

日本標準商品分類番号
87449

## 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

アレルギー性疾患治療剤  
エピナスチン塩酸塩製剤

# エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ケミファ」 エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」 Epinastine Hydrochloride Tablets 10mg・20mg “Chemiphar”

剤形	フィルムコーティング錠		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ケミファ」：1 錠中エピナスチン塩酸塩 10mg エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」：1 錠中エピナスチン塩酸塩 20mg		
一般名	和名：エピナスチン塩酸塩（JAN） 洋名：Epinastine Hydrochloride（JAN）、Epinastine（INN）		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日		10mg	20mg
	製造販売承認年月日	2012 年 1 月 31 日	2012 年 1 月 31 日
	薬価基準収載年月日	2012 年 6 月 22 日	2012 年 6 月 22 日
	販売開始年月日	2010 年 5 月 28 日	2002 年 7 月 8 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本薬品工業株式会社 販売元：日本ケミファ株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	日本ケミファ株式会社 くすり相談室 TEL.0120-47-9321 03-3863-1225／FAX.03-3861-9567 受付時間：8:45～17:30（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nc-medical.com/">https://www.nc-medical.com/</a>		

本 IF は 2024 年 2 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。

# 医薬品インタビューフォーム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）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、PMDA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PMDA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・表現には薬機法の広告規則や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、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を活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
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	2
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	3
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	4
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	5
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	5
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5
9. 溶出性	6
10. 容器・包装	8
11. 別途提供される資材類	8
12. その他	8
V.治療に関する項目	9
1. 効能又は効果	9
2. 効能又は効果に関連する注意	9
3. 用法及び用量	9
4. 用法及び用量に関連する注意	9
5. 臨床成績	9
VI.薬効薬理に関する項目	15
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15
2. 薬理作用	15
VII.薬物動態に関する項目	16
1. 血中濃度の推移	16
2. 薬物速度論的パラメータ	17
3. 母集団(ポピュレーション)解析	18
4. 吸収	18
5. 分布	18
6. 代謝	18
7. 排泄	19

8. トランスポーターに関する情報	19
9. 透析等による除去率	19
10. 特定の背景を有する患者	19
11. その他	19
VIII.安全性(使用上の注意等)に関する項目	20
1. 警告内容とその理由	20
2. 禁忌内容とその理由	20
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	20
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	20
5. 重要な基本的注意とその理由	20
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	20
7. 相互作用	21
8. 副作用	21
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
10. 過量投与	22
11. 適用上の注意	22
12. その他の注意	22
IX.非臨床試験に関する項目	23
1. 薬理試験	23
2. 毒性試験	23
X.管理的事項に関する項目	24
1. 規制区分	24
2. 有効期間	24
3. 包装状態での貯法	24
4. 取扱い上の注意	24
5. 患者向け資材	24
6. 同一成分・同効薬	24
7. 国際誕生年月日	24
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	24
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	24
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	24
11. 再審査期間	24
12. 投薬期間制限に関する情報	25
13. 各種コード	25
14. 保険給付上の注意	25
XI.文献	26
1. 引用文献	26
2. その他の参考文献	26
XII.参考資料	27
1. 主な外国での発売状況	27
2. 海外における臨床支援情報	27
XIII.備考	28
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	28
2. その他の関連資料	29

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

エピナスチン塩酸塩製剤は、アレルギー性疾患治療剤であり、本邦では1994年6月に上市されている。エピナスチン塩酸塩錠20mg「ケミファ」は、後発医薬品としてアレジオテック錠20の販売名で2002年3月に承認を取得、同年7月に上市した。その後、医政発第310001号「後発医薬品の必要な規格を揃えること等について」（平成18年3月10日）発出のため、2010年5月にアレジオテック錠10を追加発売するに至った。

さらに、医療事故防止の観点からアレジオテック錠10・20はエピナスチン塩酸塩錠10mg・20mg「ケミファ」として販売名変更承認申請を行い、2012年1月に承認を取得、2012年6月に薬価収載を行った。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 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、ロイコトリエンC<sub>4</sub> (LTC<sub>4</sub>)、血小板活性化因子 (PAF) 等に対する抗メディエーター作用やヒスタミン及びSRS-Aのメディエーター遊離抑制作用を示す（「VI.-2. 薬理作用」の項参照）。
- (2) 気管支喘息、アレルギー性鼻炎、じん麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、痒疹、そう痒を伴う尋常性乾癬に対して効能又は効果を有する1日1回経口投与のアレルギー性疾患治療剤である（「V.-1. 効能又は効果」、「V.-3. 用法及び用量」の項参照）。
- (3) 重大な副作用として肝機能障害、黄疸、血小板減少が報告されている（頻度不明）（「VIII.-8. 副作用」の項参照）。

### 3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

### 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

該当項目なし

### 6. RMPの概要

該当項目なし

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」

#### (2) 洋名

Epinastine Hydrochloride Tablets 10mg “Chemiphar”

Epinastine Hydrochloride Tablets 20mg “Chemiphar”

#### (3) 名称の由来

「有効成分」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」より命名した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

エピナスチン塩酸塩（JAN）

#### (2) 洋名（命名法）

Epinastine Hydrochloride（JAN）

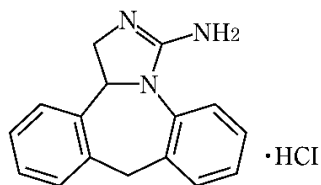
Epinastine（INN）

#### (3) ステム

抗アレルギー剤：-astine

### 3. 構造式又は示性式

構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>・HCl

分子量：285.77

### 5. 化学名（命名法）又は本質

(±)-3-Amino-9,13b-dihydro-1*H*-dibenz[ *c,f* ]imidazo[1,5-*a* ]azepine hydrochloride（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～微黄色の粉末で、においはなく、味は苦い。

##### (2) 溶解性

各種溶媒における溶解度

溶媒	日局の溶解度表記
水 メタノール エタノール (95) 酢酸 (100)	溶けやすい
アセトニトリル	溶けにくい

溶解度 (37℃) <sup>1)</sup>

条件	溶解度
pH1.2	100mg/mL 以上
pH4.0	100mg/mL 以上
pH6.8	100mg/mL 以上
水	100mg/mL 以上

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 270℃（分解）

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa：11.4（グアニジン基、吸光度法）

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

旋光性：本品のメタノール溶液（1→20）は旋光性を示さない。

pH：本品 1.0g を水 10mL に溶かした液の pH は 3.0～5.5 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：

- (1) ドラゲンドルフ試液による沈殿反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
- (4) 塩化物の定性反応 (2)

定量法：

電位差滴定法







## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」 フィルムコーティング錠  
 エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」 割線入りフィルムコーティング錠

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	表面	裏面	側面	性状
エピナスチン 塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」				白色～微黄色の フィルムコーティング錠
直径：6.6mm、厚さ：3.2mm、重量：103mg				
エピナスチン 塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」				白色～微黄色の割線入りの フィルムコーティング錠
直径：約 8.1mm、厚さ：約 3.4mm、重量：184mg				

#### (3) 識別コード

	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」
識別コード	NPI 120 (錠剤表面)	NPI AL (錠剤表面)
記載場所	錠剤、PTP シート	

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし

#### (5) その他

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」
有効成分 (1 錠中)	エピナスチン塩酸塩 10mg	エピナスチン塩酸塩 20mg
添加剤	アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマー、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒプロメロース	カルナウバロウ、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、部分アルファー化デンプン、マクロゴール 6000

#### (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. カ価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性<sup>2),3)</sup>

(1) エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40±1℃ 75±5%RH	6ヵ月	最終包装製品	規格内
無包装 安定性試験	40℃ 75%RH	3ヵ月	褐色ガラス瓶 (気密)	規格内
	25℃ 75%RH	3ヵ月	褐色ガラス瓶 (開放)	1ヵ月目以降、硬度低下
	25℃、45%RH 2500lx	20日 (総照度120万 lx・hr)	シャーレ (開放)	30万lx・hr曝露後 類縁物質の増加(規格内)

試験項目：性状、純度試験、溶出試験、定量試験、硬度〈加速試験〉

性状、純度試験、溶出性、定量法、硬度〈無包装安定性試験〉

(2) エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40℃ 75%RH	6ヵ月	最終包装製品	規格内
無包装 安定性試験	30±2℃ 75±5%RH	3ヵ月	無包装 (遮光・開放)	質量増加、硬度低下
	なりゆき 1000lx	50日 (総照度120万 lx・hr)	PTP 包装	硬度低下
	なりゆき 1000lx	50日 (総照度120万 lx・hr)	無包装 (開放)	120万lx・hr曝露後、 性状の変化、質量の若干の 増加、硬度及び含量の低下 (規格内)

試験項目：性状、確認試験、崩壊試験、定量試験〈加速試験〉

性状、質量試験、錠高、硬度、崩壊性、溶出性、純度試験、定量法〈無包装安定性試験〉

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)

該当しない

## 9. 溶出性

### (1) 溶出挙動における類似性<sup>4)</sup>

#### 1) エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」

本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに準拠

(方法) 日局溶出試験法 パドル法

試験条件：回転数 50rpm

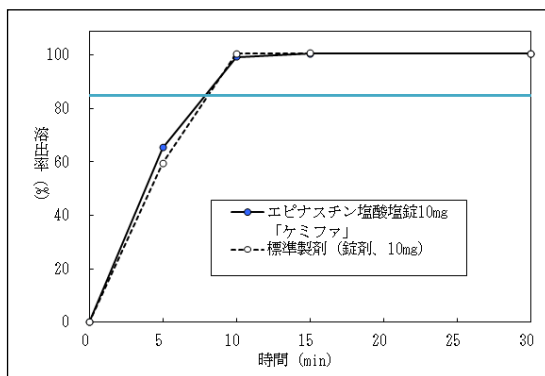
試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

判定基準：

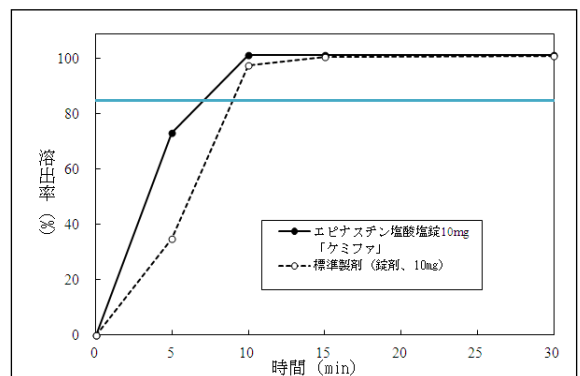
試験液	判定時間	判定基準
pH1.2 pH4.0 pH6.8 水	15 分	15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は、15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にある

(結果) すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と同等性を有することが確認された。

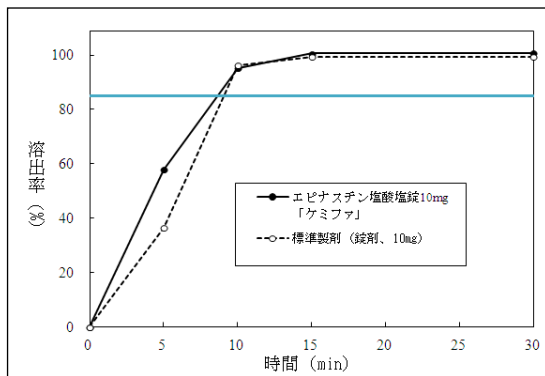
pH1.2(50rpm)による溶出曲線



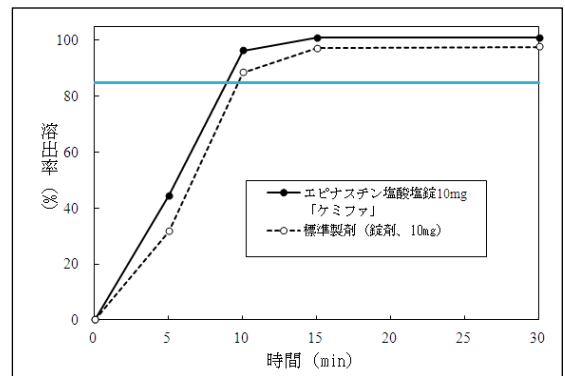
pH4.0(50rpm)による溶出曲線



pH6.8(50rpm)による溶出曲線



水(50rpm)による溶出曲線



## 2) エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」

本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに準拠

(方法) 日局溶出試験法 パドル法

試験条件：回転数 50rpm

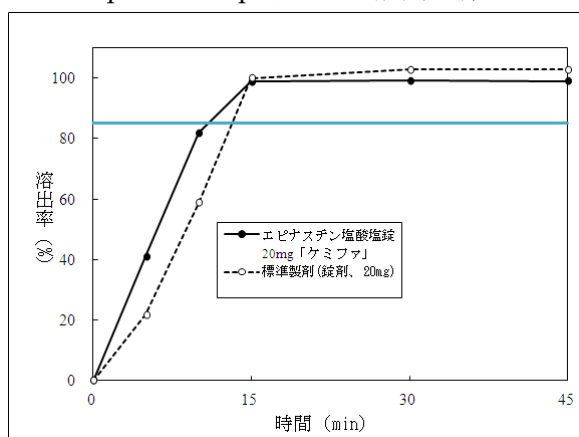
試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

判定基準：

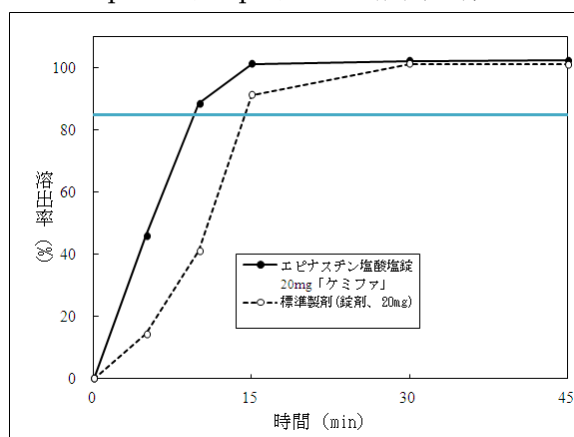
試験液	判定時間	判定基準
pH1.2 pH4.0 pH6.8 水	15 分	15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は、15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にある

(結果) すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と同等性を有することが確認された。

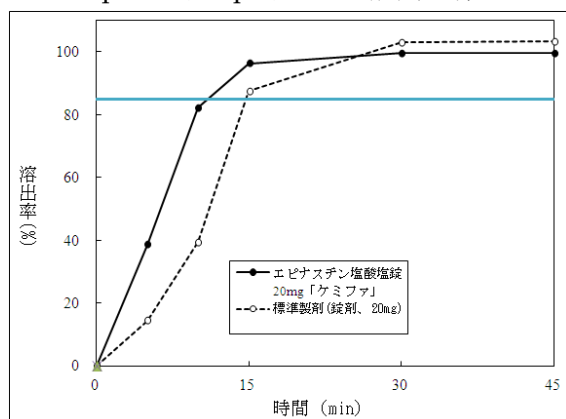
pH1.2(50rpm)による溶出曲線



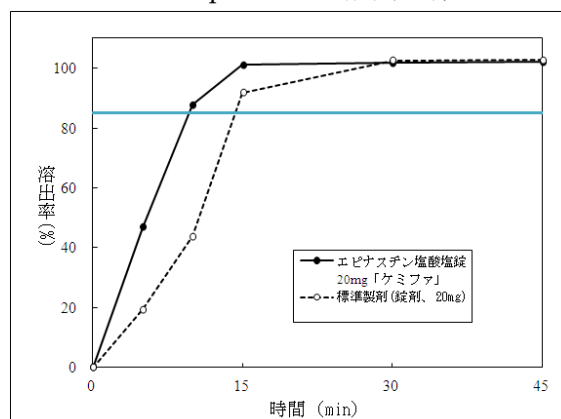
pH4.0(50rpm)による溶出曲線



pH6.8(50rpm)による溶出曲線



水(50rpm)による溶出曲線



## (2) 公的溶出規格への適合

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」 及びエピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」 は、日本薬局方外医薬品規格に定められたエピナスチ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。

(方法) 日局溶出試験法：パドル法

回転数：50rpm

試験液：水

(溶出規格) 30 分間の溶出率が 85% 以上であった。

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

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」： 100 錠（10 錠（PTP）×10）  
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」： 100 錠（10 錠（PTP）×10）、  
300 錠（10 錠（PTP）×30）

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」（PTP）：ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔  
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」（PTP）：ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン・ポ  
リエチレン多層フィルム、アルミニウム箔

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果  
○気管支喘息  
○アレルギー性鼻炎  
○じん麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、痒疹、そう痒を伴う尋常性乾癬
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  
〈気管支喘息、じん麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、痒疹、そう痒を伴う尋常性乾癬〉  
通常、成人にはエピナスチン塩酸塩として1回20mgを1日1回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。  
〈アレルギー性鼻炎〉  
通常、成人にはエピナスチン塩酸塩として1回10～20mgを1日1回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
  - (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  
該当しない
  - (2) 臨床薬理試験  
該当資料なし

- (3) 用量反応探索試験

〈気管支喘息〉

国内第Ⅱ相試験（前期）

成人気管支喘息患者 205 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg 又は 20mg1 日 1 回及び 20mg1 日 2 回を 4 週間経口投与した臨床試験の結果、各群の効果はほぼ同様であり、エピナスチン塩酸塩 10mg 又は 20mg1 日 1 回の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における臨床試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
気管支喘息	20/57	35.1%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 3.1% (2/65 例) で、眠気 1.5% (1/65 例)、口渇 1.5% (1/65 例)、鼻閉感 1.5% (1/65 例) であった<sup>5), 注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

国内第Ⅱ相試験（後期）

成人気管支喘息患者 200 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg 又は 20mg1 日 1 回を 6 週間経口投与した二重盲検比較試験及び 70 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg 又

は 20mg1 日 1 回を経口投与した長期投与試験（オープンラベル）の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた<sup>6,7)</sup>。承認された効能又は効果、用法及び用量における臨床試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
気管支喘息	29/78	37.2%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 7.2% (7/97 例) で、ALT 上昇 2.1% (2/97 例)、AST 上昇 2.1% (2/97 例)、Al-P 上昇 1.0% (1/97 例)、眠気 1.0% (1/97 例)、口のにがみ 1.0% (1/97 例)、悪夢 1.0% (1/97 例)、心悸亢進 1.0% (1/97 例) であった<sup>6,注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 〈アレルギー性鼻炎〉

#### 国内第Ⅱ相試験（前期）

通年性アレルギー性鼻炎患者 183 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 5mg、10mg、20mg1 日 1 回を 2 週間経口投与した臨床試験の結果、5mg 投与より 10mg 及び 20mg 投与の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
アレルギー性鼻炎	42/99	42.4%

エピナスチン塩酸塩 10mg 及び 20mg の副作用発現割合は 1.7% (2/116 例) で、全身倦怠感 0.9% (1/116 例)、発疹 0.9% (1/116 例) であった<sup>8)</sup>。

#### 国内第Ⅱ相試験（後期）

通年性アレルギー性鼻炎患者 194 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg 又は 20mg1 日 1 回を 2 週間経口投与した二重盲検試験の結果、10mg 以上の投与量で有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
アレルギー性鼻炎	63/149	42.3%

エピナスチン塩酸塩 10mg 及び 20mg の副作用発現割合は 5.4% (10/184 例) で、眠気 1.6% (3/184 例)、頭痛 1.1% (2/184 例)、呼吸困難、口内乾燥、嘔気、むかつき、胃痛、皮疹、手掌の皮むけ、タンパク尿各 0.5% (1/184 例) であった<sup>9,注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 〈じん麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、痒疹、そう痒を伴う尋常性乾癬〉

#### 国内第Ⅱ相試験（前期）

慢性じん麻疹患者 259 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 5mg、10mg、20mg1 日 1 回及び 20mg1 日 2 回を 7 日間経口投与した結果、10mg 又は 20mg1 日 1 回投与群ではほぼ一定の高い有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	48/61	78.7%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 11.1% (7/63 例) で、眠気 6.3% (4/63 例)、倦怠感 3.2% (2/63 例)、めまい、口渇、嘔気各 1.6% (1/63 例) であった<sup>10,注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

## 国内第Ⅱ相試験（後期）

慢性じん麻疹患者 177 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg 又は 20mg1 日 1 回を 2 週間経口投与した二重盲検試験の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	71/86	82.6%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 16.7% (15/90 例) で、眠気 8.9% (8/90 例)、倦怠感 3.3% (3/90 例)、口渇 2.2% (2/90 例)、悪心 2.2% (2/90 例)、ふらつき感、頭痛、目の奥の痛み、胃部不快感、食欲不振、気持ちが悪い、下痢各 1.1% (1/90 例) であった <sup>11), 注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

## (4) 検証的試験

### 1) 有効性検証試験

#### 〈気管支喘息〉

#### 国内第Ⅲ相試験

成人気管支喘息患者 226 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg を 1 日 1 回あるいはケトチフェン 1mg1 日 2 回を 10 週間経口投与した二重盲検比較試験の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
気管支喘息	51/95	53.7%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 8.7% (10/115 例) で、口渇 2.6% (3/115 例)、動悸 1.7% (2/115 例)、倦怠感 0.9% (1/115 例)、めまい 0.9% (1/115 例)、頭痛 0.9% (1/115 例)、痰のつまる感じ 0.9% (1/115 例)、悪心 0.9% (1/115 例)、腹部膨満感 0.9% (1/115 例)、便秘 0.9% (1/115 例)、月経周期の不順 0.9% (1/115 例) であった <sup>12), 注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

#### 国内第Ⅲ相試験

成人気管支喘息患者 70 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg 又は 20mg1 日 1 回を 12 週間以上経口投与した一般臨床試験①の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
気管支喘息	21/34	61.8%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 5.9% (3/51 例) で、眠気 2.0% (1/51 例)、不眠 2.0% (1/51 例)、薬疹 2.0% (1/51 例) であった <sup>7)</sup>。

#### 国内第Ⅲ相試験

成人気管支喘息患者 20 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg1 日 1 回を 12 週間以上経口投与した一般臨床試験②の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
気管支喘息	12/19	63.2%

本試験において副作用は認められなかった <sup>13)</sup>。

## 〈アレルギー性鼻炎〉

### 国内第Ⅲ相試験

通年性アレルギー性鼻炎患者 222 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg1 日 1 回又はアゼラスチン 1mg1 日 2 回を 2 週間経口投与した二重盲検比較試験の結果、エピナスチン塩酸塩 10mg 投与の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
アレルギー性鼻炎	47/94	50.0%

エピナスチン塩酸塩 10mg の副作用発現割合は 7.8% (8/102 例) で、眠気 3.9% (4/102 例)、頭痛、口渇、胃部不快感、下痢、じん麻疹各 1.0% (1/102 例) であった<sup>14), 注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 国内第Ⅲ相試験

通年性アレルギー性鼻炎患者 38 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg 又は 20mg1 日 1 回を 8 週間以上経口投与した一般臨床試験①の結果、エピナスチン塩酸塩 10mg 及び 20mg 投与の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
アレルギー性鼻炎	26/38	68.4%

エピナスチン塩酸塩 10mg 及び 20mg の副作用発現割合は 2.6% (1/38 例) で、発疹 2.6% (1/38 例) であった<sup>15)</sup>。

### 国内第Ⅲ相試験

通年性アレルギー性鼻炎患者 31 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 10mg1 日 1 回を 4 週間以上経口投与した一般臨床試験②の結果、エピナスチン塩酸塩 10mg 投与の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
アレルギー性鼻炎	17/29	58.6%

エピナスチン塩酸塩 10mg の副作用発現割合は 3.2% (1/31 例) で、眠気 3.2% (1/31 例) であった<sup>16)</sup>。

## 〈じん麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、痒疹、そう痒を伴う尋常性乾癬〉

### 国内第Ⅲ相試験

慢性じん麻疹患者 249 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg1 日 1 回又はケトチフェン 1mg1 日 2 回を 2 週間経口投与した二重盲検比較試験の結果、エピナスチン塩酸塩の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	95/119	79.8%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 13.7% (17/124 例) で、眠気 7.3% (9/124 例)、口渇 2.4% (3/124 例)、倦怠感、めまい、頭重感、頭痛、胃部不快感、食欲不振、気分不良、腹痛各 0.8% (1/124 例) であった<sup>17), 注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 国内第Ⅲ相試験

慢性じん麻疹患者 64 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg1 日 1 回を 8 週間経口投与した一般臨床試験①の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	56/64	87.5%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 6.3% (4/64 例) で、眠気 3.1% (2/64 例)、倦怠感 1.6% (1/64 例)、胃部不快感 1.6% (1/64 例) であった<sup>18)</sup>。

### 国内第Ⅲ相試験

湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症の患者 232 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg1 日 1 回を 2 週間経口投与した一般臨床試験②の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	162/230	70.4%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 3.0% (7/232 例) で、眠気 1.7% (4/232 例)、不眠、頭痛、胃重感、口渇、口内乾燥感、腹痛各 0.4% (1/232 例) であった<sup>19), 注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 国内第Ⅲ相試験

湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症、じん麻疹、そう痒を伴う尋常性乾癬の患者 207 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg1 日 1 回を 2～4 週間経口投与した一般臨床試験③の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	135/184	73.4%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 3.9% (8/207 例) で、眠気 1.4% (3/207 例)、頭痛、悪心、胃部不快感、食欲不振、物の味がなくなる、そう痒性紅斑各 0.5% (1/207 例) であった<sup>20), 注)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 国内第Ⅲ相試験

湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症、じん麻疹、そう痒を伴う尋常性乾癬の患者 45 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg1 日 1 回 (症状に応じて 10mg/日～40mg/日の範囲で増減可) を 2～12 週間経口投与した一般臨床試験④の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	26/45	57.8%

エピナスチン塩酸塩 20mg の副作用発現割合は 4.4% (2/45 例) で、頭がボーッとした感じ 2.2% (1/45 例)、気分が悪い 2.2% (1/45 例) であった<sup>21)</sup>。

### 国内第Ⅲ相試験

そう痒を伴う尋常性乾癬の患者 35 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg1 日 1 回を 2～4 週間経口投与した一般臨床試験⑤の結果、エピナスチン塩酸塩 20mg の有用性が認められた。承認された効能又は効果、用法及び用量における試験成績は次のとおりであった。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
そう痒性皮膚疾患	17/33	51.5%

本試験において副作用は認められなかった<sup>22)</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調査・試験の概要

該当資料なし

### (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

エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オキサトミド、エメダスチンフマル酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン等のヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗薬

注意：関連のある化合物の効能・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

##### 作用機序

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、ロイコトリエン C<sub>4</sub> (LTC<sub>4</sub>)、血小板活性化因子 (PAF) 等に対する抗メディエーター作用やヒスタミン及び SRS-A のメディエーター遊離抑制作用を示す<sup>23)~25)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 選択的 H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用

モルモット、ラット H<sub>1</sub> 受容体に対する結合親和性は、H<sub>2</sub> 受容体及びムスカリン受容体に比べ非常に高かった<sup>23)</sup>。また、ヒスタミンで誘発したモルモット、ラットの気管支収縮、鼻腔内血管透過性亢進及び皮膚膨疹を用量依存的に抑制した<sup>23), 24)</sup>。

##### ロイコトリエン C<sub>4</sub> (LTC<sub>4</sub>) 及び PAF 拮抗作用

LTC<sub>4</sub> 及び PAF 誘発のモルモット気管平滑筋の収縮反応を用量依存的に抑制した<sup>24)</sup>。

##### ヒスタミン及び SRS-A 遊離抑制作用

抗原、compound48/80、A23187 で誘発したモルモット、ラットの肺切片及び腹腔内肥満細胞からのヒスタミン、SRS-A 遊離を用量依存的に抑制し、その作用はケトチフェンより強かった<sup>25)</sup>。

##### 実験的抗炎症作用

ラットにおけるデキストラン足蹠浮腫、カラゲニン足蹠浮腫等の実験的炎症をケトチフェンと同等かそれ以上に抑制した<sup>26)</sup>。

##### 臨床薬理

健康成人におけるヒスタミン誘発の皮膚膨疹を 1 日 1 回 10mg、20mg の経口投与で、投与 24 時間後においてもプラセボに比し、有意に抑制した<sup>27)</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

##### 1) 単回投与

健康成人にエピナスチン塩酸塩錠 20mg を経口投与した場合、1.9 時間で最高血漿中濃度に達する。血漿中濃度消失半減期は 9.2 時間である<sup>28)</sup>。

##### 2) 反復投与

該当資料なし

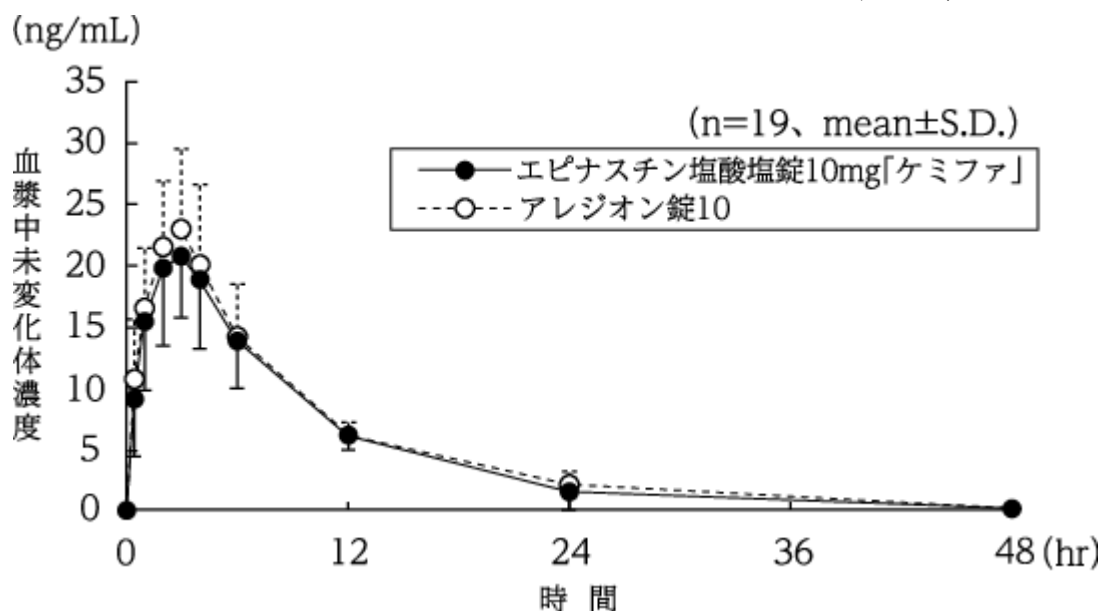
##### 3) 生物学的同等性試験

##### 〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」〉

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」とアレジオン錠 10 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2 錠（エピナスチン塩酸塩として 20mg）健康成人男子に絶食単回経口投与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、 $C_{max}$ ）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>29)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・hr/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$t_{max}$ (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」	219.46±59.57	21.93±5.29	2.8±0.8	7.1±2.3
アレジオン錠 10	236.30±61.27	23.72±6.50	2.8±0.7	6.6±1.8

(n=19, mean±S.D.)

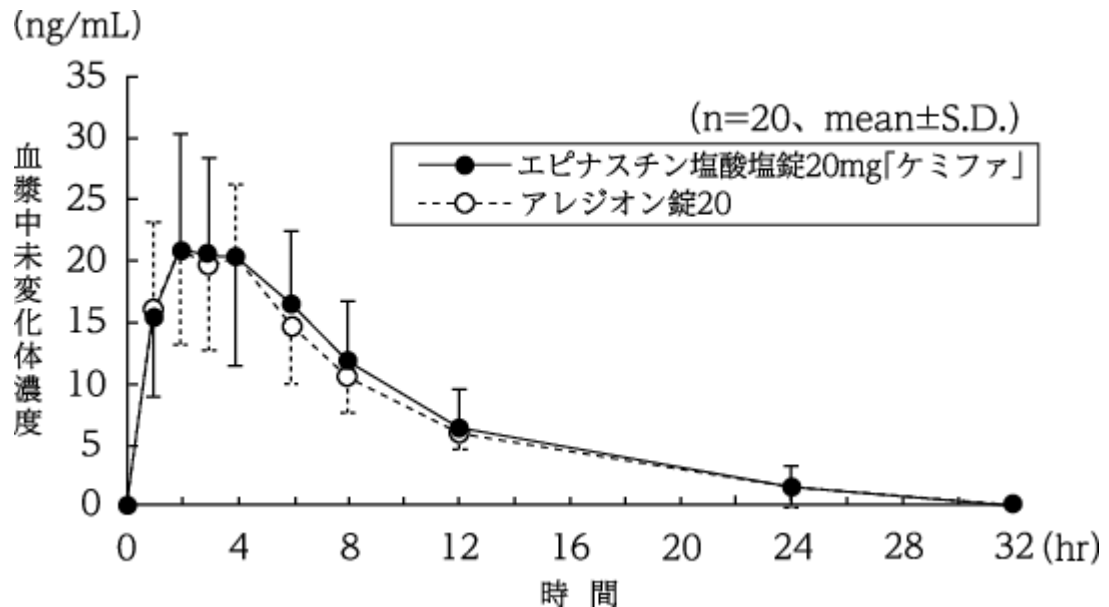


##### 〈エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」〉

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」とアレジオン錠 20 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（エピナスチン塩酸塩として 20mg）健康成人男子に絶食単回経口投与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、 $C_{max}$ ）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>29)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-32</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」	222.04±87.73	24.08±8.66	3.0±1.3	6.4±1.8
アレジオン錠 20	210.65±55.13	23.72±6.62	2.8±1.1	6.7±2.3

(n=20、mean±S.D.)



血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 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。

(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

健康成人に経口投与した場合、吸収率は約 40%であり、生物学的利用率は約 39%である<sup>30)</sup>。

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

「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意 (5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅶ-5. 分布 (5) その他の組織への移行性」、「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意 (6) 授乳婦」の項参照

(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

動物実験（ラット）で <sup>14</sup>C-エピナスチン塩酸塩を経口投与した場合の放射能は、胃、小腸内容物、肝、腎で高濃度であり、その他下垂体、唾液腺、膵、消化管粘膜層にやや高濃度に分布した。中枢神経系へはほとんど移行せず、乳汁中へは移行した<sup>31), 32)</sup>。

(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

健康成人に経口投与又は静脈内投与した場合、尿及び糞抽出物中放射能のほとんどは未変化体であり、代謝物の総量はわずかである<sup>33)</sup>。

(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化、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

健康成人に経口投与した場合、尿中及び糞中への排泄率はそれぞれ 25.4%、70.4%である<sup>34)</sup>。

(2) 排泄率

「Ⅶ-7. 排泄 (1) 排泄部位及び経路」の項参照

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

該当しない

## 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）

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

「V. 治療に関する項目」の項参照

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目」の項参照

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

##### 〈効能共通〉

8.1 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注意させること。

8.2 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。

##### 〈気管支喘息〉

8.3 気管支拡張剤、ステロイド剤などと異なり、すでに起こっている喘息発作や症状を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことは患者に十分説明しておく必要がある。

##### 〈アレルギー性鼻炎〉

8.4 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。

### 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

##### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1.1 長期ステロイド療法を受けている患者

本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は、十分な管理下で徐々に行うこと。

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

##### 9.3 肝機能障害患者

肝機能障害又はその既往歴のある患者は、肝障害が悪化又は再燃することがある。

#### (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。妊娠前及び妊娠初期試験（ラット）では受胎率の低下が、器官形成期試験（ウサギ）では胎児致死作用が、いずれも高用量で認められたとの報告がある。

(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）で乳汁中へ移行することが報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

定期的に副作用・臨床症状（発疹、口渇、胃部不快感等）の観察を行い、異常が認められた場合には、減量（例えば 10mg/日）又は休薬するなど適切な処置を行うこと。高齢者では肝・腎機能が低下していることが多く、吸収された本剤は主として腎臓から排泄される。

7. 相互作用

設定されていない

(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

11.1 重大な副作用

11.1.1 肝機能障害、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、 $\gamma$ -GTP、Al-P、LDH の上昇等の肝機能障害（初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気・嘔吐等）、黄疸があらわれることがある。

11.1.2 血小板減少（頻度不明）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹	じん麻疹、かゆみ、 そう痒性紅斑	浮腫（顔面、手足等）
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、めまい	不眠、悪夢、しびれ感、頭がボーッとした感じ	幻覚、幻聴
消化器	嘔気、食欲不振、胃部不快感、胃もたれ感、腹痛、下痢、口渇	嘔吐、胃重感、便秘、口唇乾燥感、腹部膨満感	口内炎
腎臓		蛋白尿	
泌尿器		尿閉	頻尿、血尿等の膀胱炎様症状
循環器	心悸亢進		
呼吸器		呼吸困難、去痰困難、鼻閉	
血液		白血球数増加	血小板減少
その他		月経異常、ほてり、 にがみ、味覚低下、胸痛	女性型乳房、乳房腫大

9. 臨床検査結果に及ぼす影響  
設定されていない

10. 過量投与  
設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

空腹時投与した場合は食後投与よりも血中濃度が高くなることが報告されている。気管支喘息及びアレルギー性鼻炎に対しては就寝前投与、じん麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、痒疹、そう痒を伴う尋常性乾癬に対しては食後投与で有効性及び安全性が確認されている。

(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

該当資料なし

#### (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：該当しない

有効成分：該当しない

### 2. 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

該当資料なし

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り

くすりのしおり：有り

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレジオン錠 10・20

同 効 薬：エバスタチン、アゼラスチン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、オキサトミド、エメダスチオンフマル酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン等のヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗剤

### 7. 国際誕生年月日

該当しない

### 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
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ケミファ」	2012 年 1 月 31 日	22400AMX00108000	2012 年 6 月 22 日	2010 年 5 月 28 日
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」	2012 年 1 月 31 日	22400AMX00109000	2012 年 6 月 22 日	2002 年 7 月 8 日

旧販売名

アレジオテック錠 10 薬価基準収載年月日：2010 年 5 月 28 日

アレジオテック錠 20 薬価基準収載年月日：2002 年 7 月 8 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

### 11. 再審査期間

該当しない

12. 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。

13. 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
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ケミファ」	4490014F1211	4490014F1211	119826302	621982602
エピナスチン塩酸塩 錠 20mg「ケミファ」	4490014F2250	4490014F2250	114870101	621487001

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## X I . 文献

### 1. 引用文献

- 1) (財)日本公定書協会編：医療用医薬品品質情報集 (Orange Book No.28)
- 2) 日本薬品工業株式会社：加速試験に関する資料 (社内資料)
- 3) 日本薬品工業株式会社：無包装状態での安定性に関する資料 (社内資料)
- 4) 日本薬品工業株式会社：溶出に関する資料 (社内資料)
- 5) 瀧島 任ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 97-126
- 6) 瀧島 任ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 157-184
- 7) 吉田 稔ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 185-214
- 8) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望 35 (補 2) .1992 ; 61-79
- 9) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望 35 (補 4) .1992 ; 269-288
- 10) 久木田 淳ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 25-41
- 11) 久木田 淳ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 43-57
- 12) 瀧島 任ほか：臨床医薬 8 (1) .1992 ; 169-197
- 13) 三浦 一樹ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 215-231
- 14) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望 35 (補 4) .1992 ; 289-312
- 15) 遠藤 朝彦ほか：耳鼻咽喉科展望 35 (補 6) .1992 ; 447-467
- 16) 高坂 知節ほか：耳鼻咽喉科展望 35 (補 5) .1992 ; 409-422
- 17) 久木田 淳ほか：臨床医薬 7 (10) .1991 ; 2303-2320
- 18) 久木田 淳ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 59-71
- 19) 久木田 淳ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 73-86
- 20) 秋元 隆道ほか：皮膚 34 (1) .1992 ; 105-118
- 21) 宮内 俊次ほか：西日本皮膚科 54 (1) .1992 ; 143-152
- 22) 増谷 衛ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 87-95
- 23) Fügner A et al : Arzneimittelforschung 38 (II) . 1988 ; 1446-1453
- 24) Kamei C et al : Immunopharmacology & Immunotoxicology 14 (1&2) .1992 ; 207-218
- 25) Tasaka K et al : 応用薬理 39 (4) . 1990 ; 365-373
- 26) 河野 茂勝ほか：応用薬理 42 (2) . 1991 ; 189-195
- 27) Schilling JC et al : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. Toxicol. 28 (12) . 1990 ; 493-497
- 28) 東 純一ほか：臨床医薬 8 (suppl. 1) .1992 ; 3-24
- 29) 日本薬品工業株式会社：生物学的同等性に関する資料 (社内資料)
- 30) 吸収率及び生物学的利用率 (アレジオンドライシロップ：2005 年 1 月 19 日承認、申請資料概要へ.3.1.1)
- 31) 大岩 陽子ほか：薬理と治療 20 (2) .1992 ; 483-506
- 32) 大岩 陽子ほか：薬理と治療 20 (2) .1992 ; 507-525
- 33) 代謝 (アレジオンドライシロップ：2005 年 1 月 19 日承認、申請資料概要へ.総括)
- 34) 排泄 (アレジオンドライシロップ：2005 年 1 月 19 日承認、申請資料概要へ.3.1.4)
- 35) 日本薬品工業株式会社：粉碎後の安定性に関する資料 (社内資料)
- 36) 日本薬品工業株式会社：簡易懸濁法に関する資料 (社内資料)

### 2. その他の参考文献

## 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  
該当しない

## 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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

掲載根拠：「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する Q&A について（その 3）」（令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

#### (1) 粉碎<sup>35)</sup>

##### (1) エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
粉碎後 安定性試験	40℃ 75%RH	30 日	遮光・気密容器	規格に適合
	25℃ 75%RH	30 日	無包装 (遮光・開放)	規格に適合
	25℃ 45%RH 2500lx	総照度 120 万 lx・hr	無包装 (開放)	30 万 lx・hr 曝露後、類縁物質の増加（規格外） 60 万 lx・hr 曝露後、照射面が微黄白色に着色 120 万 lx・hr 曝露後、含量低下（規格外）

試験項目：性状、純度試験、定量試験

##### (2) エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
粉碎後 安定性試験	27±8℃ 67±27%RH	3 ヶ月	グラシン紙 分包品	類縁物質の増加（規格内）
	30±2℃ 75±5%RH	3 ヶ月	グラシン紙 分包品	類縁物質の増加（規格内）
	蛍光灯下 1000lx	50 日（総照度 120 万 lx・hr）	グラシン紙 分包品	30 万 lx・hr 曝露後、類縁物質の増加（規格内） 120 万 lx・hr 曝露後、類縁物質の増加（規格外）、含量の手低下（規格内）

試験項目：性状、純度試験、定量試験

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性<sup>36)</sup>

##### (1) エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」

###### ● 目的

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」について簡易懸濁法の適否を検討するため、崩壊懸濁試験および通過性試験を実施した。

（内服薬経管ハンドブック：倉田なおみ著、榊じほう）

###### ● 試験製剤

製剤：エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ケミファ」／1 錠中エピナスチン塩酸塩 10mg 含有

###### ● 試験方法

崩壊懸濁試験：ディスペンサー内に 1 錠を入れ、55℃の温湯 20mL を吸い取り、5 分間放置

した。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認した。5 分後に崩壊しない場合、更に 5 分放置後、同様の操作を行う。  
通過性試験：崩壊懸濁試験法で得られた懸濁液を、8Fr.の経管チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、通過性を観察した。

- **試験結果**

崩壊懸濁試験結果：5 分間で完全に崩壊懸濁した。

通過性試験結果：8Fr.チューブを通過した。

- **結論**

エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ケミファ」は 55℃の温湯に対して 5 分の時点で崩壊・懸濁し、8Fr.のチューブを通過した。これより、本製剤は簡易懸濁法適用可能と考えられる。

(2) エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」

- **目的**

エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」について簡易懸濁法の適否を検討するため、崩壊懸濁試験および通過性試験を実施した。

(内服薬経管ハンドブック：倉田なおみ著、榊じほう)

- **試験製剤**

製剤：エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」／1 錠中エピナスチン塩酸塩 20mg 含有

- **試験方法**

崩壊懸濁試験：ディスペンサー内に 1 錠を入れ、55℃の温湯 20mL を吸い取り、5 分間放置した。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認した。5 分後に崩壊しない場合、更に 5 分放置後、同様の操作を行う。

通過性試験：崩壊懸濁試験法で得られた懸濁液を、8Fr.の経管チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、通過性を観察した。

- **試験結果**

崩壊懸濁試験結果：5 分間では崩壊に至らなかったが、10 分間で完全に崩壊懸濁した。

通過性試験結果：8Fr.チューブを通過した。

- **結論**

エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ケミファ」は 55℃の温湯に対して 10 分の時点で崩壊・懸濁し、8Fr.のチューブを通過した。これより、本製剤は簡易懸濁法適用可能と考えられる。

## 2. その他の関連資料

該当資料なし

