

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錠/エピナスチン塩酸塩液
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「NIG」
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「NIG」
エピナスチン塩酸塩内用液 0.2%「NIG」
Epinastine Hydrochloride Tablets/ Oral Solution

剤形	錠：フィルムコーティング錠 内用液：内用液剤			
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 内用液：1mL 中エピナスチン塩酸塩 2mg 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・販売開始 年月日		錠 10mg	錠 20mg	内用液
	製造販売承認	2014年 2月 3日	2014年 1月 17日	2009年 4月 28日
	薬価基準収載	2022年 12月 9日	2022年 12月 9日	2022年 5月 25日
	販売開始	2011年 11月 28日	2002年 7月 5日	2006年 7月 7日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工岐阜工場株式会社 発売元：日医工株式会社 販売：武田薬品工業株式会社			
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は錠：2024年1月改訂（第1版）、内用液：2024年2月改訂（第1版）の添付文書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—

(2020年4月改訂)

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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIF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IF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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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、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。IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・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利用者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、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、IF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

IF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。IF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IF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、IF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。

目 次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目	21
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ...	21
2. 製品の治療学的特性.....	2	2. 薬理作用.....	21
3. 製品の製剤学的特性.....	2	VII. 薬物動態に関する項目	22
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	2	1. 血中濃度の推移.....	22
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	2	2. 薬物速度論的パラメータ.....	24
6. RMP の概要.....	2	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	25
II. 名称に関する項目	3	4. 吸収.....	25
1. 販売名.....	3	5. 分布.....	25
2. 一般名.....	3	6. 代謝.....	25
3. 構造式又は示性式.....	3	7. 排泄.....	25
4. 分子式及び分子量.....	3	8. トランスポーターに関する情報.....	26
5. 化学名（命名法）又は本質.....	3	9. 透析等による除去率.....	26
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	10. 特定の背景を有する患者.....	26
III. 有効成分に関する項目	4	11. その他.....	26
1. 物理化学的性質.....	4	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	27
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	4	1. 警告内容とその理由.....	27
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	4	2. 禁忌内容とその理由.....	27
IV. 製剤に関する項目	5	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	27
1. 剤形.....	5	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	27
2. 製剤の組成.....	6	5. 重要な基本的注意とその理由.....	27
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	6	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	27
4. 力価.....	6	7. 相互作用.....	28
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	6	8. 副作用.....	29
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	6	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	29
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	9	10. 過量投与.....	29
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	9	11. 適用上の注意.....	29
9. 溶出性.....	10	12. その他の注意.....	30
10. 容器・包装.....	11	IX. 非臨床試験に関する項目	31
11. 別途提供される資材類.....	12	1. 薬理試験.....	31
12. その他.....	12	2. 毒性試験.....	31
V. 治療に関する項目	13	X. 管理的事項に関する項目	32
1. 効能又は効果.....	13	1. 規制区分.....	32
2. 効能又は効果に関連する注意.....	13	2. 有効期間.....	32
3. 用法及び用量.....	13	3. 包装状態での貯法.....	32
4. 用法及び用量に関連する注意.....	13	4. 取扱い上の注意点.....	32
5. 臨床成績.....	13	5. 患者向け資材.....	32

略語表

6. 同一成分・同効薬.....	32
7. 国際誕生年月日	32
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.....	32
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.....	32
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	33
11. 再審査期間	33
12. 投薬期間制限に関する情報.....	33
13. 各種コード	33
14. 保険給付上の注意	34
X I . 文献.....	35
1. 引用文献	35
2. その他の参考文献.....	35
X II . 参考資料.....	36
1. 主な外国での発売状況.....	36
2. 海外における臨床支援情報	36
X III . 備考.....	37
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たつての参考情報.....	37
2. その他の関連資料.....	39

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
tmax	最高血中濃度到達時間
t _{1/2}	消失半減期
S.D.	標準偏差

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。

「アプラチン錠 20mg」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）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）

2007年8月3日、再評価（品質再評価）の結果、「アプラチン錠 20mg」は薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの結果を得た。

「アプラチン内服液 0.2%」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）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、2006年3月15日に承認を取得、2006年7月7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錠 10mg 「タイヨー」」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）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7月15日に承認を取得、2011年11月28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、以下の販売名変更を行った。

承認年月日	販売名	旧販売名
2009年4月28日	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「タイヨー」	アプラチン錠 20mg
	エピナスチン塩酸塩内服液 0.2% 「タイヨー」	アプラチン内服液 0.2%
2014年1月17日	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「テバ」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「タイヨー」
2014年2月3日	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「テバ」	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「タイヨー」

2022年5月1日、「エピナスチン塩酸塩内服液 0.2% 「タイヨー」」は、武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「タイヨー」から「NIG」に変更した。

2022年5月25日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

2022年12月1日、「エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「テバ」」及び「エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「テバ」」は、武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「テバ」から「NIG」に変更した。

2022年12月9日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

2. 製品の治療学的特性

- (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) 重大な副作用として、肝機能障害、黄疸、血小板減少が報告されている。(「Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

- (1) 内用液は、香料としてアップルフレーバーを使用している。

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料、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として 作成されている資料	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

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」

エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」

(2) 洋名

Epinastine Hydrochloride Tablets

Epinastine Hydrochloride Oral Solution

(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)

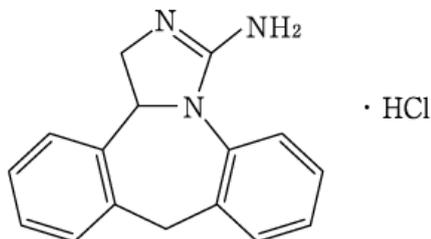
Epinastine (INN)

(3) ステム (stem)

抗ヒスタミン薬: -astine

3. 構造式又は示性式

化学構造式:



4. 分子式及び分子量

分子式: $C_{16}H_{15}N_3 \cdot HCl$

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

別名: 塩酸エピナスチン

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、においはない。

(2) 溶解性

水、メタノール、エタノール (95) 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℃ (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

エタノール (95) 溶液 (1→100) は旋光性を示さない。

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

(1) 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、だいたい色の沈殿を生じる。

2) 紫外可視吸光度測定法

本品の水溶液につき、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} 付近に吸収を認める。

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。

(2) 定量法

電位差滴定法

本品を酢酸に溶かし、無水酢酸を加え、過塩素酸で滴定する。

IV. 製剤に関する項目

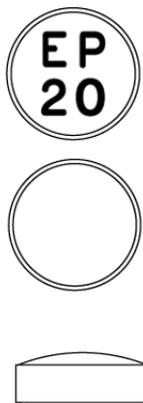
1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠：フィルムコーティング錠

内用液：内用液剤

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」
色・剤形	白色～微黄白色の 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
外形		
直径	6.0mm	8.1mm
厚さ	2.8mm	3.9mm
質量	90mg	200mg
識別コード (PTP)	EP 10	EP 20

販売名	エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」
色・剤形	無色～微黄色澄明の液
pH	3.0～4.0

(3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

(4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

(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	エピナスチン塩酸塩錠 10mg「NIG」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg「NIG」
有効成分	1錠中：エピナスチン塩酸塩 10mg	1錠中：エピナスチン塩酸塩 20mg
添加剤	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	カルナウバロウ、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒプロメロース、部分アルファー化デンプン、ポビドン、マクロゴール 6000

販売名	エピナスチン塩酸塩内用液 0.2%「NIG」
有効成分	1mL 中：エピナスチン塩酸塩 2mg
添加剤	安息香酸ナトリウム、塩化ナトリウム、精製白糖、pH 調節剤、香料

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

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

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

(1) 加速試験

◇エピナスチン塩酸塩錠 10mg「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態：PTP 包装]

試験項目 ＜規格＞	保存期間			
	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 n=3 ^{※1} ＜白色～微黄白色の フィルムコーティング錠＞	適合	適合	適合	適合
確認試験 n=3 ^{※1} (沈殿反応、紫外可視吸光度測定法)	適合	適合	適合	適合
崩壊性(分) n=3 ^{※1} ＜60 分以内＞	2～4	2～4	2～4	2～4
含量 (%) ^{※2} n=3 ^{※1} ＜95～105%＞	99.9±0.3 ^{※3}	99.9±0.3 ^{※3}	99.9±0.3 ^{※3}	99.9±0.3 ^{※3}

※1：3 ロット 各ロット n=3 ※2：表示量に対する含有率 (%) ※3：平均値±標準偏差 (S.D.)

◇エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態：アルミ袋包装]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間		
		開始時	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 n=3 ＜白色～微黄白色の フィルムコーティング錠＞	MZZR	適合	適合	適合
純度試験 ＜3%以下＞	MZZR	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜30 分、85%以上＞	MZZR	99.8～101.1	90.2～99.9	99.2～102.0
含量 (%) ※ n=3 ＜93～107%＞	MZZR	99.2～99.6	99.3～99.9	97.5～98.4

※：表示量に対する含有率 (%)

(2) 長期保存試験

◇エピナスチン塩酸塩内用液 0.2%「NIG」 長期保存試験 25℃・60%RH [最終包装形態 (褐色ガラス製
容器)]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	6 ヶ月	12 ヶ月	24 ヶ月	25 ヶ月
性状 ＜無色～微黄色澄明の液 で、芳香があり、味は甘く、 わずかに苦味がある＞	2WWQ 5WWQ 6WWQ	適合	適合	適合	適合	適合
pH ＜3.0～4.0＞	2WWQ 5WWQ 6WWQ	3.60～3.61 3.59～3.60 3.59～3.60	3.55～3.57 3.55～3.56 3.55～3.56	3.56 3.56 3.56	3.54 3.53～3.54 3.54	3.54 3.52～3.53 3.53～3.54
密度 (g/mL) ＜1.14～1.18g/mL＞	2WWQ 5WWQ 6WWQ	1.159 1.159 1.160	1.162 1.162 1.162	1.166 1.166 1.165	1.167 1.166 1.166	1.166 1.168 1.167
純度試験 ＜総類縁物質：2%以下＞	2WWQ 5WWQ 6WWQ	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※ ＜93～107%＞	2WWQ 5WWQ 6WWQ	96.9～100.5 96.4～ 99.8 98.4～100.5	98.7～99.1 98.4～98.8 98.2～99.3	97.6～98.0 97.3～99.4 97.8～98.4	96.5～96.7 96.9～98.1 95.3～97.3	95.5～98.4 95.6～97.8 95.2～97.4

※：表示量に対する含有率 (%)

(3) 無包装の安定性試験

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

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～微黄白色の フィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性 (%) n=6 ＜30 分、85%以上＞	100.0～102.8	100.3～102.2
含量 (%) ※ n=3 ＜95～105%＞	99.8	98.4～98.7
(参考値) 硬度 (kg)	5.8	5.9

※：表示量に対する含有率 (%)

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

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～微黄白色の フィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性 (%) n=6 ＜30 分、85%以上＞	100.0～102.8	98.6～102.3
含量 (%) ※ n=3 ＜95～105%＞	99.8	99.4～99.7
(参考値) 硬度 (kg)	5.8	4.8

※：表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」 無包装 25℃・曝光 [気密容器]

試験項目 ＜規格＞	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 ＜白色～微黄白色の フィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性 (%) n=6 ＜30 分、85%以上＞	100.0～102.8	98.7～101.2
含量 (%) ※ n=3 ＜95～105%＞	99.8	97.0～97.8
(参考値) 硬度 (kg)	5.8	5.3

※：表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」 無包装 40°C [遮光、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～微黄白色のフィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性 (%) ＜30 分、85%以上＞	99.8～100.5	90.2～98.0
残存率 (%)	100	100.1

※：表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」 無包装 25°C・75%RH [遮光、開放]

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヶ月
性状 ＜白色～微黄白色のフィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性 (%) ＜30 分、85%以上＞	99.8～100.5	98.6～100.1
残存率 (%)	100	100.3

※：表示量に対する含有率 (%)

◇エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」 無包装 25°C・曝光 [気密容器]

試験項目 ＜規格＞	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 ＜白色～微黄白色のフィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性 (%) ＜30 分、85%以上＞	99.8～100.5	98.1～99.9
残存率 (%)	100	99.2

※：表示量に対する含有率 (%)

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（物理化学的変化）

該当資料なし

9. 溶出性

(1) 溶出規格

エピナスチン塩酸塩錠 10mg「NIG」及びエピナスチン塩酸塩錠 20mg「NIG」の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた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「NIG」〉

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

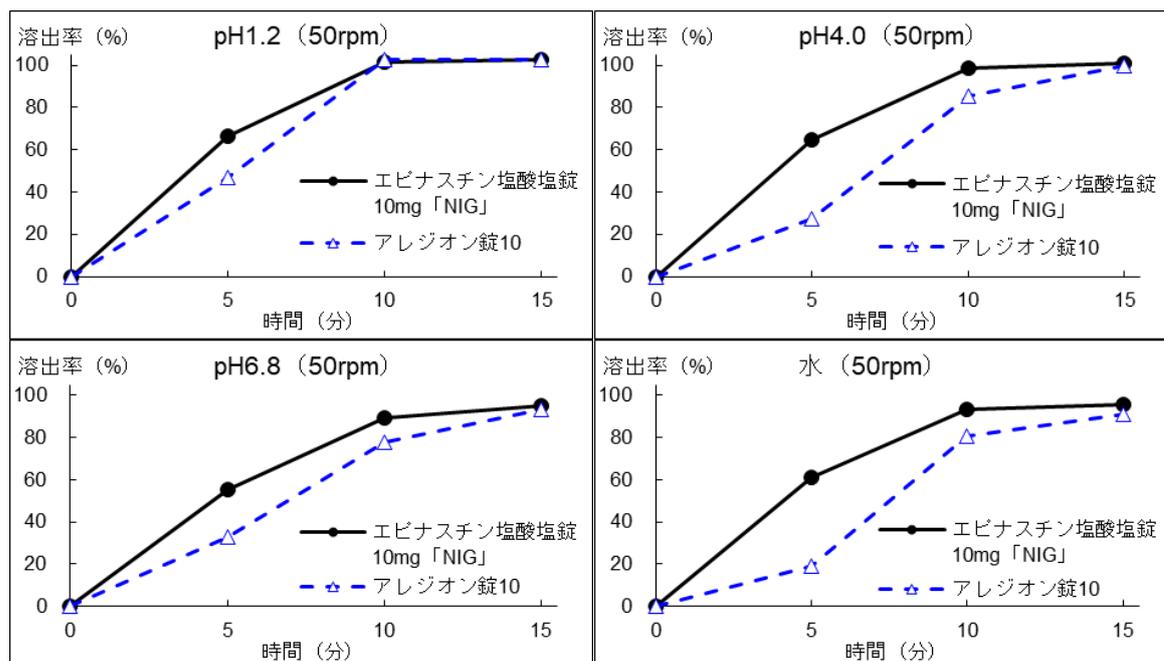
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 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（アレジオン錠 10）と比較した結果、全ての試験液において「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 「NIG」〉

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

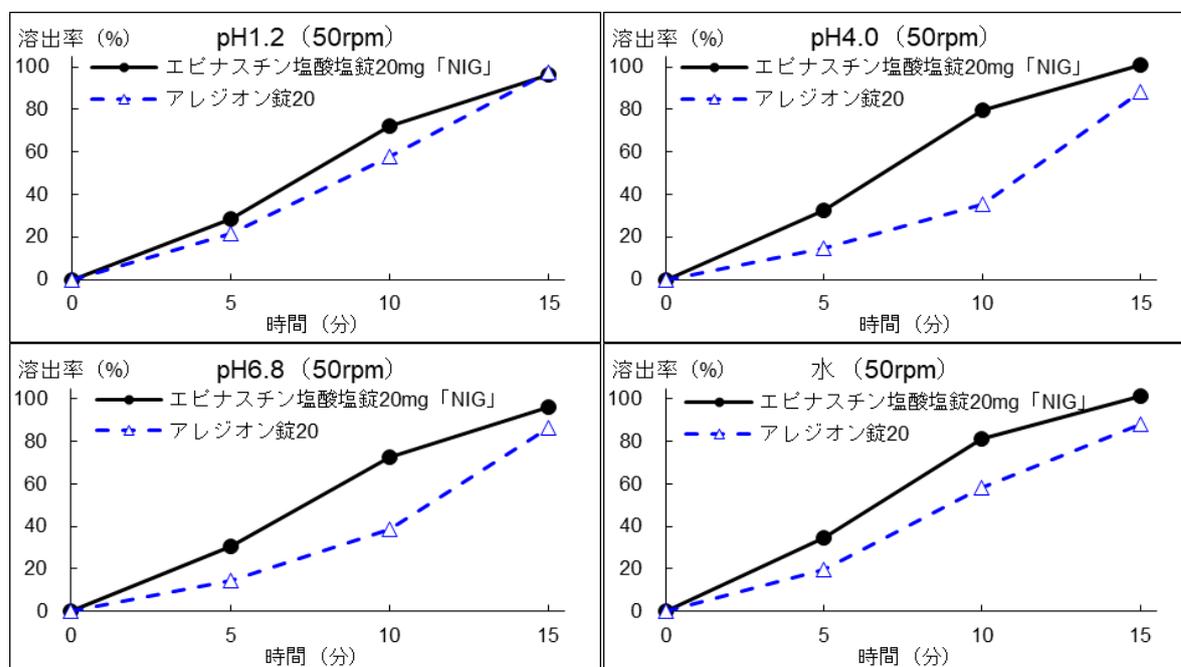
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 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（アレジオン錠 20）と比較した結果、全ての試験液において「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)

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 「NIG」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

〈エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

70mL [ガラス瓶]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

販売名	材質
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」	PTP : ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」	ピロー: アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム
エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」	瓶 : 褐色ガラス

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当記載事項なし

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

○蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、瘡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

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg/20mg 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、瘡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。

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、瘡痒を伴う尋常性乾癬〉

通常、成人には1回10mL（エピナスチン塩酸塩として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1回5～10mL（エピナスチン塩酸塩として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

〈気管支喘息〉

17.1.1 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³⁾。

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^{注)}。

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.6 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⁴⁾。

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。

〈蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

17.1.11 国内第Ⅱ相試験（前期）

慢性蕁麻疹患者 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⁵⁾。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
掻痒性皮膚疾患	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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

本剤の承認されている用法及び用量は以下の通りである。

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg/20mg 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

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。

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

通常、成人には 1 回 10mL (エピナスチン塩酸塩として 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 1 回 5～10mL (エピナスチン塩酸塩として 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。

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈気管支喘息〉

17.1.2 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臨床試験成績は次のとおりであった⁶⁾。

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)、口のながみ 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^{注)}。

17.1.3 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⁷⁾。

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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

本剤の承認されている用法及び用量は以下の通りである。

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg/20mg 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

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。

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

通常、成人には 1 回 10mL (エピナスチン塩酸塩として 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 1 回 5～10mL (エピナスチン塩酸塩として 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。

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.7 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⁸⁾。

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^{注)}。

17.1.8 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⁹⁾。

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、蕁麻疹各 1.0% (1/102 例) であった^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

本剤の承認されている用法及び用量は以下の通りである。

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg/20mg 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

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。

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

通常、成人には 1 回 10mL (エピナスチン塩酸塩として 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 1 回 5～10mL (エピナスチン塩酸塩として 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。

〈蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

17.1.12 国内第Ⅱ相試験（後期）

慢性蕁麻疹患者 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¹⁰⁾。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
痒痒性皮膚疾患	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^{注)}。

17.1.13 国内第Ⅲ相試験

慢性蕁麻疹患者 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¹¹⁾。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
痒痒性皮膚疾患	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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

本剤の承認されている用法及び用量は以下の通りである。

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg/20mg 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

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。

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

通常、成人には 1 回 10mL (エピナスチン塩酸塩として 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 1 回 5～10mL (エピナスチン塩酸塩として 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) 安全性試験

〈気管支喘息〉

17.1.4 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¹²⁾。

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。

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.9 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¹³⁾。

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

〈蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

17.1.14 国内第Ⅲ相試験

慢性蕁麻疹患者 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¹⁴⁾。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
痒疹性皮膚疾患	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。

(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

該当しない

(7) その他

〈気管支喘息〉

17.1.5 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¹⁵⁾。

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。

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.10 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¹⁶⁾。

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

〈蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬〉

17.1.15 国内第Ⅲ相試験

湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚癢痒症の患者 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¹⁷⁾。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
痒疹性皮膚疾患	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^{注)}。

17.1.16 国内第Ⅲ相試験

湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚癢痒症、蕁麻疹、痒疹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¹⁸⁾。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
痒疹性皮膚疾患	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、痒疹性紅斑各 0.5% (1/207 例) であった^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

17.1.17 国内第Ⅲ相試験

湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症、蕁麻疹、瘙癢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¹⁹⁾。

投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
瘙癢性皮膚疾患	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。

17.1.18 国内第Ⅲ相試験

瘙癢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²⁰⁾。

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

本試験において副作用は認められなかった。

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

アレルギー性疾患治療剤

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

選択的ヒスタミン H₁ 受容体拮抗作用を主作用とし、ロイコトリエン C₄ (LTC₄)、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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 選択的 H₁ 受容体拮抗作用

モルモット、ラット H₁ 受容体に対する結合親和性は、H₂ 受容体及びムスカリン受容体に比べ非常に高かった²¹⁾。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^{21)・22)}。

18.3 ロイコトリエン C₄ (LTC₄) 及び PAF 拮抗作用

LTC₄ 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²²⁾。

18.4 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²³⁾。

18.5 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²⁴⁾。

18.6 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²⁵⁾。

(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

16.1.1 単回投与

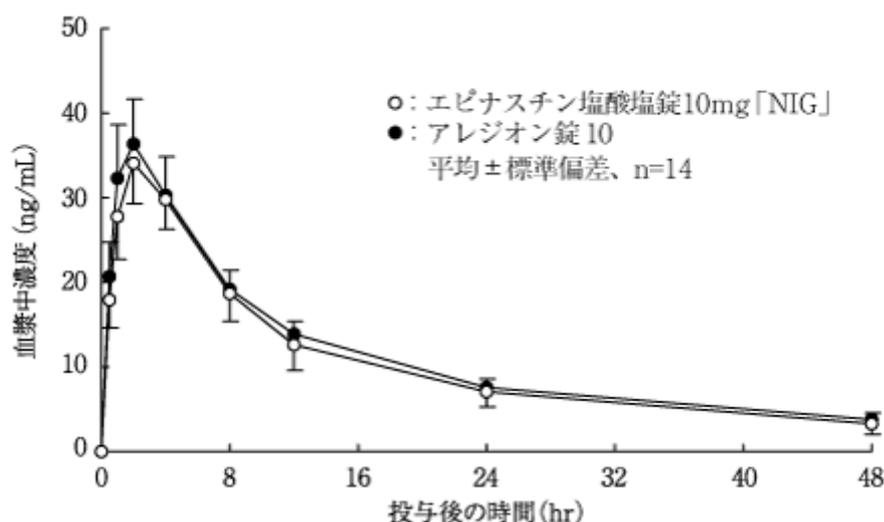
健康成人にエピナスチン塩酸塩 20mg を経口投与した場合、1.9 時間で最高血漿中濃度に達する。血漿中濃度消失半減期は 9.2 時間である²⁶⁾。

16.1.2 生物学的同等性試験

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」〉

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 「NIG」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、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²⁷⁾。



薬物動態パラメータ

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」	20	514.4±84.3	34.8±3.6	2.3±0.7	18.4±2.7
アレジオン錠 10	20	548.2±51.0	37.3±6.1	1.9±0.7	20.1±3.0

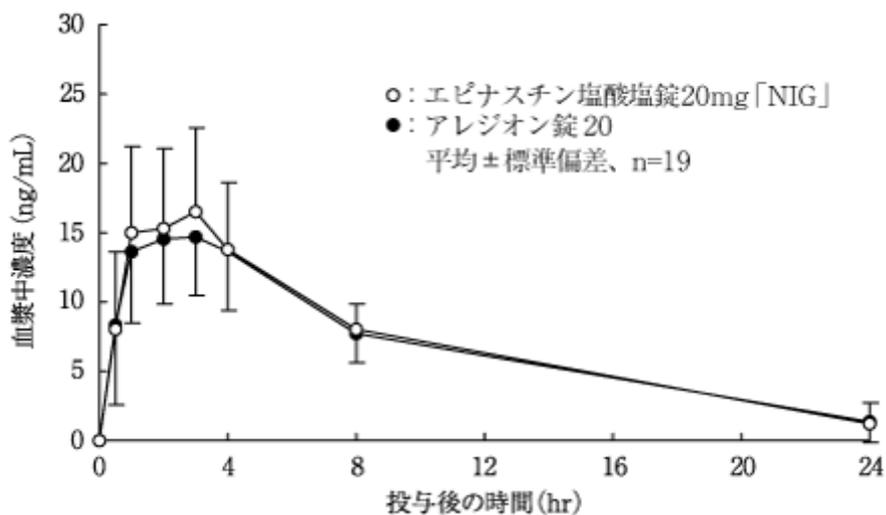
(平均±標準偏差、n=14)

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錠 20mg 「NIG」〉

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 「NIG」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、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²⁷⁾。



薬物動態パラメータ

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」	20	171.8±51.4	17.92±5.90	2.4±0.9	7.2±1.9
アレジオン錠 20	20	166.5±46.9	16.13±5.05	2.2±1.0	7.4±3.5

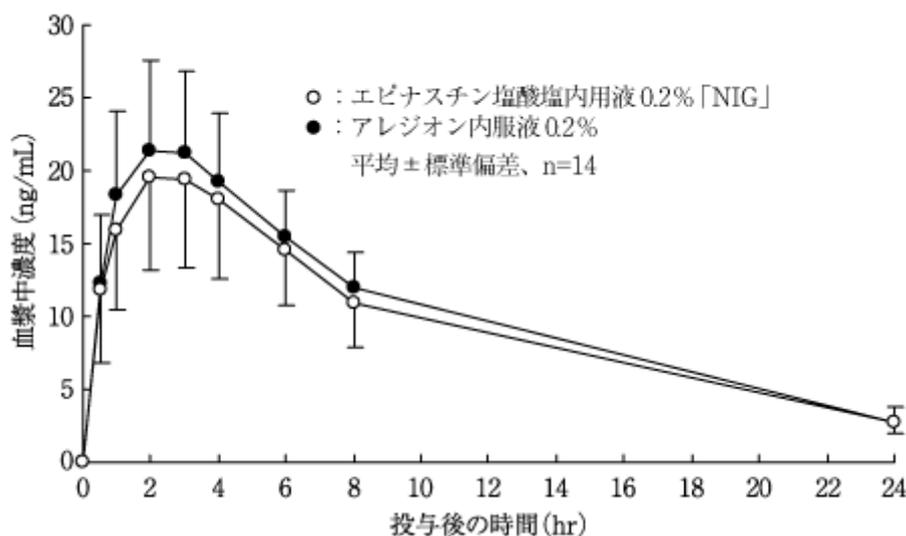
(平均±標準偏差、n=19)

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。

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

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内用液 0.2% 「NIG」 とアレジオン内服液 0.2% を、クロスオーバー法によりそれぞれ 10mL（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、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²⁷⁾。



薬物動態パラメータ

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エピナスチン塩酸塩 内用液 0.2% 「NIG」	20	233.1±63.2	21.2±6.2	2.6±1.0	7.7±0.9
アレジオン内服液 0.2%	20	252.7±49.0	22.7±5.9	2.4±0.9	7.5±1.0

(平均±標準偏差、n=14)

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

(「Ⅷ. 12. (1) 臨床使用に基づく情報」の項参照)

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²⁸⁾。

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. (5) 妊婦」の項参照）

(3) 乳汁への移行性

（「VII. 5. (5) その他の組織への移行性」、「VIII. 6. (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¹⁴C-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、脾、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^{29)・30)}。

(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³¹⁾。

(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

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³²⁾。

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

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

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

〈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。

(解説)

8.4 本剤の投与をスギ花粉の飛散初期に開始した症例群では、本格飛散後に投与を開始した症例群に比較して、症状が有意に軽度に推移し³³⁾、³⁴⁾、初期治療の有用性が報告されている。

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。

(解説)

本剤において肝機能障害や黄疸の発現が報告されており、肝障害が悪化又は再燃することが考えられることから設定した。

(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。

(解説)

本剤の妊婦あるいは産婦への投与は検討されていないため、安全性は確立していないことから記載した。

(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。

(解説)

本剤の授乳婦への投与は検討されていないため、安全性は確立していないことから記載した。なお、動物実験(ラット)において乳汁中に移行することが認められていることから、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、授乳を中止すること。

(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。

(解説)

小児を対象とした臨床試験は実施しておらず、安全性及び有効性が確立されていないことから設定した。

(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

(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、 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。

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	蕁麻疹、かゆみ、痒痒性紅斑	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

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg/20mg 「NIG」〉

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、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚瘙癢症、痒疹、瘙癢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。

(解説)

成人に本剤を投与した際の薬物動態について食事の影響が報告されていることから設定した。

(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	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」 エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」 エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」	なし
有効成分	エピナスチン塩酸塩	劇薬*

※：1錠又は1包中エピナスチンとして17.45mg以下を含有するものを除く。

2. 有効期間

錠：3年

内用液：2年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意点

<p>〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg/20mg 「NIG」〉</p> <p>20.取扱い上の注意</p> <p>アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて遮光して保存すること。</p> <p>〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉</p> <p>20.取扱い上の注意</p> <p>外箱開封後は遮光して保存すること。また開栓後は汚染に注意すること。</p>

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

6. 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%

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

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」〉

履歴	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
販売 開始	エピナスチン塩酸塩 錠 10mg 「タイヨー」	2011年 7月15日	22300AMX00745000	2011年 11月28日	2011年 11月28日
販売名 変更	エピナスチン塩酸塩 錠 10mg 「テバ」	2014年 2月3日	22600AMX00126000	2015年 6月19日	2015年 6月19日
承継	エピナスチン塩酸塩 錠 10mg 「NIG」	〃	〃	2022年 12月9日	2022年 12月9日

〈エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」〉

履歴	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
販売開始	アプラチン錠 20mg	2002年 3月14日	21400AMZ00323000	2002年 7月5日	2002年 7月5日
販売名 変更	エピナスチン塩酸塩 錠 20mg 「タイヨー」	2009年 4月28日	22100AMX00680000	2009年 9月25日	2009年 9月25日
販売名 変更	エピナスチン塩酸塩 錠 20mg 「テバ」	2014年 1月17日	22600AMX00043000	2015年 6月19日	2015年 6月19日
承継	エピナスチン塩酸塩 錠 20mg 「NIG」	〃	〃	2022年 12月9日	2022年 12月9日

〈エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」〉

履歴	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
販売開始	アプラチン内服液 0.2%	2006年 3月15日	21800AMZ10307000	2006年 7月7日	2006年 7月7日
販売名 変更	エピナスチン塩酸塩 内用液 0.2% 「タイヨー」	2009年 4月28日	22100AMX00681000	2009年 9月25日	2009年 9月25日
承継	エピナスチン塩酸塩 内用液 0.2% 「NIG」	〃	〃	2022年 5月25日	2022年 5月25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

〈再評価（品質再評価）〉

公表年月日：2007年8月3日

販売名：アプラチン錠 20mg

結果：薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない

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 「NIG」	4490014F1017	4490014F1351	121035403	622103503
エピナスチン塩酸塩 錠 20mg 「NIG」	4490014F2013	4490014F2390	114862603	621486203
エピナスチン塩酸塩 内用液 0.2% 「NIG」	4490014S1058	4490014S1058	117305503	621730503

14. 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) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) 瀧島 任ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 97-126
- 4) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補 2) : 61-79
- 5) 久木田 淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 25-41
- 6) 瀧島 任ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 157-184
- 7) 瀧島 任ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (1) : 169-197
- 8) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補 4) : 269-288
- 9) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補 4) : 289-312
- 10) 久木田 淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 43-57
- 11) 久木田 淳ほか：臨床医薬. 1991 ; 7 (10) : 2303-2320
- 12) 吉田 稔ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 185-214
- 13) 遠藤 朝彦ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補 6) : 447-467
- 14) 久木田 淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 59-71
- 15) 三浦 一樹ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 215-231
- 16) 高坂 知節ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補 5) : 409-422
- 17) 久木田 淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 73-86
- 18) 吉川 邦彦ほか：皮膚. 1992 ; 34 (1) : 105-118
- 19) 宮内 俊次ほか：西日本皮膚. 1992 ; 54 (1) : 143-152
- 20) 増谷 衛ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 87-95
- 21) Fügner A et al : Arzneimittelforschung. 1988 ; 38 (II) : 1446-1453 (PMID : 2461715)
- 22) Kamei C et al : Immunopharmacology & Immunotoxicology. 1992 ; 14 (1&2) : 207-218 (PMID : 1350791)
- 23) Tasaka K et al : 応用薬理. 1990 ; 39 (4) : 365-373
- 24) 河野 茂勝ほか：応用薬理. 1991 ; 42 (2) : 189-195
- 25) Schilling JC et al : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. Toxicol. 1990 ; 28 (12) : 493-497 (PMID : 1982280)
- 26) 東 純一ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl.1) : 3-24
- 27) 社内資料：生物学的同等性試験
- 28) 吸収率および生物学的利用率（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)
- 29) 大岩 陽子ほか：薬理と治療. 1992 ; 20 (2) : 483-506
- 30) 大岩 陽子ほか：薬理と治療. 1992 ; 20 (2) : 507-525
- 31) 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.3.1.3)
- 32) 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)
- 33) 遠藤 朝彦ほか：耳鼻咽喉科展望. 1995 ; 38 (6) : 800-17
- 34) 松田 孝一ほか：耳鼻と臨床. 1997 ; 43 (1) : 82-94

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

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

効能又は効果	用法及び用量
○気管支喘息 ○アレルギー性鼻炎 ○蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、瘙癢を伴う尋常性乾癬	<p><錠10mg/錠20mg></p> <p>〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、瘙癢を伴う尋常性乾癬〉 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。</p> <p>〈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。</p> <p><内用液></p> <p>〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、瘙癢を伴う尋常性乾癬〉 通常、成人には1回10mL（エピナスチン塩酸塩として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。</p> <p>〈アレルギー性鼻炎〉 通常、成人には1回5～10mL（エピナスチン塩酸塩として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。</p>

<DailyMed (USA)、2024年7月検索>

国名	米国
会社名	Breckenridge Pharmaceutical, Inc.
販売名	EPINASTINE HYDROCHLORIDE solution/ drops
剤形・規格	solution/ drops
INDICATIONS AND USAGE	
Epinastine HCl Ophthalmic Solution 0.05% is indicated for the prevention of itching associated with allergic conjunctivitis.	
DOSAGE AND ADMINISTRATION	
The recommended dosage is one drop in each eye twice a day.	
Treatment should be continued throughout the period of exposure (i.e., until the pollen season is over or until exposure to the offending allergen is terminated), even when symptoms are absent.	

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 「NIG」

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」の粉砕物安定性を曝光下の保存条件で検討した結果、性状は開始時には白色の粉末であり、総曝光量 60 万 Lx・hr 照射後、淡黄白色の粉末であった。含量は規格外であった。

25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 <規格>	保存期間	
	開始時	4 週
性状 n=3	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <95~105%>	99.4~100.0	99.3~99.7

※：表示量に対する含有率 (%)

● 粉砕物 25℃・60%RH・曝光量 60 万 Lx・hr [遮光・開放]

試験項目 <規格>	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 n=3	白色の粉末	淡黄白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <95~105%>	99.4~100.0	93.1~93.8

※：表示量に対する含有率 (%)

規格外：太字

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」の粉砕物安定性を 40℃で検討した結果、性状は白色の粉末で、含量は規格内であった。25℃・75%RH で検討した結果、性状は開始時には白色の粉末であり、2 週後に一部塊があり、含量は規格内であった。曝光下の保存条件で検討した結果、性状は開始時には白色の粉末であり、総曝光量 60 万 Lx・hr 照射後に微黄白色の粉末であった。含量は総曝光量 60 万 Lx・hr 照射後に規格外であった。

● 粉砕物 40℃ [遮光・PE 包装]

試験項目 <規格>	ロット番号	保存期間		
		開始時	2 週	4 週
性状	911491	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) * n=3 <93~107%>	911491	97.1~97.3	97.3~97.5	96.0~96.7

※：表示量に対する含有率 (%)

● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光・PE 包装]

試験項目 <規格>	ロット番号	保存期間		
		開始時	2 週	4 週
性状	911491	白色の粉末	白色の粉末で、 一部塊があった※2	白色の粉末で、 一部塊があった※2
含量 (%) *1 n=3 <93~107%>	911491	97.1~97.3	96.8	96.6~97.0

※1：表示量に対する含有率 (%)

※2：塊は固化しておらず、軽く押すことで粉末となった

● 粉砕物 曝光量 60 万 Lx・hr [PE 包装]

試験項目 <規格>	ロット番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx・hr
性状	911491	白色の粉末	微黄白色の粉末
含量 (%) * n=3 <93~107%>	911491	97.1~97.3	92.5~92.8

※：表示量に対する含有率 (%)

規格外：太字

(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 「NIG」

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°C 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。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

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 「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・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 「NIG」

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°C 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。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

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 「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・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

該当資料なし