

医薬品インタビューフォーム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)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り、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF記載要領2018が公表され、今般「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」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や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、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

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	38
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	38
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	38
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	38
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	38
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	38
6. RMPの概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	38
II. 名称に関する項目	2	7. 相互作用	39
1. 販売名	2	8. 副作用	39
2. 一般名	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	40
3. 構造式又は示性式	2	10. 過量投与	40
4. 分子式及び分子量	2	11. 適用上の注意	40
5. 化学名(命名法)又は本質	2	12. その他の注意	41
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	IX. 非臨床試験に関する項目	42
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理試験	42
1. 物理化学的性質	4	2. 毒性試験	42
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	X. 管理的事項に関する項目	43
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 規制区分	43
IV. 製剤に関する項目	5	2. 有効期間	43
1. 剤形	5	3. 包装状態での貯法	43
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	43
3. 添付溶解液の組成及び容量	8	5. 患者向け資材	43
4. 力価	8	6. 同一成分・同効薬	43
5. 混入する可能性のある夾雑物	8	7. 国際誕生年月日	43
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	44
7. 調製法及び溶解後の安定性	15	9. 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	44
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	15	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	44
9. 溶出性	15	11. 再審査期間	44
10. 容器・包装	20	12. 投薬期間制限に関する情報	44
11. 別途提供される資材類	21	13. 各種コード	44
12. その他	21	14. 保険給付上の注意	44
V. 治療に関する項目	23	XI. 文献	45
1. 効能又は効果	23	1. 引用文献	45
2. 効能又は効果に関連する注意	23	2. その他の参考文献	46
3. 用法及び用量	23	XII. 参考資料	47
4. 用法及び用量に関連する注意	23	1. 主な外国での発売状況	47
5. 臨床成績	23	2. 海外における臨床支援情報	47
VI. 薬効薬理に関する項目	29	XIII. 備考	48
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	29	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たつての参考情報	48
2. 薬理作用	29	2. その他の関連資料	50
VII. 薬物動態に関する項目	31		
1. 血中濃度の推移	31		
2. 薬物速度論的パラメータ	35		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	35		
4. 吸収	35		
5. 分布	35		
6. 代謝	36		
7. 排泄	37		
8. トランスポーターに関する情報	37		
9. 透析等による除去率	37		
10. 特定の背景を有する患者	37		
11. その他	37		

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2.5mg/錠5mg/OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」は日局オロパタジン塩酸塩を含有するアレルギー性疾患治療剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

	錠2.5mg/錠5mg	OD錠2.5mg/OD錠5mg
承認申請に際し 準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号(平成21年3月4日 薬食発第0304004号により一部改正)	
承認	2012年8月	2014年8月
上市	2012年12月	2014年12月

2014年12月に「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」の効能又は効果が追加承認された。(X. -9. 参照)

2. 製品の治療学的特性

1) 本剤の用法は、「1日2回投与」である。(V. -3. 参照)

2) 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。(VI. -2. 参照)

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. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

「IV. 製剤に関する項目」及び沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」
<https://med.sawai.co.jp/> 参照

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2026年4月1日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

1) 承認条件

該当しない

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

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「サワイ」

オロパタジン塩酸塩錠5mg「サワイ」

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

2) 洋名

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE Tablets, OD Tablets [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

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)

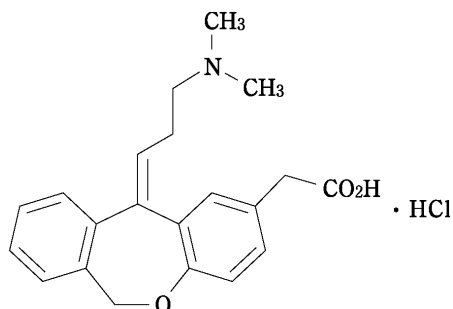
Olopatadine Hydrochloride(JAN)

Olopatadine(INN)

3) ステム(stem)

-tadine : tricyclic histamine- H_1 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)又は本質

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号
特になし

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

乾燥減量：0.3%以下(1g、105℃、3時間)

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である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

保存条件：密閉容器

3. 有効成分の確認試験法、定量法

＜確認試験法＞

日局「オロパタジン塩酸塩」の確認試験に準ずる。

1) 紫外可視吸光度測定法

2) 赤外吸収スペクトル測定法

3) 塩化物の定性反応

＜定量法＞

日局「オロパタジン塩酸塩」の定量法に準ずる。(電位差滴定法)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」：フィルムコーティング錠

オロパタジン塩酸塩錠5mg「サワイ」：割線入りフィルムコーティング錠

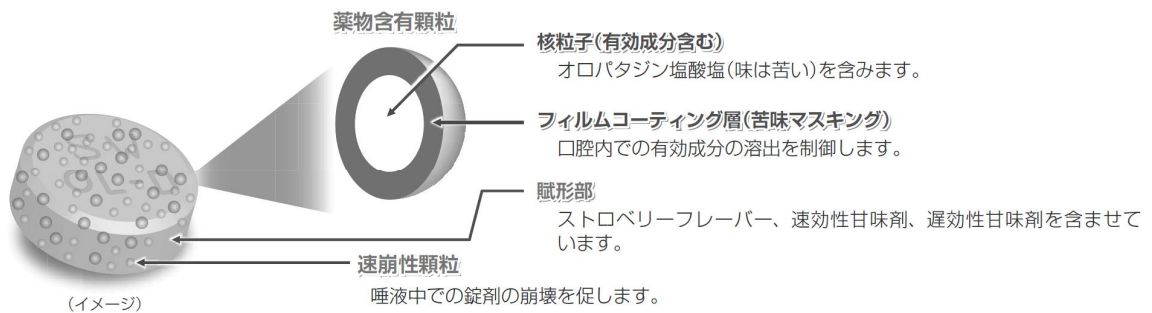
オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」：素錠(口腔内崩壊錠)

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」：割線入り素錠(口腔内崩壊錠)

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

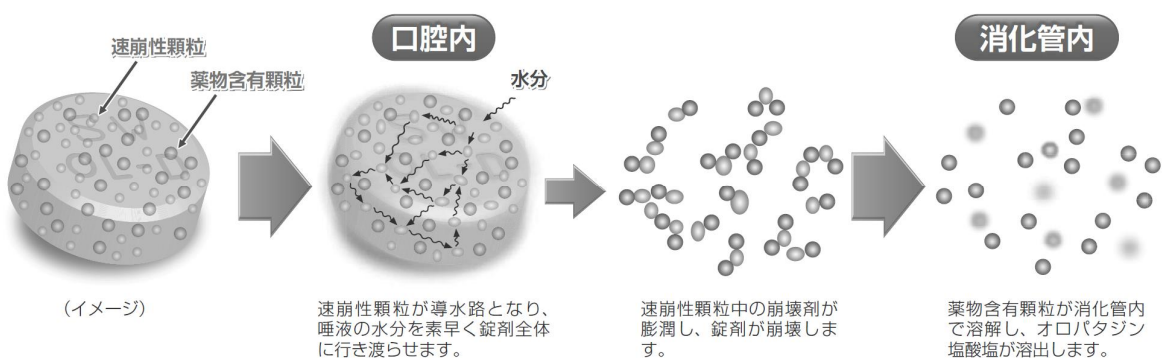
1. 苦味マスキング

核粒子(有効成分含む)にコーティングを施すことで、口腔内での有効成分の溶出を抑制する。更に速効性甘味剤・遅効性甘味剤を添加し、ストロベリーフレーバーを採用している。



2. 速崩性機構

添加された速崩性顆粒が錠剤中で導水路の役目を果たす。口腔内では錠剤全体に素早く水分を行き渡らせ、崩壊を促す。



IV. 製剤に関する項目

2) 製剤の外観及び性状

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」

品 名	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性 状
オロパタジン 塩酸塩錠 2.5mg「サワイ」	 6.2	 約75	 2.9	淡黄赤色
オロパタジン 塩酸塩錠 5mg「サワイ」	 7.2	 約118	 3.0	淡黄赤色

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

品 名	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性 状
オロパタジン 塩酸塩OD錠 2.5mg「サワイ」	 7.0	 約110	 2.3	ごくうすい赤色
オロパタジン 塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」	 8.5	 約220	 3.2	ごくうすい赤色

ストロベリー様芳香、添加剤由来の甘みを有する。

3) 識別コード

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW OL2.5

●オロパタジン塩酸塩錠5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW OL5

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW OL-D 2.5

●オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW OL-D 5

4) 製剤の物性

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」

製剤均一性：日局オロパタジン塩酸塩錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局オロパタジン塩酸塩錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

摩損度：日本薬局方 参考情報 錠剤の摩損度試験法により試験を行う。(25rpm、4分間)
0.13%(OD錠2.5mg)、0.06%(OD錠5mg)

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」

品 名	オロパタジン塩酸塩錠2.5mg 「サワイ」	オロパタジン塩酸塩錠5mg 「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局オロパタジン塩酸塩	
	2.5mg	5mg
添加剤	カルナウバロウ、クロスカルメロースNa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000、D-マンニトール	

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

品 名	オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg 「サワイ」	オロパタジン塩酸塩OD錠5mg 「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局オロパタジン塩酸塩	
	2.5mg	5mg
添加剤	カルメロース、カルメロースCa、クエン酸トリエチル、クロスボビドン、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、スクラロース、ステアリン酸Mg、タウマチン、タルク、バニリン、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリソルベート80、D-マンニトール、メタクリル酸コポリマーLD、メタケイ酸アルミン酸Mg、ラウリル硫酸Na、黄色5号アルミニウムレーキ、香料	

2) 電解質等の濃度

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」

Ca量：1錠中、カルメロースCaとしてCaを約0.021mg含有する。[理論値]

IV. 製剤に関する項目

●オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

Ca量：1錠中、カルメロースCaとしてCaを約0.043mg含有する。[理論値]

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)¹⁾

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)したもののについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保 存 条 件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性 状	淡黄赤色のフィルムコーティング錠であった	同左
確 認 試 験	規格に適合	同左
含 量 均 一 性 試 験	規格に適合	同左
溶 出 試 験	規格に適合	同左
定 量 試 験 ※	98.9	98.8

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験²⁾

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性 状	淡黄赤色の フィルムコー ティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬 度 (kg)	5.7	4.5	4.3	4.9	5.1
溶 出 試 験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定 量 試 験 ※	100.0	101.2	101.4	101.6	101.0

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)³⁾

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保 存 条 件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヶ月
性 状	淡黄赤色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確 認 試 験	規格に適合	同左
含 量 均 一 性 試 験	規格に適合	同左
溶 出 試 験	規格に適合	同左
定 量 試 験 ※	99.7	98.6

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)³⁾

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保 存 条 件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヶ月
性 状	淡黄赤色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確 認 試 験	規格に適合	同左
含 量 均 一 性 試 験	規格に適合	同左
溶 出 試 験	規格に適合	同左
定 量 試 験 ※	99.7	99.1

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性試験⁴⁾

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3 ヶ月)
性 状	淡黄赤色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬 度 (kg)	6.0	4.7	4.5	5.3	5.4
溶 出 試 験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定 量 試 験 ※	100.0	99.6	99.8	99.6	100.1

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁵⁾

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保 存 条 件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性 状	ごくうすい赤色の素錠であった	同左
確 認 試 験	規格に適合	同左
含 量 均 一 性 試 験	規格に適合	同左
崩 壊 試 験	規格に適合	同左
溶 出 試 験	規格に適合	同左
定 量 試 験 ※	102.9	103.3

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁶⁾

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
583T5S9205	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	D65ランプ(1000lx)、開放

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・溶出試験・崩壊試験・定量試験	1回
硬度*(5錠の平均値)	1回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(N)	崩壊試験	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	56	適合	適合	100.0
温度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 53	変化なし	変化なし	変化なし 101.5
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 41	変化なし	変化なし	変化なし 100.2
室温(3ヵ月)	変化なし	変化なし 51	変化なし	変化なし	変化なし 101.6
光(60万lx・hr)	変化あり (規格内) (b)	変化なし 50	変化なし	変化なし	変化なし 100.0

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：ごくうすい赤色の口腔内崩壊錠

(b)：ごくうすい赤色の口腔内崩壊錠であったが、若干の退色を認めた

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁷⁾

目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
583T5S9205	室温	25℃/60%RH、遮光開放

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・溶出試験・崩壊試験・定量試験	1回
硬度*(5錠の平均値)	1回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(N)	崩壊試験	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	56	適合	適合	100.0
室温(6ヵ月)	変化なし	変化なし 57	変化なし	変化なし	変化なし 101.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：ごくうすい赤色の口腔内崩壊錠

IV. 製剤に関する項目

●オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁸⁾

オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保 存 条 件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性 状	ごくうすい赤色の割線入り素錠であった	同左
確 認 試 験	規格に適合	同左
含 量 均 一 性 試 験	規格に適合	同左
崩 壊 試 験	規格に適合	同左
溶 出 試 験	規格に適合	同左
定 量 試 験 ※	103.9	103.2

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁹⁾

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
583T6S9210	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	D65ランプ(1000lx)、開放

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・溶出試験・崩壊試験・定量試験	1回
硬度*(5錠の平均値)	1回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

結果

試験項目 保存条件・期間		性状	硬度(N)	崩壊試験	溶出試験	定量試験※
イニシャル		(a)	83	適合	適合	100.0
温度(3ヵ月)		変化なし	変化なし 81	変化なし	変化なし	変化なし 100.9
湿度	1ヵ月	変化なし	変化なし 59	変化なし	変化なし	変化なし 99.5
	3ヵ月	変化なし	変化あり (規格内) 58	変化なし	変化なし	変化なし 99.2
室温(3ヵ月)		変化なし	変化なし 76	変化なし	変化なし	変化なし 99.9
光(60万lx・hr)		変化あり (規格内) (b)	変化なし 74	変化なし	変化なし	変化なし 100.3

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：ごくうすい赤色の割線入り口腔内崩壊錠

(b)：ごくうすい赤色の割線入り口腔内崩壊錠であったが、若干の退色を認めた

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験¹⁰⁾

目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
583T6S9210	室温	25°C/60%RH、遮光開放

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状・溶出試験・崩壊試験・定量試験	1回
硬度*(5錠の平均値)	1回

*：本製剤の未設定規格のため参考値

IV. 製剤に関する項目

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(N)	崩壊試験	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	83	適合	適合	100.0
室温(6ヵ月)	変化なし	変化なし 80	変化なし	変化なし	変化なし 100.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：ごくうすい赤色の割線入り口腔内崩壊錠

4) 分割後の安定性試験¹¹⁾

目的

本製剤の分割後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を割線に沿って二分割*し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「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(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

*：分割操作は「Cleyera錠剤カッター CHOPPER」を使用

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
621601	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx)、開放

試験項目及び試験回数

試験項目	試験回数
性状†・定量試験・含量均一性試験	1回

†：分割面は未設定規格のため参考として記載

結果

試験項目 保存条件・期間	性状		定量試験※	含量均一性試験
	表面	分割面		
イニシャル	ごくうすい赤色	ごくうすい赤色	100.0	適合
室温(3ヵ月)	変化なし	変化なし	変化なし 99.4	—
光(総照度 120万lx・hr)	変化なし	変化なし	変化なし 98.3	—

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

—：実施無し

A) 評価分類基準

【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
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
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合

【硬度】

分類	評価基準
変化なし	硬度変化が30%未満の場合
変化あり(規格内)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合
変化あり(規格外)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合

【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

9. 溶出性

<溶出挙動における同等性及び類似性>

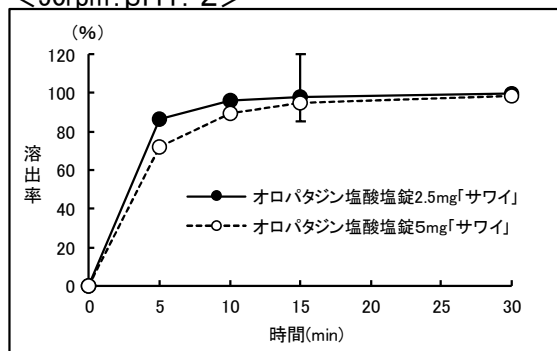
●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」¹²⁾

通知等	「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18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0)
試験回数	12 ベッセル	
試験製剤	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「サワイ」(ロット番号:583T1S1201)	
標準製剤	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」(ロット番号:583T2S0802)	
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±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かった。 <50rpm : pH5.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±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かった。	

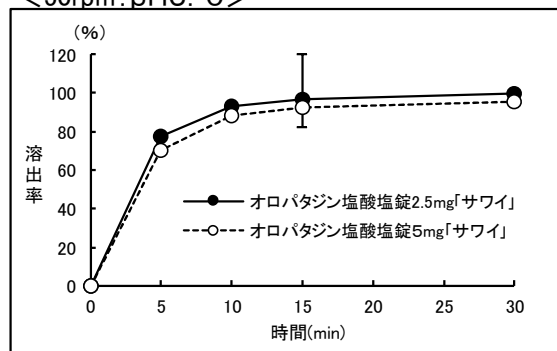
IV. 製剤に関する項目

結果及び考察	<50rpm : pH6. 8> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点(15 分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率$\pm 15\%$の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、$\pm 25\%$の範囲を超えるものがなかった。 <50rpm : 水> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点(15 分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率$\pm 15\%$の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、$\pm 25\%$の範囲を超えるものがなかった。 <100rpm : pH5. 0> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点(15 分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率$\pm 15\%$の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、$\pm 25\%$の範囲を超えるものがなかった。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。 本剤の処方変更水準C水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。
--------	---

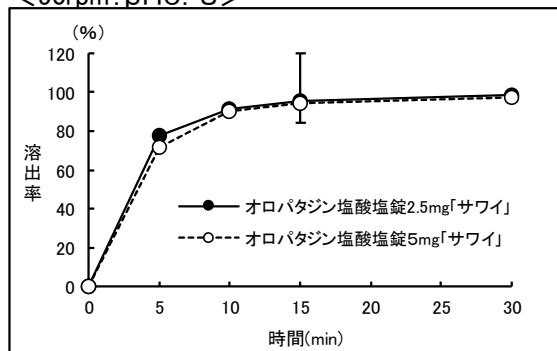
<50rpm: pH1. 2>



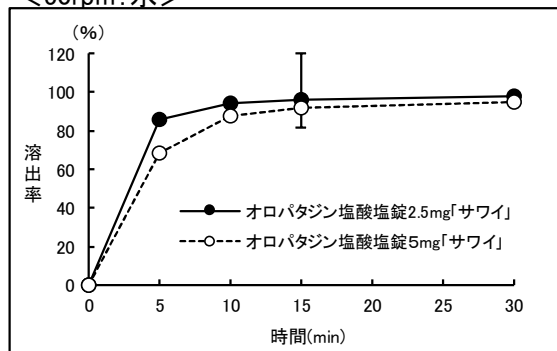
<50rpm: pH5. 0>



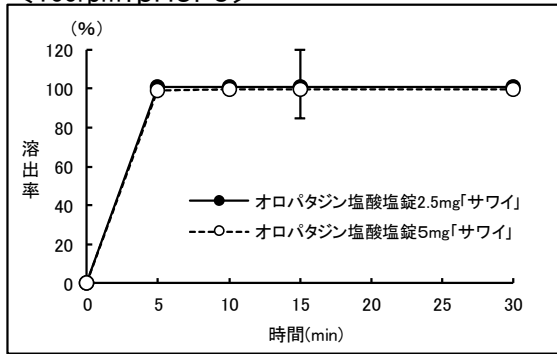
<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



<100rpm:pH5.0>

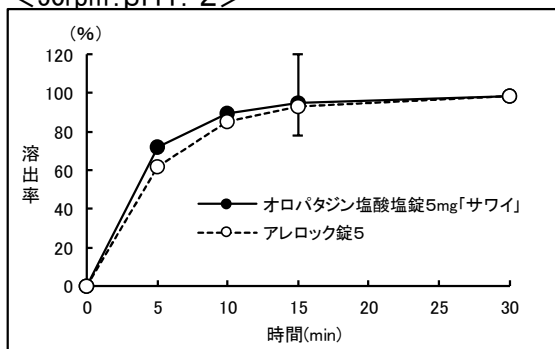


(I : 判定基準の適合範囲)

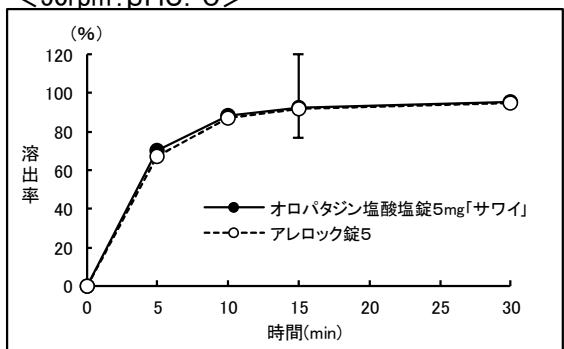
●オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」^{13, 14)}

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0)
試験回数	12 ベッセル	
試験製剤	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」(ロット番号：583T2S0802)	
標準製剤	アレロック錠 5 (ロット番号：079AIA)	
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 <50rpm : pH5.0> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 <50rpm : pH6.8> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 <50rpm : 水> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 <100rpm : pH5.0> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	

<50rpm:pH1.2>

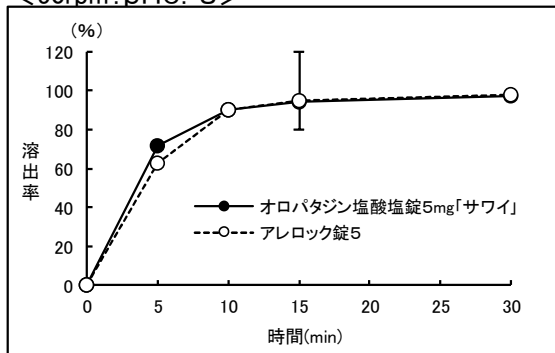


<50rpm:pH5.0>

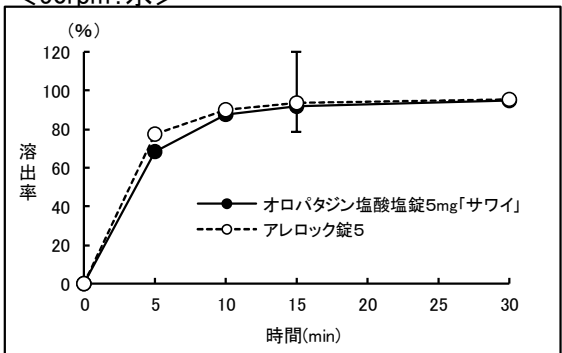


IV. 製剤に関する項目

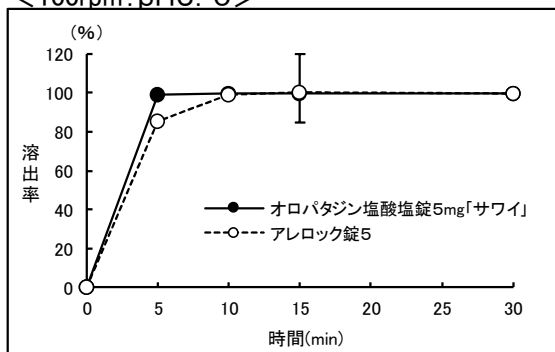
<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



<100rpm: pH5. 0>



([] : 判定基準の適合範囲)

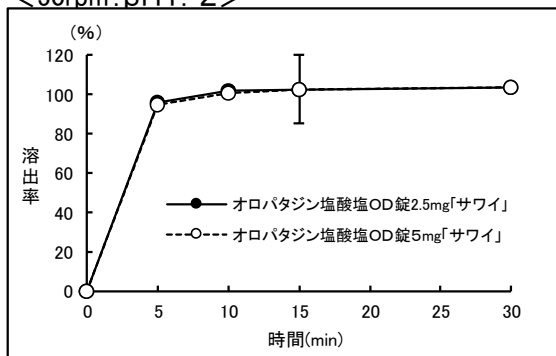
●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」¹⁵⁾

通知等	「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 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1. 2、4. 0、6. 8、水)
試験回数	12 ベッセル	
試験製剤	オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg「サワイ」(ロット番号: 583T5S9202)	
標準製剤	オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」(ロット番号: 583T6S9206)	
結果及び考察	<50rpm: pH1. 2> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点(15 分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±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かった。 <50rpm: pH4. 0> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点(15 分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±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かった。 <50rpm: pH6. 8> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点(15 分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±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かった。	

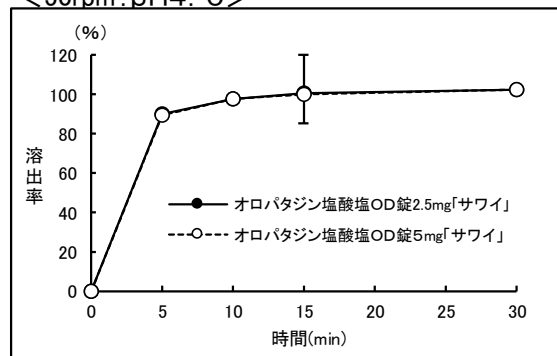
IV. 製剤に関する項目

結果及び考察	<50rpm：水> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点(15 分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±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かった。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。 本剤の処方変更水準はA水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。
--------	---

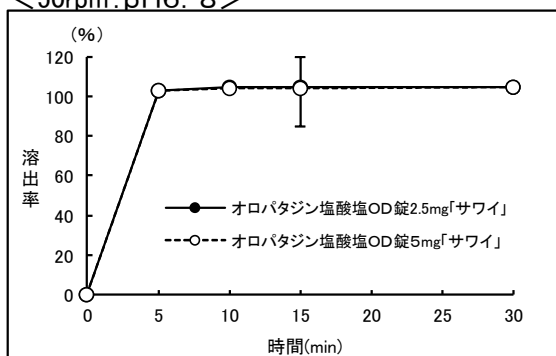
<50rpm:pH1. 2>



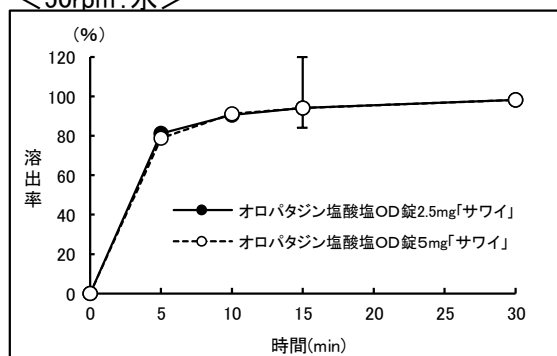
<50rpm:pH4. 0>



<50rpm:pH6. 8>



<50rpm：水>



([] : 判定基準の適合範囲)

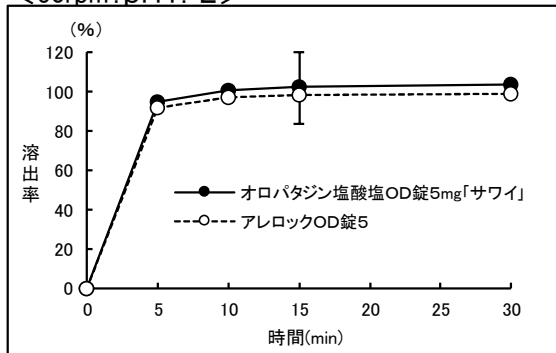
●オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」¹⁶⁾

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1. 2、5. 0、6. 8、水)
試験回数	12 ベッセル	
試験製剤	オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」(ロット番号：583T6S9206)	
標準製剤	アレロックOD錠 5 (ロット番号：229AAI)	
結果及び考察	<50rpm：pH1. 2> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 <50rpm：pH5. 0> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 <50rpm：pH6. 8> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。	

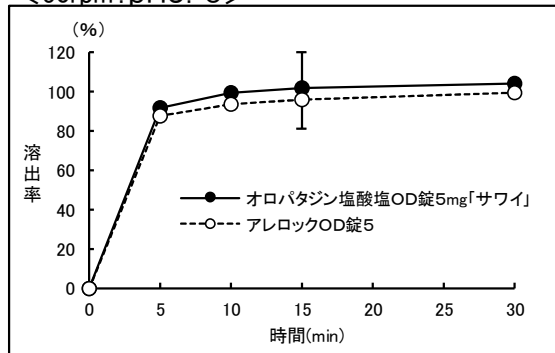
IV. 製剤に関する項目

結果及び考察	<50rpm：水> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。
--------	--

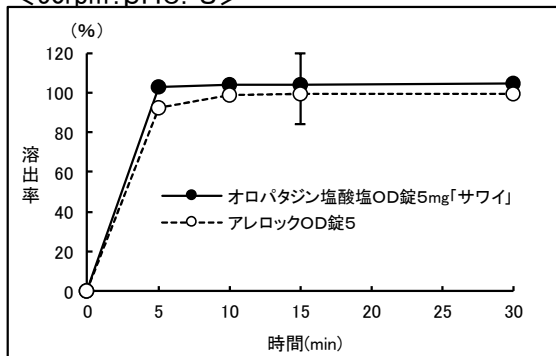
<50rpm：pH1. 2>



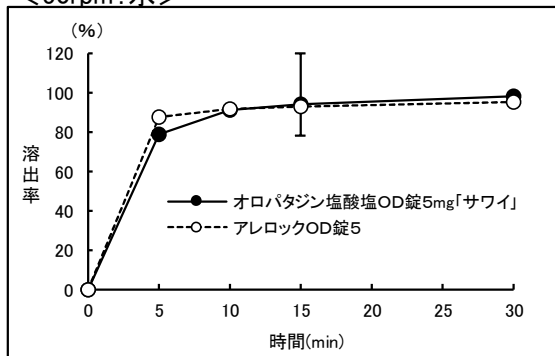
<50rpm：pH5. 0>



<50rpm：pH6. 8>



<50rpm：水>



(I : 判定基準の適合範囲)

10. 容器・包装

1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

2) 包装

●オロパタジン塩酸塩錠2. 5mg/錠 5 mg「サワイ」

22. 包装

<オロパタジン塩酸塩錠2. 5mg「サワイ」>

PTP：100錠(10錠×10)

<オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」>

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

22. 包装

〈オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」〉

PTP：100錠(10錠×10)

〈オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」〉

PTP：100錠(10錠×10)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔
[ピロー]ポリエチレンフィルム

●オロパタジン塩酸塩錠5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔
[ピロー]ポリエチレンフィルム

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミラミネートフィルム

●オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミラミネートフィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

＜自動分包機錠剤落下試験＞

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」¹⁷⁾

湯山製作所製自動分包機による試験

試験機器：Ⅰ. YS-TR-330/260FDSⅡ (ユヤマ)

Ⅱ. YS-TR-130FDX-ⅡSE (ユヤマ)

試験方法：① 本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、それぞれ
1錠ずつ50包に分包した。② 本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、それぞれ
5錠ずつ50包に分包した。

IV. 製剤に関する項目

試験結果(試験機器Ⅰ使用)

	イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
①	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。
②	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。

試験結果(試験機器Ⅱ使用)

	イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
①	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。
②	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。

<参考：加湿による錠剤サイズの変化>

イニシャル			→	25°C75%RH2週間保存品		
質量 (mg)	厚み (mm)	硬度 (kg)		質量 (mg)	厚み (mm)	硬度 (kg)
109.6	2.30	6.7		112.9	2.45	4.6

●オロパジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」¹⁸⁾

湯山製作所製自動分包機による試験

試験機器：Ⅰ. YS-TR-330/260FDSⅡ (ユヤマ)

Ⅱ. YS-TR-130FDX-ⅡSE (ユヤマ)

試験方法：① 本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、それぞれ1錠ずつ50包に分包した。

② 本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、それぞれ5錠ずつ50包に分包した。

試験結果(試験機器Ⅰ使用)

	イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
①	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。 カセット出口でわずかに詰まる傾向が認められた。
②	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。 カセット出口でわずかに詰まる傾向が認められた。

試験結果(試験機器Ⅱ使用)

	イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
①	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。
②	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。

<参考：加湿による錠剤サイズの変化>

イニシャル			→	25°C75%RH2週間保存品		
質量 (mg)	厚み (mm)	硬度 (kg)		質量 (mg)	厚み (mm)	硬度 (kg)
219.4	3.13	10.6		226.0	3.34	6.9

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、皮膚掻痒症、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、皮膚掻痒症）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

該当資料なし

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

V. 治療に関する項目

4) 検証的試験

(1) 有効性検証試験

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.1 国内第Ⅲ相比較試験(成人)

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%上乗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)¹⁹⁾。

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〉

17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験(成人)

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)²⁰⁾。

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)〉

17.1.3 国内第Ⅲ相一般試験(成人)

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²¹⁾。

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。

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.5 国内二重盲検比較試験(小児)

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^{22,23)}。

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。

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。

〈アトピー性皮膚炎〉

17.1.7 国内二重盲検比較試験(小児)

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)²⁴⁾。

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。

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.1 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%上乗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)¹⁹。

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〉

17.1.2 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)²⁰。

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)〉

17.1.3 国内第Ⅲ相一般試験(成人、オロパタジン塩酸塩錠)

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²¹。

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。

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.5 国内二重盲検比較試験(小児、オロパタジン塩酸塩錠)

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^{22,23)}。

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。

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。

〈アトピー性皮膚炎〉

17.1.7 国内二重盲検比較試験(小児、オロパタジン塩酸塩錠)

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)²⁴⁾。

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。

V. 治療に関する項目

(2) 安全性試験

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.6 国内非盲検試験(小児)

小児通年性アレルギー性鼻炎患者(7～16歳、30kg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²⁵⁾。

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。

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.6 国内非盲検試験(小児、オロパタジン塩酸塩錠)

小児通年性アレルギー性鼻炎患者(7～16歳、30kg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²⁵⁾。

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。

5) 患者・病態別試験

〈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)〉

17.1.4 高齢者(65歳以上)における臨床成績

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²⁶⁾。[9.8参照]

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

該当しない

7) その他

該当資料なし

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

抗ヒスタミン作用

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベボタスチンベシル酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩²⁷⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

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

18.2 薬理作用

18.2.1 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(Ki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²⁸⁾。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²⁹⁾。

18.2.2 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^{30~32)}。

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^{33, 34)}。

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³⁵⁾。

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³⁶⁾。

18.2.3 化学伝達物質の産生・遊離過程に及ぼす影響

ラット腹腔肥満細胞からのヒスタミンの遊離を抑制(IC₃₀値；72 μmol/L：卵白アルブミン刺激、110 μmol/L：ジニトロフェニル化ウシ血清アルブミン刺激、26 μmol/L：A-23187刺激、270 μmol/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(IC₃₀値；1.8 μmol/L)、トロンボキサン(IC₃₀値；0.77 μmol/L)、PAF(産生：10 μmol/Lで52.8%抑制、遊離：10 μmol/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^{37~40)}。

VI. 薬効薬理に関する項目

18.2.4 タキキニン遊離抑制作用

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; $5.0 \mu\text{mol/L}$)した。その作用はカリウムチャネル(SKCaチャネル: small conductance Ca^{2+} -activated K^+ チャネル)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^{41, 42)}。

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

1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

(1) 成人

健康成人男性にオロパタジン塩酸塩錠 5 mg 及び 10 mg を絶食下单回経口投与したときの血漿中薬物動態パラメータは以下のとおりであった⁴³⁾。

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)
5 mg (n=6)	1.00 ± 0.32	107.66 ± 22.01	326 ± 63 ^{a)}	8.75 ± 4.63 ^{a)}
10 mg (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.

(2) 小児

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 5 mg を単回経口投与したときの血漿中薬物動態パラメータは以下のとおりであった⁴⁴⁾。

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)
5 mg (n=6)	1.33 ± 0.52	81.57 ± 9.91	228 ± 20

mean ± S. D.

16.1.2 反復投与

健康成人男性 (8 例) にオロパタジン塩酸塩錠 1 回 10 mg 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⁴³⁾。

<生物学的同等性試験>

●オロパタジン塩酸塩錠 2.5 mg「サワイ」¹²⁾

16.8 その他

<オロパタジン塩酸塩錠 2.5 mg「サワイ」>

オロパタジン塩酸塩錠 2.5 mg「サワイ」は溶出挙動に基づき、オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」と生物学的に同等とみなされた。

IV. -9. 参照

VII. 薬物動態に関する項目

●オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」^{13, 45)}

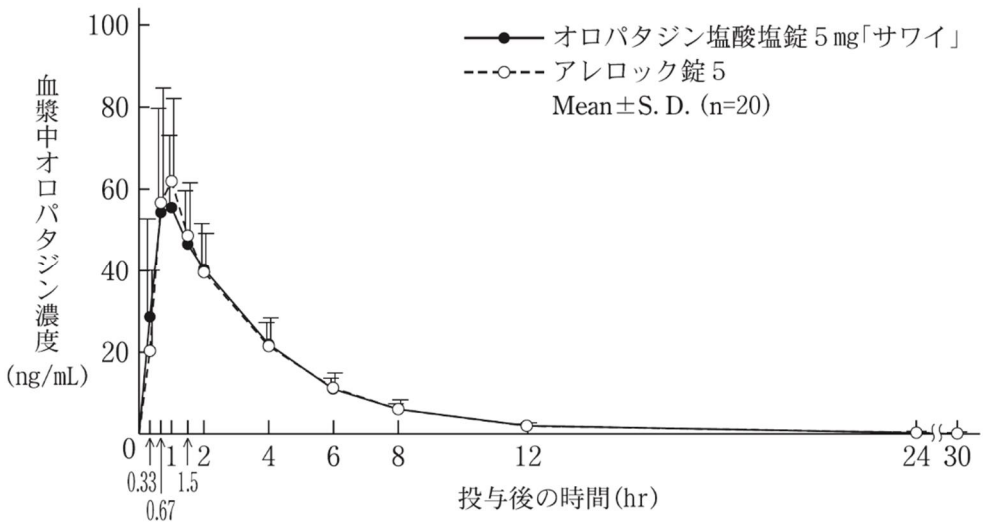
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、4、6、8、12、24、30hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
標準製剤	アレロック錠 5

オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」とアレロック錠 5 を健康成人男子にそれぞれ 1 錠(オロパタジン塩酸塩として 5 mg) 空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オロパタジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、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。

各製剤 1 錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-30hr} (ng・hr/mL)
オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」	68.08±15.32	1.0±0.5	4.2±2.7	227.13±36.80
アレロック錠 5	70.45±20.23	1.1±0.8	4.5±2.4	228.73±43.53

(Mean±S.D.)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-30hr}	log(1.00)	log(0.97)～log(1.02)
Cmax	log(0.98)	log(0.89)～log(1.08)

血漿中濃度ならびにAUCt、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OD錠2.5mg「サワイ」¹⁵⁾

16.8 その他

〈オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」〉

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」は溶出挙動に基づき、オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」と生物学的に同等とみなされた。

IV. -9. 参照

●オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」^{46, 47)}

通知等	「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
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、4、6、8、12、24、30hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」
標準製剤	アレロックOD錠5

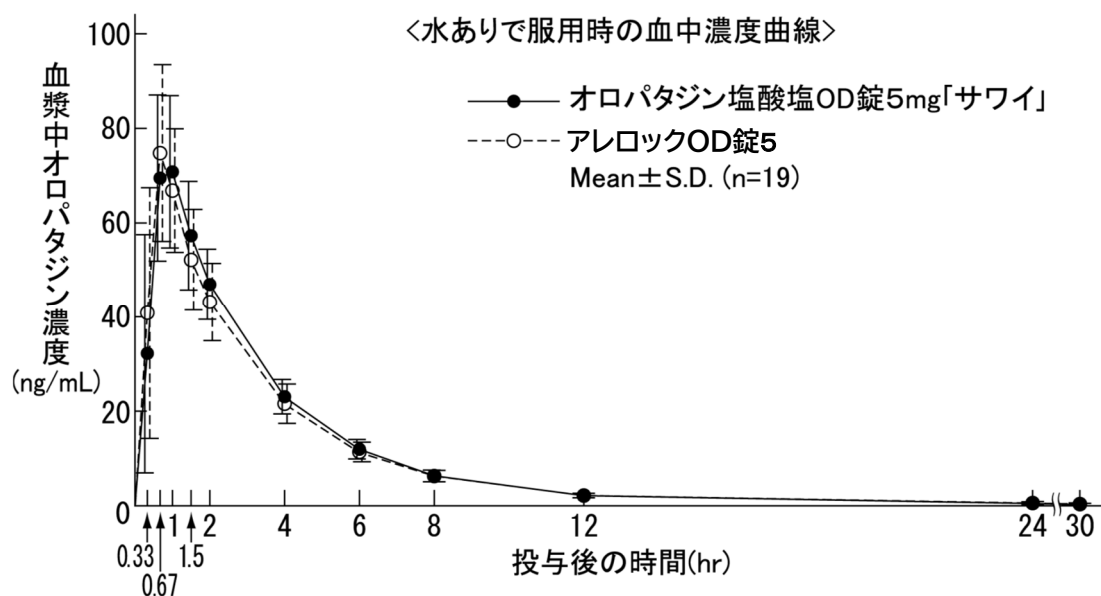
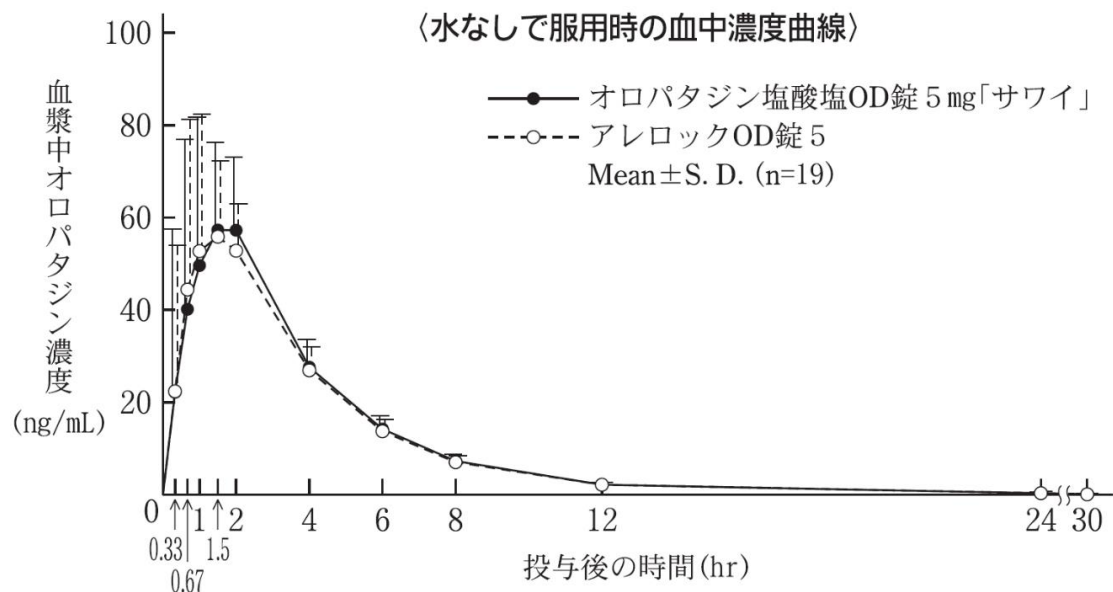
オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」とアレロックOD錠5を健康成人男子にそれぞれ1錠（オロパタジン塩酸塩として5mg）空腹時単回経口投与（クロスオーバー法）し、血漿中オロパタジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC_t、C_{max}）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-30hr} (ng・hr/mL)
水なし	オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」	79.4±18.9	1.2±0.6	4.1±2.4	267.8±36.3
	アレロックOD錠5	75.7±16.8	1.2±0.6	4.1±2.4	261.2±32.3
水あり	オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」	78.4±14.8	0.8±0.2	5.6±3.0	262.1±28.5
	アレロックOD錠5	78.8±14.9	0.8±0.3	5.8±2.8	254.2±33.6

(Mean±S.D.)

VII. 薬物動態に関する項目



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC _{0-30hr}	log (1.02)	log (1.00) ~ log (1.05)
	C _{max}	log (1.05)	log (0.97) ~ log (1.13)
水あり	AUC _{0-30hr}	log (1.03)	log (0.99) ~ log (1.08)
	C _{max}	log (1.00)	log (0.91) ~ log (1.09)

血漿中濃度ならびにAUC_t、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) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

●オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(オロパタジン塩酸塩として 5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{13, 45)}
 $0.217 \pm 0.092 \text{ hr}^{-1}$

●オロパタジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(オロパタジン塩酸塩として 5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{46, 47)}
 [水なし] $0.220 \pm 0.102 \text{ hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.165 \pm 0.093 \text{ hr}^{-1}$

4) クリアランス

該当資料なし

5) 分布容積

該当資料なし

6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

1) 解析方法

該当資料なし

2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

1) 血液－脳関門通過性

16.3.2 血液－脳関門通過性

ラットに¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1 mg/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⁴⁸⁾。

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

2) 血液－胎盤関門通過性

16.3.3 血液－胎盤関門通過性

妊娠ラットに¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1 mg/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⁴⁹⁾。

3) 乳汁への移行性

16.3.4 母乳中への移行性

授乳期のラットに¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1 mg/kgを経口投与したとき、乳汁中放射能濃度のAUC_{0-∞}は、血漿中放射能濃度のAUC_{0-∞}の約1.5倍であった⁴⁹⁾。

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

16.3.1 体組織への分布

ラットに¹⁴C-オロパタジン塩酸塩 1 mg/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⁴⁸⁾。

6) 血漿蛋白結合率

16.3.5 蛋白結合率

ヒト血清蛋白結合率は以下のとおりであった⁵⁰⁾ (*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)

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

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^{43, 51)}。

(注) オロパタジン塩酸塩80mg単回投与は、承認外用量である。

本剤の承認されている用法及び用量はⅤ. -3. を参照すること。

2) 代謝に關与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

16.5.1 成人

健康成人にオロパタジン塩酸塩錠 5 mg (6 例) 及び 10 mg (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 10 mg 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⁴³⁾。

16.5.2 小児

小児アレルギー患者 (10～16 歳、40～57 kg、6 例) にオロパタジン塩酸塩錠 5 mg 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⁴⁴⁾。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能低下患者 (血液透析導入前)

クレアチニンクリアランスが 2.3～34.4 mL/min の腎機能低下患者及び健康成人 (各 6 例) にオロパタジン塩酸塩錠 10 mg を朝食後単回経口投与したとき、健康成人と比較して、腎機能低下患者の C_{max} は 2.3 倍、AUC は約 8 倍であった^{52, 53)}。[9.2.1 参照]

16.6.2 高齢者

高齢者 (70 歳以上) 及び健康成人 (各 6 例) にオロパタジン塩酸塩錠 10 mg を単回経口投与したとき、高齢者の血漿中濃度は健康成人に比べ高く推移し、 C_{max} は約 1.3 倍、AUC は約 1.8 倍であった。 $t_{1/2}$ は両者とも 10～11 時間と同様であった⁵³⁾。[9.8 参照]

11. その他

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。

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

1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

2) 併用注意とその理由

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、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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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, Al-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、アレルゲン皮内反応を抑制し、アレルゲンの確認に支障を来すので、アレ
ルゲン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

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

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。

14.1.2 本剤は舌の上に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

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) 安全性薬理試験
該当資料なし
 - 3) 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) 遺伝毒性試験
該当資料なし
 - 4) がん原性試験
該当資料なし
 - 5) 生殖発生毒性試験
VIII. - 6. -6) 参照
 - 6) 局所刺激性試験
該当資料なし
 - 7) 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

	規制区分
製剤	該当しない
有効成分	該当しない

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」

該当しない

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg/OD錠5mg「サワイ」

20. 取扱い上の注意

20.1 本剤の錠剤表面に斑点が認められることがあるが、これは使用色素によるものであり、品質に影響はない。

20.2 開封後は湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資料

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

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

パタノール点眼液0.1%

同効薬：抗ヒスタミン作用

ジフェンヒドラミン塩酸塩、クレマスチンフマル酸塩、ヒドロキシジン塩酸塩、ヒドロキシジンパモ酸塩、シプロヘプタジン塩酸塩、プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、d-クロルフェニラミンマレイン酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、オキサトミド、ベポタスチンベシル酸塩、メキタジン、フマル酸エメダスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、エバスチン、ロラタジン、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩²⁷⁾

7. 国際誕生年月日

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日……………

製品名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
オロパタジン塩酸塩 錠2.5mg「サワイ」	2012年 8 月15日	22400AMX00963000	2012年12月14日	2012年12月14日
オロパタジン塩酸塩 錠 5mg「サワイ」	2012年 8 月15日	22400AMX00962000	2012年12月14日	2012年12月14日
オロパタジン塩酸塩 OD錠2.5mg「サワイ」	2014年 8 月15日	22600AMX01169000	2014年12月12日	2014年12月12日
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「サワイ」	2014年 8 月15日	22600AMX01170000	2014年12月12日	2014年12月12日

9. 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……………

承認年月日：2014年12月10日

効能又は効果内容：「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」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。

10. 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

11. 再審査期間……………

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報……………

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。

13. 各種コード……………

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
オロパタジン塩酸塩 錠2.5mg「サワイ」	4490025F1015	4490025F1198	122184801	622218401
オロパタジン塩酸塩 錠 5mg「サワイ」	4490025F2011	4490025F2194	122185501	622218501
オロパタジン塩酸塩 OD錠2.5mg「サワイ」	4490025F3018	4490025F3158	123900301	622390001
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「サワイ」	4490025F4014	4490025F4154	123901001	622390101

14. 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) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品の安定性(加速試験)] オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験] オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品の安定性(加速試験)] オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠
2.5mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品の安定性(加速試験)] オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠
5mg「サワイ」
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」
- 13) 竹内譲他：診療と新薬，2012；49(8)：1021-1027
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サワイ」
- 15) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」
- 16) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 17) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包機錠剤落下試験] オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」
- 18) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包機錠剤落下試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「サワイ」
- 19) 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年12月12日承認、申請資料概要ト. I. 2. 3)
- 20) 西山茂夫他：臨床医薬，2001；17：237-264
- 21) 西山茂夫他：臨床医薬，1996；12：1615-1640
- 22) Okubo, K. et al. : Curr. Med. Res. Opin., 2010；26：1657-1665
- 23) 国内二重盲検比較試験(小児)(アレロック錠/OD錠：2010年7月23日承認、申請資料概要2. 7. 6. 2)
- 24) 川島眞他：西日皮膚，2011；73：278-289
- 25) 大久保公裕：アレルギー・免疫，2011；18：108-116
- 26) 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年12月12日承認、
申請資料概要ト. I. 5. 2, ト. II. 2)
- 27) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>
(2026/4/1 アクセス)
- 28) 野中裕美他：薬理と臨床，1995；5：1817-1824
- 29) 佐々木康夫他：薬理と臨床，1995；5：1825-1835
- 30) 貝瀬俊彦他：アレルギー，1995；44：1229-1233
- 31) Kamei, C. et al. : Arzneim.-Forsch./Drug Res., 1995；45：1005-1008
- 32) Kaise, T. et al. : Jpn. J. Pharmacol., 1995；69：435-438
- 33) 石井秀衛他：日薬理誌，1995；106：289-298
- 34) 石井秀衛他：基礎と臨床，1995；29：3543-3559

X I. 文献

- 35) Ohmori, K. et al. : Int. Arch. Allergy Immunol., 1996 ; 110 : 64-72
- 36) 佐々木康夫他 : 日薬理誌, 1995 ; 106 : 347-357
- 37) 佐々木康夫他 : 薬理と臨床, 1995 ; 5 : 1837-1850
- 38) Ikemura, T. et al. : Int. Arch. Allergy Immunol., 1996 ; 110 : 57-63
- 39) 池村俊秀他 : アレルギー, 1994 ; 43 : 1087
- 40) 化学伝達物質の産生・遊離過程に及ぼす影響(アレロック錠 : 2000年12月12日承認、申請資料概要ホ. II. 2. 3)
- 41) Ikemura, T. et al. : Br. J. Pharmacol., 1996 ; 117 : 967-973
- 42) タキキニンの遊離に及ぼす影響(アレロック錠 : 2000年12月12日承認、申請資料概要ホ. II. 3)
- 43) 角尾道夫他 : 基礎と臨床, 1995 ; 29 : 4129-4147
- 44) 小児における薬物動態試験(アレロック錠/OD錠 : 2010年7月23日承認、申請資料概要2. 7. 2. 2. 1, 2. 7. 2. 3. 1)
- 45) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 46) 陶易王他 : 診療と新薬, 2014 ; 51(9) : 855-862
- 47) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 48) 大石孝義他 : 薬物動態, 1995 ; 10 : 651-668
- 49) 大石孝義他 : 薬物動態, 1995 ; 10 : 707-721
- 50) 血清蛋白結合率(*in vitro*) (アレロック錠 : 2000年12月12日承認、申請資料概要へ. II. 2. 5)
- 51) 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年12月12日承認、申請資料概要へ. III. 1. 1)
- 52) 越川昭三他 : 腎と透析, 1997 ; 42 : 107-114
- 53) 小林真一他 : 臨床薬理, 1996 ; 27 : 673-681
- 54) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] オロパタジン塩酸塩錠 2. 5 mg「サワイ」
- 55) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 56) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」
- 57) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] オロパタジン塩酸塩錠 2. 5 mg「サワイ」
- 58) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」
- 59) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 2. 5 mg「サワイ」
- 60) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] オロパタジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
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。

1) 粉砕

<粉砕後の安定性試験>

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」⁵⁴⁾

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30 日)	透明瓶密栓 (室温、30 日)	褐色瓶密栓 (室温、30 日)
性 状	淡黄赤色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験※	100.0	99.6	99.5	100.5

※：イニシャルを 100 としたときの含有率(%)

●オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」⁵⁵⁾

オロパタジン塩酸塩錠 5 mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30 日)	透明瓶密栓 (室温、30 日)	褐色瓶密栓 (室温、30 日)
性 状	淡黄赤色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験※	100.0	99.5	99.4	100.4

※：イニシャルを 100 としたときの含有率(%)

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」は、オロパタジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」と含量違いの製剤であり、すべての組成比が同一(有効成分及び各添加剤の含有比率が同じ)であるため、オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」の粉砕後の安定性試験は、オロパタジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」の試験結果を適用する。

●オロパタジン塩酸塩OD錠 5 mg「サワイ」⁵⁶⁾

目的

本製剤の粉砕後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を粉碎し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
583T6S9210	成り行き室温	透明瓶開放
		透明瓶密栓
		褐色瓶密栓

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	定量試験※
イニシャル	白色の粉末	100.0
透明瓶開放(30日)	白色の粉末	規格内 99.4
透明瓶密栓(30日)	白色の粉末	規格内 99.7
褐色瓶密栓(30日)	白色の粉末	規格内 99.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

<崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>

●オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」⁵⁷⁾

試験方法

1. オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径 2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	錠剤は5分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

●オロパタジン塩酸塩錠5mg「サワイ」⁵⁸⁾

試験方法

1. オロパタジン塩酸塩錠5mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径 2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

●オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」⁵⁹⁾

試験方法

1. オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径 2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸 濁 状 態	錠剤は2分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となったが、試料は沈殿しやすかった
チューブ通過性	通過したが、シリンジに若干の付着が認められた

●オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」⁶⁰⁾

試験方法

1. オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径 2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸 濁 状 態	錠剤は2分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となったが、試料は沈殿しやすかった
チューブ通過性	通過したが、シリンジに若干の付着が認められた

備考

シリンジ内に試料が沈殿した状態で懸濁液をチューブに注入すると、チューブを閉塞させる可能性があるため、試料を十分に懸濁させる等の注意が必要である。

2. その他の関連資料.....

患者向け資料

- ・気になる皮膚のかゆみ じんましん
- ・花粉症のセルフケアと治療法
- ・自動車運転等はいらないでください・お知らせ指導箋

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

