

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（一部2018に準拠）

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「VTRS」
オロパタジン塩酸塩錠5mg「VTRS」
OLOPATADINE Hydrochloride Tablets
オロパタジン塩酸塩口腔内崩壊錠
オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「VTRS」
オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「VTRS」
OLOPATADINE Hydrochloride OD Tablets

剤形	オロパタジン塩酸塩錠2.5mg・錠5mg「VTRS」：フィルムコーティング錠 オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg・OD錠5mg「VTRS」：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錠2.5mg「VTRS」 1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩2.5mg オロパタジン塩酸塩錠5mg「VTRS」 1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩5.0mg オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「VTRS」 1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩2.5mg オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「VTRS」 1錠中 日局 オロパタジン塩酸塩5.0mg													
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・ 販売開始年月日	<table><tr><td></td><td>オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」 オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」</td><td>オロパタジン塩酸塩OD 錠2.5mg「VTRS」 オロパタジン塩酸塩OD 錠5mg「VTRS」</td></tr><tr><td>製造販売承認年月日</td><td>2012年 8月15日</td><td>2013年 2月15日</td></tr><tr><td>薬価基準収載年月日</td><td>2022年 6月 1日 (2.5mg) 2022年 6月17日 (5mg)</td><td>2022年 6月 1日 (2.5mg) 2022年 6月17日 (5mg)</td></tr><tr><td>販売開始年月日</td><td>2012年12月14日</td><td>2013年 6月21日</td></tr></table>		オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」 オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」	オロパタジン塩酸塩OD 錠2.5mg「VTRS」 オロパタジン塩酸塩OD 錠5mg「VTRS」	製造販売承認年月日	2012年 8月15日	2013年 2月15日	薬価基準収載年月日	2022年 6月 1日 (2.5mg) 2022年 6月17日 (5mg)	2022年 6月 1日 (2.5mg) 2022年 6月17日 (5mg)	販売開始年月日	2012年12月14日	2013年 6月21日	
	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」 オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」	オロパタジン塩酸塩OD 錠2.5mg「VTRS」 オロパタジン塩酸塩OD 錠5mg「VTRS」												
製造販売承認年月日	2012年 8月15日	2013年 2月15日												
薬価基準収載年月日	2022年 6月 1日 (2.5mg) 2022年 6月17日 (5mg)	2022年 6月 1日 (2.5mg) 2022年 6月17日 (5mg)												
販売開始年月日	2012年12月14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：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販売元：ヴィアトリス製薬株式会社													
医薬情報担当者の連絡先														
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 https://www.viatrix-e-channel.com/													

本IFは2023年11月改訂（オロパタジン塩酸塩錠2.5mg・錠5mg「VTRS」）、2023年11月改訂（オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg・OD錠5mg「VTRS」）の電子化された添付文書の記載に基づき改訂した。最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <https://www.info.pmda.go.jp/> 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 IF 記載要領が策定された。

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 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。
- 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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 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、「IF 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 IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 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、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR 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 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。

(2008 年 9 月)

目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	3
5. 化学名（命名法）	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6
4. 製剤の各種条件下における安定性	7
5. 調製法及び溶解後の安定性	12
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	12
7. 溶出性	13
8. 生物学的試験法	19
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	19
10. 製剤中の有効成分の定量法	19
11. 力価	19
12. 混入する可能性のある夾雑物	19
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	19
14. その他	19

V. 治療に関する項目	20
1. 効能又は効果	20
2. 効能又は効果に関連する注意	20
3. 用法及び用量	20
4. 用法及び用量に関連する注意	20
5. 臨床成績	20
VI. 薬効薬理に関する項目	24
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	24
2. 薬理作用	24
VII. 薬物動態に関する項目	25
1. 血中濃度の推移・測定法	25
2. 薬物速度論的パラメータ	29
3. 吸収	29
4. 分布	30
5. 代謝	30
6. 排泄	30
7. 透析等による除去率	31
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	32
1. 警告内容とその理由	32
2. 禁忌内容とその理由	32
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	32
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	32
5. 重要な基本的注意とその理由	32
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	32
7. 相互作用	34
8. 副作用	34
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	35
10. 過量投与	35
11. 適用上の注意	35
12. その他の注意	35
IX. 非臨床試験に関する項目	36
1. 薬理試験	36
2. 毒性試験	36

X. 管理的事項に関する項目	37
1. 規制区分	37
2. 有効期間又は使用期限	37
3. 貯法・保存条件	37
4. 薬剤取扱い上の注意点	37
5. 承認条件等	37
6. 包装	37
7. 容器の材質	38
8. 同一成分・同効薬	38
9. 国際誕生年月日	38
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	38
11. 薬価基準収載年月日	38
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.....	38
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	38
14. 再審査期間	38
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	39
16. 各種コード	39
17. 保険給付上の注意	39
XI. 文献	40
1. 引用文献	40
2. その他の参考文献	41
XII. 参考資料	42
1. 主な外国での発売状況	42
2. 海外における臨床支援情報	42
XIII. 備考	43
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報.....	43
2. その他の関連資料	46

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オロパタジン塩酸塩は、ヒスタミン H₁ 受容体に対する選択的拮抗作用を主作用とし、各種ケミカルメディエーターの遊離抑制作用を併せ持つ、国内で開発されたアレルギー性疾患治療剤である。

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg、OD 錠 2.5mg・5mg「ファイザー」は、ファイザー株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「ファイザー」は 2012 年 8 月に、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg・5mg「ファイザー」は 2013 年 2 月に承認を得た製剤である。さらに、2014 年 11 月に小児適応の承認を得た（一部変更承認）。

2022 年 6 月、ファイザー株式会社からマイラン EPD 合同会社（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社）へ製造販売移管したため、販売名を、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg「V T R S」及びオロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg・5mg「V T R S」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 選択的な抗ヒスタミン作用と多彩な薬理作用

オロパタジン塩酸塩は、ヒスタミン H₁ 受容体に選択的かつ競合的に結合し、更に、アレルギーに関与する各種ケミカルメディエーターの遊離抑制作用などを有する。アレルギー性鼻炎や蕁麻疹のほか、尋常性乾癬及び多形滲出性紅斑などに伴う痒痒に対しても治療効果がある。

（「VI-2. (1) 作用部位・作用機序」、「V-1. 効能又は効果」の項参照）

2. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み

- 1) 包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている^{1)~3)}
- 2) 小函に製品情報カードの機能を付加している
- 3) 規格取り違えを防ぐ試みとして、複数規格の製剤は、上の規格（高用量）がある場合、記載含量の上に▲を配置し、下の規格（低用量）がある場合、記載含量の下に▼を配置している
- 4) PTP シートや錠剤のデザインを工夫することで識別性を高めている

3. 重大な副作用として、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸が報告されている。

（「VIII-8. 副作用」の項参照）

* 「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

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 「V T R S」
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「V T R S」
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」

(2) 洋名

OLOPATADINE Hydrochloride Tablets
OLOPATADINE Hydrochloride OD Tablets

(3) 名称の由来

有効成分であるオロパタジン塩酸塩に剤形、含量及び「V T R S」を付した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

オロパタジン塩酸塩（JAN）

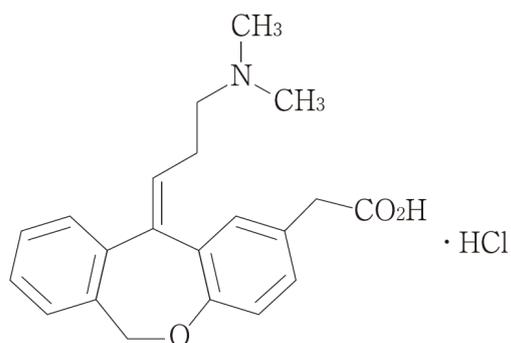
(2) 洋名（命名法）

Olopatadine Hydrochloride（JAN）
olopatadine（INN）

(3) ステム

三環系 H₁ 受容体拮抗薬：-tadine：tricyclic histamine-H₁ receptor antagonists, tricyclic compounds

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*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

該当資料なし

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。
0.01mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 250℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

1.0g を水 100mL に溶かした液の pH は 2.3～3.3

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（塩化カリウム錠剤法）
- (3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法

滴定終点検出法（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	外形			色調等
	上面	下面	側面	
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」				淡黄赤色 フィルムコーテ ィング錠
	直径 6.6mm	厚さ 3.1mm	重量 103.0mg	
オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」				淡黄赤色 割線入り フィルムコーテ ィング錠
	直径 7.1mm	厚さ 3.0mm	重量 124.0mg	

販売名	外形			色調等
	上面	下面	側面	
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「VTRS」				ごくうすい黄色 円形の素錠
	直径 6.5mm	厚さ 2.65mm	重量 100mg	
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「VTRS」				ごくうすい黄色 割線入り 円形の素錠
	直径 8.0mm	厚さ 3.5mm	重量 200mg	

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」：上面 OL2.5

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」：-

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「VTRS」：上面 D2.5、下面 OL

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「VTRS」：上面 D5、下面 OL

(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「V T R S」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「V T R S」

1 錠中 日局 オロパタジン塩酸塩 2.5mg

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「V T R S」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「V T R S」

1 錠中 日局 オロパタジン塩酸塩 5.0mg

(2) 添加物

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「V T R S」、オロパタジン塩酸塩錠 5mg「V T R S」

乳糖水和物、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、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「V T R S」、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「V T R S」

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

(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

加速試験

試験条件：40±1℃、75±5%RH

■オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「V T R S」⁴⁾

包装形態：PTP包装（紙箱）

項目及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（淡黄赤色のフィルムコーティング錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験（紫外可視吸光度測定法）		適合	—	—	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
溶出試験（85%以上）（%）		95.4～101.1	96.1～101.1	96.5～100.7	95.2～100.0
定量試験（95.0～105.0%）（%）		97.9～100.4	99.4～100.3	99.1～100.4	98.3～99.1
純度試験	（参考）類縁物質の総量（%）（1.0%以下）	0.15～0.24	0.26～0.34	0.41～0.46	0.79～0.82
	（参考）報告の必要な閾値：0.1（%）	<LOD～0.10	<LOD～0.10	<LOD～0.10	<LOD～0.12

ロット数：3

<LOD：検出限界未満

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「V T R S」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。

■オロパタジン塩酸塩錠 5mg「V T R S」⁵⁾

包装形態：PTP包装（紙箱）

項目及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（淡黄赤色の割線入りのフィルムコーティング錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験（紫外可視吸光度測定法）		適合	—	—	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
溶出試験（85%以上）（%）		90.1～104.0	91.1～102.9	90.8～103.4	92.5～101.4
定量試験（95.0～105.0%）（%）		99.1～101.3	99.8～102.2	99.3～101.3	99.8～101.9
純度試験	（参考）類縁物質の総量（%）（1.0%以下）	0.11～0.13	0.16～0.21	0.26～0.31	0.45～0.50
	（参考）報告の必要な閾値：0.1（%）	<LOD～0.05	<LOD～0.07	<LOD～0.08	<LOD～0.08

ロット数：3

<LOD：検出限界未満

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 5mg「V T R S」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。

■オロパタジン塩酸塩 0D錠 2.5mg「V T R S」⁶⁾

包装形態：PTP包装（アルミピロー、紙箱）

項目及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（ごくうすい黄色の円形の素錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験（紫外可視吸光度測定法）		適合	—	—	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
溶出試験（85%以上）（%）		99.3～105.2	97.0～103.4	96.4～102.5	97.8～103.5
崩壊試験		適合	適合	適合	適合
定量試験（95.0～105.0%）（%）		99.9～102.5	99.8～101.9	99.4～101.3	100.4～102.4
純度試験	（参考）報告の必要な 閾値：0.1（%）	<LOD～0.04	<LOD～0.05	<LOD～0.09	<LOD～0.14

ロット数：3

<LOD：検出限界未満

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 0D錠 2.5mg「V T R S」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。

■オロパタジン塩酸塩 0D錠 5mg「V T R S」⁷⁾

包装形態：PTP包装（アルミピロー、紙箱）

項目及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（ごくうすい黄色の円形の割線入り素錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験（紫外可視吸光度測定法）		適合	—	—	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
溶出試験（85%以上）（%）		100.0～104.2	96.7～102.1	97.7～102.0	98.8～102.5
崩壊試験		適合	適合	適合	適合
定量試験（95.0～105.0%）（%）		100.4～102.1	100.3～101.3	99.9～101.5	100.4～101.8
純度試験	（参考）報告の必要な 閾値：0.1（%）	<LOD～0.05	<LOD～0.05	<LOD～0.09	<LOD～0.13

ロット数：3

<LOD：検出限界未満

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 0D錠 5mg「V T R S」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。

無包装状態の安定性試験^{8)、9)}

【試験方法】

保存条件：

- ①温度：40℃±1℃・75%RH±5%RH（褐色ガラス・気密）
- ②湿度：25℃±2℃・75%RH±5%RH（遮光・シャーレ開放）
- ③光：2500lux、25℃±2℃・45%RH±5%RH、（シャーレ開放）

測定時期：①、②開始時、1、2、3ヵ月

- ③開始時、30万、60万、120万Lux・hr到達時

試験項目：性状、含量、溶出性、硬度

試験回数：性状1回、含量3回、溶出性1回（6ベッセル）、硬度1回（5錠）

■オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTR S」

①温度に対する安定性試験 [40℃±1℃・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠
含量 (%) [対開始時(%)]	97.5 [100.0]	97.6 [100.1]	99.2 [101.7]	98.9 [101.4]
溶出性 (%) [最小-最大 (%)]	99.7 [98.4-101.4]	99.1 [98.4-99.6]	100.2 [99.0-101.1]	99.3 [97.4-100.2]
硬度 (N)	45	44	42	38

②湿度に対する安定性試験 [25℃±2℃・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠
含量 (%) [対開始時(%)]	97.5 [100.0]	99.6 [102.2]	100.0 [102.6]	98.9 [101.4]
溶出性 (%) [最小-最大 (%)]	99.7 [98.4-101.4]	98.9 [98.1-99.3]	99.5 [99.2-99.9]	98.7 [98.3-100.2]
硬度 (N)	45	36	30	28

③光に対する安定性試験 [2500Lux、25℃±2℃・45%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	30万Lux・hr	60万Lux・hr	120万Lux・hr
性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	わずかに退色
含量 (%) [対開始時(%)]	97.5 [100.0]	98.0 [100.5]	99.1 [101.6]	99.1 [101.6]
溶出性 (%) [最小-最大 (%)]	99.7 [98.4-101.4]	99.9 [98.8-101.3]	98.6 [97.0-99.6]	99.4 [98.4-100.1]
硬度 (N)	45	44	41	39

■オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40°C±2°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠
含量 (%) [対開始時(%)]	99.2 [100.0]	98.7 [99.5]	99.5 [100.3]	98.7 [99.5]
溶出性 (%) [最小-最大(%)]	99.7 [99.1-100.7]	99.7 [99.2-100.3]	100.5 [99.7-101.2]	99.5 [98.8-101.4]
硬度 (N)	53	54	54	47

②湿度に対する安定性試験 [25°C±2°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠
含量 (%) [対開始時(%)]	99.2 [100.0]	100.3 [101.1]	100.7 [101.5]	99.7 [100.5]
溶出性 (%) [最小-最大(%)]	99.7 [99.1-100.7]	99.8 [99.1-100.5]	99.7 [98.3-100.5]	100.5 [99.8-101.6]
硬度 (N)	53	37	38	35

③光に対する安定性試験 [2500Lux、25°C±2°C・45%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
性状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	淡黄赤色のフィルムコーティング錠	わずかに退色
含量 (%) [対開始時(%)]	99.2 [100.0]	97.2 [98.0]	99.1 [99.9]	99.8 [100.6]
溶出性 (%) [最小-最大(%)]	99.7 [99.1-100.7]	99.6 [98.0-100.8]	98.4 [96.1-99.8]	99.9 [98.5-101.4]
硬度 (N)	53	52	50	52

【試験方法】

保存条件：①温度：40℃±1℃・75%RH±5%RH ガラス瓶遮光・気密容器
 ②湿度：25℃±2℃・75%RH±5%RH 透明プラスチックシャーレ
 ③光：2500Lux、25℃±2℃・45%RH±5%RH 透明プラスチックシャーレ

測定時期：①、②開始時、1、2、3ヵ月
 ③開始時、30万、60万、120万Lux・hr

試験項目：性状、含量、溶出性、硬度

試験回数：性状3回、含量3回、溶出性1回（6ベッセル）、硬度5回

■オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「VTR S」

①温度に対する安定性試験 [40℃±1℃・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
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	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
含量 (%)	100.1	98.2	99.3	99.1
溶出性 (%)	97.3	98.4	98.5	98.5
[最小-最大 (%)]	[96.6-98.4]	[97.7-99.2]	[96.8-99.7]	[98.0-99.2]
硬度 (N)	27.0	30.0	22.2	24.1

②湿度に対する安定性試験 [25℃±2℃・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
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	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
含量 (%)	100.1	99.7	99.3	98.8
溶出性 (%)	97.3	98.0	99.1	98.0
[最小-最大 (%)]	[96.6-98.4]	[96.2-98.8]	[97.3-100.6]	[96.9-98.8]
硬度 (N)	27.0	15.9	15.8	14.4

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	30万Lux・hr	60万Lux・hr	120万Lux・hr
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	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
含量 (%)	100.1	99.6	98.1	96.6
溶出性 (%)	97.3	98.7	97.7	97.8
[最小-最大 (%)]	[96.6-98.4]	[98.0-99.7]	[96.8-98.2]	[95.9-99.1]
硬度 (N)	27.0	27.2	30.3	31.7

■オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40°C±1°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 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	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
含量 (%)	99.4	97.0	99.1	99.2
溶出性 (%)	97.9	98.2	99.3	98.9
[最小-最大 (%)]	[96.5-100.0]	[96.6-99.9]	[96.7-101.2]	[97.0-100.3]
硬度 (N)	30.8	43.3	33.9	36.7

②湿度に対する安定性試験 [25°C±2°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 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	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
含量 (%)	99.4	98.1	100.1	99.7
溶出性 (%)	97.9	98.2	97.8	98.9
[最小-最大 (%)]	[96.5-100.0]	[96.8-100.0]	[96.5-100.1]	[98.3-100.1]
硬度 (N)	30.8	19.2	20.2	21.1

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
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	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
含量 (%)	99.4	99.0	98.0	97.7
溶出性 (%)	97.9	98.2	98.3	97.7
[最小-最大 (%)]	[96.5-100.0]	[97.1-99.2]	[96.3-99.1]	[96.5-99.5]
硬度 (N)	30.8	35.1	37.3	39.1

本剤の無包装状態での保存は弊社としては推奨していない。

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

7. 溶出性

溶出挙動

①オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」¹⁰⁾

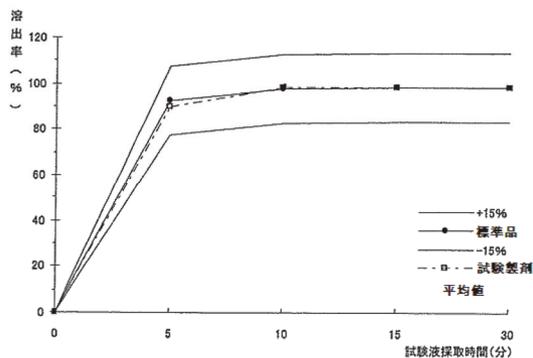
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」と標準品の溶出試験を実施した結果、オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

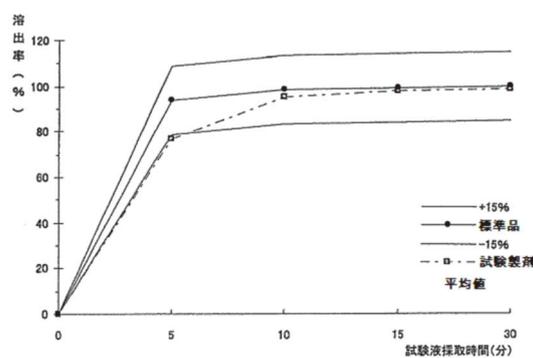
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液)	900mL	50rpm
	pH5.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液)		
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)		
	水		
	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液)	900mL	100rpm

n=12

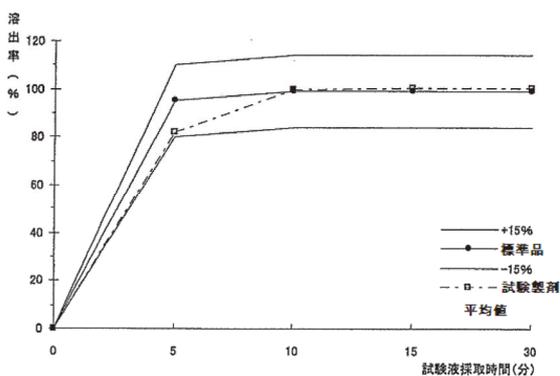
pH1.2 (50rpm)



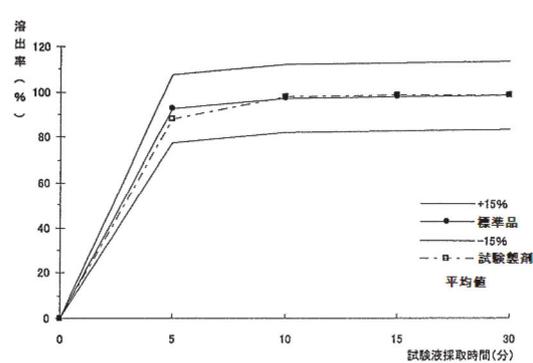
pH5.0 (50rpm)



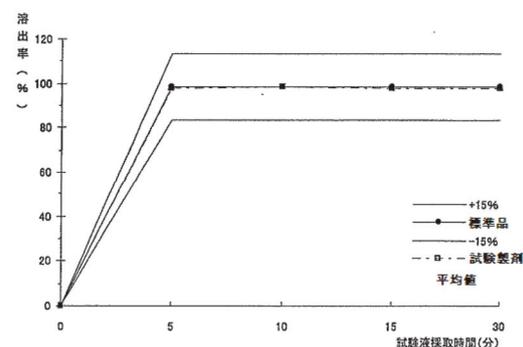
pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)



pH1.2 (100rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)			
		5分	10分	15分	30分
pH1.2 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」	90.2 ±8.9	98.3 ±1.3	98.7 ±0.9	98.6 ±0.9
	標準品	92.8 ±4.0	97.8 ±1.8	98.4 ±1.4	98.5 ±1.1
pH5.0 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」	77.1 ±28.2	95.5 ±5.7	97.9 ±1.2	98.4 ±0.6
	標準品	93.7 ±5.1	98.2 ±1.8	98.9 ±0.9	99.5 ±0.6
pH6.8 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」	81.9 ±20.8	99.7 ±1.9	100.3 ±1.1	100.2 ±1.0
	標準品	95.5 ±4.1	98.9 ±1.7	99.1 ±1.2	99.1 ±1.3
水 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」	88.1 ±19.5	97.8 ±2.8	98.8 ±1.5	98.7 ±1.4
	標準品	92.5 ±6.6	97.1 ±2.9	98.1 ±1.8	98.7 ±1.4
pH1.2 100rpm	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」	98.1 ±0.8	98.4 ±0.7	98.1 ±1.4	98.1 ±0.7
	標準品	98.4 ±1.5	98.8 ±1.4	98.7 ±1.3	98.6 ±1.3

平均値±標準偏差 n=12

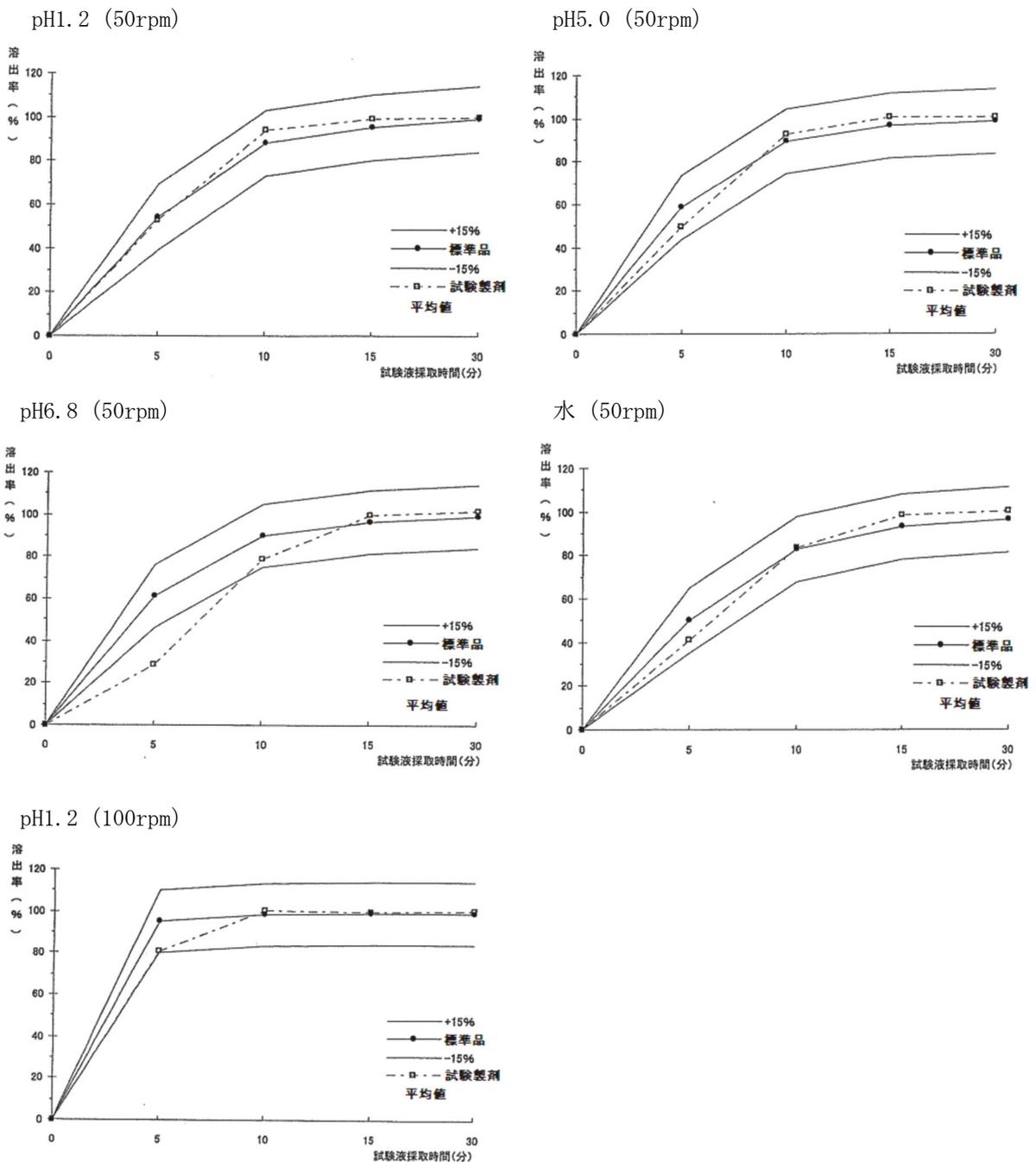
②オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「VTRS」¹¹⁾

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「VTRS」と標準品の溶出試験を実施した結果、オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「VTRS」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液) pH5.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液) pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液) 水	900mL	50rpm
	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液)	900mL	100rpm

n=12



試験条件	薬剤	溶出率 (%)			
		5分	10分	15分	30分
pH1.2 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」	52.7 ±22.2	93.8 ±9.7	99.2 ±1.3	99.7 ±0.7
	標準品	53.9 ±21.3	88.2 ±11.1	95.3 ±5.9	98.9 ±2.7
pH5.0 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」	49.8 ±14.4	92.7 ±13.2	100.3 ±1.8	100.6 ±1.4
	標準品	58.9 ±21.3	89.1 ±9.4	96.6 ±4.9	98.3 ±3.3
pH6.8 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」	29.0 ±17.7	78.8 ±21.5	99.7 ±3.5	101.6 ±1.0
	標準品	61.1 ±26.2	89.7 ±11.2	96.3 ±4.5	99.2 ±3.5
水 50rpm	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」	41.3 ±20.6	83.6 ±25.1	98.3 ±5.3	100.4 ±1.4
	標準品	50.1 ±23.0	82.7 ±14.6	93.1 ±7.1	96.6 ±4.1
pH1.2 100rpm	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」	80.9 ±14.5	100.5 ±1.6	100.1 ±1.6	100.2 ±1.5
	標準品	95.0 ±5.8	98.5 ±2.1	99.1 ±2.3	99.3 ±2.5

平均値±標準偏差 n=12

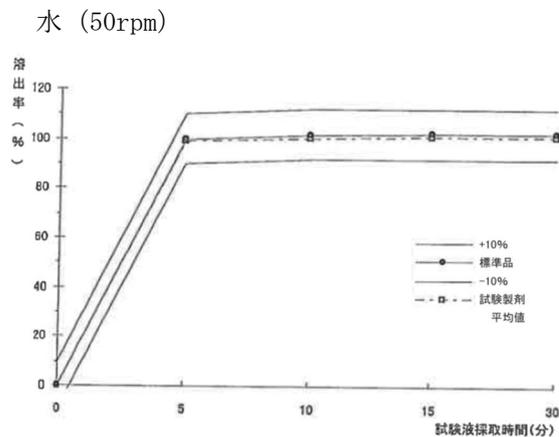
③オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「VTRS」¹²⁾

「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12年2月14日 医薬審第64号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号)に基づき、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「VTRS」を標準品としてオロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「VTRS」の溶出試験を実施した結果、溶出挙動の同等性が示され、両薬剤は生物学的に同等とみなされた。

試験条件

試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	水	900mL	50rpm

n=12



試験条件	薬剤	溶出率 (%)			
		5分	10分	15分	30分
水 50rpm	オロパタジン塩酸塩 0D錠 2.5mg「VTR S」	99.3 ±1.0	100.7 ±1.1	101.0 ±1.0	101.1 ±1.0
	標準品	100.1 ±0.5	101.9 ±0.6	102.2 ±0.5	102.3 ±0.7

平均値±標準偏差 n=12

④オロパタジン塩酸塩 0D錠 5mg「VTR S」¹³⁾

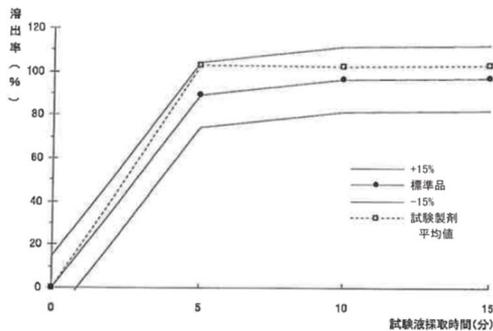
オロパタジン塩酸塩 0D錠 5mg「VTR S」と標準品の溶出試験を実施した結果、オロパタジン塩酸塩 0D錠 5mg「VTR S」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

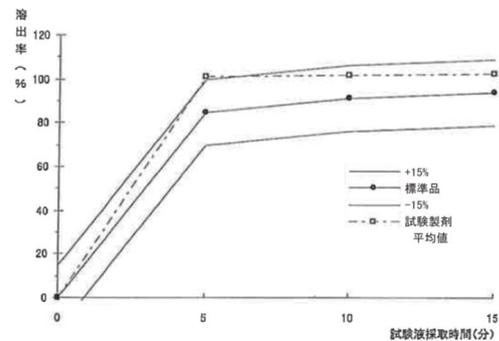
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液)	900mL	50rpm
	pH5.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液)		
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)		
	水		
	pH5.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液)	900mL	100rpm

n=12

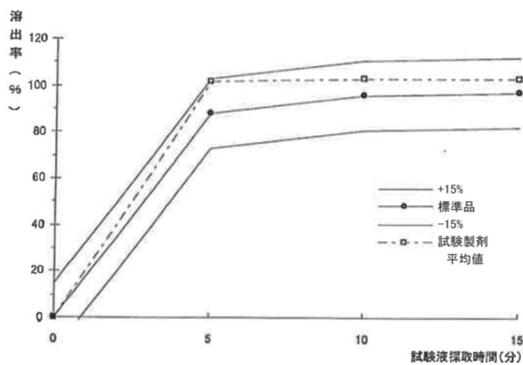
pH1.2 (50rpm)



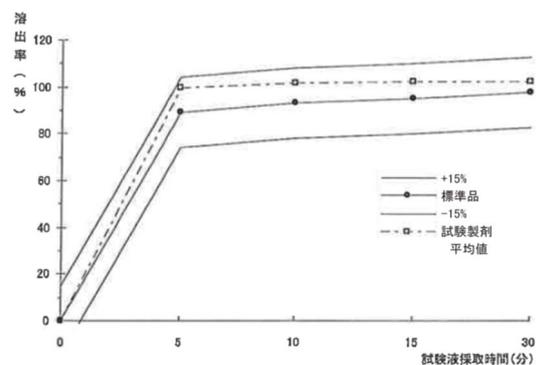
pH5.0 (50rpm)



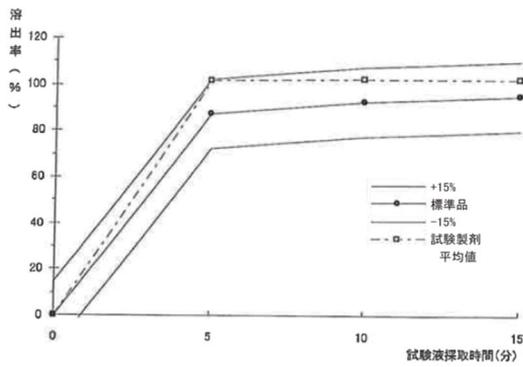
pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)



pH5.0 (100rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)		
		5分	10分	15分
pH1.2 50rpm	オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「VTRS」	102.9 ±0.7	102.6 ±0.9	103.2 ±0.8
	標準品	89.5±1.7	96.4±1.4	97.4±1.4
pH5.0 50rpm	オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「VTRS」	101.3 ±0.8	101.9 ±0.9	102.2 ±0.9
	標準品	85.0±1.4	91.3±1.2	94.1±1.3
pH6.8 50rpm	オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「VTRS」	102.0 ±1.3	103.0 ±0.8	103.2 ±0.9
	標準品	87.9±5.4	95.6±3.3	97.1±3.3
水 50rpm	オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「VTRS」	100.1 ±0.5	101.9 ±0.6	102.2 ±0.5
	標準品	89.6±1.9	93.5±1.9	94.9±1.8
pH5.0 100rpm	オロパタジン塩酸塩 OD錠5mg「VTRS」	102.0 ±1.3	102.2 ±1.3	102.3 ±1.3
	標準品	87.6±2.0	92.9±2.1	95.1±2.0

平均値±標準偏差 n=12

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. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

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

4. 効能又は効果

成人：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症、尋常性乾癬、多形滲出性紅斑）

小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚瘙癢症）に伴う瘙痒

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

「V-5. (3) 用量反応探索試験」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

〈アレルギー性鼻炎〉¹⁴⁾

国内第Ⅲ相比較試験（成人、オロパタジン塩酸塩錠）

通年性アレルギー性鼻炎患者（211例）を対象に、オキサトミドを対照薬とした二重盲検比較試験を実施した。オロパタジン塩酸塩（5mg錠又はプラセボ錠）及びオキサトミド（30mg錠又はプラセボ錠）を1日2回4週間反復経口投与した結果、最終全般改善度の改善率（「改善」以上）はオロパタジン塩酸塩62.4%（53/85例）、オキサトミド56.6%（47/83例）であった。10%上乘せ方式による同等性の検証の結果、同等性が確認された（ $p=0.018$ ）。概括安全度の安全率（「安全性に問題なし」）はオロパタジン塩酸塩68.0%（70/103例）、オキサトミド61.4%（62/101例）であった。両群間に有意差は認められなかった（ $p=0.301$ ；U検定、 $p=0.403$ ； χ^2 検定）。

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩群29.1%（30/103例）、オキサトミド群30.7%（31/101例）であった。オロパタジン塩酸塩群の主な副作用は、眠気25.2%（26/103例）であった。

〈じん麻疹〉¹⁵⁾

国内第Ⅲ相比較試験（成人、オロパタジン塩酸塩錠）

慢性じん麻疹患者（256例）を対象に、ケトチフェンを対照薬とした二重盲検比較試験を実施した。オロパタジン塩酸塩（5mg錠又はプラセボ錠）及びケトチフェンフマル酸塩（1mgカプセル又はプラセボカプセル）を1日2回2週間反復経口投与した結果、最終全般改善度の改善率（「改善」以上）はオロパタジン塩酸塩77.7%（87/112例）、ケトチフェンフマル酸塩66.9%（81/121例）であった。主たる検定であるU検定において、オロパタジン塩酸塩はケトチフェンフマル酸塩と比べ有意な改善を示した（ $p=0.019$ ；U検定、 $p=0.093$ ； χ^2 検定）。概括安全度の安全率（「安全性に問題なし」）はオロパタジン塩酸塩77.2%（95/123例）、ケトチフェンフマル酸塩53.9%（69/128例）であった。オロパタジン塩酸塩はケトチフェンフマル酸塩と比べ有意に概括安全度が高かった（ $p=0.0001$ ；U検定、 $p=0.0001$ ； χ^2 検定）。

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩群21.1%（26/123例）、ケトチフェン群41.4%（53/128例）であった。オロパタジン塩酸塩群の主な副作用は、眠気19.5%（24/123例）であった。

〈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）〉
国内第Ⅲ相一般試験（成人、オロパタジン塩酸塩錠）¹⁶⁾

皮膚疾患に伴うそう痒の患者（湿疹・皮膚炎 152 例、痒疹 72 例、皮膚そう痒症 80 例、尋常性乾癬 70 例及び多形滲出性紅斑 24 例、計 398 例）を対象に、オロパタジン塩酸塩 10mg/日（1 回 5mg、1 日 2 回）を 2 週間反復投与した。各皮膚疾患に対する有効率は、湿疹・皮膚炎 74.6%（91/122 例）、痒疹 50.8%（31/61 例）、皮膚そう痒症 49.3%（33/67 例）、尋常性乾癬 52.8%（28/53 例）、多形滲出性紅斑 83.3%（15/18 例）であり、全体での有効率は 61.7%（198/321 例）であった。副作用発現頻度は 19.0%（74/390 例）であった。主な副作用は、眠気 11.3%（44/390 例）であった。

高齢者（65 歳以上）における臨床成績¹⁷⁾

承認時までの高齢者（65 歳以上）への使用経験 191 例（気管支喘息 57 例、アレルギー性鼻炎 3 例、じん麻疹 31 例、そう痒性皮膚疾患 100 例）における副作用発現率は 22.5%（43/191 例）であり、主な副作用は眠気 23 件（12.0%）、倦怠感 7 件（3.7%）、腹痛 4 件（2.1%）、顔面・四肢等の浮腫 3 件（1.6%）、頭痛・頭重感 3 件（1.6%）、めまい 2 件（1.0%）、下痢 2 件（1.0%）、胸部不快感 2 件（1.0%）等であった。高齢者における副作用発現率は 65 歳未満 15.3%（238/1,555 例）に比べ高かった。また、高齢者に対する有効率は気管支喘息 25.5%（12/47 例）、アレルギー性鼻炎 100%（2/2 例）、じん麻疹 80.6%（25/31 例）、皮膚疾患に伴うそう痒全体で 58.3%（49/84 例）であった。

〈アレルギー性鼻炎〉

国内二重盲検比較試験（小児、オロパタジン塩酸塩錠）¹⁸⁾

小児通年性アレルギー性鼻炎患者（7～16 歳）を対象に、オロパタジン塩酸塩（1 回 2.5mg、1 日 2 回、もしくは 1 回 5mg、1 日 2 回）^{注)}あるいは、対照薬としてプラセボを 2 週間投与した。主要評価項目である「鼻の 3 主徴（くしゃみ、鼻汁、鼻閉）合計スコアの観察期からの変化量」について共分散分析を行った結果、オロパタジン塩酸塩 5mg 群はプラセボ群に対し有意な改善を示した。

小児通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした比較試験成績

投与群	症例数	投与前 (mean±S. D.)	変化量 (mean±S. D.)	解析結果 (共分散分析 ^{a)})
オロパタジン塩酸塩 5mg/回	100	6.14±1.44	-1.41±1.99	最小二乗平均の差 (プラセボ群-5mg群) : 0.51 95%信頼区間 : 0.04~0.98 p値 : 0.019 ^{b)}
プラセボ	97	5.99±1.17	-0.84±1.58	—

a) 投与群を要因、観察期の鼻の 3 主徴合計スコアを共変量とした共分散分析

b) 各投与群の最小二乗平均に対する Williams 検定の結果

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩 2.5mg 群 12.6%（13/103 例）^{注)}、5mg 群 16.0%（16/100 例）、プラセボ群 8.2%（8/98 例）であった。オロパタジン塩酸塩 5mg 群で発現した主な副作用は、ALT 増加 6.0%（6/100 例）、白血球数増加 4.0%（4/100 例）であった¹⁹⁾。

注) 7 歳以上の小児における本剤の承認用量は 1 回 5mg、1 日 2 回である。

国内非盲検試験（小児、オロパタジン塩酸塩錠）²⁰⁾

小児通年性アレルギー性鼻炎患者（7～16 歳、30 kg 以上、33 例）を対象に、オロパタジン塩酸塩 1 回 5mg を 1 日 2 回 12 週間投与した結果、鼻の 3 主徴（くしゃみ、鼻汁、鼻閉）合計スコアの観察期からの変化量（mean±S. D.）は投与 2 週後-2.08±1.73、投与 12 週後-2.41±2.09 であり、効果は投与終了時まで減弱することなく安定していた。

副作用発現頻度は 15.2%（5/33 例）であった。主な副作用は、傾眠 9.1%（3/33 例）であった。

〈アトピー性皮膚炎〉

国内二重盲検比較試験（小児、オロパタジン塩酸塩錠）²¹⁾

小児アトピー性皮膚炎患者（7～16歳）を対象に、オロパタジン塩酸塩（1回5mg、1日2回）あるいは、対照薬としてケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ（1回1g、1日2回）を2週間投与した。主要評価項目である「そう痒スコアの治験薬投与前からの変化量」について共分散分析を行った結果、ケトチフェンフマル酸塩ドライシロップに対するオロパタジン塩酸塩の非劣性が検証された（95%信頼区間の上限が0.4以下）。

小児アトピー性皮膚炎患者を対象とした比較試験成績

投与群	症例数	投与前 (mean±S. D.)	変化量 (mean±S. D.)	解析結果 (共分散分析 ^{a)})
オロパタジン塩酸塩	152	2.36±0.46	-0.78±0.84	最小二乗平均の差 (オロパタジン塩酸塩群-ケトチフェンフマル酸塩群) : -0.08 95%信頼区間 : -0.25~0.09
ケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ	153	2.38±0.44	-0.71±0.76	

a) 投与群を要因、治験薬投与前のそう痒スコアを共変量とした共分散分析

副作用発現頻度はオロパタジン塩酸塩群 11.8% (18/152例)、ケトチフェンフマル酸塩ドライシロップ群 6.5% (10/153例)であった。オロパタジン塩酸塩群で発現した主な副作用は、傾眠 5.9% (9/152例)、ALT増加 4.6% (7/152例) 及びAST増加 2.6% (4/152例)であった。

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^{22)、23)}

オロパタジン塩酸塩は、選択的ヒスタミン_{H₁}受容体拮抗作用を主作用とし、更に化学伝達物質（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF等）の産生・遊離抑制作用を有し、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

抗ヒスタミン作用

受容体結合実験において、ヒスタミン_{H₁}受容体に強い拮抗作用（ K_i 値：16nmol/L）を有するが、ムスカリン_{M₁}受容体にはほとんど親和性を示さず、その作用は選択的であった²⁴⁾。また、モルモットにおけるヒスタミン誘発気道収縮反応にも抑制作用を示すことが確認された²⁵⁾。

実験的抗アレルギー作用

実験的アレルギー性鼻炎モデル（モルモット、ラット）において、抗原誘発による血管透過性亢進や鼻閉を抑制した^{26)~28)}。

ラット、モルモットにおける受身皮膚アナフィラキシーやアナフィラキシー性気道収縮を強力に抑制した^{29)、30)}。

能動感作モルモットにおける遅発型気道収縮と炎症細胞の浸潤を抑制した³¹⁾。また、モルモットにおいて、血小板活性化因子（PAF）による気道過敏性亢進を抑制した³²⁾。

化学伝達物質の産生・遊離過程に及ぼす影響^{33)~36)}

ラット腹腔肥満細胞からのヒスタミンの遊離を抑制（ IC_{30} 値；72 μ mol/L：卵白アルブミン刺激、110 μ mol/L：ジニトロフェニル化ウシ血清アルブミン刺激、26 μ mol/L：A-23187刺激、270 μ mol/L：コンパウンド48/80刺激）するとともに、アラキドン酸代謝系に作用して、ヒト好中球からのロイコトリエン（ IC_{30} 値；1.8 μ mol/L）、トロンボキサン（ IC_{30} 値；0.77 μ mol/L）、PAF（産生：10 μ mol/Lで52.8%抑制、遊離：10 μ mol/Lで26.7%抑制）等脂質メディエーターの産生あるいは遊離を抑制することが確認された。

タキキニン遊離抑制作用^{37)、38)}

知覚神経終末から遊離する神経伝達物質タキキニンは、アレルギー性疾患の発症・増悪に関与することが知られている。

オロパタジン塩酸塩は、モルモットの主気管支筋標本において、フィールド電気刺激時のタキキニン関与の収縮反応を抑制（ IC_{30} 値；5.0 μ mol/L）した。その作用はカリウムチャンネル（SKCaチャンネル：small conductance Ca^{2+} -activated K^+ チャンネル）の活性化を介したタキキニン遊離抑制作用によると考えられた。

(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^{13)~15)}

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「V T R S」 : 0.8±0.3 (hr)

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」 : 0.8±0.3 (hr)

オロパタジン塩酸塩錠 0D錠 5mg 「V T R S」 : 0.8±0.4 (hr) (水で服用)

1.5±0.8 (hr) (水なしで服用)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

単回投与

<成人>³⁹⁾

健康成人男性にオロパタジン塩酸塩錠 5mg 及び 10mg を絶食下单回経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった。

健康成人男性に単回経口投与したときの薬物動態パラメータ

投与量	t_{max} (h)	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng·h/mL)	$t_{1/2}$ (h)
5mg (n=6)	1.00±0.32	107.66±22.01	326±63 ^{a)}	8.75±4.63 ^{a)}
10mg (n=12)	0.92±0.47	191.78±42.99	638±136 ^{b)}	7.13±2.21 ^{b)}

a) n=4、b) n=10

mean±S. D.

<小児>⁴⁰⁾

小児アレルギー患者 (10~16 歳、40~57kg) にオロパタジン塩酸塩錠 5mg を単回経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった。

小児アレルギー患者に単回経口投与したときの薬物動態パラメータ

投与量	t_{max} (h)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{0-12} (ng·h/mL)
5mg (n=6)	1.33±0.52	81.57±9.91	228±20

mean±S. D.

反復投与³⁹⁾

健康成人男性 (8 例) にオロパタジン塩酸塩錠 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とき、4 日目までに血漿中濃度は定常状態に達し、 C_{max} は単回経口投与時の 1.14 倍であった。

生物学的同等性試験

①オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」⁴¹⁾

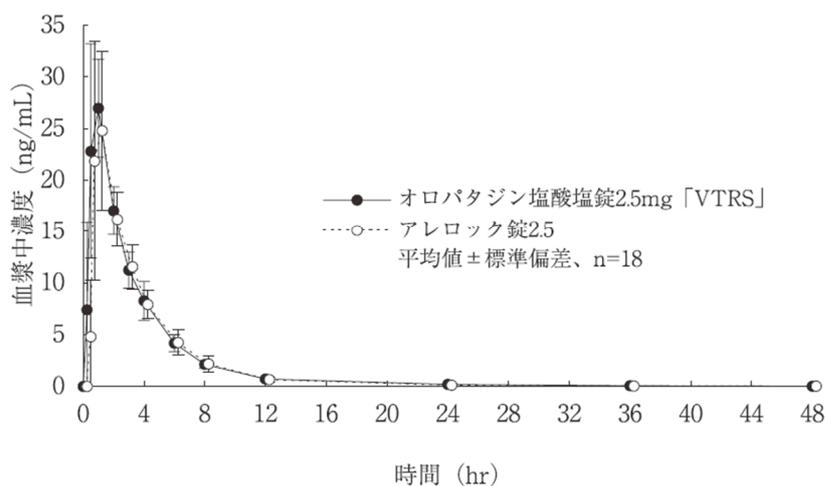
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」とアレロック錠 2.5 を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（オロパタジン塩酸塩として 2.5mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中オロパタジン塩酸塩濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

血漿中オロパタジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

投与量	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」	95.12±12.35	30.07±6.09	0.8±0.3	8.95±7.11
アレロック錠 2.5	89.93±11.24	28.19±6.22	0.9±0.5	5.77±5.54

(平均値±標準偏差、n=18)

血漿中オロパタジン塩酸塩の濃度推移



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。

②オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」⁴²⁾

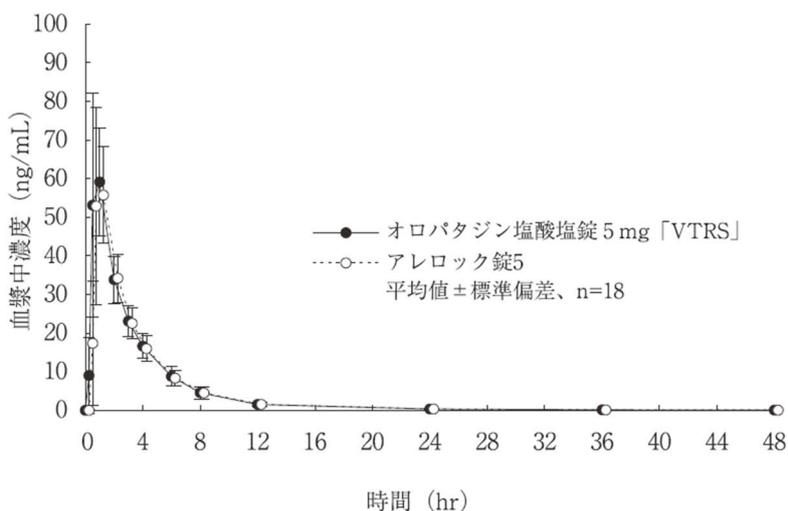
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」とアレロック錠 5 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（オロパタジン塩酸塩として 5mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中オロパタジン塩酸塩濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

血漿中オロパタジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

投与量	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」	197.35±33.79	68.46±22.55	0.8±0.3	8.38±6.08
アレロック錠 25	194.36±26.38	65.85±18.04	0.8±0.4	8.81±9.28

(平均値±標準偏差、n=18)

血漿中オロパタジン塩酸塩の濃度推移



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。

③オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「V T R S」⁴³⁾

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「V T R S」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 12 年 2 月 14 日 医薬審第 64 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正）」に基づき、オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5 mg 「V T R S」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。

④オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」⁴⁴⁾

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」とアレロック OD 錠 5 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時単回経口投与（水で服用及び水なしで服用）して血漿中オロパタジン塩酸塩濃度を測定し、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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

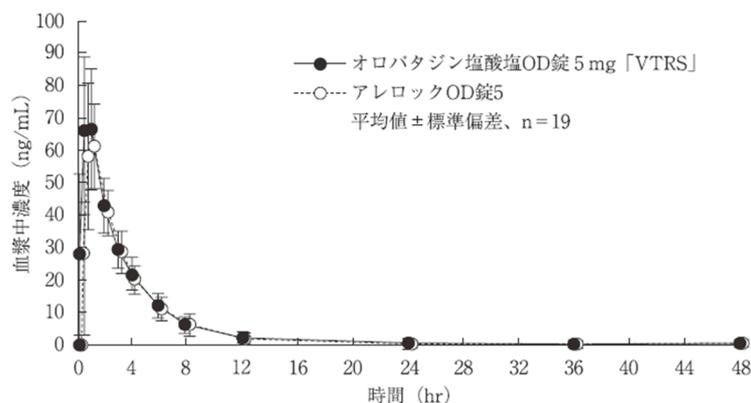
<水で服用>

血漿中オロパタジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

投与量	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (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「VTRS」	253.41±48.30	76.85±19.03	0.8±0.4	10.00±7.7
アレロック OD錠5	237.14±41.17	69.04±14.05	0.7±0.3	11.5±8.7

(平均値±標準偏差、n=19)

血漿中オロパタジン塩酸塩の濃度推移



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。

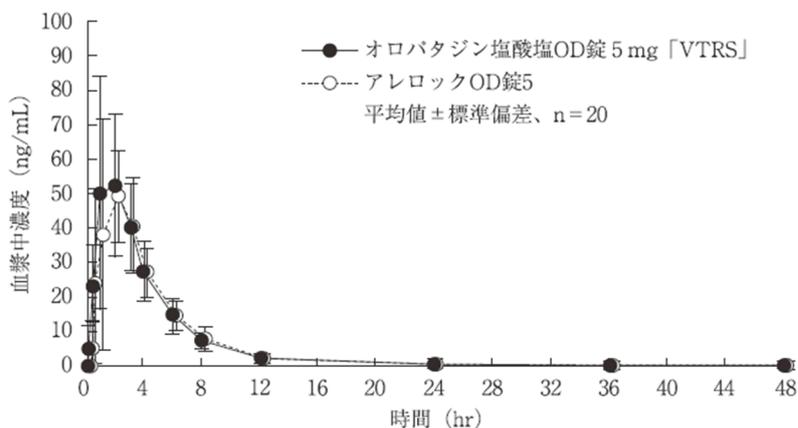
<水なしで服用>

血漿中オロパタジン塩酸塩の薬物動態パラメータ

投与量	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _t (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「VTRS」	255.57±44.36	72.77±15.54	1.5±0.8	11.0±9.2
アレロック OD錠5	245.78±43.68	64.91±15.72	1.8±0.7	10.6±6.5

(平均値±標準偏差、n=20)

血漿中オロパタジン塩酸塩の濃度推移



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。

(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

該当資料なし

(4) 消失速度定数

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「V T R S」 : 0.1107±0.0538 (/hr)

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」 : 0.1147±0.0511 (/hr)

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」 : 0.1005±0.0525 (/hr) (水で服用)

0.0975±0.0525 (/hr) (水なしで服用)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積⁴⁵⁾

ラットに¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、大部分の組織で投与後 30 分に最も高い放射能濃度を示した。消化管のほか、肝臓、腎臓及び膀胱の放射能濃度は、血漿中放射能濃度より高かった。

(7) 血漿蛋白結合率⁴⁶⁾

ヒト血清蛋白結合率は以下のとおりであった (*in vitro*)。

添加濃度 (ng/mL)	0.1	10	1000
血清蛋白結合率 (%)	54.7±1.7	55.2±0.8	54.7±5.5

限外ろ過法による

mean±S. D. (n=3)

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性⁴⁵⁾

ラットに ¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、脳内放射能濃度は測定した組織中で最も低く、その C_{max} は血漿中放射能濃度の C_{max} の約 1/25 であった。

(2) 血液－胎盤関門通過性⁴⁷⁾

妊娠ラットに ¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、胎児血漿中及び組織内の放射能濃度は、母体血漿中放射能濃度の 0.07～0.38 倍であった。

(3) 乳汁への移行性⁴⁷⁾

授乳期のラットに ¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1mg/kg を経口投与したとき、乳汁中放射能濃度の $AUC_{0-\infty}$ は、血漿中放射能濃度の $AUC_{0-\infty}$ の約 1.5 倍であった。

(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^{39)、48)}

健康成人 (6 例) にオロパタジン塩酸塩錠 80mg を単回経口投与したときの血漿中代謝物は、N-酸化体約 7%、N-モノ脱メチル体約 1%未変化体との AUC 比) であり、尿中代謝物は、各々約 3%、約 1% (48 時間までの累積尿中排泄率) であった。

(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

＜成人＞³⁹⁾

健康成人にオロパタジン塩酸塩錠 5mg (6 例) 及び 10mg (12 例) を単回経口投与したときの 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、健康成人 (8 例) にオロパタジン塩酸塩錠 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ときの尿中排泄率は、単回経口投与後と同程度であった。

＜小児＞⁴⁰⁾

小児アレルギー患者 (10～16 歳、40～57kg、6 例) にオロパタジン塩酸塩錠 5mg を単回投与したときの 12 時間までの未変化体の尿中排泄率は、投与量の 61.8%であった。

(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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 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。

8.2 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

〈アレルギー性鼻炎〉

8.3 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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 長期ステロイド療法を受けている患者

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。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 腎機能低下患者（クレアチニンクリアランス 30mL/min 未満）

高い血中濃度が持続するおそれがある。 [16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

肝機能障害が悪化するおそれがある。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

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。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

(7) 小児等

9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。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。 [16.6.2、17.1.4 参照]

7. 相互作用

設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

劇症肝炎、AST、ALT、 γ -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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症		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	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, AST, LDH, γ -GTP, A1-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) 発現頻度はアレロック錠における成人の使用成績調査及び特別調査、アレロック錠、OD錠及び顆粒における小児の特定使用成績調査を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

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。

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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ある。

〈オロパタジン塩酸塩錠〉

14.1.2 分割したときは遮光下に保存すること。

〈オロパタジン塩酸塩OD錠〉

14.1.2 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 因果関係は明らかではないが、オロパタジン塩酸塩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。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験
該当資料なし

(3) 安全性薬理試験
該当資料なし

(4) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験
該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験
該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験
該当資料なし

(4) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「V T R S」 該当しない
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」 該当しない
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「V T R S」 該当しない
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」 該当しない
有効成分：日局 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

有効期間：3年

（「IV. 製剤に関する項目」の「4. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照。）

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) 薬局での取り扱いについて

OD 錠（口腔内崩壊錠）

本剤の錠剤表面に斑点が認められることがありますが、これは使用色素によるものであり、品質に影響はありません。

(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」の「11. 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

〈オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

〈オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [10錠 (PTP) ×50]

〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [10錠 (PTP) ×50]

7. 容器の材質

PTP シート（オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg・5mg）：環状ポリオレフィン、ポリプロピレン、アルミニウム箔

PTP シート（オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg・5mg）：ポリ塩化ビニリデン（PVDC）、アルミニウム箔

8. 同一成分・同効薬

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

（協和発酵キリン株式会社）

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

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造承認年月日	承認番号
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」	2012年8月15日	22400AMX00960
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「VTRS」	2012年8月15日	22400AMX00961
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「VTRS」	2013年2月15日	22500AMX00082
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「VTRS」	2013年2月15日	22500AMX00083

11. 薬価基準収載年月日

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTRS」：2022年6月1日

オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「VTRS」：2022年6月17日

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「VTRS」：2022年6月1日

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「VTRS」：2022年6月17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

2014年11月14日：効能・効果及び用法・用量の追加（一部変更承認）

「小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症）に伴う掻痒」

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、厚生労働省告示第 107 号（平成 18 年 3 月 6 日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9 桁) 番号	厚生労働省薬価基準収載 医薬品コード	レセプト電算処理 システムコード
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「V T R S」	122053703	統一名：4490025F1015 個 別：4490025F1325	622205303
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」	122054402	4490025F2321	622205402
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「V T R S」	122320002	統一名：4490025F3018 個 別：4490025F3190	622232002
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「V T R S」	122321703	4490025F4197	622232103

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (1) -明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較-」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009：25
- 2) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (2) -低視力状態での可視性の比較-」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009：29
- 3) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (3) -低コントラスト状態での可視性の比較-」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009：33
- 4) 社内資料：安定性試験（加速試験）（オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」）
- 5) 社内資料：安定性試験（加速試験）（オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」）
- 6) 社内資料：安定性試験（加速試験）（オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「VTRS」）
- 7) 社内資料：安定性試験（加速試験）（オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「VTRS」）
- 8) 社内資料：安定性試験（無包装状態）（オロパタジン塩酸塩錠「VTRS」）
- 9) 社内資料：安定性試験（無包装状態）（オロパタジン塩酸塩 OD 錠「VTRS」）
- 10) 社内資料：溶出試験（オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「VTRS」）
- 11) 社内資料：溶出試験（オロパタジン塩酸塩錠 5mg「VTRS」）
- 12) 社内資料：溶出試験（オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「VTRS」）
- 13) 社内資料：溶出試験（オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「VTRS」）
- 14) 通年性アレルギー性鼻炎に対する臨床評価-Oxatomide を対照薬とした二重盲検比較試験-（アレロック錠：2000.12.22 承認、申請資料概要ト-I-2-3）
- 15) 西山茂夫ほか：臨床医薬. 2001；17：237-264
- 16) 西山茂夫ほか：臨床医薬. 1996；12：1615-1640
- 17) 臨床試験における高齢者（65歳以上）の安全性と有効性のまとめ（アレロック錠：2000.12.22 承認、申請資料概要ト-I-5-2、ト-II-2）
- 18) Okubo K, et al. : Curr Med Res Opin. 2010；26：1657-1665
- 19) 小児通年性アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験（アレロック錠/OD 錠：2010.7.23 承認、CTD2.7.6.2）
- 20) 大久保公裕：アレルギー・免疫. 2011；18：108-116
- 21) 川島眞ほか：西日皮膚. 2011；73：278-289
- 22) 第十八改正 日本薬局方解説書. 廣川書店. 2021：C-1276-1282
- 23) 大森健守ほか：日薬理法. 2001；118：51-58
- 24) 野中裕美ほか：薬理と臨床. 1995；5：1817-1824
- 25) 佐々木康夫ほか：薬理と臨床. 1995；5：1825-1835
- 26) 貝瀬俊彦ほか：アレルギー. 1995；44：1229-1233
- 27) Kamei C, et al. : Arzneim-Forsch/Drug Res. 1995；45：1005-1008
- 28) Kaise T, et al. : Jpn J Pharmacol. 1995；69：435-438
- 29) 石井秀衛ほか：日薬理誌. 1995；106：289-298
- 30) 石井秀衛ほか：基礎と臨床. 1995；29：3543-3559
- 31) Ohmori K, et al. : Int Arch Allergy Immunol. 1996；110：64-72
- 32) 佐々木康夫ほか：日薬理誌. 1995；106：347-357
- 33) 佐々木康夫ほか：薬理と臨床. 1995；5：1837-1850
- 34) Ikemura T, et al. : Int Arch Allergy Immunol. 1996；110：57-63
- 35) 化学伝達物質の産生・遊離に及ぼす影響（アレロック錠：2000.12.22 承認、申請資料概要 ホ-II-2 3.）
- 36) 池村俊秀ほか：アレルギー. 1994；43：1087

- 37) Ikemura T, et al. : Br J Pharmacol. 1996 ; 117 : 967-973
- 38) タキキニンの遊離に及ぼす影響 (アレロック錠 : 2000. 12. 22 承認、申請資料概要ホ-II-3)
- 39) 角尾道夫ほか : 基礎と臨床. 1995 ; 29 : 4129-4147
- 40) 小児における薬物動態試験 (アレロック錠/OD錠 : 2010. 7. 23 承認、CTD2. 7. 2. 2. 1、CTD2. 7. 2. 3. 1)
- 41) 社内資料 : 生物学的同等性試験 (オロパタジン塩酸塩錠 2. 5mg 「V T R S」)
- 42) 社内資料 : 生物学的同等性試験 (オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」)
- 43) 社内資料 : 生物学的同等性試験 (オロパタジン塩酸塩 OD錠 2. 5mg 「V T R S」)
- 44) 社内資料 : 生物学的同等性試験 (オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「V T R S」)
- 45) 大石孝義ほか : 薬物動態. 1995 ; 10 : 651-668
- 46) 血清蛋白結合率 (in vitro) (アレロック錠 : 2000. 12. 22 承認、申請資料概要へ-II-2 5.)
- 47) 大石孝義ほか : 薬物動態. 1995 ; 10 : 707-721
- 48) 国内第 I 相単回投与試験における代謝物の検討 (アレロック錠 : 2000. 12. 22 承認、申請資料概要へ-III-1 1.)

2. その他の参考文献

参考文献 1) 藤島 一郎 監修 : 内服薬経管投与ハンドブック第 2 版 p37-43、東京、じほう、2006

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. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関するQ&Aについて(その3)」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課事務連絡)

(1) 粉碎

〈オロパタジン塩酸塩錠〉

【試験方法】

試料の調整方法：粉碎用ミルを用いて粉碎した

保存条件：①温度：40℃±1℃、75%RH±5%RH 褐色ガラス瓶（気密）

②湿度：25℃±2℃、75%±5%RH シャーレ開放（遮光）

③光：2500Lux、25℃±2℃、45%RH±5%RH（シャーレ開放）

測定時期：①・②開始時、7日、14日、30日

③開始時、30万Lux・hr、60万Lux・hr、120万Lux・hr 到達時

試験項目：外観、含量

試験回数：外観1回、含量3回

【試験結果】

製品名：オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40℃/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末
含量 (%)	99.0	97.5	98.8	97.6
[対開始時 (%)]	[100.0]	[98.5]	[99.8]	[98.6]

②湿度に対する安定性試験 [25℃/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末
含量 (%)	99.0	97.4	97.5	96.6
[対開始時 (%)]	[100.0]	[98.4]	[98.5]	[97.6]

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	30万Lux・hr	60万Lux・hr	120万Lux・hr
外観	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末
含量 (%)	99.0	93.5	92.7	90.0
[対開始時 (%)]	[100.0]	[94.4]	[93.6]	[90.9]

製品名：オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40°C/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末
含量 (%) [対開始時 (%)]	99.4 [100.0]	97.6 [98.2]	98.5 [99.1]	98.8 [99.4]

②湿度に対する安定性試験 [25°C/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末
含量 (%) [対開始時 (%)]	99.4 [100.0]	97.6 [98.2]	97.8 [98.4]	97.2 [97.8]

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	30万 Lux・hr	60万 Lux・hr	120万 Lux・hr
外観	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末	微赤色の粉末
含量 (%) [対開始時 (%)]	99.4 [100.0]	93.4 [94.0]	93.5 [94.1]	92.2 [92.8]

〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠〉

【試験方法】

保存条件：①温度：40°C±1°C・75%RH±5%RH（ガラス瓶遮光・気密容器）

②湿度：25°C±2°C・75%RH±5%RH（透明プラスチックシャーレ開放）

③光：2500Lux、25°C±2°C・45%RH±5%RH（透明プラスチックシャーレ開放）

測定時期：①・② 開始時、7、14、30日目、③ 開始時、30万、60万、120万 Lux・hr

試験項目：外観、含量

試験回数：外観1回、含量3回

【試験結果】

製品名：オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40°C±1°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末
含量 (%)	100.3	100.4	98.9	98.8

②湿度に対する安定性試験 [25°C±2°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末
含量 (%)	100.3	99.5	97.6	97.6

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	30万 Lux・hr	60万 Lux・hr	120万 Lux・hr
外観	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末	ごくうすい黄色 の粉末
含量 (%)	100.3	99.8	98.2	97.0

製品名：オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40°C±1°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末
含量 (%)	99.8	101.2	99.7	98.5

②湿度に対する安定性試験 [25°C±2°C・75%RH±5%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末
含量 (%)	99.8	98.7	98.3	97.6

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	30万Lux・hr	60万Lux・hr	120万Lux・hr
外観	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末	ごくうすい黄色の粉末
含量 (%)	99.8	98.8	98.5	98.1

本剤の粉碎しての投与は弊社としては推奨していない。

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

〈オロパタジン塩酸塩錠〉

【崩壊懸濁試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」^{参考文献1)}に準じて実施。

1錠又は1カプセルをカテーテル用ディスペンサーに入れ、これに55°Cの温湯20mLを吸い取り、ディスペンサーの先端に蓋をし、横向きに5分間放置する。5分後、ディスペンサーを手で90度の角度で15回往復横転し、「崩壊・懸濁」を観察する。

5分後に崩壊・懸濁しないものは更に5分間放置し、同様の操作を行う。それでも「崩壊・懸濁」しないものは、この方法による試料調製を中止する。

中止した薬剤は、粉碎可能な錠剤は、シート(PTP、SP)の上から乳棒で数回叩いてコーティング破壊をするか、開封可能なカプセル剤は開封してカテーテル用ディスペンサーに入れ、以下、上記と同様に操作を行う。

【通過性試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」^{参考文献1)}に準じて実施。

ディスペンサー内で、崩壊懸濁試験で得られた試料溶液を経管栄養カテーテルの注入先端より約2～3mL/秒の速度で注入する。カテーテルはベッド上の患者を想定して、体内挿入端から2/3を水平にする。他端(ディスペンサー注入先)は30cmの高さにセットする。経管栄養カテーテルのサイズは「8Fr」を用いる。

薬剤注入後、適量の水(約10mL)で洗浄するとき、薬剤の残存を確認する。

【試験結果】

剤型	崩壊懸濁試験				通過性試験
	水 (約 55℃)		破壊→水		通過サイズ
	5分	10分	5分	10分	
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg 「VTR S」	○	/	/	/	8Fr.
オロパタジン塩酸塩錠 5mg 「VTR S」	×	○	/	/	8Fr.

○：完全崩壊 ×：投与困難な崩壊状態

〈オロパタジン塩酸塩 OD 錠〉

【崩壊懸濁試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」^{参考文献1)}に準じて実施。

- ・ディスペンサー内に薬剤を入れ 55℃の温湯 20 mL を吸い取り、筒先の蓋をして 5 分間自然放置する。
- ・5 分後にディスペンサーを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。
- ・5 分後に崩壊しない場合、更に 5 分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止する。
- ・中止した錠剤はコーティング破壊をしてから同様に試験を行う。コーティング破壊はシートの上から錠剤を乳棒で数回叩いて行う。

【通過性試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」^{参考文献1)}に準じて実施。

- ・崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をサイズ 8Fr. (フレンチ) の経管チューブに約 2~3 mL/秒の速度で注入し、通過性を観察する。
- ・懸濁液を注入した後に適量の水を同じ注入器で吸い取り、注入してチューブ内を洗う時、チューブ内に薬が残存していなければ通過性に問題なしとする。

【試験結果】

剤型	崩壊懸濁試験				通過性試験
	水 (約 55℃)		破壊→水		通過サイズ
	5分	10分	5分	10分	
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「VTR S」	○	/	/	/	8Fr.
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「VTR S」	○	/	/	/	8Fr.

○：完全に崩壊し、良好な懸濁状態を示した

2. その他の関連資料

該当資料なし

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ヴィアトリス製薬株式会社　メディカルインフォメーション部
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号
フリーダイヤル　0120-419-043

製造販売元

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

販売元

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

