

※※2020年12月改訂（第3版 製造販売元の住所変更に伴う改訂）
 ※2019年5月改訂（第2版 包装(分包)追加）

日本標準商品分類番号	
8 7 4 4 9	
承認番号	23000AMX00690000
薬価収載	2018年12月
販売開始	2019年1月

アレルギー性疾患治療剤

オロパタジン塩酸塩ドライシロップ[®]1%「日本臓器」

貯 法：気密容器、室温保存（1～30℃）。
 有効期間：3年。

Olopatadine Hydrochloride Dry syrup 1% “Nippon-zoki”

【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

【組成・性状】

販売名	オロパタジン塩酸塩ドライシロップ 1%「日本臓器」
剤 形	ドライシロップ剤
成分・含量 1g中	日局オロパタジン塩酸塩 10mg 含有
添加物	白糖、トレハロース水和物、アセスル ファムカリウム、デキストリン、ヒド ロキシプロピルセルロース、軽質無水 ケイ酸、エデト酸ナトリウム水和物、 DL-リンゴ酸、ジブチルヒドロキシト ルエン、タウマチン *着色料無配合
※ 色調・性状	白色の顆粒で、苦味をマスキングして おり、味はわずかに甘い。また、分包 品もある。 用時溶解するとき、ごくわずかに濁っ た透明な液になる。

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（ドライシロップとして0.5g）を朝及び就寝前の1日2回、用時溶解して経口投与する。

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（ドライシロップとして0.25g）を朝及び就寝前の1日2回、用時溶解して経口投与する。

【使用上の注意】

1. 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。〕

2. 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に十分注意すること。
- (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。

3. 副作用

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。

(1)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

【効能・効果】

成人：アレルギー性鼻炎、^{じんましん}蕁麻疹、皮膚疾患に伴う^{そうよう}掻痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚^{そうよう}掻痒症、尋常性乾癬、多形^{じんしつづせい}滲出性紅斑）

小児：アレルギー性鼻炎、^{じんましん}蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚^{そうよう}掻痒症）に伴う^{そうよう}掻痒

【用法・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（ドライシロップとして0.5g）を朝及び就寝前の1日2回、用時溶解して経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

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。

(2)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）、 掻痒、呼吸困難
精神神経系	眠気、倦怠感、口渇、頭痛・頭重感、 めまい、集中力低下、しびれ感、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〔ALT (GPT)、AST (GOT)、 LDH、 γ -GTP、 $\text{A}\ell$ -P、総ビリルビン上昇〕
血液	白血球増多、好酸球増多、リンパ球減少、 白血球減少、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、頻尿、排尿困難
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.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。

5.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。〕

6.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）。

7.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。

8.適用上の注意

調製時：用時調製して用いる製剤であるため、調製後は速やかに使用すること。

9.その他の注意

因果関係は明らかではないが、オロパタジン塩酸塩製剤投与中に心筋梗塞の発症がみられた症例が報告されている。

【薬物動態】

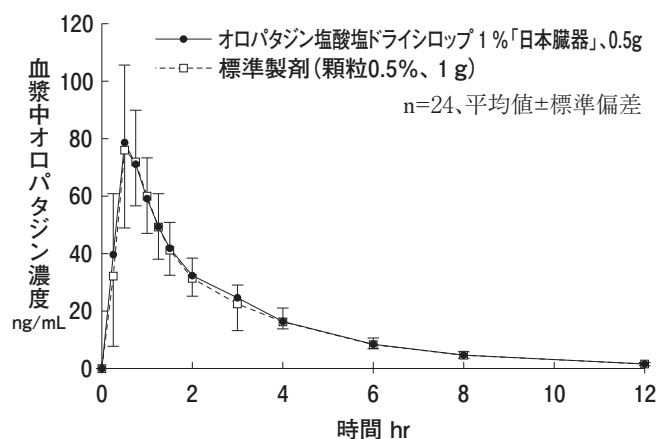
生物学的同等性試験

オロパタジン塩酸塩ドライシロップ1%「日本臓器」0.5gと標準製剤1g（いずれもオロパタジン塩酸塩として5mg）を、クロスオーバー法により健康成人男子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、生物学的同等性の判定基準 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

(①)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-30hr} ng·hr/mL	Cmax ng/mL	Tmax hr	T _{1/2} hr
オロパタジン塩酸塩 ドライシロップ1% 「日本臓器」、0.5g	206.94 ±25.65	84.89 ±19.32	0.688 ±0.512	2.474 ±0.322
標準製剤 顆粒0.5%、1g	201.16 ±24.28	82.99 ±22.97	0.698 ±0.516	2.501 ±0.263

n=24、平均値±標準偏差



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。

【薬効薬理】

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・遊離抑制作用を示す。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用を有する。(②)

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オロパタジン塩酸塩

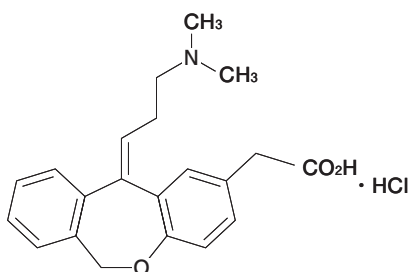
Olopatadine Hydrochloride

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

分子式：C₂₁H₂₃NO₃ · HCl

分子量：373.87

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。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。

融点：約250℃（分解）

【取扱い上の注意】

開封後は、湿気・光を避けて保存すること。

安定性試験

温度40℃、相対湿度75%、6ヵ月の加速試験及び温度25℃、相対湿度60%、2年の長期保存試験の結果、本剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。(3)

※【包装】

分包：0.25g×100包

バラ：100g

【主要文献】

- ①オロパタジン塩酸塩ドライシロップ1%「日本臓器」の生物学的同等性試験：社内資料
- ②第十七改正日本薬局方解説書C-1204, 廣川書店（2016年）
- ③オロパタジン塩酸塩ドライシロップ1%「日本臓器」の安定性試験：社内資料

※※【文献請求先】

主要文献として記載されている資料をご希望の方は下記にご請求ください。

日本臓器製薬 くすりの相談窓口
〒541-0046 大阪府中央区平野町4丁目2番3号
フリーダイヤル 0120-630-093
電話 06-6233-6085 FAX 06-6233-6087
受付時間 9:00～17:00 土・日・祝日を除く
ホームページ <http://www.nippon-zoki.co.jp/>