

貯 法：室温保存
使用期限：包装に表示

日本標準商品分類番号	8 7 4 4 9	
	2.5mg	5mg
承認番号	22400AMX00956000	22400AMX00957000
薬価収載	2012年12月	2012年12月
販売開始	2012年12月	2012年12月
効能追加	2014年12月	2014年12月

アレルギー性疾患治療剤

オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「サンド」

オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サンド」

Olopatadine Hydrochloride Tablets 2.5mg・5mg [SANDOZ]

日本薬局方 オロパタジン塩酸塩錠

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

販 売 名	オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「サンド」	オロパタジン塩酸塩錠 5mg「サンド」				
有効成分	日局 オロパタジン塩酸塩					
含 量 (1錠中)	2.5mg	5.0mg				
添 加 物	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					
色・剤形 (又は性状)	淡黄赤色の フィルムコーティング錠	淡黄赤色の割線入りの フィルムコーティング錠				
外 形	表	裏	側面	表	裏	側面
						
大 小 寸	直径	6.6mm		7.1mm		
	厚さ	3.2mm		3.0mm		
質 量	103.0mg		124.0mg			
識別コード(PTP)	OS2.5		OS5			

【効能又は効果】

成人：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患に伴う痒痒（湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚痒痒症、尋常性乾癬、多形発出性紅斑）

小児：アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患（湿疹・皮膚炎、皮膚痒痒症）に伴う痒痒

【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。

【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- 腎機能低下患者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。〕
- 高齢者〔「4. 高齢者への投与」の項参照〕
- 肝機能障害のある患者〔肝機能障害が悪化するおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

- 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。
- 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。
- 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
- 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用（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、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ので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

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

種 類	頻度不明
過 敏 症 ^{注)}	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、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、Al-P、総ビリルビン上昇〕
血 液	白血球増多・減少、好酸球増多、リンパ球減少、血小板減少
腎臓・泌尿器	尿潜血、BUN上昇、尿蛋白陽性、血中クレアチニン上昇、排尿困難、頻尿
循 環 器	動悸、血圧上昇
そ の 他	血清コレステロール上昇、尿糖陽性、胸部不快感、味覚異常、体重増加、ほてり、月経異常、筋肉痛、関節痛

注)このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

4. 高齢者への投与

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

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2)授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。[動物実験(ラット)で乳汁中への移行及び出生児の体重増加抑制が報告されている。]

6. 小児等への投与

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

7. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与は、アレルギー皮内反応を抑制し、アレルギーの確認に支障をきたすので、アレルギー皮内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。

8. 適用上の注意

(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、さら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)薬剤分割時

分割したときは遮光下に保存すること。

9. その他の注意

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

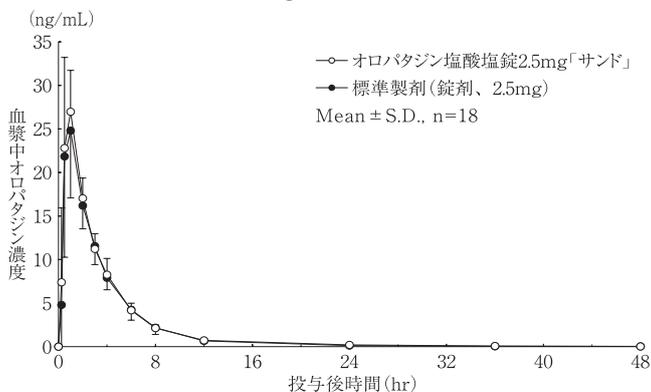
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

(1)オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」¹⁾

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」と標準製剤(錠剤、2.5mg)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)健康成人男性に絶食下单回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた未変化体の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。

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」投与後の血漿中濃度推移



薬物動態パラメータ

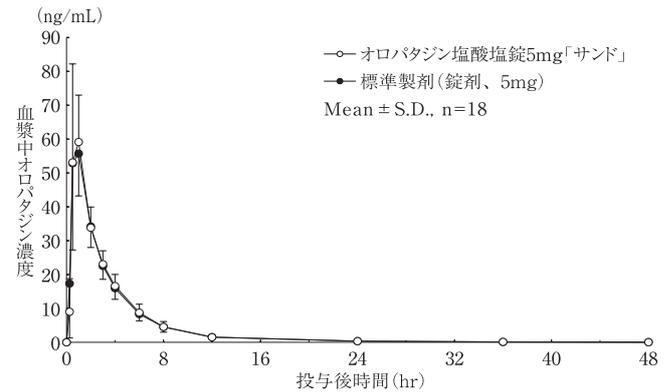
	AUC _t (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
オロパタジン塩酸塩錠 2.5mg「サンド」	95.12 ±12.35	30.07 ±6.09	0.8±0.3	9.0±7.1
標準製剤 (錠剤、2.5mg)	89.93 ±11.24	28.19 ±6.22	0.9±0.5	5.8±5.5

(Mean ± S.D., n=18)

(2)オロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」²⁾

オロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」と標準製剤(錠剤、5mg)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)健康成人男性に絶食下单回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた未変化体の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。

オロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」投与後の血漿中濃度推移



薬物動態パラメータ

	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「サンド」	197.35 ±33.79	68.46 ±22.55	0.8±0.3	8.4±6.1
標準製剤 (錠剤、5mg)	194.36 ±26.38	65.85 ±18.04	0.8±0.4	8.8±9.3

(Mean ± S.D., n=18)

なお、血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等の薬物動態パラメータは、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. 溶出挙動^{3),4)}

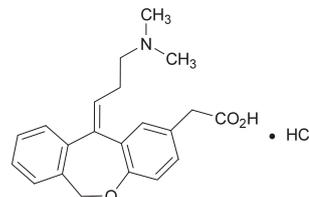
オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」及びオロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」は、日本薬局方医薬品各条に定められたオロパタジン塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

抗アレルギー薬。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・遊離抑制作用を現す。更に、神経伝達物質タキキニン遊離抑制作用も有する。⁵⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：オロパタジン塩酸塩(Olopatadine Hydrochloride)

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

分子式：C₂₁H₂₃NO₃・HCl

分子量：373.87

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

ギ酸に極めて溶けやすく、水にやや溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。

0.01mol/L塩酸試液に溶ける。

本品1.0gを水100mLに溶かした液のpHは2.3～3.3である。

融点：約250℃(分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験^{6),7)}

最終包装製品を用いた加速試験(40±1℃、相対湿度75±5%、6ヵ月)の結果、オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」及びオロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」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。

**【包装】

オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」：100錠(PTP)

オロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」：100錠(PTP)

140錠(PTP)

500錠(PTP)

700錠(PTP)

*【主要文献】

- 1) オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」の生物学的同等性試験に関する資料(サンド株式会社社内資料)
- 2) オロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」の生物学的同等性試験に関する資料(サンド株式会社社内資料)
- 3) オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」の溶出試験に関する資料(サンド株式会社社内資料)
- 4) オロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」の溶出試験に関する資料(サンド株式会社社内資料)
- 5) 第十七改正日本薬局方解説書(廣川書店)C-1204(2016)
- 6) オロパタジン塩酸塩錠2.5mg「サンド」の安定性試験に関する資料(サンド株式会社社内資料)
- 7) オロパタジン塩酸塩錠5mg「サンド」の安定性試験に関する資料(サンド株式会社社内資料)

*【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

サンド株式会社 カスタマーケアグループ

〒105-6333 東京都港区虎ノ門1-23-1

 0120-982-001

FAX 03-6257-3633

** 製造販売

サンド株式会社

東京都港区虎ノ門1-23-1
URL: <http://www.sandoz.jp/>