

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2013 に準拠して作成

アレルギー性疾患治療剤

オロパタジン塩酸塩OD錠 2.5mg「フェルゼン」

オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg「フェルゼン」

OLOPATADINE HYDROCHLORIDE OD TABLETS

剤形	オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg：素錠（口腔内崩壊錠） オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg：割線入り素錠（口腔内崩壊錠）		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	OD 錠 2.5mg：1錠中、オロパタジン塩酸塩 2.5mg を含有 OD 錠 5mg：1錠中、オロパタジン塩酸塩 5mg を含有		
一般名	和名：オロパタジン塩酸塩（JAN） 洋名：Olopatadine Hydrochloride（JAN）		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日		OD 錠 2.5mg	OD 錠 5mg
	製造販売承認年月日	2018年2月15日	2018年2月15日
	薬価基準収載年月日	2018年6月15日	2018年6月15日
発売年月日	2018年6月15日	2018年6月15日	
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：株式会社フェルゼンファーマ		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	株式会社フェルゼンファーマ 安全管理部 TEL：03-6368-5160、FAX：03-3580-1522 医療関係者向けホームページ http://www.feldsenfpharma.co.jp		

本 IF は 2018 年 6 月改訂（第 2 版）の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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要 — 日本病院薬剤師会 —

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第3小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を保管する適正使用情報として適切に審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IFとは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

【IF の様式】

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② IF 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]

- ① IF は原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ② IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」(以下、「IF 記載要領 2013」と略す)により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目	15
1. 開発の経緯	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	15
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬理作用	15
II. 名称に関する項目	2	VII. 薬物動態に関する項目	16
1. 販売名	2	1. 血中濃度の推移・測定法	16
2. 一般名	2	2. 薬物速度論的パラメータ	17
3. 構造式又は示性式	2	3. 吸収	18
4. 分子式及び分子量	3	4. 分布	18
5. 化学名（命名法）	3	5. 代謝	19
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3	6. 排泄	19
7. CAS登録番号	3	7. トランスポーターに関する情報	19
III. 有効成分に関する項目	4	8. 透析等による除去率	19
1. 物理化学的性質	4	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	20
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	1. 警告内容とその理由	20
3. 有効成分の確認試験法	4	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	20
4. 有効成分の定量法	4	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20
IV. 製剤に関する項目	5	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	20
1. 剤形	5	5. 慎重投与内容とその理由	20
2. 製剤の組成	6	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	20
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	6	7. 相互作用	21
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	8. 副作用	21
5. 調製法及び溶解後の安定性	9	9. 高齢者への投与	22
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	9	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	22
7. 溶出性	9	11. 小児等への投与	22
8. 生物学的試験法	12	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12	13. 過量投与	22
10. 製剤中の有効成分の定量法	12	14. 適用上の注意	23
11. 力価	12	15. その他の注意	23
12. 混入する可能性のある夾雑物	12	16. その他	23
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12	IX. 非臨床試験に関する項目	24
14. その他	12	1. 薬理試験	24
V. 治療に関する項目	13	2. 毒性試験	24
1. 効能又は効果	13		
2. 用法及び用量	13		
3. 臨床成績	13		

X. 管理的事項に関する項目	25
1. 規制区分	25
2. 有効期間又は使用期限	25
3. 貯法・保存条件	25
4. 薬剤取扱い上の注意点	25
5. 承認条件等	25
6. 包装	25
7. 容器の材質	25
8. 同一成分・同効薬	26
9. 国際誕生年月日	26
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26
11. 薬価基準収載年月日	26
12. 効能又は効果追加，用法及び用量変更 等追加の年月日及びその内容	26
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及び その内容	26
14. 再審査期間	26
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	27
16. 各種コード	27
17. 保険給付上の注意	27
X I. 文献	28
1. 引用文献	28
2. その他の参考文献	28
X II. 参考資料	29
1. 主な外国での発売状況	29
2. 海外における臨床支援情報	29
X III. 備考	30

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、第二世代抗ヒスタミン薬の一種で、ヒスタミン H_1 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産生・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 OD錠 2.5mg・5mg「フェルゼン」は、株式会社フェルゼンファーマ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、2018 年 2 月に製造販売承認を得た製剤である。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF 等）の産生・遊離抑制作用を発現するとともに、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する。
- (2) 水なしでも服用可能な口腔内崩壊錠（OD錠）である。
- (3) 本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していないが、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。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg 「フェルゼン」

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5 mg 「フェルゼン」

(2) 洋名

Olopatadine Hydrochloride OD Tablets 2.5mg [Feldsenf]

Olopatadine Hydrochloride OD Tablets 5 mg [Feldsenf]

(3) 名称の由来

有効成分の一般名に剤形、含量及び屋号（「フェルゼン」）を付して表記した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

オロパタジン塩酸塩（JAN）

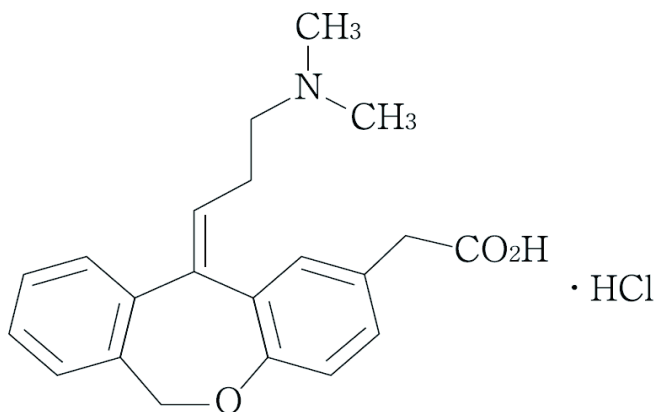
(2) 洋名（命名法）

Olopatadine Hydrochloride（JAN）

(3) ステム

-tadine：三環系H₁受容体拮抗薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{21}H_{23}NO_3 \cdot HCl$

分子量 : 373.87

5. 化学名 (命名法)

{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

該当資料なし

7. CAS登録番号

140462-76-6

113806-05-6 (Olopatadine)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理学的性質

(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、外観及び性状

販売名	オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「フェルゼン」			オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「フェルゼン」		
剤形	ごくうすい黄色の円形の素錠			ごくうすい黄色の円形の 割線入り素錠		
外形	表	裏	側面	表	裏	側面
						
	直径	厚さ	質量	直径	厚さ	質量
	6.5mm	2.7mm	100mg	8.0mm	3.6mm	200mg

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

販売名	識別コード
オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「フェルゼン」	F5
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「フェルゼン」	F6

※識別コードは、錠剤（オモテ面）に表示

(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 OD錠 2.5mg 「フェルゼン」

1錠中、日局オロパタジン塩酸塩 2.5mg を含有する。

オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「フェルゼン」

1錠中、日局オロパタジン塩酸塩 5mg を含有する。

(2) 添加物

販売名	オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「フェルゼン」	オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「フェルゼン」
添加物	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、ステビア抽出精製物、スクラロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、黄色三二酸化鉄、香料、バニリン	

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

<オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「フェルゼン」>

包装形態：PTP包装（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）

保存条件：40℃、75%RH

試験項目	規格	試験結果	
		イニシャル	6ヵ月
性状	ごくうすい黄色の円形の素錠	適合	適合
確認試験	紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 295~299nm に吸収の極大を示す	適合	適合
製剤均一性	含量均一性試験を行うとき、日局に適合する	適合	適合
崩壊試験	日局に適合（試験時間：90 秒）	適合	適合
溶出試験	15 分、85%以上（パドル法、試験液：水）	101.7% ^{注)}	100.6% ^{注)}
定量試験	表示量の 95.0~105.0%	101.3% ^{注)}	101.7% ^{注)}
純度試験	類縁物質：0.1%以下（参考）	適合	適合

注)：3 ロットの平均値

加速試験の結果、オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「フェルゼン」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¹⁾。

<オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」>

包装形態：PTP包装（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）

保存条件：40℃、75%RH

試験項目	規格	試験結果	
		イニシャル	6ヵ月
性状	ごくうすい黄色の円形の割線入り素錠	適合	適合
確認試験	紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 295~299nm に吸収の極大を示す	適合	適合
製剤均一性	含量均一性試験を行うとき、日局に適合する	適合	適合
崩壊試験	日局に適合（試験時間：90 秒）	適合	適合
溶出試験	15 分、85%以上（パドル法、試験液：水）	102.2% ^{注)}	100.6% ^{注)}
定量試験	表示量の 95.0~105.0%	101.3% ^{注)}	101.2% ^{注)}
純度試験	類縁物質：0.1%以下（参考）	適合	適合

注)：3 ロットの平均値

加速試験の結果、オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」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¹⁾。

(2) 無包装状態の安定性試験

<オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「フェルゼン」>

保存条件：①40℃（温度；遮光・気密） ②25℃、75%RH（湿度；開放）

③2500 lux、25℃、45%RH（光；開放）

試験項目	イニシャル	温度	湿度	光
		3ヵ月	3ヵ月	20日 (120万 lux・hr)
性状	ごくうすい黄色 の円形の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	97.3%	98.5%	98.0%	97.8%
定量試験	100.1%	99.1%	98.8%	96.6%
硬度	27.0N	24.1N	14.4N	31.7N

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg「フェルゼン」について、各種条件下で保存し、無包装状態における安定性試験を行った。

その結果、光の条件下で含量低下（規格内）が観察された。また、湿度の条件下では硬度低下がみられ、20 Nを下回っていることから取り扱いには注意が必要と考えられる²⁾。

<オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」>

保存条件：①40℃（温度；遮光・気密） ②25℃、75%RH（湿度；開放）

③2500 lux、25℃、45%RH（光；開放）

試験項目	イニシャル	温度	湿度	光
		3ヵ月	3ヵ月	20日 (120万 lux・hr)
性状	ごくうすい黄色 の円形の割線入 り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験	97.9%	98.9%	98.9%	97.7%
定量試験	99.4%	99.2%	99.7%	97.7%
硬度	30.8N	36.7N	21.1N	39.1N

オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」について、各種条件下で保存し、無包装状態における安定性試験を行った。

その結果、光の条件下で含量低下（規格内）が観察された。また、湿度の条件下で硬度低下が観察されたが、20 Nを上回っており問題となるレベルの変化とは言えないものの、取り扱いに際しては配慮する事が好ましいと考えられる²⁾。

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）

該当資料なし

7. 溶出性

【生物学的同等性試験（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 OD錠 2.5mg「フェルゼン」>

「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号）に基づき、ヒトでの生物学的同等性が確認されたオロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」を標準剤として溶出挙動を比較したとき、溶出挙動は同等と判定され、両剤は生物学的に同等とみなされた³⁾。

なお、試験剤の処方変更水準は、A水準に該当した。

[試験条件]

試験法	日局 溶出試験法（パドル法）
試験液量	900 mL（温度：37±0.5℃）
試験液	水
回転数	50 rpm
判定時間	15分

[判定基準]

平均溶出率	試験剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分以内における試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率の±10%の範囲にある。
個々の溶出率	最終比較時点における試験剤の個々の溶出率において、試験剤の平均溶出率±15%を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

《平均溶出率の比較》

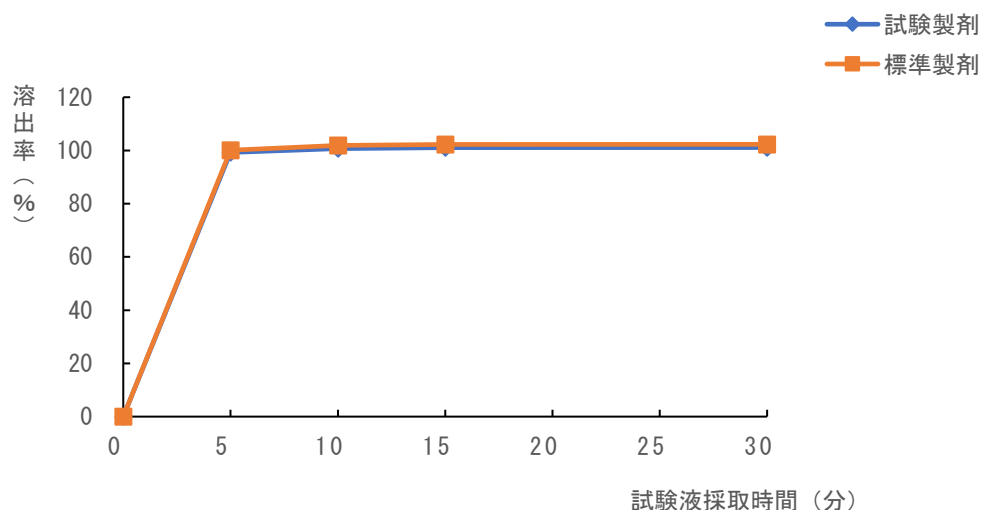
判定時間 (分)	試験剤の溶出率 (%)			標準剤の溶出率 (%)			平均溶出率 の差 (%)	判定
	平均値	最小値	最大値	平均値	最小値	最大値		
15	101.0	99.2	102.5	102.2	101.5	103.1	-1.2	適合

(n=12)

《試験剤の個々の溶出率》

判定時間 (分)	試験剤の溶出率 (%)			±15% を超える 個数	±25% を超える 個数	判定
	平均値	最小値～最大値	平均値±15%			
15	101.0	99.2～102.5	86.0～116.0	0	0	適合

(n=12)



<オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「フェルゼン」>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」(平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号)に従い、標準製剤とオロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg 「フェルゼン」の溶出挙動の比較を行った結果、溶出挙動の類似性が確認された³⁾。

[試験条件]

試験法	日局 溶出試験法 (パドル法)	
試験液量	900mL (温度: 37±0.5℃)	
試験液	pH 1.2	日局 溶出試験液第1液
	pH 5.0	薄めた McIlvaine 緩衝液
	pH 6.8	日局 溶出試験液第2液
	水	日局 精製水
回転数	50 rpm、100 rpm	

[判定基準]

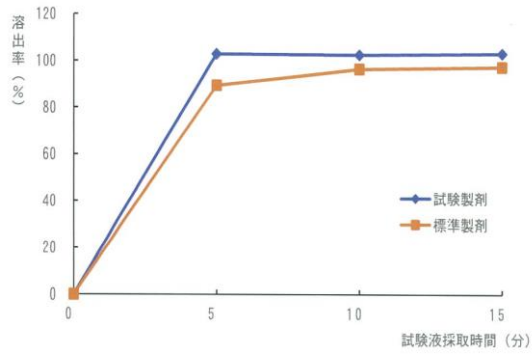
試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分以内における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の±10%の範囲にある。

《溶出挙動の類似性の判定；平均溶出率の比較》

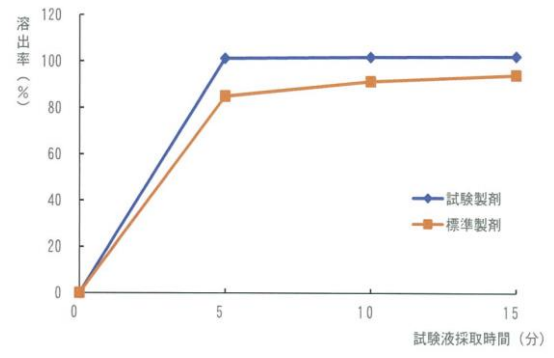
回転数	試験液	判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		平均溶出率の差 (%)	判定
			試験製剤	標準製剤		
50 rpm	pH 1.2	15	103.2	97.4	5.8	適合
	pH 5.0	15	102.2	94.1	8.1	適合
	pH 6.8	15	103.2	97.1	6.1	適合
	水	15	102.2	94.9	7.3	適合
100 rpm	pH 5.0	15	102.3	95.1	7.2	適合

(n=12)

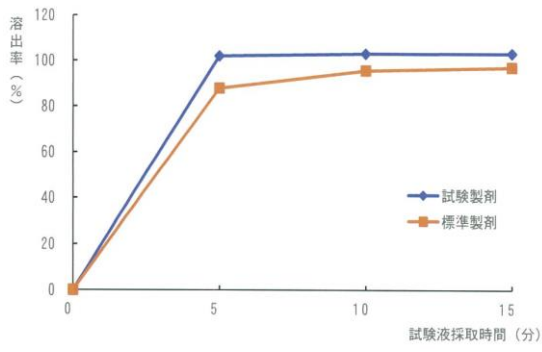
pH 1.2、50 rpm



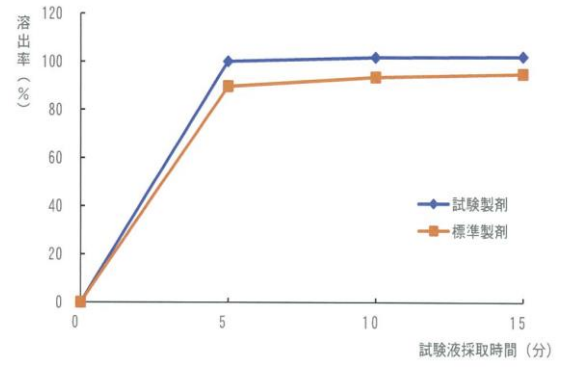
pH 5.0、50 rpm



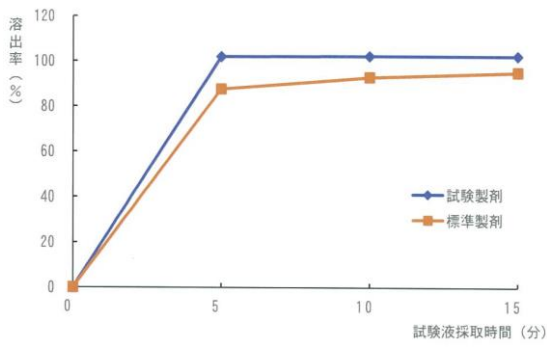
pH 6.8、50 rpm



水、50 rpm



pH 5.0、100 rpm



8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

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. 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。

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。

<用法・用量に関する使用上の注意>

本剤は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜から吸収されないため、唾液又は水で飲みこむこと。[「Ⅷ-14. 適用上の注意」の項参照]

3. 臨床試験

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）、製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ヒスタミン H₁ 受容体拮抗剤：

メキタジン、ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、エメダスチンフマル酸塩（第二世代；I 類）

エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ロラタジン、レボセチリジン、デスロラタジン、ビラスチン（第二世代；II 類）

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター（ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF 等）の産生・遊離抑制作用をあらわす。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する⁴⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間⁵⁾

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「フェルゼン」: 1.5 ± 0.8 hr (水なしで服用)

0.8 ± 0.4 hr (水で服用)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

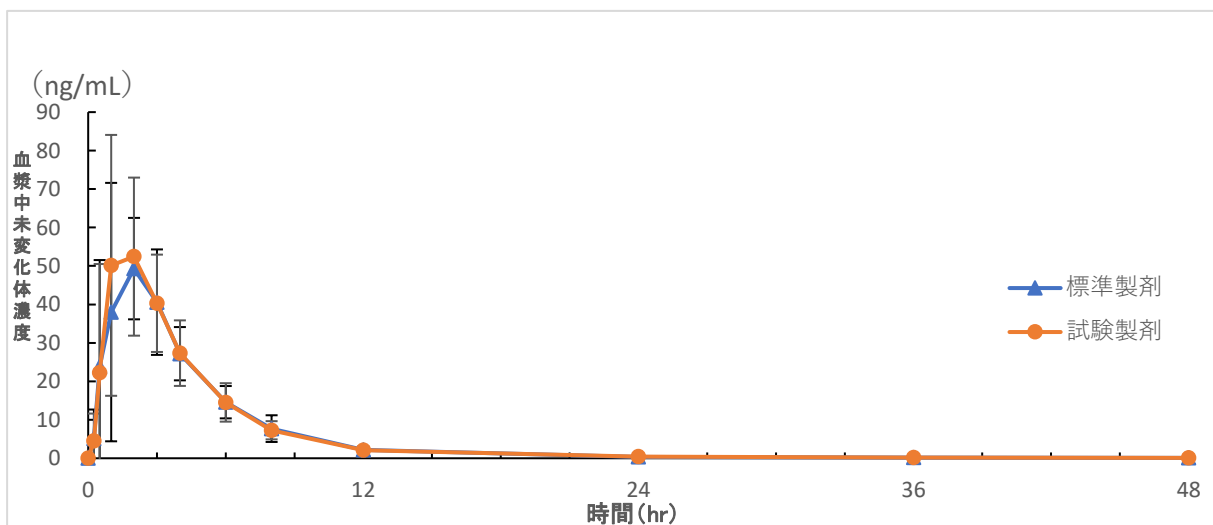
<生物学的同等性試験：オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5 mg 「フェルゼン」>

健康成人男子にオロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「フェルゼン」と標準製剤を、クロスオーバー法でそれぞれ 1 錠 (オロパタジン塩酸塩として 5mg) 絶食時単回投与 (水なしで服用及び水で服用) して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された⁵⁾。

【水なしで服用】

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg 「フェルゼン」	255.57 ± 44.36	72.77 ± 15.54	1.5 ± 0.8	11.0 ± 9.2
標準製剤 (OD錠、5mg)	245.78 ± 43.68	64.91 ± 15.72	1.8 ± 0.7	10.6 ± 6.5

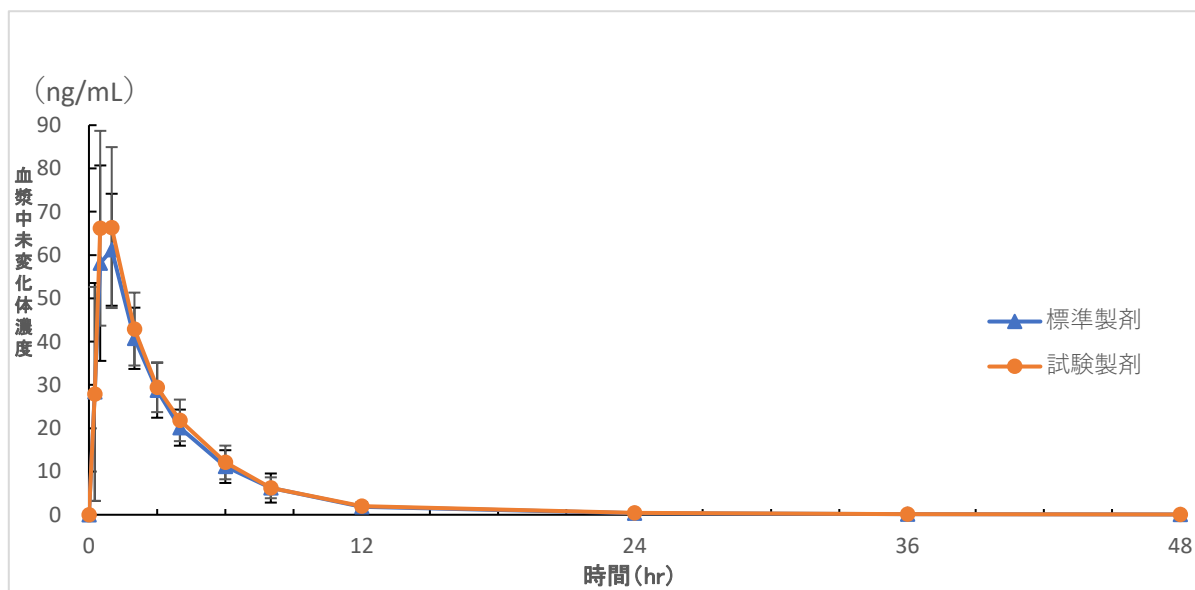
(Mean±S.D., n=20)



【水で服用】

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩OD錠 5mg 「フェルゼン」	253.41 ± 48.30	76.85 ± 19.03	0.8 ± 0.4	10.0 ± 7.7
標準製剤 (OD錠、5mg)	237.14 ± 41.17	69.04 ± 14.05	0.7 ± 0.3	11.5 ± 8.7

(Mean±S.D., n=20)



(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数⁵⁾

オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg 「フェルゼン」: $0.1005 \pm 0.0525 \text{ hr}^{-1}$ (水で服用)

$0.0975 \pm 0.0525 \text{ hr}^{-1}$ (水なしで服用)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血圧－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁の移行性

該当資料なし

「Ⅷ-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の(2)を参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

<用法・用量に関する使用上の注意>

本剤は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜から吸収されないため、唾液又は水で飲みこむこと。

〔VIII-14. 適用上の注意〕の項参照

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

(1) 腎機能低下患者 [高い血中濃度が持続するおそれがある。]

(2) 高齢者 [「VIII-9. 高齢者への投与」の項参照]

(3) 肝機能障害のある患者 [肝機能障害が悪化するおそれがある。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

(1) **眠気**を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。

(2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。

(3) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

(4) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

劇症肝炎、肝機能障害、黄疸：劇症肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、LDH、ALP の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

下記のような副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には減量・休薬等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症^{注)}	紅斑等の発疹、浮腫（顔面・四肢等）、痒痒、呼吸困難
精神神経系	眠気、倦怠感、口渇、頭痛・頭重感、めまい、しびれ感、集中力低下、不随意運動（顔面・四肢等）
消化器	腹部不快感、腹痛、下痢、嘔気、便秘、口内炎・口角炎・舌痛、胸やけ、食欲亢進、嘔吐
肝臓	肝機能異常 [AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、LDH、ALP、総ビリルビン上昇]
血液	白血球増多・減少、好酸球増多、リンパ球減少、血小板減少
腎臓・泌尿器	尿潜血、BUN 上昇、尿蛋白陽性、血中クレアチニン上昇、排尿困難、頻尿
循環器	動悸、血圧上昇
その他	血清コレステロール上昇、尿糖陽性、胸部不快感、味覚異常、体重増加、ほてり、月経異常、筋肉痛、関節痛

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験方法

該当資料なし

9. 高齢者への投与

高齢者では生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすいので、低用量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず、投与する場合は授乳を中止させること。〔動物実験（ラット）で乳汁中への移行及び出生児の体重増加抑制が報告されている。〕

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

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には本剤を投与しないこと。

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

(1) 薬剤交付時

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること（PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている）。

(2) 服用時

本剤は舌の上へのせ、唾液を浸潤させて、唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

15. その他の注意

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

16. その他

該当しない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「フェルゼン」	該当しない
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5 mg 「フェルゼン」	該当しない
有効成分：オロパタジン塩酸塩	該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（外箱に表示；安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

特になし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等の留意すべき必須事項等）

「Ⅷ-14.適用上の注意」の項参照

患者向け医薬品ガイド：無し くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

オロパタジン塩酸塩 OD錠 2.5mg 「フェルゼン」： 100錠（10錠×10）

オロパタジン塩酸塩 OD錠 5 mg 「フェルゼン」： 100錠（10錠×10）

7. 容器の材質

PTP包装

PTPシート：ポリ塩化ビニル、アルミニウム箔

ピロー：ポリエチレン、アルミニウム箔（アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム）

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレロック錠 2.5・5、アレロック OD 錠 2.5・5、アレロック顆粒 0.5%、パタノール点眼液 0.1%

同効薬：メキタジン、ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、エメダスチンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ロラタジン、レボセチリジン、デスロラタジン、ビラスチン等のヒスタミン_{H₁}受容体拮抗剤

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日

販売名	承認年月日	承認番号
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「フェルゼン」	2018年2月15日	23000AMX00323000
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「フェルゼン」	2018年2月15日	23000AMX00324000

11. 薬価基準収載年月日

販売名	収載年月日
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 2.5mg「フェルゼン」	2018年6月15日
オロパタジン塩酸塩 OD 錠 5mg「フェルゼン」	2018年6月15日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT(9桁)コード	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 OD錠 2.5mg「フェルゼン」	126421001	4490025F3018	622642101
オロパタジン塩酸塩 OD錠 5mg「フェルゼン」	126422701	4490025F4014	622642201

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 株式会社フェルゼンファーマ：安定性に関する資料（社内資料）
- 2) 株式会社フェルゼンファーマ：無包装状態における安定性に関する資料（社内資料）
- 3) 株式会社フェルゼンファーマ：溶出性に関する資料（社内資料）
- 4) 第十七改正日本薬局方解説書 廣川書店 2016：C-1204
- 5) 株式会社フェルゼンファーマ：生物学的同等性に関する資料（社内資料）

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 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

その他の関連資料

該当資料なし



製造販売元

株式会社フェルゼンファーマ

札幌市中央区北10条西24丁目3番地