

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錠10mg「ダイト」

エピナスチン塩酸塩錠20mg「ダイト」

Epinastine Hydrochloride Tablets "DAITO"

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「ダイト」：1錠中 エピナスチン塩酸塩 10mg エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ダイト」：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）
製造販売承認年月日・ 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2023年12月13日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2024年6月14日 販売開始年月日：2024年6月14日
開発・製造販売（輸入） ・提携・販売会社名	製造販売元：ダイト株式会社 販売元：共創未来ファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室 TEL：050-3383-3846 受付時間：9：00～17：00（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ： https://www.kyosomirai-p.co.jp/medical/top.html

本IFは2024年6月作成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 ー日本病院薬剤師会ー

(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、「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. 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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じで行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	4. 用法及び用量に関連する注意	13
1. 開発の経緯	1	5. 臨床成績	13
2. 製品の治療学的特性	1	VI. 薬効薬理に関する項目	20
3. 製品の製剤学的特性	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	20
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	2. 薬理作用	20
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	VII. 薬物動態に関する項目	21
6. RMPの概要	2	1. 血中濃度の推移	21
II. 名称に関する項目	3	2. 薬物速度論的パラメータ	22
1. 販売名	3	3. 母集団（ポピュレーション）解析	23
2. 一般名	3	4. 吸収	23
3. 構造式又は示性式	3	5. 分布	23
4. 分子式及び分子量	3	6. 代謝	24
5. 化学名（命名法）又は本質	3	7. 排泄	24
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	8. トランスポーターに関する情報	24
III. 有効成分に関する項目	5	9. 透析等による除去率	24
1. 物理化学的性質	5	10. 特定の背景を有する患者	24
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	11. その他	24
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	25
IV. 製剤に関する項目	6	1. 警告内容とその理由	25
1. 剤形	6	2. 禁忌内容とその理由	25
2. 製剤の組成	6	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	25
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	25
4. 力価	7	5. 重要な基本的注意とその理由	25
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	25
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	7. 相互作用	26
7. 調製法及び溶解後の安定性	9	8. 副作用	27
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	9	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	27
9. 溶出性	10	10. 過量投与	28
10. 容器・包装	11	11. 適用上の注意	28
11. 別途提供される資材類	12	12. その他の注意	28
12. その他	12	IX. 非臨床試験に関する項目	29
V. 治療に関する項目	13	1. 薬理試験	29
1. 効能又は効果	13	2. 毒性試験	29
2. 効能又は効果に関連する注意	13		
3. 用法及び用量	13		

X. 管理的事項に関する項目	30
1. 規制区分.....	30
2. 有効期間.....	30
3. 包装状態での貯法.....	30
4. 取扱い上の注意.....	30
5. 患者向け資材.....	30
6. 同一成分・同効薬.....	30
7. 国際誕生年月日.....	30
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.....	31
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.....	31
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び その内容.....	31
11. 再審査期間.....	31
12. 投薬期間制限に関する情報.....	31
13. 各種コード.....	31
14. 保険給付上の注意.....	31
X I. 文献	32
1. 引用文献.....	32
2. その他の参考文献.....	33
X II. 参考資料	34
1. 主な外国での発売状況.....	34
2. 海外における臨床支援情報.....	34
X III. 備考	35
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.....	35
2. その他の関連資料.....	37

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

エピナスチン塩酸塩は、ベーリンガーインゲルハイム社（ドイツ）で1975年に合成されたアレルギー性疾患治療剤である。

本薬は、H₁受容体に働き強力な抗ヒスタミン作用を示すことから、臨床的にはアレルギー性鼻炎を始め、気管支喘息や蕁麻疹、湿疹、皮膚炎等の各種皮膚疾患に使用されている。

アルピード錠10及びアルピード錠20は、後発医薬品としてダイト株式会社が開発し、2002年3月承認を取得、同年10月より販売開始し、2013年1月よりセオリアファーマ株式会社が販売している。2020年7月に医療事故防止のためエピナスチン塩酸塩錠10mg「CEO」及びエピナスチン塩酸塩錠20mg「CEO」として販売名の代替新規承認を取得した。

その後、2023年12月に販売会社変更に伴う販売名変更（エピナスチン塩酸塩錠10mg「ダイト」及びエピナスチン塩酸塩錠20mg「ダイト」）の承認を取得、2024年6月に発売した。

2. 製品の治療学的特性

(1) 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^{1~3)}。

(2) 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。
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. 副作用」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

(1) 錠剤表面には、識別コードを表示している。（「Ⅳ-1. 剤形」の項参照）

(2) PTPシート表面には、1錠単位で成分名、規格を表記している。

(3) PTPシート裏面には、薬剤の判別を容易にするため1錠単位で販売名、薬効分類、GS1コードを表記している。

(4) 外箱には、切り離し可能な切り取りタグを施している。

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材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」

(2) 洋名

Epinastine Hydrochloride Tablets 10mg “DAITO”

Epinastine Hydrochloride Tablets 20mg “DAITO”

(3) 名称の由来

成分名+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）

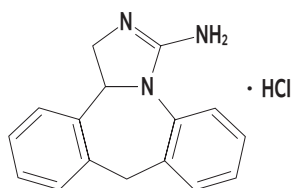
(2) 洋名（命名法）

Epinastine Hydrochloride（JAN）

(3) ステム（stem）

抗ヒスタミン剤：-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）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

該当なし

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

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い。

(3) 吸湿性

高湿度で吸湿

(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

(6) 分配係数

9.2×10^{-2} （pH7、n-オクタノール／水）

(7) その他の主な示性値

メタノール溶液（1→20）は旋光性を示さない。

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

有効成分の確認試験法

- (1) ドラー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
- (4) 塩化物の定性反応

有効成分の定量法

電位差滴定法







IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

販売名	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」
剤形の区分	フィルムコーティング錠	

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」	
色・剤形	白色～微黄色フィルムコーティング錠		
外形	表		
	裏		
	側面		
直径	6.6mm	8.1mm	
厚さ	3.2mm	3.7mm	
質量	103mg	175mg	

(3) 識別コード

販売名	識別コード
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」	DK409
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」	DK410

識別コードは錠剤表面、PTP シート裏面に表示

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」	エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」
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	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、タルク、低置換度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	

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験⁴⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40°C、75%RH、3ロット (n=1)

	試験項目	開始時	6 ヶ月
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」	性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
	確認試験	適合	同左
	純度試験	規格内	同左
	溶出率 (%)	96~104	95~103
	含量 (%)	99.6~100.3	98.7~101.3
	硬度 (N) 参考値	69~78	72~93
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」	性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
	確認試験	適合	同左
	純度試験	規格内	同左
	溶出率 (%)	91~98	95~103
	含量 (%)	98.4~100.3	98.6~99.9
	硬度 (N) 参考値	67~69	69~76

(2) 長期保存試験⁴⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、3ロット (n=1)

	試験項目	開始時	3年
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ダイト」	性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
	確認試験	適合	同左
	純度試験	規格内	同左
	溶出率 (%)	96~104	89~99
	含量 (%)	99.6~100.3	99.2~101.8
	硬度 (N) 参考値	69~76	68~81
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ダイト」	性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
	確認試験	適合	同左
	純度試験	規格内	同左
	溶出率 (%)	90~107	92~106
	含量 (%)	99.8~100.9	97.8~100.2
	硬度 (N) 参考値	67~74	69~76

(3) 無包装状態の安定性⁵⁾

エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ダイト」

試験条件：

温度：40℃、遮光、気密容器

湿度：25℃、75%RH、遮光、シャーレ開放

光：D65-2500lx、25℃、45%RH

試験項目	開始時	温度	湿度	光
		3ヵ月	3ヵ月	120万lx・hr
外観	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
溶出性 (%)	100.5	99.9	99.7	99.9
含量 (%)	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格：93~107%	99.7	101.0	99.6	98.9
硬度	規格内	変化なし	変化あり* (規格内)	変化なし
規格(参考値)20N以上	83	90	39	73

*：83N (開始時) →34N (規格内、1ヵ月) →39N (規格内、3ヵ月)

注)「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成11年8月20日」を参考に評価した。

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」

試験条件：

温度：40℃、遮光、気密容器

湿度：25℃、75%RH、遮光、シャーレ開放

光：D65-2500lx、25℃、45%RH

試験項目	開始時	温度	湿度	光
		3 ヶ月	3 ヶ月	120 万 lx・hr
外観	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
溶出性 (%)	100.5	99.9	99.7	99.9
含量 (%)	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格：93～107%	99.7	101.0	99.6	98.9
硬度	規格内	変化なし	変化あり* (規格内)	変化なし
規格(参考値)20N 以上	83	90	39	73

*：83N（開始時）→34N（規格内、1 ヶ月）→39N（規格内、3 ヶ月）

注）「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成11年8月20日」を参考に評価した。

【評価基準】

分類	外観	含量	硬度	崩壊性 溶出性 類縁物質
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	含量低下が3%未満の場合	硬度変化が30%未満の場合	規格値内の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合	含量低下が3%以上で、規格値内の場合	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(20N)以上の場合	
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している場合	規格値外の場合	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(20N)未満の場合	規格値外の場合

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性⁶⁾

(1) エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ダイト」

1) 公的溶出試験への適合性

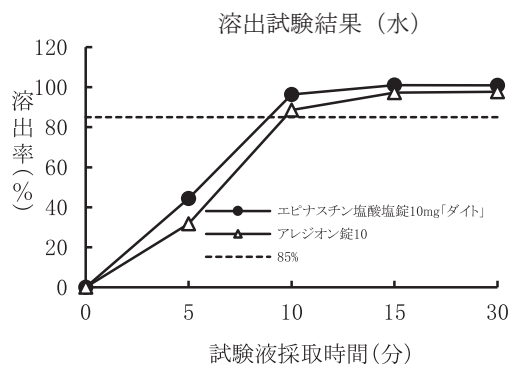
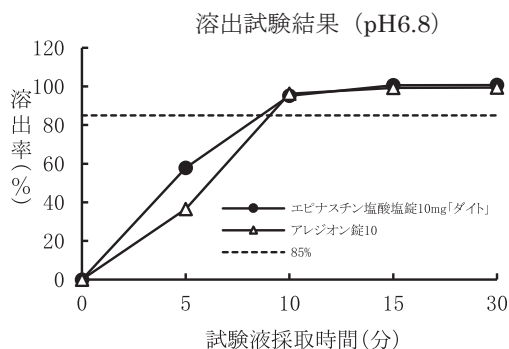
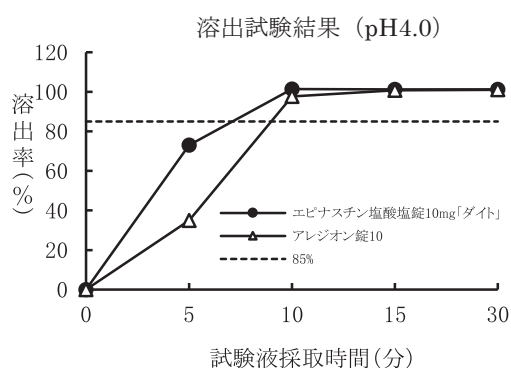
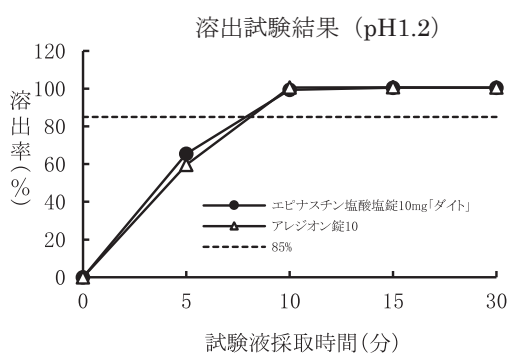
日本薬局方外医薬品規格第三部「エピナスチン塩酸塩錠」に従い試験を行うとき、定められた溶出規格に適合していることが確認されている（30分間の溶出率が85%以上）。

2) 溶出挙動における類似性

すべての試験条件において、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成9年12月22日付医薬審第487号）」に示された基準に適合し、エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ダイト」と標準製剤（アレジオン錠 10）の溶出挙動の類似性が確認された。

溶出挙動の同等性の判定結果

回転数 (rpm)	試験液	判定時点	溶出率 (%)		判定基準	判定
			標準製剤	試験製剤		
50	pH1.2	15分	100.7	100.5	85%以上	適合
	pH4.0	15分	100.7	101.3	85%以上	適合
	pH6.8	15分	99.3	100.6	85%以上	適合
	水	15分	97.2	101.0	85%以上	適合



(2) エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」

1) 公的溶出試験への適合性

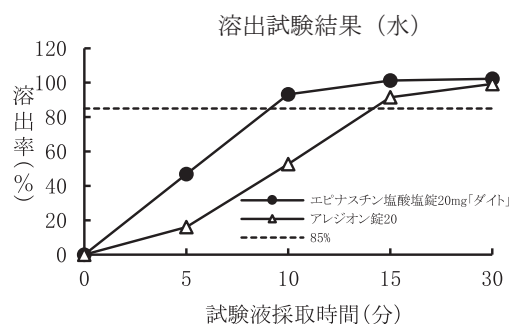
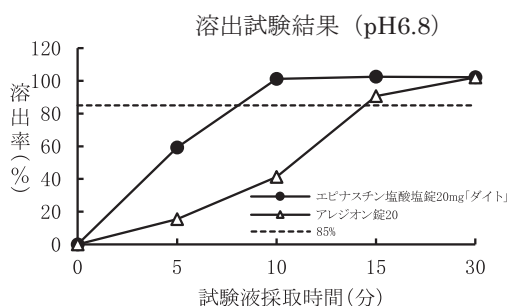
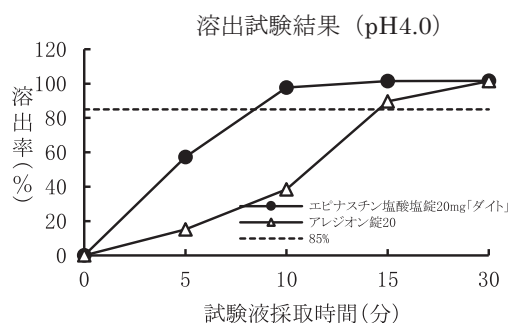
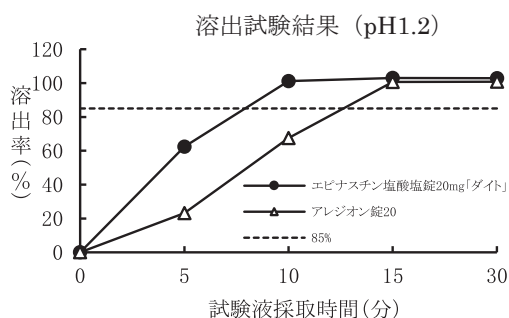
日本薬局方外医薬品規格第三部「エピナスチン塩酸塩錠」に従い試験を行うとき、定められた溶出規格に適合していることが確認されている（30 分間の溶出率が 85%以上）。

2) 溶出挙動における類似性

すべての試験条件において、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号）」に示された基準に適合し、エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」と標準製剤（アレジオン錠 20）の溶出挙動の類似性が確認された。

溶出挙動の同等性の判定結果

回転数 (rpm)	試験液	判定時点	溶出率 (%)		判定基準	判定
			標準製剤	試験製剤		
50	pH1.2	15 分	100.7	103.0	85%以上	適合
	pH4.0	15 分	89.6	101.4	85%以上	適合
	pH6.8	15 分	90.6	102.5	85%以上	適合
	水	15 分	91.5	101.2	85%以上	適合



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「ダイト」

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ダイト」

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP包装：

PTPシート：ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔

アルミピロー：ポリエステル・アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

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
- 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

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈気管支喘息〉

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 20mg 1 日 1 回及び 20mg 1 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 20mg 1 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	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)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

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 20mg 1 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）
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)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

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 1mg 1 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）
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。

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 20mg 1 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）
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。

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 20mg 1 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）
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〉

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、20mg 1 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）
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。

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 20mg 1 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	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)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

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 10mg 1 日 1 回又はアレラスチン 1mg 1 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）
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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

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 20mg 1 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）
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。

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 10mg 1 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。

〈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〉

⑪ 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、20mg 1 日 1 回及び 20mg 1 日 2 回を 7 日間経口投与した結果、10mg 又は 20mg 1 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）
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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

⑫ 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 20mg 1 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)
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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

⑬ 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 20mg 1 日 1 回又はケトチフェン 1mg 1 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)
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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

⑭ 国内第Ⅲ相試験

慢性じん麻疹の患者 64 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩 20mg 1 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)
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。

⑮ 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 20mg 1 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

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²¹⁾。

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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

⑩ 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 20mg 1 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²²⁾。

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^{注)}。

注) 1 例に複数の副作用がある。

⑪ 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 20mg 1 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²³⁾。

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。

⑫ 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 20mg 1 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²⁴⁾。

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。

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

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ケトチフェンフマル酸塩、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、ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩等のヒスタミン H₁ 受容体拮抗薬

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子化された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^{1~3)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 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¹⁾。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^{1,2)}。

2) 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²⁾。

3) 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³⁾。

4) 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²⁵⁾。

5) 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²⁶⁾。

(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) 血中濃度

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²⁷⁾。

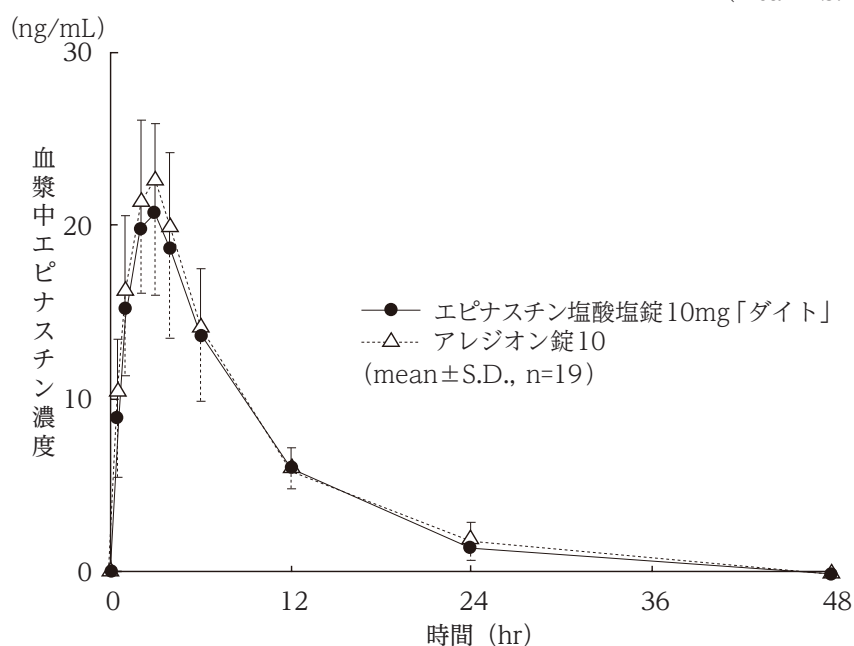
2) 生物学的同等性試験²⁸⁾

健康成人男性にエピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」又はエピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」とアレジオン錠 10 又はアレジオン錠 20 をそれぞれエピナスチン塩酸塩として 20mg をクロスオーバー法により絶食時に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}) について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」〉

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₄₈ (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 「ダイト」	20mg (2 錠)	219.46±59.57	21.93±5.29	2.8±0.8	7.1±2.3
アレジオン錠 10	20mg (2 錠)	236.30±61.27	23.72±6.50	2.8±0.7	6.6±1.8

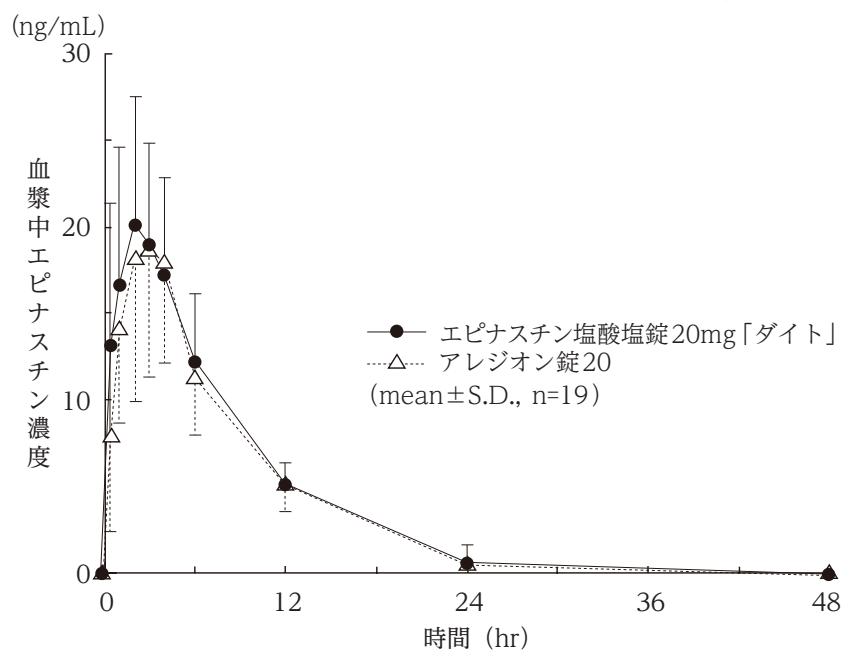
(mean±S.D., n=19)



〈エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」〉

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」	20mg (1錠)	188.77±63.43	21.43±7.51	2.2±0.9	5.6±1.8
アレジオン錠 20	20mg (1錠)	183.18±69.29	20.28±8.07	2.7±1.0	5.6±1.5

(mean±S.D., n=19)



血漿中濃度並びに C_{max}、AUC 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

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。
 (「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²⁸⁾

10mg 錠 : 0.1075 ± 0.0341 (hr^{-1})

20mg 錠 : 0.1349 ± 0.0377 (hr^{-1})

(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

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

(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²⁹⁾。

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」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、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^{30, 31)}。

(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³²⁾。

(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

(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³³⁾。

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

(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	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：エピナスチン塩酸塩 劇薬

2. 有効期間

使用期限：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり

くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレジオン錠 10・錠 20、アレジオンドライシロップ 1%、アレジオン点眼液 0.05%、アレジオン LX 点眼液 0.1%

同 効 薬：エバスチン、アゼラスチン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、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、ベポタスチンベシル酸塩、メキタジン、ロラタジン等

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
アルピード錠 10	2002年3月15日	21400AMZ00396000	2002年7月5日	2002年10月4日
アルピード錠 20	2002年3月15日	21400AMZ00397000	2002年7月5日	2002年10月4日
販売名変更 エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「CEO」	2020年7月9日	30200AMX00671000	2020年12月11日	2020年12月11日
販売名変更 エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「CEO」	2020年7月9日	30200AMX00672000	2020年12月11日	2020年12月11日
販売名変更 エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」	2023年12月13日	30500AMX00291000	2024年6月14日	2024年6月14日
販売名変更 エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」	2023年12月13日	30500AMX00292000	2024年6月14日	2024年6月14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 「ダイト」	4490014F1360	4490014F1360	114851002	621485102
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」	4490014F2404	4490014F2404	114861902	621486102

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) Fügner A, et al. : Arzneimittelforschung. 1988 ; 38(II) : 1446-1453
- 2) Kamei C, et al. : Immunopharmacology & Immunotoxicology. 1992 ; 14(1&2) : 207-218
- 3) Tasaka K, et al. : 応用薬理. 1990 ; 39(4) : 365-373
- 4) 社内資料 : 安定性試験に関する資料
- 5) 社内資料 : 無包装状態における安定性に関する資料
- 6) 社内資料 : 溶出試験に関する資料
- 7) 瀧島任他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 97-126
- 8) 瀧島任他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 157-184
- 9) 瀧島任他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(1) : 169-197
- 10) 吉田稔他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 185-214
- 11) 三浦一樹他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 215-231
- 12) 奥田稔他 : 耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35(補 2) : 61-79
- 13) 奥田稔他 : 耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35(補 4) : 269-288
- 14) 奥田稔他 : 耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35(補 4) : 289-312
- 15) 遠藤朝彦他 : 耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35(補 6) : 447-467
- 16) 高坂知節他 : 耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35(補 5) : 409-422
- 17) 久木田淳他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 25-41
- 18) 久木田淳他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 43-57
- 19) 久木田淳他 : 臨床医薬. 1991 ; 7(10) : 2303-2320
- 20) 久木田淳他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 59-71
- 21) 久木田淳他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 73-86
- 22) 吉川邦彦他 : 皮膚. 1992 ; 34(1) : 105-118
- 23) 宮内俊次他 : 西日本皮膚. 1992 ; 54(1) : 143-152
- 24) 増谷衛他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 87-95
- 25) 河野茂勝他 : 応用薬理. 1991 ; 42(2) : 189-195
- 26) Schilling JC, et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. Toxicol. 1990 ; 28(12) : 493-497
- 27) 東純一他 : 臨床医薬. 1992 ; 8(Suppl. 1) : 3-24
- 28) 社内資料 : 生物学的同等性試験に関する資料
- 29) 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)
- 30) 大岩陽子他 : 薬理と治療. 1992 ; 20(2) : 483-506
- 31) 大岩陽子他 : 薬理と治療. 1992 ; 20(2) : 507-525
- 32) 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)
- 33) 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)
- 34) 社内資料 : 粉碎後の安定性に関する資料
- 35) 社内資料 : 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験に関する資料

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

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦への投与に関する海外情報

該当資料なし

(2) 小児等への投与に関する海外情報

該当資料なし

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。

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) 粉砕³⁴⁾

<エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」>

保存条件	試験項目	開始時	7日後	14日後	30日後
40℃、75%RH 褐色ガラス瓶 (気密)	外観 白色の粉末	白色の粉末	同左	同左	同左
	含量 (%) (残存率 (%))	98.9	99.2 (100.3)	99.0 (100.1)	98.9 (100.0)
	純度試験 (参考試験)	規格内	同左	同左	同左
25℃、75%RH 褐色ガラス瓶 開放	外観 白色の粉末	白色の粉末	同左	同左	同左
	含量 (%) (残存率 (%))	98.9	98.6 (99.7)	98.0 (99.1)	98.5 (99.6)
	純度試験 (参考試験)	規格内	同左	同左	同左
保存条件	試験項目	開始時	30万 lx・hr	60万 lx・hr	120万 lx・hr
D65-2500lx 25℃、45%RH	外観 白色の粉末	白色の粉末	同左	照射面が微黄 白色に着色	照射面が微黄 白色に着色
	含量 (%) (残存率 (%))	98.9	96.3 (97.4)	96.0 (97.1)	92.7 (93.7)
	純度試験 (参考試験)	規格内	規格外	規格外	規格外

<エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ダイト」>

保存条件	試験項目	開始時	7日後	14日後	30日後
40℃、75%RH 褐色ガラス瓶 (気密)	外観 白色の粉末	白色の粉末	同左	同左	同左
	含量 (%) (残存率 (%))	97.6	97.2 (99.6)	97.5 (99.9)	97.2 (99.6)
	純度試験 (参考試験)	規格内	同左	同左	同左
25℃、75%RH 褐色ガラス瓶 開放	外観 白色の粉末	白色の粉末	同左	同左	同左
	含量 (%) (残存率 (%))	97.6	96.3 (98.7)	96.3 (98.7)	96.3 (98.7)
	純度試験 (参考試験)	規格内	同左	同左	同左
保存条件	試験項目	開始時	30万 lx・hr	60万 lx・hr	120万 lx・hr
D65-2500lx 25℃、45%RH	外観 白色の粉末	白色の粉末	同左	同左	照射面が微黄 白色に着色
	含量 (%) (残存率 (%))	97.6	96.2 (98.6)	95.6 (98.0)	95.4 (97.7)
	純度試験 (参考試験)	規格内	規格内	規格外	規格外

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性³⁵⁾

1. 崩壊懸濁試験

ディスペンサー内に本品 1 錠を入れ、55℃の温湯 20mL を吸い取り、5 分間自然放置した後、ディスペンサーを 90 度で 15 往復横転させ、崩壊・懸濁状態を観察した。5 分後に崩壊しない場合は、更に 5 分間放置後、同様な操作を行い、崩壊・懸濁の状態を観察した。

2. 通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をディスペンサー内に吸い取り、経管栄養チューブ (8Fr.) の注入端より 2~3mL/秒 (10 秒で 20mL) の速度で注入し、通過性を観察した。

3. 試験結果

販売名	試験項目	結果
エピナスチン塩酸塩錠 10mg「ダイト」	崩壊懸濁試験	5 分間時で完全に崩壊し、良好な懸濁状態を示した。
	通過性試験	8Fr.経管チューブを通過した。
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「ダイト」	崩壊懸濁試験	5 分間時で錠剤は完全に崩壊せず、液はある程度の懸濁状態を示した。更に 5 分後錠剤は完全に崩壊し、良好な懸濁状態を示した。
	通過性試験	8Fr.経管チューブを通過した。

2. その他の関連資料

1) 患者向け説明用資材

該当資料なし

2) GS1 コード

販売名	包装単位	GS1 コード	
		調剤包装単位コード	販売包装単位コード
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「ダイト」	100 錠 PTP	(01) 04987885226779	(01) 14987885026772
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「ダイト」	100 錠 PTP	(01) 04987885226786	(01) 14987885026789

製造販売元

DAITO **ダイト株式会社**

富山県富山市八日町326番地

販売元

 **共創未来ファーマ株式会社**

東京都品川区広町 1-4-4