



遺伝性血管性浮腫発作抑制用 血漿カリクレイン阻害剤

処方箋医薬品<sup>注</sup>

**オラデオ<sup>®</sup> 顆粒分包** 72mg・96mg  
108mg・132mg

ORLADEYO<sup>®</sup> Granules 72mg, 96mg, 108mg, 132mg [薬価基準未収載]

ベロトラスタット塩酸塩顆粒

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

発売  
準備中

## 2歳以上12歳未満の小児に対する 製造販売承認取得のお知らせ

このたび、遺伝性血管性浮腫 (HAE) 発作抑制用血漿カリクレイン阻害剤「オラデオ顆粒分包72mg、96mg、108mg及び132mg」(一般名：ベロトラスタット塩酸塩) が、2歳以上12歳未満の小児を対象に製造販売承認を取得しましたので、ご案内申し上げます。

### 効能又は効果

遺伝性血管性浮腫の急性発作の発症抑制

### 用法及び用量

通常、2歳以上12歳未満の小児には、ベロトラスタットとして  
下記の体重別の用量を、1日1回、食後又は食事とともに経口投与する。

15kg以上24kg未満：ベロトラスタットとして72mg

24kg以上32kg未満：ベロトラスタットとして96mg

32kg以上40kg未満：ベロトラスタットとして108mg

40kg以上：ベロトラスタットとして132mg

### ● 保険適用上の留意事項通知 ●

本製剤の効能又は効果が「遺伝性血管性浮腫の急性発作の発症抑制」であることを踏まえ、関連する学会のガイドライン等を参考に、遺伝性血管性浮腫の確定診断がされ、急性発作のおそれがある患者に対して使用すること。

使用薬剤の薬価(薬価基準)の一部改正等について(令和3年4月20日保医発0420第3号)

### 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

オラデオ<sup>®</sup>顆粒分包

72mg・96mg  
108mg・132mg

ORLADEYO<sup>®</sup>Granules 72mg, 96mg, 108mg, 132mg

処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注)注意－医師等の処方箋により使用すること

Drug Information

|      |      |
|------|------|
| 貯法   | 室温保存 |
| 有効期間 | 24箇月 |

|       |                  |                                   |                  |                  |                  |
|-------|------------------|-----------------------------------|------------------|------------------|------------------|
| 商 品 名 | 和 名              | オラデオ顆粒分包72・96・108・132mg           | 一 般 名            | ペロトラルスタット塩酸塩顆粒   |                  |
|       | 洋 名              | ORLADEYO Granules 72・96・108・132mg | 日本標準商品分類番号       | 87449            |                  |
|       | オラデオ顆粒分包72mg     |                                   | オラデオ顆粒分包96mg     | オラデオ顆粒分包108mg    | オラデオ顆粒分包132mg    |
| 承認番号  | 30800AMX00300000 |                                   | 30800AMX00297000 | 30800AMX00298000 | 30800AMX00299000 |
| 承認年月  | 2026年8月          |                                   |                  |                  |                  |
| 薬価収載  |                  |                                   |                  |                  |                  |
| 販売開始  |                  |                                   |                  |                  |                  |

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. 組成・性状

3.1 組成

|      |                                                                                              |                                                   |                                                    |                                                    |
|------|----------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------|----------------------------------------------------|----------------------------------------------------|
| 販売名  | オラデオ顆粒分包72mg                                                                                 | オラデオ顆粒分包96mg                                      | オラデオ顆粒分包108mg                                      | オラデオ顆粒分包132mg                                      |
| 有効成分 | 1包中<br>ペロトラルスタット塩酸塩81.33mg<br>(ペロトラルスタットとして72mg)                                             | 1包中<br>ペロトラルスタット塩酸塩108.44mg<br>(ペロトラルスタットとして96mg) | 1包中<br>ペロトラルスタット塩酸塩122.00mg<br>(ペロトラルスタットとして108mg) | 1包中<br>ペロトラルスタット塩酸塩149.11mg<br>(ペロトラルスタットとして132mg) |
| 添加剤  | 部分アルファー化デンプン、クロスボビドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、アミノアルキルメタクリレートコポリマー E、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸、タルク、酸化チタン |                                                   |                                                    |                                                    |

3.2 製剤の性状

|        |                  |              |               |               |
|--------|------------------|--------------|---------------|---------------|
| 販売名    | オラデオ顆粒分包72mg     | オラデオ顆粒分包96mg | オラデオ顆粒分包108mg | オラデオ顆粒分包132mg |
| 剤形     | 白色の円柱状のコーティング顆粒剤 |              |               |               |
| 色      | 白                |              |               |               |
| 直径(mm) | 約2               |              |               |               |
| 厚さ(mm) | 約3               |              |               |               |

4. 効能又は効果

遺伝性血管性浮腫の急性発作の発症抑制

5. 効能又は効果に関連する注意

臨床試験において、侵襲を伴う処置による急性発作の発症抑制に対する有効性及び安全性は検討されていない。

6. 用法及び用量

通常、2歳以上12歳未満の小児には、ペロトラルスタットとして下記の体重別の用量を、1日1回、食後又は食事とともに経口投与する。  
15kg以上24kg未満：ペロトラルスタットとして72mg  
24kg以上32kg未満：ペロトラルスタットとして96mg  
32kg以上40kg未満：ペロトラルスタットとして108mg  
40kg以上：ペロトラルスタットとして132mg

7. 用法及び用量に関連する注意

本剤とオラデオカプセルの生物学的同等性は示されていないため、互換使用を行わないこと。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 患者又はその家族に以下の内容を十分に説明し、理解を得た上で使用すること。  
(1)急性発作の治療を目的に本剤を服用しないこと。  
(2)本剤にはQT延長を含めた安全性の懸念があること。
- 8.2 QT延長があらわれるおそれがあるので、本剤投与前及び投与中は、心電図検査を行うなど患者の状態を十分に確認すること。また、QT延長を起こしやすい患者や、本剤の血中濃度が上昇する可能性のある患者では、QT延長等の副作用があらわれやすくなるので特に注意すること。[電子化された添付文書の9.1.1、9.3.1、10.2、16.6.3参照]

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

- 9.1.1 QT延長又はその既往歴のある患者、QT延長を起こしやすい患者(不整脈、虚血性心疾患、低カリウム血症等の患者)

QT延長が悪化する又はあらわれるおそれがある。[電子化された添付文書の8.2、10.2参照]

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 中等度及び重度の肝機能障害(Child-Pugh分類B、C)のある患者

本剤の血中濃度が上昇し、QT延長があらわれやすくなるおそれがある。[電子化された添付文書の8.2、10.2、11.1.2、16.6.2、17.3.1参照]

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。

ラット及びウサギで胎盤を通過することが確認されている。ラットの胚・胎児発生に関する試験で妊娠6～17日にペロトラルスタットの成人及び12歳以上の小児の臨床用量を1日1回投与時の8.6倍の曝露がみられた用量を投与したとき、妊娠の維持や分娩、胚・胎児発生、生存又は成長には影響を及ぼさなかった。ウサギの胚・胎児発生に関する試験で妊娠7～19日にペロトラルスタットの成人及び12歳以上の小児の臨床曝露量(150mg<sup>(B)</sup>)を1日1回投与)の1.5倍の曝露がみられた用量を投与したとき、胚・胎児発生、生存、成長には影響を及ぼさなかった。

注)本剤の承認された用法用量は「体重に応じペロトラルスタットとして72mg、96mg、108mg、132mgを1日1回投与する」である。

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。

授乳14日目の仔ラットの血漿中にペロトラルスタットが母体血漿中の約5%の濃度で検出された。

9.7 小児等

臨床試験において3歳未満及び体重15kg未満の幼児に対する使用経験はない。

10. 相互作用

本剤は主にCYP2D6及びCYP3A4で代謝される(*in vitro*)。[電子化された添付文書の16.4参照]

また、本剤はP-糖蛋白質及び乳癌耐性蛋白(BCRP)の基質であり、P-糖蛋白質、CYP2D6及びCYP3A4の阻害作用を有する。

10.2 併用注意(併用に注意すること)

| 薬剤名等                                                            | 臨床症状・措置方法                                 | 機序・危険因子                                                                      |
|-----------------------------------------------------------------|-------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------|
| シクロスポリン<br>[電子化された添付文書の16.7.1参照]                                | シクロスポリンの併用により、ペロトラルスタットの血中濃度が上昇したとの報告がある。 | シクロスポリンがP-糖蛋白質、BCRP、及びCYP3A4を阻害することにより、ペロトラルスタットの血中濃度が上昇すると考えられる。            |
| CYP3A4で代謝される薬剤<br>ミダゾラム、アムロジピン等<br>[電子化された添付文書の16.7.2、16.7.3参照] | ペロトラルスタットの併用により、これらの薬剤の血中濃度が上昇したとの報告がある。  | ペロトラルスタットはCYP3A4を中程度に阻害するため、これらの薬剤の代謝を抑制し、血中濃度を上昇させると考えられる。                  |
| CYP2D6で代謝される薬剤<br>デキストロメトルフアン等<br>[電子化された添付文書の16.7.4参照]         | ペロトラルスタットの併用により、これらの薬剤の血中濃度が上昇したとの報告がある。  | ペロトラルスタットはCYP2D6を阻害するため、これらの薬剤の代謝を抑制し、血中濃度が上昇すると考えられる。                       |
| ジゴキシン<br>[電子化された添付文書の16.7.5参照]                                  | ペロトラルスタットの併用により、ジゴキシンの血中濃度が上昇したとの報告がある。   | ペロトラルスタットはP-糖蛋白質を阻害するため、P-糖蛋白質を介したジゴキシンの輸送が阻害されることにより、ジゴキシンの血中濃度が上昇すると考えられる。 |
| QT延長を起こすことが知られている薬剤<br>抗不整脈薬等<br>[電子化された添付文書の8.2、9.1.1、9.3.1参照] | QT延長があらわれるおそれがある。                         | 併用によりQT延長作用が増強するおそれがある。                                                      |

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 肝機能障害 (3.8%)

11.1.2 QT 延長 (頻度不明) [電子化された添付文書の 9.3.1、16.6.2、17.3.1 参照]

11.2 その他の副作用

|            |           |                     |
|------------|-----------|---------------------|
|            | 5%以上10%未満 | 1%以上5%未満            |
| 消化器        | 腹痛、下痢、鼓腸  | 上腹部痛、胃食道逆流性疾患、嘔吐    |
| 皮膚及び皮下組織障害 |           | 発疹                  |
| 肝臓         |           | ALT上昇、AST上昇、γ-GTP上昇 |

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 本剤は主薬の苦味を避けるためコーティングをほどこしてあるので、顆粒を噛んだり砕いたり、又は溶かしたりすることなく、顆粒のまま服用するよう指導すること。なお、オレンジジュースのような酸性の食品は、本剤の味をマスキングするコーティングを溶かし苦味を引き起こす可能性があるため、使用しないよう指導すること。

14.1.2 以下のいずれかの方法で本剤 1 包を服用するよう指導すること。

・ 1 包の全量を直接口に含み、酸性飲料を避け、速やかに水又は牛乳で飲み込む。

・ 1 包の全量を約大さじ 1 杯 (15mL) の柔らかい非酸性の食品に混合し、混合後 10 分以内に服用する。食品は室温のものとする。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

成人及び 12 歳以上の小児を対象とした海外臨床試験において、アンドロゲン製剤の投与歴のある患者に基準範囲上限の 3 倍を超える ALT の上昇が認められている。

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 非臨床薬理試験において、K チャネル遮断作用、Na チャネル遮断作用及び Ca チャネル遮断作用が認められた。

15.2.2 ラット及びカンキイザルの反復投与毒性試験において、本剤投与後に、複数の器官・組織にリン脂質症に関連する所見 (マクロファージ及び組織球系細胞の空胞化／泡沫化) が認められた。

22. 包 装

〈オラデオ顆粒分包 72mg〉

7 包

〈オラデオ顆粒分包 96mg〉

7 包

〈オラデオ顆粒分包 108mg〉

7 包

〈オラデオ顆粒分包 132mg〉

7 包

24. 文献請求先及び問い合わせ先

バイオクリスト・ジャパン株式会社

〒102-0083 東京都千代田区麹町 2-10-3 TERADA 麹町ビル

TEL 03-4216-8260 E-mail infojapan@biocryst.com

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

株式会社オーファンパシフィック

〒105-0023 東京都港区芝浦 1-1-1

26.2 販売提携

鳥居薬品株式会社

東京都中央区日本橋本町 3-4-1

26.3 提携

バイオクリスト・ジャパン株式会社

東京都千代田区麹町 2-10-3 TERADA 麹町ビル

詳細は電子化された添付文書をご参照ください。

電子化された添付文書の改訂に十分ご注意ください。

