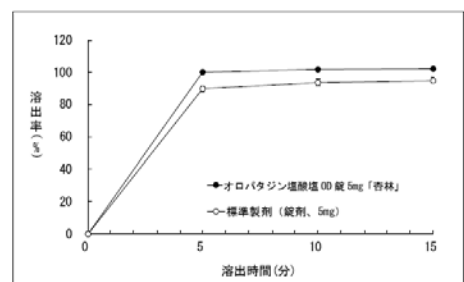
50rpm[pH5.0]



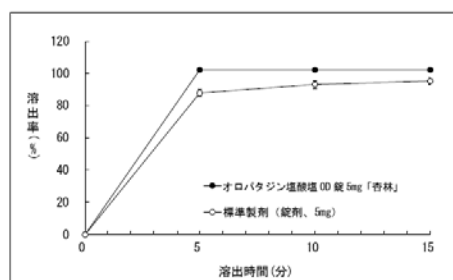
50rpm[pH6.8]



50rpm[水]



100rpm[pH1.2]



## IV. 製剤に関する項目

---

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	紫外可視吸光度測定法
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	該当資料なし
13. 注意が必要な容器・ 外観が特殊な容器に 関する情報	特になし
14. その他	特になし

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	<p>成人：アレルギー性鼻炎 蕁麻疹 皮膚疾患に伴う痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚う痒症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑）</p> <p>小児：アレルギー性鼻炎 蕁麻疹 皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚う痒症）に伴う痒</p>
2. 用法及び用量	<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を朝及び就寝前の1日2回経口投与する。</p>
<p>＜用法・用量に関連する使用上の注意＞</p> <p>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）</p>	
<p>3. 臨床成績</p> <p>(1) 臨床データパッケージ</p> <p>(2) 臨床効果</p> <p>(3) 臨床薬理試験</p> <p>(4) 探索的試験</p> <p>(5) 検証的試験</p> <p>1) 無作為化並行用量反応試験</p> <p>2) 比較試験</p> <p>3) 安全性試験</p> <p>4) 患者・病態別試験</p>	<p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p>

## V. 治療に関する項目

---

(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	第2世代H <sub>1</sub> 受容体拮抗薬： ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、エメダスチンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩
2. 薬理作用	抗アレルギー薬。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抑制作用も有する。 <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

VII. 薬物動態に関する項目、1. 血中濃度の推移・測定法(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】<sup>6)</sup>

##### 【オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「杏林」】

「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（薬食審査発第 1124004 号 平成 18 年 11 月 24 日）」に基づき、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「杏林」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

(IV. 製剤に関する項目 7. 溶出性の項を参照)

##### 【オロパタジン塩酸塩 OD5mg「杏林」】

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（薬食審査発第 1124004 号 平成 18 年 11 月 24 日）に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

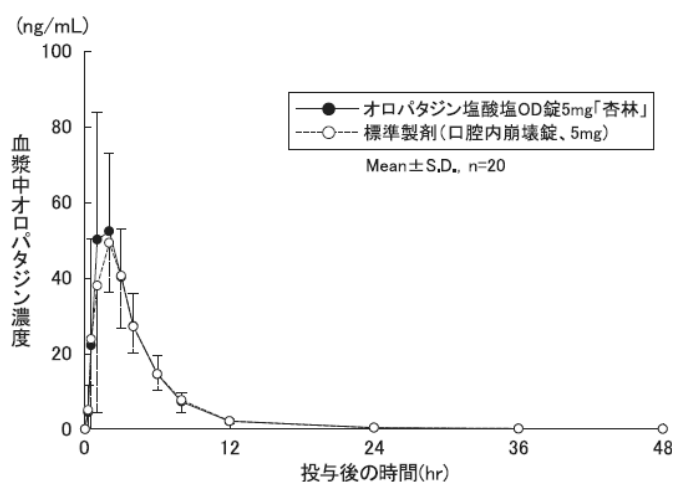
生物学的同等性試験オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「杏林」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）健康成人男子に水なし又は水ありで絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

－水なし－

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→48</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5 mg「杏林」	255.6 ±44.4	72.8 ±15.5	1.5 ±0.8	11.0 ±9.2
標準製剤 (口腔内崩壊錠、5mg)	245.8 ±43.7	64.9 ±15.7	1.8 ±0.7	10.6 ±6.5

(Mean ± S. D., n=20)

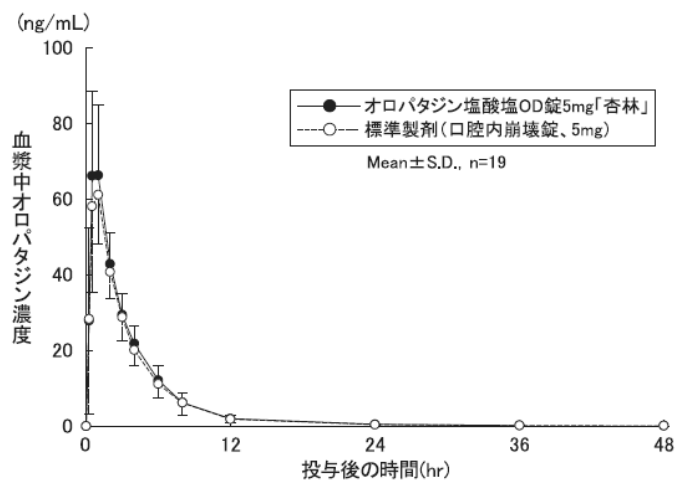
## VII. 薬物動態に関する項目



—水あり—

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→48</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「杏林」	253.4 ±48.3	76.9 ±19.0	0.8 ±0.4	10.0 ±7.7
標準製剤 (口腔内崩壊錠、5mg)	237.1 ±41.2	69.0 ±14.0	0.7 ±0.3	11.5 ±8.7

(Mean ± S. D., n=19)



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

## VII. 薬物動態に関する項目

(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	該当資料なし
(5) クリアランス	健康成人男子（摂食下）にオロパタジン塩酸塩 10mg を単回経口投与したときのクリアランス CL/F は平均で 19.33L/hr と算出された。 <sup>1)</sup>
(6) 分布容積	健康成人男子（摂食下）にオロパタジン塩酸塩 10mg を単回経口投与したときの分布容積 $Vd\beta/F$ は平均で 305L と算出された。 <sup>1)</sup>
(7) 血漿蛋白結合率	健康成人男子（摂食下）にオロパタジン塩酸塩 10mg を単回経口投与したとき、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	該当資料なし
(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. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)の項を参照

## VII. 薬物動態に関する項目

(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	健康成人にオロパタジン塩酸塩 5mg 及び 10mg を単回経口投与した場合の 48 時間までの未変化体の尿中排泄率は、投与量の 63.0~71.8%であった。また、1 回 10mg を 1 日 2 回 6 日間、7 日目に 1 回の計 13 回反復経口投与した時、単回経口投与後の尿中排泄率と同程度であった。 <sup>1)</sup>
(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)	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>【禁忌（次の患者には投与しないこと）】</b> 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者</p> </div>
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、2. 用法及び用量＜用法・用量に関連する使用上の注意＞の項を参照
5. 慎重投与内容とその理由	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）</b></p> <p>(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。]</p> <p>(2) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）</p> <p>(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。]</p> </div>
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>重要な基本的注意</b></p> <p>(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。</p> <p>(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。</p> <p>(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。</p> <p>(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。</p> </div>
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

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 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、A1-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。

分類	副作用（頻度不明）
過敏症 <sup>注)</sup>	紅斑等の発疹、浮腫（顔面・四肢等）、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)、 $\gamma$ -GTP、LDH、A1-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

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(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	<p>(1) 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</p> <p>(2) その他の副作用（頻度不明） 過敏症：紅斑等の発疹、浮腫（顔面・四肢等）、う痒、呼吸困難 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。</p>
9. 高齢者への投与	<p>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。</p>
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	<p>(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。]</p> <p>(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。]</p>
11. 小児等への投与	<p>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）。</p>
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	<p>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。</p>
13. 過量投与	該当資料なし



## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 14. 適用上の注意

#### (1) 薬剤交付時：

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。(PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を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：

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。

### 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（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

特になし

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

---

1. 薬理試験	
(1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）	
(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 OD錠 2.5mg「杏林」	該当しない
		オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「杏林」	該当しない
	有効成分	オロパタジン塩酸塩	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 <sup>2)</sup> ）		
3. 貯法・保存条件	室温保存		
4. 薬剤取扱い上の注意点			
(1) 薬局での取り扱い上の留意点について	特になし		
(2) 薬剤交付時の取り扱いについて（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、14. 適用上の注意の項を参照 くすりのしおり：有り		
(3) 調剤時の留意点について	特になし		
5. 承認条件等	該当しない		
6. 包装	オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「杏林」	PTP：100錠	
	オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「杏林」	PTP：100錠、500錠	
7. 容器の材質	[PTP包装品] PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箱 ピロー包装：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム 箱：紙		

## X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬	<p>同一成分薬：アレロック錠 2.5/5、アレロック OD 錠 2.5/5、アレロック顆粒 0.5%</p> <p>同効薬：第2世代H<sub>1</sub>受容体拮抗薬（ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、エメダスチンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩）</p>									
9. 国際誕生年月日	1996年12月18日									
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	<table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="480 734 799 786">販売名</th> <th data-bbox="799 734 1118 786">製造販売承認年月日</th> <th data-bbox="1118 734 1437 786">承認番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="480 786 799 882">オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「杏林」</td> <td data-bbox="799 786 1118 882">2013年 2月15日</td> <td data-bbox="1118 786 1437 882">22500AMX00113</td> </tr> <tr> <td data-bbox="480 882 799 981">オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」</td> <td data-bbox="799 882 1118 981">2013年 2月15日</td> <td data-bbox="1118 882 1437 981">22500AMX00114</td> </tr> </tbody> </table>	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 OD 錠 2.5mg「杏林」	2013年 2月15日	22500AMX00113	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」	2013年 2月15日	22500AMX00114
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 OD 錠 2.5mg「杏林」	2013年 2月15日	22500AMX00113								
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」	2013年 2月15日	22500AMX00114								
11. 薬価基準収載年月日	<table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="480 1023 1007 1075">販売名</th> <th data-bbox="1007 1023 1437 1075">薬価基準収載年月日</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="480 1075 1007 1126">オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「杏林」</td> <td data-bbox="1007 1075 1437 1126">2020年 8月26日</td> </tr> <tr> <td data-bbox="480 1126 1007 1178">オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」</td> <td data-bbox="1007 1126 1437 1178">2020年 8月26日</td> </tr> </tbody> </table> <p>（旧販売名）オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「アメル」・OD 錠 5mg「アメル」</p> <p>薬価基準収載年月日：2013年 6月21日</p> <p>経過措置期間終了：2021年 3月31日</p>	販売名	薬価基準収載年月日	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「杏林」	2020年 8月26日	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」	2020年 8月26日			
販売名	薬価基準収載年月日									
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「杏林」	2020年 8月26日									
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「杏林」	2020年 8月26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	<p>○一部変更承認年月日：2014年12月17日</p> <p>内容：下記内容の追加</p> <table border="1"> <tr> <td data-bbox="512 1458 679 1554">効能・効果</td> <td data-bbox="679 1458 1426 1554">小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症）に伴う痒痒</td> </tr> <tr> <td data-bbox="512 1554 679 1650">用法・用量</td> <td data-bbox="679 1554 1426 1650">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。</td> </tr> </table>	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、皮膚癢痒症）に伴う痒痒	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。					
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、皮膚癢痒症）に伴う痒痒									
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、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。									

## X. 管理的事項に関する項目

### 16. 各種コード

販売名	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錠 2.5mg「杏林」	122374303	4490025F3182	622237403
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「杏林」	122375003	4490025F4189	622237503

### 17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## XI. 文献

<p>1. 引用文献</p>	<p>1) 第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店, G-1204, 2016</p> <p>2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「杏林」・5mg 「杏林」の安定性試験(加速条件)に関する資料</p> <p>3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「杏林」の安定性に関する資料(無包装)</p> <p>4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「杏林」の安定性に関する資料(無包装)</p> <p>5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「杏林」・5mg 「杏林」の溶出性に関する資料</p> <p>6) キョーリンリメディオ株式会社社内資料: オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「杏林」・5mg 「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料</p>
<p>2. その他の参考文献</p>	<p>該当資料なし</p>

## XII. 参考資料

---

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

## XIII. 備考

---

### 1. その他の関連資料

該当資料なし