

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

オロパタジン塩酸塩口腔内崩壊錠






貯 法：室温保存  
使用期限：外箱に表示

	OD錠2.5mg	OD錠5mg
承認番号	23000AMX00323000	23000AMX00324000
* 薬価収載	2018年6月	
* 販売開始	2018年6月	2018年6月

【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」	
成分・含量 (1錠中)	日局オロパタジン塩酸塩 2.5mg	日局オロパタジン塩酸塩 5mg	
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		
性 状	ごくうすい黄色の 円形の素錠	ごくうすい黄色の 円形の割線入り素錠	
外 形	表		
	裏		
	側面		
大きさ等	直径：6.5mm 厚さ：2.7mm 質量：100mg	直径：8.0mm 厚さ：3.6mm 質量：200mg	
識別コード	F5	F6	

【効能・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、皮膚痒痒症)に伴う痒痒

【用法・用量】

成人：通常、成人には1回オロパタジン塩酸塩として5mg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。

〈用法及び用量に関連する使用上の注意〉

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。〔適用上の注意〕の項参照

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

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

2. 重要な基本的注意

- (1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないよう十分注意すること。
- (2) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量を図る場合には十分な管理下で徐々に行うこと。
- (3) 本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
- (4) 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

劇症肝炎、肝機能障害、黄疸：劇症肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -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。

(2) その他の副作用

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

	頻度不明
過敏症 <sup>(注)</sup>	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〔ALT(GPT)、AST(GOT)、LDH、 $\gamma$ -GTP、ALP、総ビリルビン上昇〕
血 液	白血球増多、好酸球増多、リンパ球減少、白血球減少、血小板減少
腎臓・泌尿器	尿潜血、BUN上昇、尿蛋白陽性、血中クレアチニン上昇、頻尿、排尿困難
循環器	動悸、血圧上昇
その他	血清コレステロール上昇、尿糖陽性、胸部不快感、味覚異常、体重増加、ほてり、月経異常、筋肉痛、関節痛

注)このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

#### 4. 高齢者への投与

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

#### 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。〔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。〕

#### 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。

#### 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、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

本剤は舌の上のにせ、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。

#### 9. その他の注意

因果関係は明らかではないが、オロパタジン塩酸塩(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。

### 【薬物動態】

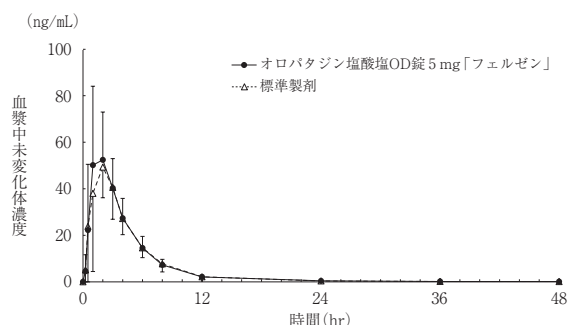
#### 生物学的同等性試験

- (1) 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2.5mg「フェルゼン」は、「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 薬食審査発第1124004号)に基づき、オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「フェルゼン」を標準剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。<sup>1)</sup>
- (2) オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「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。<sup>1)</sup>

<水なしで服用>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T1/2 (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	11.03 ±9.19
標準剤 (OD錠、5mg)	245.78 ±43.68	64.91 ±15.72	1.8 ±0.7	10.55 ±6.48

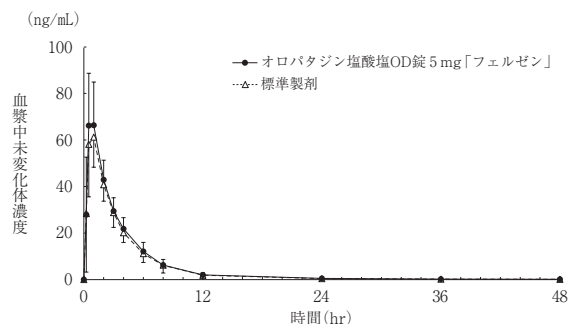
(Mean ± SD, n = 20)



<水で服用>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T1/2 (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	9.96 ±7.74
標準剤 (OD錠、5mg)	237.14 ±41.17	69.04 ±14.05	0.7 ±0.3	11.45 ±8.70

(Mean ± SD, n = 19)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### 【薬効薬理】

ヒスタミンH<sub>1</sub>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。<sup>2)</sup>

### 【有効成分に関する理化学的知見】

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

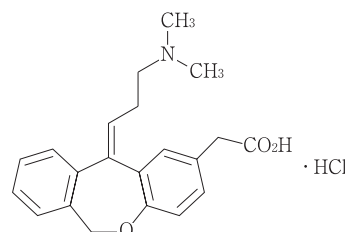
化学名：{11-[(1Z)-3-(Dimethylamino)propylidene]-

6,11-dihydrodibenzo[*b,e*]oxepin-2-yl} acetic acid monohydrochloride

分子式：C<sub>21</sub>H<sub>23</sub>NO<sub>3</sub> · HCl

分子量：373.87

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

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

0.01mol/L塩酸試液に溶ける。

1.0gを水100mLに溶かした液のpHは2.3~3.3である。

融点：約250℃(分解)

### 【取扱い上の注意】

#### 安定性試験

最終包装品を用いた加速試験(40℃、75% RH、6ヵ月)の結果、外観、溶出性及び含量等は規格の範囲内であり、オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「フェルゼン」及び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。<sup>3)</sup>

### 【包装】

オロパタジン塩酸塩OD錠2.5mg「フェルゼン」：

100錠(PTP)

オロパタジン塩酸塩OD錠5mg「フェルゼン」：

100錠(PTP)

## 【主要文献】

- 1) (株)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) 第十七改正日本薬局方解説書 廣川書店 2016：C-1204
- 3) (株)フェルゼンファーマ：安定性に関する資料(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ください。

株式会社フェルゼンファーマ 安全管理部  
〒105-0001 東京都港区虎ノ門1-1-18 ヒューリック虎ノ門ビル  
TEL：03-6368-5160 FAX：03-3580-1522

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 AKKビル