

## 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2018(2019年更新版)に準拠して作成

抗アレルギー点眼剤  
オロパタジン塩酸塩点眼液

**オロパタジン点眼液0.1%「三和」**  
OLOPATADINE Ophthalmic Solution "SANWA"

剤形	無菌水性点眼液
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL中「日局」オロパタジン塩酸塩 1.1mg (オロパタジンとして 1mg)
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	製造販売承認年月日：2021年 8月 16日 薬価基準収載年月日：2021年 12月 10日 販売開始年月日：2021年 12月 10日
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：株式会社三和化学研究所
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	株式会社三和化学研究所 コンタクトセンター TEL 0120-19-8130 FAX(052)950-1305 受付時間：9時～17時（土、日、祝日及び弊社休日を除く） 医療関係者向けウェブサイト <a href="https://med.skk-net.com/">https://med.skk-net.com/</a>

本IFは2023年9月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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（<https://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I F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I F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て、「I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMD A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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMD A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

I F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。I F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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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I F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、I Fを利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. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1
6. RMPの概要	1
II. 名称に関する項目	
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	2
5. 化学名（命名法）又は本質	2
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	2
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法，定量法	3
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 添付溶解液の組成及び容量	4
4. 力価	4
5. 混入する可能性のある夾雑物	5
6. 製剤の各種条件下における安定性	5
7. 調製法及び溶解後の安定性	6
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	6
9. 溶出性	6
10. 容器・包装	6
11. 別途提供される資材類	7
12. その他	7
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	8
2. 効能又は効果に関連する注意	8
3. 用法及び用量	8
4. 用法及び用量に関連する注意	8
5. 臨床成績	8
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	10
2. 薬理作用	10
VII. 薬物動態に関する項目	

1.	血中濃度の推移	11
2.	薬物速度論的パラメータ	11
3.	母集団（ポピュレーション）解析	12
4.	吸収	12
5.	分布	12
6.	代謝	12
7.	排泄	13
8.	トランスポーターに関する情報	13
9.	透析等による除去率	13
10.	特定の背景を有する患者	13
11.	その他	13
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	14
2.	禁忌内容とその理由	14
3.	効能又は効果に関連する注意とその理由	14
4.	用法及び用量に関連する注意とその理由	14
5.	重要な基本的注意とその理由	14
6.	特定の背景を有する患者に関する注意	14
7.	相互作用	15
8.	副作用	15
9.	臨床検査結果に及ぼす影響	15
10.	過量投与	16
11.	適用上の注意	16
12.	その他の注意	16
IX. 非臨床試験に関する項目		
1.	薬理試験	17
2.	毒性試験	17
X. 管理的事項に関する項目		
1.	規制区分	18
2.	有効期間	18
3.	包装状態での貯法	18
4.	取扱い上の注意	18
5.	患者向け資材	18
6.	同一成分・同効薬	18
7.	国際誕生年月日	18
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	18
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	18
10.	再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	18
11.	再審査期間	19
12.	投薬期間制限に関する情報	19
13.	各種コード	19
14.	保険給付上の注意	19

X I. 文献	
1. 引用文献	20
2. その他の参考文献	20
X II. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21
X III. 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	22
2. その他の関連資料	22

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

オロパタジン点眼液 0.1%「三和」は、後発医薬品として平成 26 年 11 月 21 日付薬食発 1121 第 2 号厚生労働省医薬食品局長通知「医薬品の承認申請について」に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験を実施した。また、標準製剤の分析結果に基づき、添加剤の種類及び含量（濃度）が標準製剤と同一となるよう処方設計を行ったものであり、pH、粘度、浸透圧などの物理化学的性質が近似することから、生物学的に同等とみなされ、2021 年 8 月 16 日に承認を取得し、2021 年 12 月 10 日に販売を開始した。

なお、本剤は後発医薬品として、株式会社三和化学研究所、キョーリンリメディオ株式会社、高田製薬株式会社の 3 社と共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

### 2. 製品の治療学的特性

オロパタジン塩酸塩は Allergic disease の抑制作用を持つ第二世代抗 histamine 薬で、histamine H<sub>1</sub> 受容体拮抗を主作用とし、肥満細胞からの chemical mediator の遊離抑制作用を併せ持つ<sup>1)</sup>。

### 3. 製品の製剤学的特性

該当しない

### 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、最適使用推進ガイドライン等	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

### 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

オロパタジン点眼液 0.1%「三和」

#### (2) 洋名

OLOPATADINE Ophthalmic Solution 0.1% “SANWA”

#### (3) 名称の由来

成分の一般名に由来する。

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

オロパタジン塩酸塩 (JAN)

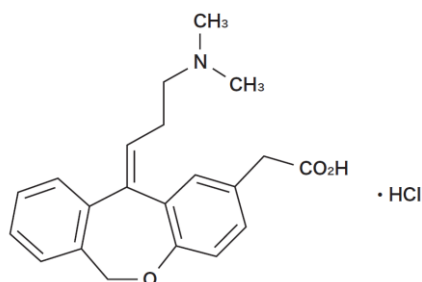
#### (2) 洋名 (命名法)

Olopatadine Hydrochloride (JAN) Olopatadine (INN)

#### (3) ステム (stem)

-tadine 三環系 H<sub>1</sub> 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<sub>21</sub>H<sub>23</sub>NO<sub>3</sub> · HCl

分子量 : 373.87

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

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

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当しない



### 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

各種溶媒に対する溶解性

溶媒名	1gを溶かすのに要する溶媒量	溶解性
ギ酸	1mL 未満	極めて溶けやすい
水	30mL 以上 100mL 未満	やや溶けにくい
エタノール(99.5)	1000mL 以上 10000mL 未満	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 である。

#### 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，定量法

確認試験法

「日局」オロパタジン塩酸塩の確認試験法に準拠する。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）

定量法

「日局」オロパタジン塩酸塩の定量法に準拠する。

0.1mol/L 過塩素酸で滴定（電位差滴定法）

#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

無菌水性点眼液

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	オロパタジン点眼液 0.1%「三和」
pH	6.8～7.2
浸透圧比	0.9～1.1
性状	無色～微黄色澄明、無菌水性点眼液

###### (3) 識別コード

該当しない

###### (4) 製剤の物性

該当資料なし

###### (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

販売名	オロパタジン点眼液 0.1%「三和」
有効成分	1mL 中「日局」オロパタジン塩酸塩 1.1mg (オロパタジンとして 1mg)
添加剤	リン酸水素ナトリウム水和物、ベンザルコニウム塩化物液、 等張化剤、pH 調節剤

###### (2) 電解質等の濃度

該当しない

###### (3) 熱量

該当しない

##### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

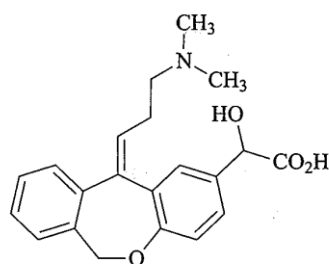
##### 4. 力価

該当しない

## 5. 混入する可能性のある夾雑物<sup>1)</sup>

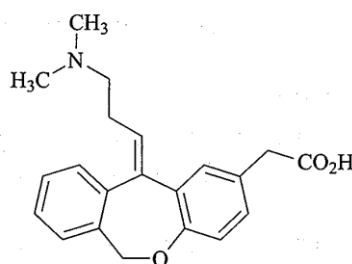
不純物として  $\alpha$ -hydroxy 体及び  $E$ -体が知られている。

$\alpha$ -hydroxy 体



(*Z*)-2-(11-(3-(dimethylamino)propylidene)-6,11-dihydrodibenzo[*b,e*]oxepin-2-yl)-2-hydroxyacetic acid

$E$ -体



(*E*)-2-(11-(3-(dimethylamino)propylidene)-6,11-dihydrodibenzo[*b,e*]oxepin-2-yl)acetic acid

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

### (1) 加速試験<sup>2)</sup>

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
加速試験	40±1℃、 75±5%RH	6 ヶ月	最終包装 <sup>※1</sup>	規格内

※1：本品をポリプロピレン製容器に入れ、紙箱に入れる。

測定項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌、定量  
最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、オロパタジン点眼液 0.1% 「三和」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。

### (2) 長期保存試験<sup>3)</sup>

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
長期保存試験	25±2℃、 60±5%RH	36 ヶ月	最終包装 <sup>※1</sup>	規格内

※1：本品をポリプロピレン製容器に入れ、紙箱に入れる。

測定項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌、定量

### (3) 光安定性試験<sup>4)</sup>

試験項目	保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
光安定性試験	1000lx/h 25±2℃、 60±5%RH	開始時 <sup>※1</sup> 、 60 万及び 120 万 lx・h 曝光後	曝光	規格内
			遮光袋 <sup>※2</sup> 入り	規格内
	暗所 25±2℃、 60±5%RH	開始時 <sup>※1</sup> 、 120 万 lx・h 曝光検体測定時	遮光袋 <sup>※2</sup> なし	規格内

※1：各包装形態検体の開始時における測定は兼ねて行い、結果を共用する。

※2：点眼透明袋、材質:Pe0.05mm 紫外線防止マスターバッチ 10%混入

測定項目：性状、純度試験、定量

## 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）<sup>5)</sup>

オロパタジン点眼液 0.1%「三和」について、併用の可能性が高いと予想される点眼薬を選択し、配合変化試験を実施した。

試験製剤：オロパタジン点眼液 0.1%「三和」

対象製剤：ヒアレイン点眼液 0.1%、フルメトロン点眼液 0.1%、ニフラン点眼液 0.1%、ジクロード点眼液 0.1%、リンデロン点眼・点耳・点鼻液 0.1%、点眼・点鼻用リンデロン A 液、ブロナック点眼液 0.1%、キサラタン点眼液 0.005%、チモプトール点眼液 0.5%、チモプトール XE 点眼液 0.5%、クラビット点眼液 0.5%、クラビット点眼液 1.5%、ミケラン点眼液 2%、ミケラン LA 点眼液 2%

測定項目：性状、pH、浸透圧比、含量

保存条件：室温保存

保存期間：混合直後、24 時間後

試験方法：試験製剤及び対象製剤を正確に 1:1 の割合で混合し、各測定ポイントにてサンプリングした後、試験を行う。試験方法はオロパタジン点眼液 0.1%「三和」の規格試験に準じる。

結果：オロパタジン点眼液 0.1%「三和」にリンデロン点眼・点耳・点鼻液 0.1%を配合したとき、外観ににごりを認め「変化あり（規格外）」とした。フルメトロン点眼液 0.1%、ジクロード点眼液 0.1%、点眼・点鼻用リンデロン A 液、ブロナック点眼液 0.1%、チモプトール XE 点眼液 0.5%、クラビット点眼液 0.5%及びクラビット点眼液 1.5%を配合したとき、配合した製剤の特性により、着色、白濁及び粘性等の変化を認め「変化あり（規格内）」とした。チモプトール XE 点眼液 0.5%を配合したとき、含量低下が配合前よりも 3.0%以上あったが、規格値内であったため「変化あり（規格内）」とした。それ以外の製剤との配合についてはいずれの測定項目についても変化を認めなかった。

## 9. 溶出性

該当しない

## 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

該当しない

(2) 包装

5mL×10 本

(3) 予備容量

該当しない

#### (4) 容器の材質

本体：ポリプロピレン(PP)

キャップ：ポリプロピレン(PP)

中栓：ポリエチレン(PE)

シュリンクラベル：ポリエチレンテレフタレート(PET)

#### 1 1. 別途提供される資材類

投薬袋

#### 1 2. その他<sup>6)</sup>

1 滴質量：32.4mg (30 回滴下の平均値)

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

アレルギー性結膜炎

### 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

通常、1回1～2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

#### (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

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

##### ① 海外後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験）

無症状期の日本人アレルギー性結膜炎患者（147例）を対象に海外で実施した後期第Ⅱ相試験において、片眼にオロパタジン点眼液（0.01%群38例、0.05%群38例、0.1%群35例、0.15%群36例）、対眼にプラセボをそれぞれ1回1滴点眼し、点眼4時間後に抗原誘発を行った。抗原誘発5分後におけるそう痒感の平均スコアの0.1%群（オロパタジン点眼液群）とプラセボ群との差と95%信頼区間は、-1.19、[-1.52, -0.85]であり、抗原誘発20分後における総合充血の平均スコアのオロパタジン点眼液群とプラセボ群との差と95%信頼区間は、-0.93、[-1.49, -0.37]であった。

オロパタジン点眼液投与群35例（安全評価対象例）で副作用は認められなかった<sup>7)</sup>。

② 国内第Ⅲ相比較試験（ケトチフェンフマル酸塩点眼液を対照薬とした二重盲検並行群間比較試験）

アレルギー性結膜炎患者（247例）を対象に、0.1%オロパタジン点眼液又は0.05%ケトチフェンフマル酸塩点眼液を両眼に1回2滴、1日4回（朝、昼、夕、就寝前）28日間点眼投与したところ、そう痒感及び充血の重症度点数において、0.1%オロパタジン点眼液は0.05%ケトチフェンフマル酸塩点眼液に劣らない有効性を示した。

副作用発現頻度は、0.1%オロパタジン点眼液投与群で4.8%（6/124例）であった。副作用は眼痛2.4%（3/124例）、角膜炎NOS0.8%（1/124例）、アラニン・アミノトランスフェラーゼ増加1.6%（2/124例）、アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加0.8%（1/124例）であった<sup>8)</sup>。

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

該当しない

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. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

ケトチフェンフマル酸塩、レボカバスチン塩酸塩、クロモグリク酸ナトリウム、トラニラスト、ペミロラストカリウム、イブジラスト、アシタザノラスト水和物 等

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

オロパタジン塩酸塩は、選択的ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用を主作用とし、更に肥満細胞からの化学伝達物質の遊離・産生抑制作用を有する<sup>1)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 抗ヒスタミン作用 (*in vitro*)

受容体結合実験において、ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体に強い拮抗作用 (K<sub>i</sub> 値: 41.1~59.0nmol/L) を有し、その作用は選択的である。

ヒスタミン刺激によるヒト結膜上皮細胞からのインターロイキン-6 (IC<sub>50</sub> 値: 5.5nmol/L) 及びインターロイキン-8 (IC<sub>50</sub> 値: 1.7nmol/L) の遊離・産生を抑制した<sup>9)-11)</sup>。

##### 2) 抗アレルギー作用 (*in vitro*)

抗ヒト IgE 抗体刺激によるヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン (IC<sub>50</sub> 値: 314~859 μmol/L)、プロスタグランジン D<sub>2</sub> (IC<sub>50</sub> 値: 736 μmol/L) 及び TNF α (IC<sub>50</sub> 値: 13.1 μmol/L) の遊離・産生を抑制した<sup>12), 13)</sup>。

##### 3) 動物結膜炎モデルにおける作用

ヒスタミン誘発によるモルモット結膜における血管透過性亢進を抑制 (ED<sub>50</sub> 値: 0.002%) した。感作モルモットの抗原誘発による眼瞼と眼球結膜の充血及び膨疹を抑制 (ED<sub>50</sub> 値: 0.017%) した<sup>14)</sup>。

#### (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

反復投与

アレルギー患者（12例）に0.1%オロパタジン点眼液を、両眼に1回2滴、6時間ごとに（1日4回点眼）4日間反復点眼したときのオロパタジン（未変化体）の薬物動態パラメータは下記のとおりであった（定量限界値は0.05ng/mL<sup>15</sup>）。

オロパタジン（未変化体）の薬物動態パラメータ

（平均値±標準偏差 n=12）

点眼日	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (h)	AUC <sub>0-6</sub> (ng·h/mL)	消失半減期 (h)
3日目	0.610±0.518	1.21±0.62	2.07±1.46	算出できず
4日目	0.520±0.416	1.23±0.62	1.90±1.16 <sup>※2</sup>	3.1±1.3
検定 <sup>※1</sup> (Paired t test)	p=0.0814	検定せず	p=0.1249	検定せず

※1：3日目と4日目の比較

※2：n=11

#### (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

該当資料なし

#### (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

該当資料なし

(2) 血液—胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 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（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

該当資料なし

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

該当資料なし

11. その他

生物学的同等性試験

オロパタジン点眼液 0.1%「三和」は、パタノール点眼液 0.1%の分析結果に基づき添加剤の種類及び含量(濃度)がパタノール点眼液 0.1%と同一となるよう処方設計を行ったものであり、pH、粘度、浸透圧などの物理化学的性質が近似することから、生物学的に同等とみなされた。

## 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）

2.1 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

8.1 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注意すること。

### 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

設定されていない

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (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、経口）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、乳児を対象とした臨床試験は実施していない。

## (8) 高齢者

設定されていない

## 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

設定されていない

### (2) その他の副作用

#### 11.2 その他の副作用

	0.5～5%未満	0.5%未満	頻度不明
眼	眼痛	角膜炎、そう痒症、眼刺激、眼瞼浮腫、眼の異常感、充血、眼瞼炎、眼脂、結膜濾胞、結膜出血、眼瞼湿疹、眼瞼紅斑、流涙増加、眼の異物感、眼部不快感、眼瞼障害	眼乾燥、眼瞼縁痂皮、霧視、眼瞼痛
精神神経系		頭痛	味覚異常、めまい
肝臓		ALT 上昇、AST 上昇	
その他		ヘマトクリット減少、尿中ブドウ糖陽性	接触性皮膚炎、口内乾燥、悪心、過敏症、咽喉乾燥

注) 使用成績調査及び特定使用成績調査を含む。

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 10. 過量投与

該当資料なし

## 11. 適用上の注意

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- ・患眼を開眼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉眼して涙嚢部を圧迫させた後、開眼すること。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物は、ソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、点眼時はコンタクトレンズをはずし、10分以上経過後装用すること<sup>16),17)</sup>。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

### (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」の項参照

#### (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

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

眼粘膜刺激性試験<sup>18)</sup>

雄性ウサギ(n=6)を用いて、右眼にオロパタジン点眼液 0.1%「三和」を、左眼に陰性対照物質として生理食塩液を各々1回につき 100  $\mu$ L ずつ 30 分間隔で 8 回投与を 7 日間行い、眼粘膜刺激性を検討した。投与日 1 日の 1 回目投与前及び最終投与(8 回目投与)後 1 時間、投与日 4 日及び 7 日の 1 回目投与前、投与日 7 日の最終投与後 1、24、48、72、96 及び 168 時間に、両眼を肉眼的に観察し、Draize の基準により角膜、虹彩及び結膜の刺激性反応を評価した。その結果、オロパタジン点眼液 0.1%「三和」は無刺激物であると評価された。

#### (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

製 剤：オロパタジン点眼液 0.1%「三和」 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

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

#### 20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無し

くすりのしおり：有り

その他の患者向け資材：オロパタジン点眼液0.1%「三和」を使用される患者様へ  
(「XⅢ. 備考 その他の関連資料」の項参照)

### 6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：パタノール点眼液 0.1%

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 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

販売名	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 点眼液 0.1% 「三和」	2021年8月16日	30300AMX00317000	2021年12月10日	2021年12月10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

該当しない

### 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



1 1. 再審査期間

該当しない

1 2. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

1 3. 各種コード

販売名	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(9桁)番号	レセプト電算処理 システム用コード
オロパタジン 点眼液 0.1% 「三和」	1319752Q1075	1319752Q1075	128770701	622877001

1 4. 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) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店. 2021 ; C-1276-1280
- 2) 社内資料 : 加速試験
- 3) 社内資料 : 長期安定性試験
- 4) 社内資料 : 光安定性試験
- 5) 社内資料 : 配合変化試験
- 6) 社内資料 : 1 滴質量に関する資料
- 7) 後期第Ⅱ相試験 (抗原誘発試験 2) (パタノール点眼液 0.1% 承認年月日 : 2006 年 7 月 26 日、申請資料概要ト-1 (10))
- 8) 第Ⅲ相試験 1 (フマル酸ケトチフェン点眼薬との比較) (パタノール点眼液 0.1% 承認年月日 : 2006 年 7 月 26 日、申請資料概要ト-1 (8))
- 9) Sharif NA, et al. : J Ocul Pharmacol Ther. 1996 ; 12 (4) : 401-407 (PMID : 8951676)
- 10) 作用機序 (ヒスタミン受容体拮抗作用) (パタノール点眼液 0.1% 承認年月日 : 2006 年 7 月 26 日、申請資料概要ホ-3)
- 11) Yanni JM, et al. : Arch Ophthalmol. 1999 ; 117 (5) : 643-647 (PMID : 10326962)
- 12) 作用機序 (ヒト結膜肥満細胞からの炎症性伝達物質遊離へ及ぼす影響) (パタノール点眼液 0.1% 承認年月日 : 2006 年 7 月 26 日、申請資料概要ホ-2)
- 13) Cook EB, et al. : Ann Allergy Asthma Immunol. 2000 ; 84 (5) : 504-508 (PMID : 10326962)
- 14) Yanni JM, et al. : J Ocul Pharmacol Ther. 1996 ; 12 (4) : 389-400 (PMID : 8951675)
- 15) アレルギー患者における血中濃度 (パタノール点眼液 0.1% 承認年月日 : 2006 年 7 月 26 日、申請資料概要ヘ-4 (2))
- 16) Momose T, et al. : CLAO J. 1997 ; 23 (2) : 96-99 (PMID : 10326962)
- 17) Christensen MT, et al. : CLAO J. 1998 ; 24 (4) : 227-231 (PMID : 9800062)
- 18) 社内資料 : 眼粘膜刺激性試験
- 19) Therapeutic Goods Administration, Prescribing medicines in pregnancy database  
<<https://www.tga.gov.au/products/medicines/find-information-about-medicine/prescribing-medicines-pregnancy-database>> (2024/04/03 アクセス)

### 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

- (1) 本剤と同一製剤は外国で発売されていない。
- (2) オロパタジン製剤としては、各国で販売されている。

### 2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリアの分類）<sup>19)</sup>

日本の電子添文の「9.5 妊婦」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリアの分類とは異なる。

本邦における注意事項等情報

#### 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。

	分類
オーストラリアの分類： An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy	B1（2024年4月現在）

参考：分類の概要

<オーストラリアの分類：An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy>

B1: Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have not shown evidence of an increased occurrence of fetal damage.

[妊婦および妊娠可能年齢の女性への使用経験はまだ限られているが、この薬による奇形やヒト胎児への直接・間接的有害作用の発生頻度増加は観察されていない。動物を用いた研究では、胎児への障害発生が増加したという証拠は示されていない。]

### 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

##### (1) 粉碎

該当しない

##### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

#### 2. その他の関連資料

##### 患者用使用説明書

「オロパタジン点眼液 0.1%「三和」を使用される患者様へ」(B6版、20枚1冊、2021年9月作成)

### オロパタジン点眼液 0.1%「三和」を使用される患者様へ

**この点眼液は、アレルギー性結膜炎を治療するお薬です。**




**使用する際に注意すること**

**点眼前** 手をきれいに洗ってください。

**点眼時** 1回1～2滴、1日4回(朝、昼、夕方及び就寝前)です。  
決められた点眼回数をお守りください。  
点眼のとき、容器の先が目やまぶた、まつ毛に触れないように注意してください。  
ソフトコンタクトレンズははずし、10分以上経ってから装着してください。  
ハードコンタクトレンズの場合もはずして投与する方が安全です。

**点眼後** 点眼液が眼のまわりについたときはティッシュや清潔なタオルでふき取ってください。  
他の目薬を使用するときは、5分以上の間隔を開けてください。

**点眼以外の目的で使用しないでください。**




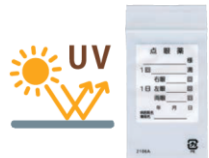
### オロパタジン点眼液 0.1%「三和」を使用される患者様へ

**点眼液の保管・取扱いで注意すること**

- 点眼袋はUVカット機能のある点眼袋です。使用後は点眼袋に入れて室温(1～30℃)で保管してください。
- 開封後は4週間以内に使用し、残液は使用しないでください。

**その他、注意すること**

- 医師に指示された用法・点眼方法を必ず守ってください。
- 点眼後、しみるなどの自覚症状が続く場合は、医師の診察を受けるようにしてください。
- その他、点眼後に異常を感じた際には、すぐに医師または薬剤師にご相談ください。



株式会社 三和化学研究所  
S K K

2021年9月作成  
OLO-02 A01127 WK0921