

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2013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錠 10mg「日医工」

エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」

エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」

Epinastine Hydrochloride

剤形	錠 10mg/錠 20mg：フィルムコーティング錠 DS1%：ドライシロップ剤		
製剤の規制区分	なし		
規格・含量	錠 10mg：1錠中エピナスチン塩酸塩 10mg 含有 錠 20mg：1錠中エピナスチン塩酸塩 20mg 含有 DS1%：1g 中エピナスチン塩酸塩 10mg 含有		
一般名	和名：エピナスチン塩酸塩 洋名：Epinastine Hydrochloride		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日		錠 10mg/錠 20mg	DS1%
	承認年月日	2012年 1月 30日	2011年 1月 14日
	薬価基準収載	2012年 12月 14日	2011年 6月 24日
発売年月日	2012年 12月 14日	2011年 6月 24日	
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ https://www.nichiiko.co.jp/		

本IFは2012年12月作成(錠10mg/錠20mg：第1版)，2015年1月改訂(DS1%：第3版)の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ
<http://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

IF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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、（独）医薬品医療機器総合機構のホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公式サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIF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IFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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。

【IFの様式】

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

【IFの作成】

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」（以下、「IF記載要領2013」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【IFの発行】

- ① 「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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薬剤師等自らが内容を充実させ、IF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、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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

IFを薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目	16
1. 開発の経緯	1	1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群	16
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬理作用	16
II. 名称に関する項目	2	VII. 薬物動態に関する項目	17
1. 販売名	2	1. 血中濃度の推移・測定法	17
2. 一般名	2	2. 薬物速度論的パラメータ	20
3. 構造式又は示性式	2	3. 吸収	20
4. 分子式及び分子量	2	4. 分布	20
5. 化学名（命名法）	2	5. 代謝	20
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	2	6. 排泄	21
7. CAS 登録番号	2	7. トランスポーターに関する情報	21
III. 有効成分に関する項目	3	8. 透析等による除去率	21
1. 物理化学的性質	3	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	22
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	1. 警告内容とその理由	22
3. 有効成分の確認試験法	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	22
4. 有効成分の定量法	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	22
IV. 製剤に関する項目	4	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	22
1. 剤形	4	5. 慎重投与内容とその理由	22
2. 製剤の組成	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	22
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	4	7. 相互作用	23
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	8. 副作用	23
5. 調製法及び溶解後の安定性	9	9. 高齢者への投与	24
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	9	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	25
7. 溶出性	9	11. 小児等への投与	25
8. 生物学的試験法	13	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	13	13. 過量投与	25
10. 製剤中の有効成分の定量法	13	14. 適用上の注意	25
11. 力価	13	15. その他の注意	26
12. 混入する可能性のある夾雑物	13	16. その他	26
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	13	IX. 非臨床試験に関する項目	27
14. その他	13	1. 薬理試験	27
V. 治療に関する項目	14	2. 毒性試験	27
1. 効能又は効果	14	X. 管理的事項に関する項目	28
2. 用法及び用量	14	1. 規制区分	28
3. 臨床成績	15		

2.	有効期間又は使用期限	28
3.	貯法・保存条件	28
4.	薬剤取扱い上の注意点	28
5.	承認条件等	28
6.	包装	28
7.	容器の材質	28
8.	同一成分・同効薬	28
9.	国際誕生年月日	28
10.	製造販売承認年月日及び承認番号	29
11.	薬価基準収載年月日	29
12.	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	29
13.	再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	29
14.	再審査期間	29
15.	投与期間制限医薬品に関する情報	29
16.	各種コード	29
17.	保険給付上の注意	29
X I.	文献	30
1.	引用文献	30
2.	その他の参考文献	30
X II.	参考資料	30
1.	主な外国での発売状況	30
2.	海外における臨床支援情報	30
X III.	備考	31
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	31
2.	その他の関連資料	35

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、エピナスチン塩酸塩を有効成分とするアレルギー性疾患治療剤である。

エピナスチン塩酸塩製剤の「アレロオフ錠 10」及び「アレロオフ錠 20」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2002年3月14日に承認を取得、2002年7月5日に販売を開始した。（医薬発第481号（平成11年4月8日）に基づき承認申請）

「エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2011年1月14日に承認を取得、2011年6月24日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

医療事故防止のため、2012年1月30日に販売名を「アレロオフ錠 10」から「エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」」に、「アレロオフ錠 20」から「エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」」に変更の承認を得て、2012年12月14日から販売した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、エピナスチン塩酸塩を有効成分とするアレルギー性疾患治療剤である。
- (2) 重大な副作用（頻度不明）として、肝機能障害、黄疸、血小板減少が報告されている。

[錠 10mg/錠 20mg]

- (1) PTPシートはピッチコントロールを行い、1錠ごとに成分名、含量を表示した。
- (2) PTPシートのウラ面に「アレルギー性疾患治療薬」を表記した。

[DS1%]

- (1) 1日1回投与のドライシロップ製剤である。
- (2) 有効成分をコーティングして、苦味をマスキングしている。
- (3) 本剤はヨーグルト風味を有する。
- (4) バラ包装のボトルはキャップに貼付可能な副片ラベル付きである。

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 「日医工」

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」

エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」

(2) 洋名

Epinastine Hydrochloride

(3) 名称の由来

一般名より

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

エピナスチン塩酸塩 (JAN)

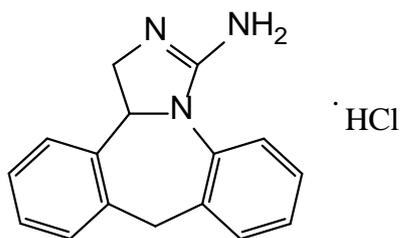
(2) 洋名 (命名法)

Epinastine Hydrochloride (JAN)

(3) ステム

抗ヒスタミン薬: -astine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: C₁₆H₁₅N₃ · HCl

分子量: 285.77

5. 化学名 (命名法)

(±)-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

別名: 塩酸エピナスチン

7. CAS 登録番号

80012-43-7

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。

本品の水溶液(1→20)は旋光性がない。

(2) 溶解性

水、メタノール、エタノール(99.5)又は酢酸(100)に溶けやすく、アセトニトリルに溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(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°C (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

本品の水溶液(1→10)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

(1) 沈殿反応

本品の水溶液にドラーゲンドルフ試液を加えるとき、だいたい色の沈澱を生じる。

(2) 紫外可視吸光度測定法

本品の水溶液の吸収スペクトルを測定するとき、波長 261～265nm に吸収の極大を示す。

(3) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行うとき、波数 1662 cm^{-1} , 1588 cm^{-1} , 1554 cm^{-1} , 774 cm^{-1} , 及び 760 cm^{-1} 付近に吸収を示す。

(4) 定性反応

本品の水溶液は塩化物の定性反応(2)を呈する。

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

本品を無水酢酸、酢酸混液に溶かし、過塩素酸で滴定する。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状

販売名	色調 剤形	形 状			本体コード 包装コード
		質量(mg)	直径(mm)	厚さ(mm)	
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」	白色～微黄色のフィルムコーティング錠	 87.5	 6.1	 2.9	本体： n 511 包装： n 511
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」	白色～微黄色のフィルムコーティング錠	 175	 8.1	 3.5	本体： n 512 包装： n 512
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」	白色～帯黄白色の顆粒状の粉末			—	

(2) 製剤の物性

(「IV - 4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

(3) 識別コード

(「IV - 1.(1) 剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」：1 錠中エピナスチン塩酸塩 10mg 含有

エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」：1 錠中エピナスチン塩酸塩 20mg 含有

エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」：1g 中エピナスチン塩酸塩 10mg 含有

(2) 添加物

販売名	添加物
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」	乳糖, トウモロコシデンプン, セルロース, ヒドロキシプロピルセルロース, 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, 酸化チタン, タルク
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」	
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」	D - マンニトール, ヒドロキシプロピルセルロース, ショ糖脂肪酸エステル, エチルセルロース, 硬化油, タルク, エリスリトール, アスパルテーム (L - フェニルアラニン化合物), サッカリンナトリウム, 二酸化ケイ素, 香料

(3) その他

該当記載事項なし

3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

(1) 加速試験

本品につき加速試験（40℃，75%RH，6ヵ月）を行った結果，エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」，エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」及びエピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」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。

◇エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状 ＜白色～微黄色のフィルムコーティング錠＞	JT2901	適合	適合	適合	適合
確認試験 (沈殿反応，紫外可視吸光度測定法)	JT2901	適合	—	—	適合
純度試験 (HPLC) ＜総類縁物質 1.0%以下＞	JT2901	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 (含量均一性) ＜15.0%以下＞	JT2901	2.9	—	—	4.7
溶出性 (%) ＜30分，85%以上＞	JT2901	95.1～104.2	100.8～101.7	101.8～102.9	99.6～101.3
含量 (%) * ＜93～107%＞	JT2901	99.0	98.4	99.4	99.2

※：表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状 ＜白色～微黄色のフィルムコーティング錠＞	JP28A1 JP29A1 JP30A1	適合	適合	適合	適合
確認試験 (沈殿反応，紫外可視吸光度測定法)	JP28A1 JP29A1 JP30A1	適合	—	—	適合
純度試験 (HPLC) ＜総類縁物質 1.0%以下＞	JP28A1 JP29A1 JP30A1	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 (含量均一性) ＜15.0%以下＞	JP28A1 JP29A1 JP30A1	2.5 3.4 3.6	—	—	3.3 3.0 3.2
溶出性 (%) ＜30分，85%以上＞	JP28A1 JP29A1 JP30A1	97.4～100.1 92.7～99.5 95.2～100.8	97.7～100.0 97.2～99.2 99.0～100.4	96.5～99.5 92.5～99.8 98.9～100.8	89.5～99.3 96.4～99.5 98.7～100.0
含量 (%) * ＜93～107%＞	JP28A1 JP29A1 JP30A1	100.9 99.2 100.8	98.0 97.6 99.3	99.3 99.3 99.6	100.5 101.1 101.9

※：表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (バラ包装)]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <白色～帯黄白色の 顆粒状の粉末>	EPI1DS-4 EPI1DS-5 EPI1DS-6	適合	適合	適合	適合
確認試験 (薄層クロマトグラフィー)	EPI1DS-4 EPI1DS-5 EPI1DS-6	適合	適合	適合	適合
純度試験 (HPLC) <※1>	EPI1DS-4 EPI1DS-5 EPI1DS-6	適合	適合	適合	適合
水分 (%) <2.0%以下>	EPI1DS-4 EPI1DS-5 EPI1DS-6	0.43～0.45 0.44～0.45 0.41～0.44	0.68～0.69 0.72～0.74 0.68～0.70	0.59～0.60 0.62～0.65 0.59～0.61	0.92 0.97～1.01 0.90～0.93
溶出性 (%) <15 分, 85%以上>	EPI1DS-4 EPI1DS-5 EPI1DS-6	94.3～98.5 90.7～93.4 89.6～96.8	—	—	95.4～98.5 91.5～93.2 91.8～93.6
含量 (%) ※2 <93.0～107.0%>	EPI1DS-4 EPI1DS-5 EPI1DS-6	102.1～103.1 97.0～97.6 97.6～98.3	—	—	101.5～102.1 97.4～98.2 97.5～97.6

※1: RRT 約 2.4 : 1.0%以下, 個々の類縁物質 : 0.2%以下, 総類縁物質 : 1.5%以下 ※2: 表示量に対する含有率 (%)

(2) 無包装の安定性試験

本資料の情報に関する注意

本資料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, 可否を示すものではない。

試験期間 : 2010/11/24～2011/3/24

◇エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光, 気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 <白色～微黄色のフィルム コーティング錠>	HC2301	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	HC2301	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 <30 分, 85%以上>	HC2301	101.6～105.7	98.5～103.8	99.4～105.9	104.0～108.8
含量 (%) ※2 n=3 <93.0～107.0%>	HC2301	101.1～101.3	100.5	99.9～101.1	100.4～100.6
(参考値) 硬度 (N) n=10	HC2301	87～106	84～101	86～94	83～95

※1: 総類縁物質 ; 1.0%以下 ※2: 表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光, 開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 <白色～微黄色のフィルム コーティング錠>	HC2301	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	HC2301	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 <30 分, 85%以上>	HC2301	101.6～105.7	96.8～102.5	102.4～107.0	101.0～107.8
含量 (%) ※2 n=3 <93.0～107.0%>	HC2301	101.1～101.3	100.7～101.0	99.9～101.3	100.5～100.9
(参考値) 硬度 (N) n=10	HC2301	87～106	61～67	58～64	49～60

※1: 総類縁物質; 1.0%以下 ※2: 表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」 無包装 室温, 曝光 [D65 光源 (1600Lx), 気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10 <白色～微黄色のフィルム コーティング錠>	HC2301	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠	白色～微黄色のフ ィルムコーティン グ錠
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	HC2301	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 <30 分, 85%以上>	HC2301	101.6～105.7	104.4～108.9	103.1～108.0	103.1～106.7
含量 (%) ※2 n=3 <93.0～107.0%>	HC2301	101.1～101.3	100.9～101.2	100.0～100.3	100.1～100.6
(参考値) 硬度 (N) n=10	HC2301	87～106	91～106	81～101	88～97

※1: 総類縁物質; 1.0%以下 ※2: 表示量に対する含有率 (%)

試験報告日: 2002/6/18

◇エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」 無包装 25℃・90%RH [遮光, グラシンポリエチレンラミネート紙で分包]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 週	2 週	1 ヶ月
性状 <白色のフィルム コーティング錠>	CI180	白色の錠剤	白色の錠剤	白色の錠剤	錠剤が膨張 した
残存率 (%)	CI180	100.0	99.9	99.2	99.4
(参考値) 硬度 (N)	CI180	81.4	27.2	15.9	16.6

◇エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」 無包装 成り行き温湿度 [室内散光下, グラシンポリエチレンラミネート紙で分包]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 週	2 週	1 ヶ月
性状 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	CI180	白色の錠剤	白色の錠剤	白色の錠剤	白色の錠剤
残存率 (%)	CI180	100.0	99.3	99.7	100.4
(参考値) 硬度 (N)	CI180	81.4	73.8	58.7	60.2

試験期間：2011/1/7～2011/4/19

◇エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」 無包装 40℃ [遮光, 気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 ＜白色～帯黄色の 顆粒状の粉末＞	KT200	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	KT200	適合	適合	適合	不適合	不適合
溶出性 (%) n=6 ＜15 分, 85%以上＞	KT200	87.5～101.2	95.7～97.0	94.8～95.8	93.7～97.2	96.5～100.3
含量 (%) ※2 n=3 ＜93.0～107.0%＞	KT200	102.2～103.1	102.0～103.2	101.3～102.5	101.2～102.1	101.7～101.9

※1：類縁物質 A；1.0%以下，個々の類縁物質；0.2%以下，総類縁物質；1.5%以下 ※2：表示量に対する含有率 (%)
規格外：太字

◇エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光, 開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 ＜白色～帯黄色の 顆粒状の粉末＞	KT200	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末	白色～帯黄色の 顆粒状の粉末
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	KT200	適合	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜15 分, 85%以上＞	KT200	87.5～101.2	93.0～94.7	91.7～96.0	91.3～94.5	99.7～102.8
含量 (%) ※2 n=3 ＜93.0～107.0%＞	KT200	102.2～103.1	99.4～ 99.6	99.0～ 99.2	100.5～101.0	98.8～ 99.7

※1：類縁物質 A；1.0%以下，個々の類縁物質；0.2%以下，総類縁物質；1.5%以下 ※2：表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」 無包装 室温, 曝光 [D65 光源 (約 1600Lx), 気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10 <白色~帯黄色の 顆粒状の粉末>	KT200	白色~帯黄色の顆 粒状の粉末	やや黄色味 を増す	やや黄色味 を増す	やや黄色味 を増す
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	KT200	適合	不適合	不適合	不適合
溶出性 (%) n=6 <15 分, 85%以上>	KT200	87.5~101.2	93.5~100.4	90.7~94.4	89.9~91.6
含量 (%) ※2 n=3 <93.0~107.0%>	KT200	102.2~103.1	100.5~101.2	98.7~99.4	97.0~97.4

※1: 類縁物質 A; 1.0%以下, 個々の類縁物質; 0.2%以下, 総類縁物質; 1.5%以下 ※2: 表示量に対する含有率 (%)
規格外: 太字

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当しない

7. 溶出性

(1) 溶出規格

エピナスチン塩酸塩錠10mg「日医工」及びエピナスチン塩酸塩錠20mg「日医工」は, 日本薬局方外医薬品規格第3部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。

(試験液に水 900mL を用い, パドル法により 50rpm で試験を行う)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
10mg	30 分	85%以上
20mg	30 分	85%以上

(2) 溶出試験²⁾

＜エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」＞

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日薬食審査発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

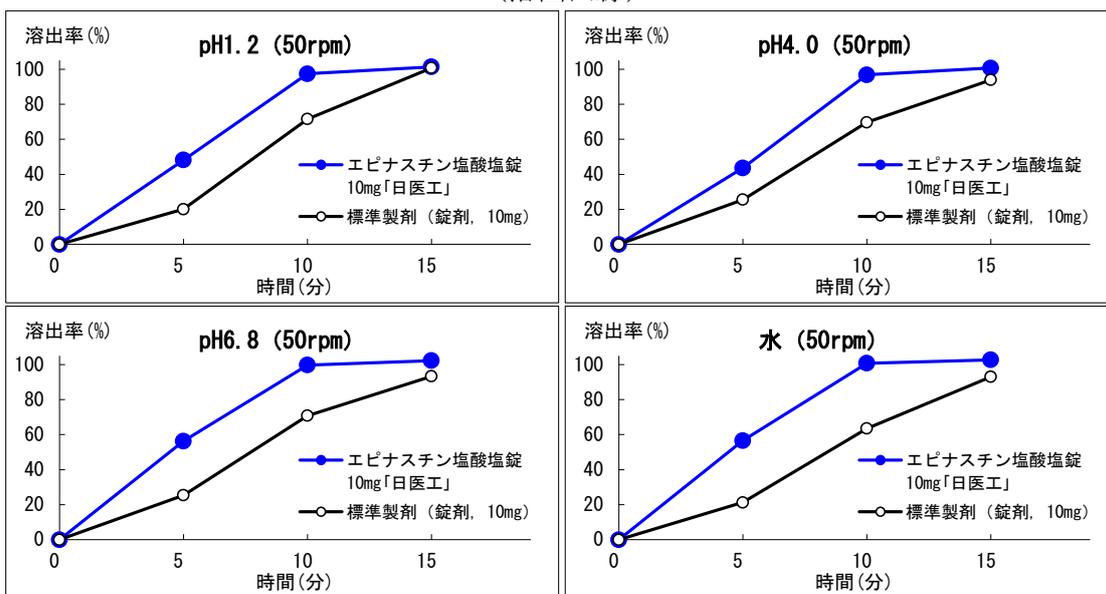
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、本品及び標準製剤はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、本品及び標準製剤はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、本品及び標準製剤はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水 (50rpm) では、本品及び標準製剤はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=6)

<エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日
薬食審査発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

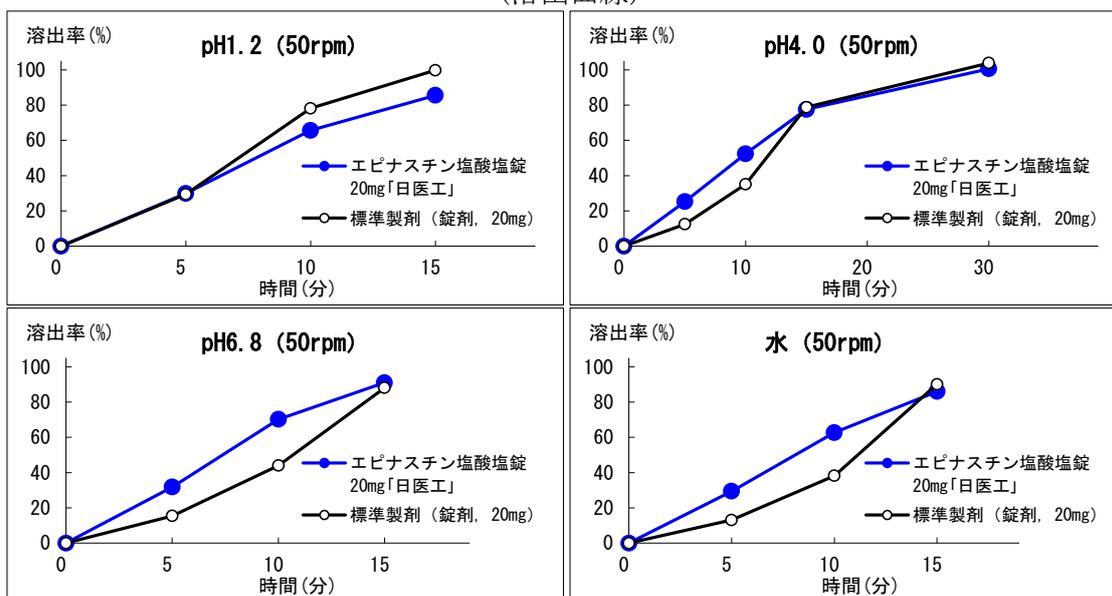
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、本品及び標準製剤はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。
- ・ pH6.8（50rpm）では、本品及び標準製剤はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、本品及び標準製剤はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=6)

<エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成18年11月24日薬食審査発第1124004号）

試験条件

装置：日本薬局方溶出試験法 パドル法

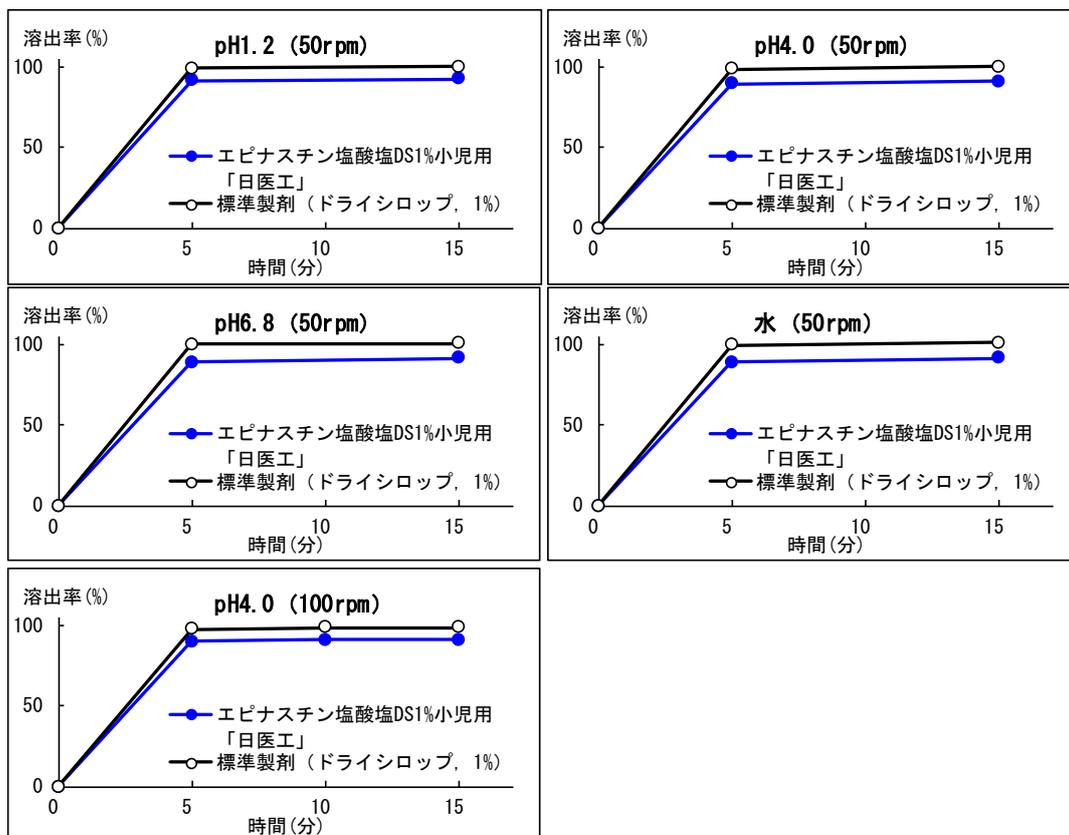
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水）, 100rpm（pH4.0）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品ともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤及び本品ともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品ともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤及び本品ともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（100rpm）では、標準製剤及び本品ともに15分以内に平均85%以上溶出した。

以上、本品は標準製剤の平均溶出率と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

[錠 10mg/錠 20mg]

(1) 沈殿反応

本品に水を加え攪拌後ろ過する。ろ液にドラーゲンドルフ試液を加えるとき、だいだい色の沈殿を生じる。

(2) 紫外可視吸光度測定法

上記(1)のろ液に水を加え吸収スペクトルを測定するとき、波長 261~265nm に吸収の極大を示す。

[DS1%]

薄層クロマトグラフィー

試料溶液から得た主スポット及び標準溶液から得たスポットの R_f 値は等しい。

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

[錠 10mg/錠 20mg]

検出器：紫外吸光光度計

移動相：トリエチルアミン溶液，メタノール混液

[DS1%]

検出器：紫外吸光光度計

移動相：酢酸，水，トリエチルアミン，アセトニトリル混液

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

販売名	効能・効果
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「日医工」	気管支喘息 アレルギー性鼻炎
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「日医工」	蕁麻疹, 湿疹・皮膚炎, 皮膚そう痒症, 痒疹, そう痒を伴う尋常性乾癬
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」	アレルギー性鼻炎, 蕁麻疹, 皮膚疾患(湿疹・皮膚炎, 皮膚そう痒症)に伴うそう痒

2. 用法及び用量

	効能・効果	用法・用量									
錠 10mg / 錠 20mg	気管支喘息, 蕁麻疹, 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。									
DS1%	アレルギー性鼻炎	通常, 小児には 1 日 1 回 0.025~0.05g/kg (エピナスチン塩酸塩として 0.25~0.5mg/kg) を用時溶解して経口投与する。なお, 年齢・症状により適宜増減する。 ただし, 1 日投与量はドライシロップとして 2 g (エピナスチン塩酸塩として 20 mg) を超えないこと。 年齢別の標準投与量は, 通常, 下記の用量を 1 日量とし, 1 日 1 回用時溶解して経口投与する。 <table border="1" data-bbox="743 1070 1422 1319"> <thead> <tr> <th>年齢</th> <th>標準体重</th> <th>1 日用量</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>3 歳以上 7 歳未満</td> <td>14kg 以上 24kg 未満</td> <td>0.5~1g (エピナスチン塩酸塩として 5~10 mg)</td> </tr> <tr> <td>7 歳以上</td> <td>24kg 以上</td> <td>1~2g (エピナスチン塩酸塩として 10~20 mg)</td> </tr> </tbody> </table>	年齢	標準体重	1 日用量	3 歳以上 7 歳未満	14kg 以上 24kg 未満	0.5~1g (エピナスチン塩酸塩として 5~10 mg)	7 歳以上	24kg 以上	1~2g (エピナスチン塩酸塩として 10~20 mg)
	年齢	標準体重	1 日用量								
3 歳以上 7 歳未満	14kg 以上 24kg 未満	0.5~1g (エピナスチン塩酸塩として 5~10 mg)									
7 歳以上	24kg 以上	1~2g (エピナスチン塩酸塩として 10~20 mg)									
蕁麻疹, 皮膚疾患(湿疹・皮膚炎, 皮膚そう痒症)に伴うそう痒	通常, 小児には 1 日 1 回 0.05g/kg (エピナスチン塩酸塩として 0.5mg/kg) を用時溶解して経口投与する。なお, 年齢・症状により適宜増減する。 ただし, 1 日投与量はドライシロップとして 2 g (エピナスチン塩酸塩として 20 mg) を超えないこと。 年齢別の標準投与量は, 通常, 下記の用量を 1 日量とし, 1 日 1 回用時溶解して経口投与する。 <table border="1" data-bbox="743 1599 1422 1848"> <thead> <tr> <th>年齢</th> <th>標準体重</th> <th>1 日用量</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>3 歳以上 7 歳未満</td> <td>14kg 以上 24kg 未満</td> <td>1g (エピナスチン塩酸塩として 10 mg)</td> </tr> <tr> <td>7 歳以上</td> <td>24kg 以上</td> <td>2g (エピナスチン塩酸塩として 20 mg)</td> </tr> </tbody> </table>	年齢	標準体重	1 日用量	3 歳以上 7 歳未満	14kg 以上 24kg 未満	1g (エピナスチン塩酸塩として 10 mg)	7 歳以上	24kg 以上	2g (エピナスチン塩酸塩として 20 mg)	
年齢	標準体重	1 日用量									
3 歳以上 7 歳未満	14kg 以上 24kg 未満	1g (エピナスチン塩酸塩として 10 mg)									
7 歳以上	24kg 以上	2g (エピナスチン塩酸塩として 20 mg)									

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

ケトチフェンフマル酸塩、メキタジン、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、エメダスチンフマル酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序³⁾

本剤はエピナスチン塩酸塩を有効成分とするアレルギー性疾患治療剤である。

<参考>

病態にヒスタミンが比較的強く関与しているアレルギー性鼻炎のくしゃみ・鼻汁，アトピー性皮膚炎やじんま疹の痒みに著効を示す。抗ヒスタミン作用をもつ塩基性抗アレルギー薬（第二世代抗ヒスタミン薬）は選択的にヒスタミン H₁ 受容体に拮抗する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

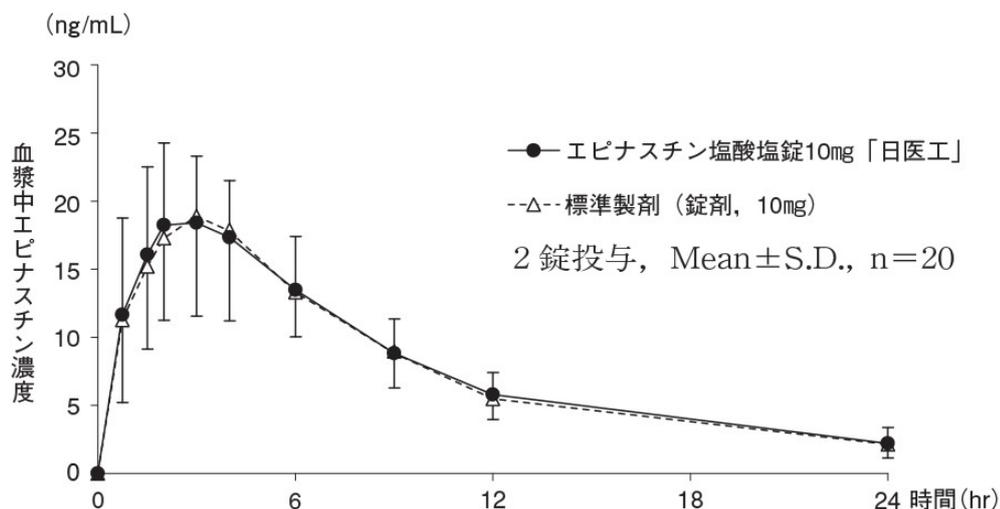
(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

<エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」>⁴⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日 医薬審第487号別添)

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」及び標準製剤を、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エピナスチン濃度を測定し、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(0.8)~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。



[薬物速度論的パラメータ]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (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 「日医工」	193.82±49.06	20.25±5.16	2.63±0.84	8.30±2.66
標準製剤 (錠剤, 10mg)	190.66±53.34	19.96±7.00	2.66±0.97	7.57±1.74

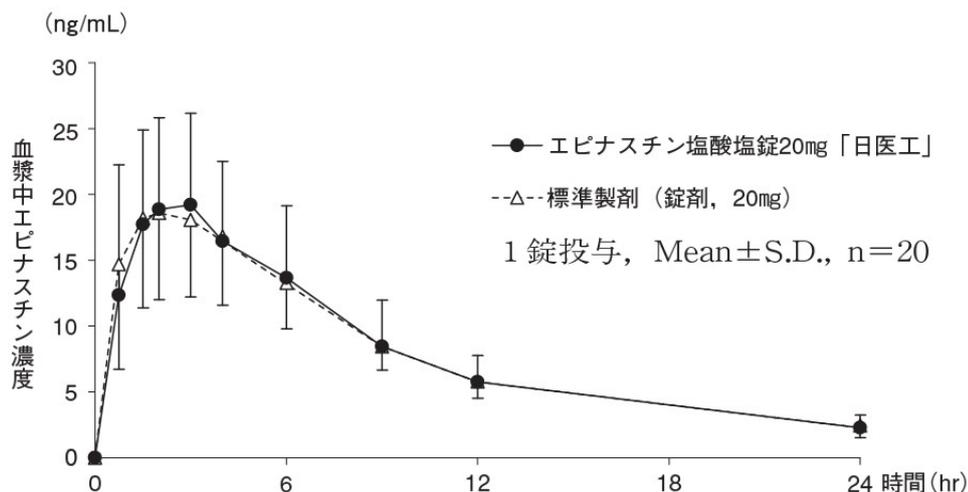
(2錠投与, Mean±S.D., n=20)

血漿中濃度並びに AUC, C_{max} 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。

<エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」 >⁴⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日 医薬審第487号別添)

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」 及び標準製剤を、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エピナスチン濃度を測定し、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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



[薬物速度論的パラメータ]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」	194.67±68.43	20.85±7.82	2.33±0.78	9.02±2.60
標準製剤 (錠剤, 20mg)	196.22±48.92	20.69±6.56	2.23±1.41	8.97±2.56

(1 錠投与, Mean±S.D.,n=20)

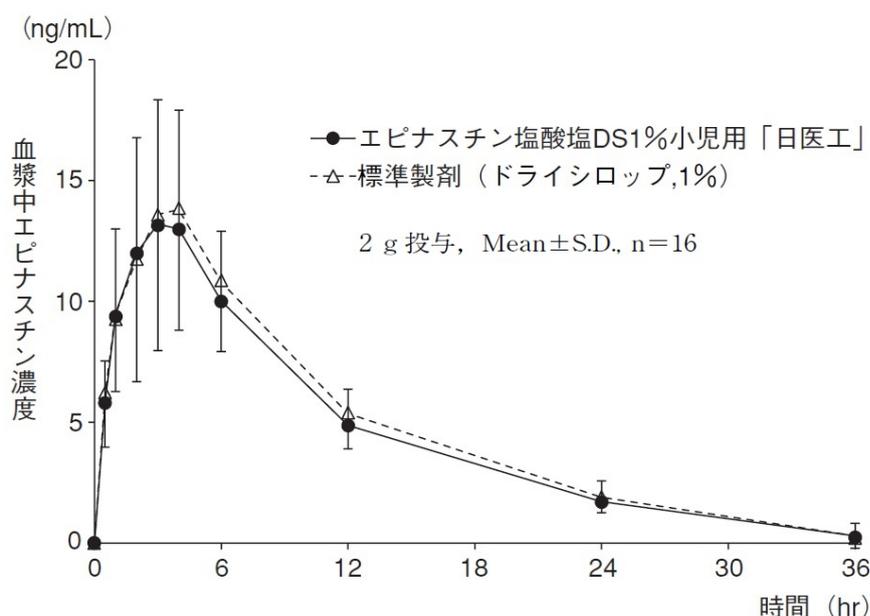
血漿中濃度並びに AUC, Cmax 等のパラメータは, 被験者の選択, 体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」>⁵⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成18年11月24日薬食審査発第1124004号）

エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2g（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エピナスチン濃度を測定し、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。

（注意：本剤は小児用製剤である。）



[薬物速度論的パラメータ]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」	160.9±55.0	13.8±5.0	3.4±1.1	7.75±1.52
標準製剤 (ドライシロップ, 1%)	172.3±51.3	14.6±5.4	3.7±1.1	7.46±1.02

(2g 投与, Mean±S.D., n=16)

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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 - 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

(3) 乳汁への移行性

(「VIII - 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」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

該当資料なし

5. 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 (CYP450 等) の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

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

該当記載事項なし

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

【慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）】

【錠 10mg/錠 20mg】

肝障害又はその既往歴のある患者 [肝障害が悪化又は再燃することがある。]

【DS1%】

- (1) 肝障害又はその既往歴のある患者 [肝障害が悪化又は再燃することがある。]
- (2) フェニルケトン尿症の患者 [本剤は 1g 中 60mg のアスパルテーム (L-フェニルアラニン化合物) を含有する。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

【錠 10mg/錠 20mg】

- (1) 本剤は、気管支拡張剤、ステロイド剤等と異なり、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。
- (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の減量をはかる場合は、十分な管理下で徐々に行うこと。
- (3) 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。
- (4) 本剤を季節性の患者に投与する場合には、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。
- (5) 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。

【DS1%】

- (1) 眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には危険を伴う機械の操作に注意させること。また、保護者に対しても注意を与えること。
- (2) 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。
- (3) 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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

(2) 併用注意とその理由

該当記載事項なし

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状（頻度不明）

- 1) **肝機能障害, 黄疸** : AST (GOT) , ALT (GPT) , γ - 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) **血小板減少** : 血小板減少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。

(3) その他の副作用

以下のような副作用が認められた場合には, 症状に応じて適切な処置を行うこと。

[錠 10mg/錠 20mg]

	頻度不明
過 敏 症 ^{注1)}	浮腫（顔面, 手足等）, 発疹, 蕁麻疹, かゆみ, そう痒性紅斑
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, 胃部不快感, 腹痛, 口渇, 口内炎, 食欲不振, 嘔吐, 胃重感, 胃もたれ感, 下痢, 便秘, 口唇乾燥感, 腹部膨満感
腎 臓	蛋白尿
泌 尿 器 ^{注2)}	頻尿, 血尿等の膀胱炎様症状, 尿閉
循 環 器	心悸亢進
呼 吸 器	呼吸困難, 去痰困難, 鼻閉
血 液 ^{注2)}	白血球数増加, 血小板減少
そ の 他	月経異常, ほてり, にかみ, 味覚低下, 胸痛, 女性型乳房, 乳房腫大

注1) 発現した場合には, 投与を中止し, 適切な処置を行うこと。

注2) 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。

続き

[DS1%]	
	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	顔面浮腫, 発疹, 蕁麻疹, かゆみ, 浮腫 (手足等), そう痒性紅斑
精神神経系	眠気, 頭痛, 倦怠感, 不快気分, 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, 腹痛, 腹鳴, 下痢, 咽頭痛, 嘔吐, 便秘, 胃部不快感, 口渇, 口内炎, 食欲不振, 胃重感, 胃もたれ感, 口唇乾燥感, 腹部膨満感
呼吸器	鼻出血, 鼻閉, 呼吸困難, 去痰困難
肝臓	肝機能異常, ALT (GPT) 上昇
腎臓	蛋白尿, BUN 上昇, 尿中赤血球, 尿中白血球陽性
泌尿器 ^{注2)}	頻尿, 血尿等の膀胱炎様症状, 尿閉
循環器	心悸亢進
血液 ^{注2)}	白血球数減少, 血小板減少, 白血球数増加
眼	眼痛
その他	にがみ, 女性型乳房, 乳房腫大, 月経異常, ほてり, 味覚低下, 胸痛

注1) 発現した場合には, 投与を中止し, 適切な処置を行うこと。
 注2) 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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患, 合併症, 重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

1) **禁忌**: 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。

2) **その他の副作用**:

[錠 10mg/錠 20mg] 過敏症 (浮腫 (顔面, 手足等), 発疹, 蕁麻疹, かゆみ, そう痒性紅斑) が発現した場合には, 投与を中止し, 適切な処置を行うこと。

[DS1%] 過敏症 (顔面浮腫, 発疹, 蕁麻疹, かゆみ, 浮腫 (手足等), そう痒性紅斑) が発現した場合には投与を中止し, 適切な処置を行うこと。

9. 高齢者への投与

[錠 10mg/錠 20mg]

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ことから, 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。

[DS1%]

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ことから, 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, 減量又は休薬するなど適切な処置を行うこと。

10. 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。また，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ている。〕
- (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）で母乳中へ移行することが報告されている。〕

11. 小児等への投与

〔錠 10mg/錠 20mg〕

低出生体重児，新生児，乳児，幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

〔DS1%〕

- (1) 低出生体重児，新生児，乳児に対する安全性は確立していない。〔低出生体重児，新生児には使用経験がない。乳児には使用経験は少ない。「副作用」の項参照〕
- (2) 小児気管支喘息に対する本剤の有効性及び安全性は確立していない。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当記載事項なし

13. 過量投与

該当記載事項なし

14. 適用上の注意

〔錠 10mg/錠 20mg〕

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。）

〔DS1%〕

- (1) **調製時：**本剤は用時調製の製剤であるので，調製後の保存は避け，水に溶かした後は速やかに使用すること。やむを得ず保存を必要とする場合は，冷蔵庫内に保存し，できるかぎり速やかに使用すること。
- (2) **配合変化：**本剤は，他剤と配合した場合に，本剤の含量低下等の変化が起こることがあるので，原則として他剤との配合は行わないこと。

15. その他の注意

[錠 10mg/錠 20mg]

エピナスチン塩酸塩製剤（錠剤）を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，蕁麻疹，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。）

[DS1%]

成人に錠剤を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。（アレルギー性鼻炎患児に対しては就寝前投与，湿疹・皮膚炎の代表的疾患であるアトピー性皮膚炎患児に対しては朝食後投与で有効性，安全性が確認されている。）

16. その他

該当記載事項なし

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」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」 エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」 エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用 「日医工」	なし
有効成分	エピナスチン塩酸塩	劇薬

2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示の使用期限内に使用すること。（3年：安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

[錠 10mg/錠 20mg] 気密容器で室温保存

[DS1%] 気密容器で室温保存，遮光保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

（「貯法・保存条件」の項参照）

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

[錠 10mg/錠 20mg] 患者向医薬品ガイド：有，くすりのしおり：有

[DS1%] くすりのしおり：有

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目」の項を参照のこと）

(3) 調剤時の留意点について

該当記載事項なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」	100錠（10錠×10；PTP） 500錠（10錠×50；PTP）
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」	100錠（10錠×10；PTP） 500錠（10錠×50；PTP）
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用 「日医工」	100g（バラ）

7. 容器の材質

[錠 10mg/錠 20mg] PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム，アルミニウム箔

[DS1%] バラ包装：褐色ガラス瓶，金属キャップ

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アレジオン錠 10，アレジオン錠 20，アレジオンドライシロップ 1%

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」	2012年 1月 30日	22400AMX00086000
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」	2012年 1月 30日	22400AMX00087000
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用 「日医工」	2011年 1月 14日	22300AMX00016000

旧販売名	承認年月日	承認番号
アレロオフ錠 10	2002年 3月 14日	21400AMZ00315000
アレロオフ錠 20	2002年 3月 14日	21400AMZ00316000

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」	2012年 12月 14日
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」	2012年 12月 14日
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用 「日医工」	2011年 6月 24日

旧販売名	薬価基準収載年月日
アレロオフ錠 10	2002年 7月 5日
アレロオフ錠 20	2002年 7月 5日

12. 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

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

(「VIII - 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照)

16. 各種コード

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	HOT(9桁) コード
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」	4490014F1220	621485401	114854101
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」	4490014F2269	621486901	114869501
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用 「日医工」	4490014R1064	622071501	120715601

17. 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) 日医工株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 日医工株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 3) NEW 薬理学 (改訂第 7 版) , 451 (2019)
- 4) 日医工株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)
- 5) 山口明志 他 : 医学と薬学, 65(4), 495 (2011)

2. その他の参考文献

なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

なし

2. 海外における臨床支援情報

なし

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。

(1) 粉砕

粉砕物の安定性試験

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は白色～微黄色の粉末であり、含量は規格内であった。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉砕した。

試験実施期間：2014/1/10～2014/3/18

● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光, 開放]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	4 週	6 週	8 週
性状 n=10	GK2501	白色～微黄色 の粉末	白色～微黄色 の粉末	白色～微黄色 の粉末	白色～微黄色 の粉末	白色～微黄色 の粉末
含量 (%) *n=3 <93.0～107.0%>	GK2501	98.6～99.0	98.7～99.2	99.1～99.3	98.9～100.2	98.3～99.7
(参考値) 重量変化 (%)	GK2501	—	+2.5	+2.7	+2.6	+2.9

※：表示量に対する含有率 (%)

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」

粉碎物の安定性を成り行き室温の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であった。
25℃・90%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時白色の粉末であり、2 週間後固化した。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉碎した。

● 粉碎物 成り行き温湿度 [室内散光下]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 週	2 週	1 ヶ月
性状	CI180	白色の粉末 (フィルム層が 粉碎できない)	白色の粉末 (フィルム層が 粉碎できない)	白色の粉末 (フィルム層が 粉碎できない)	白色の粉末 (フィルム層が 粉碎できない)
(参考値) 重量変化 (%)	CI180	—	+0.9	+1.5	+2.3
残存率 (%)	CI180	100.0	98.2	98.5	100.7

● 粉碎物 25℃・90%RH [遮光]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 週	2 週	1 ヶ月
性状	CI180	白色の粉末 (フィルム層が 粉碎できない)	白色の粉末 (フィルム層が 粉碎できない)	固化	固化
(参考値) 重量変化 (%)	CI180	—	+4.5	+5.9	+6.9
残存率 (%)	CI180	100.0	99.5	99.5	99.8

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」

1) 試験方法

[崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

[通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2019/1/30~2/7

ロット番号：D00100

2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「日医工」	5 分で溶解せず 10 分以内に溶解・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（（株）じほう）」に準じて実施しました。

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」

1) 試験方法

[崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

[通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2005/11/10

ロット番号：FR02A1

2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「日医工」	5 分以内に溶解・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（（株）じほう）」に準じて実施しました。

エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」

1) 試験方法

[崩壊懸濁試験]

検体 1g を容器にとり、約 55℃の温湯 20mL を加え、軽く攪拌し、ディスペンサー内に入れ、ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1g を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

[通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2011/3/23~3/29

ロット番号：KT200

2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
エピナスチン塩酸塩 DS1%小児用「日医工」	5分以内に溶解・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（（株）じほう）」に準じて実施しました。

2. その他の関連資料

なし