

# 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「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 Tab.**

**EPINASTINE HCl**

|                           |   |               |              |              |
|---------------------------|---|---------------|--------------|--------------|
| 剤形                        | 錠 10mg/20mg：フィルムコーティング錠<br>内用液 0.2%：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<br>錠 20mg：1錠中 エピナスチン塩酸塩 20mg 含有<br>内用液 0.2%：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<br>洋名：Epinastine Hydrochloride   |               |              |              |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・発売年月日 |   | 錠 10mg        | 錠 20mg       | 内用液 0.2%     |
|                           | 承認年月日   | 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 |
|                           | 発売年月日   | 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)・<br>提携・販売会社名  | 販売：武田薬品工業株式会社<br>発売元：日医工株式会社<br>製造販売元：日医工岐阜工場株式会社   |               |              |              |
| 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<br>TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948<br>医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a> |               |              |              |

本IFは2022年12月改訂（錠：第13版，承継に伴う改訂），2022年5月改訂（内用液：第7版，承継に伴う改訂）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

<https://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（<https://www.info.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、添付文書で赤字・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

|                                  |    |                                      |    |
|----------------------------------|----|--------------------------------------|----|
| <b>I. 概要に関する項目</b> .....         | 1  | <b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....          | 13 |
| 1. 開発の経緯 .....                   | 1  | 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .              | 13 |
| 2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....          | 1  | 2. 薬理作用 .....                        | 13 |
| <b>II. 名称に関する項目</b> .....        | 2  | <b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....         | 14 |
| 1. 販売名 .....                     | 2  | 1. 血中濃度の推移・測定法 .....                 | 14 |
| 2. 一般名 .....                     | 2  | 2. 薬物速度論的パラメータ .....                 | 17 |
| 3. 構造式又は示性式 .....                | 2  | 3. 吸収 .....                          | 17 |
| 4. 分子式及び分子量 .....                | 2  | 4. 分布 .....                          | 17 |
| 5. 化学名（命名法） .....                | 2  | 5. 代謝 .....                          | 17 |
| 6. 慣用名，別名，略号，記号番号 .....          | 2  | 6. 排泄 .....                          | 18 |
| 7. CAS登録番号 .....                 | 2  | 7. トランスポーターに関する情報 .....              | 18 |
| 8. 透析等による除去率 .....               | 18 |                                      |    |
| <b>III. 有効成分に関する項目</b> .....     | 3  | <b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .... | 19 |
| 1. 物理化学的性質 .....                 | 3  | 1. 警告内容とその理由 .....                   | 19 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....       | 3  | 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .              | 19 |
| 3. 有効成分の確認試験法 .....              | 3  | 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由.....       | 19 |
| 4. 有効成分の定量法 .....                | 3  | 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由.....       | 19 |
| <b>IV. 製剤に関する項目</b> .....        | 4  | 5. 慎重投与内容とその理由 .....                 | 19 |
| 1. 剤形 .....                      | 4  | 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法               | 19 |
| 2. 製剤の組成 .....                   | 4  | 7. 相互作用 .....                        | 19 |
| 3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 .....        | 4  | 8. 副作用 .....                         | 20 |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性 .....         | 5  | 9. 高齢者への投与 .....                     | 20 |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性 .....            | 7  | 10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....             | 21 |
| 6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....       | 7  | 11. 小児等への投与 .....                    | 21 |
| 7. 溶出性 .....                     | 8  | 12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....               | 21 |
| 8. 生物学的試験法 .....                 | 10 | 13. 過量投与 .....                       | 21 |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....          | 10 | 14. 適用上の注意 .....                     | 21 |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法 .....           | 10 | 15. その他の注意 .....                     | 21 |
| 11. 力価 .....                     | 10 | 16. その他 .....                        | 21 |
| 12. 混入する可能性のある夾雑物 .....          | 10 | <b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....         | 22 |
| 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報..... | 10 | 1. 薬理試験 .....                        | 22 |
| 14. その他 .....                    | 10 | 2. 毒性試験 .....                        | 22 |
| <b>V. 治療に関する項目</b> .....         | 11 | <b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....          | 23 |
| 1. 効能又は効果 .....                  | 11 | 1. 規制区分 .....                        | 23 |
| 2. 用法及び用量 .....                  | 11 |                                      |    |
| 3. 臨床成績 .....                    | 11 |                                      |    |

|               |                                |           |
|---------------|--------------------------------|-----------|
| 2.            | 有効期間又は使用期限                     | 23        |
| 3.            | 貯法・保存条件                        | 23        |
| 4.            | 薬剤取扱い上の注意点                     | 23        |
| 5.            | 承認条件等                          | 23        |
| 6.            | 包装                             | 23        |
| 7.            | 容器の材質                          | 23        |
| 8.            | 同一成分・同効薬                       | 23        |
| 9.            | 国際誕生年月日                        | 23        |
| 10.           | 製造販売承認年月日及び承認番号                | 24        |
| 11.           | 薬価基準収載年月日                      | 24        |
| 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 | 24        |
| 13.           | 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容         | 24        |
| 14.           | 再審査期間                          | 25        |
| 15.           | 投薬期間制限医薬品に関する情報                | 25        |
| 16.           | 各種コード                          | 25        |
| 17.           | 保険給付上の注意                       | 25        |
| <b>X I.</b>   | <b>文献</b>                      | <b>26</b> |
| 1.            | 引用文献                           | 26        |
| 2.            | その他の参考文献                       | 26        |
| <b>X II.</b>  | <b>参考資料</b>                    | <b>27</b> |
| 1.            | 主な外国での発売状況                     | 27        |
| 2.            | 海外における臨床支援情報                   | 27        |
| <b>X III.</b> | <b>備考</b>                      | <b>28</b> |
| 1.            | 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報   | 28        |
| 2.            | その他の関連資料                       | 31        |

## 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）

「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<br>「タイヨー」   | アプラチン錠 20mg               |
|            | エピナスチン塩酸塩内用液 0.2%<br>「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<br>「テバ」     | エピナスチン塩酸塩錠 20mg<br>「タイヨー」 |
| 2014年2月 3日 | エピナスチン塩酸塩錠 10mg<br>「テバ」     | エピナスチン塩酸塩錠 10mg<br>「タイヨー」 |

2022年5月1日、エピナスチン塩酸塩内用液 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・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) 内用液 0.2%は、香料としてアップルフレーバーを使用している。
- (3) 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。

## 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 Tab.

EPINASTINE HCl

#### (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)

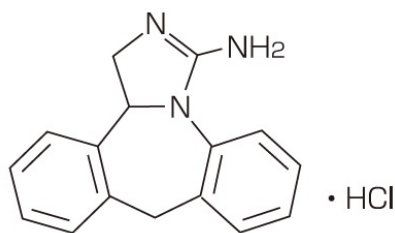
#### (2) 洋名 (命名法)

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:  $C_{16}H_{15}N_3 \cdot HCl$

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°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

本品のエタノール（95）溶液（1→100）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

##### (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，紫外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 $\text{cm}^{-1}$ ，1588 $\text{cm}^{-1}$ ，1554 $\text{cm}^{-1}$ ，774 $\text{cm}^{-1}$  及び 760 $\text{cm}^{-1}$  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。

#### 4. 有効成分の定量法

##### 電位差滴定法


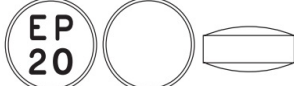
本品を酢酸（100）に溶かし，無水酢酸を加え，過塩素酸で滴定する。



#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別, 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」  | エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」            |
|-------------|---|--|------------------------------------|
| 性状          | 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   | 芳香があり, 味は甘く, わずかに苦味がある, 無色～微黄色澄明の液 |
| 外形          |  |  | —                                  |
| 直径(mm)      | 6.0   | 8.1  | —                                  |
| 厚さ(mm)      | 2.8   | 3.9  | —                                  |
| 質量(mg)      | 90  | 200  | —                                  |
| 識別コード (PTP) | EP10  | EP20   | —                                  |

###### (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

内用液 0.2% : pH : 3.0~4.0

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

| 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」   | エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」              |
|------|---|---|--------------------------------------|
| 有効成分 | 1錠中<br>エピナスチン塩酸塩 10mg   | 1錠中<br>エピナスチン塩酸塩 20mg   | 1mL 中<br>エピナスチン塩酸塩 2mg               |
| 添加物  | 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 | 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) 添加物

(「IV. 2. (1) 有効成分 (活性成分) の含量」の項参照)

###### (3) その他

該当しない

##### 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<sup>1)</sup>

##### (1) 加速試験

加速試験 (40°C, 75%RH, 6 ヶ月) の結果, 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」 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 「NIG」 加速試験 [最終包装形態: PTP 包装]

| 試験項目<br><規格>  | 保存期間                   |                        |                        |                        |
|---|------------------------|------------------------|------------------------|------------------------|
|   | 開始時                    | 1 ヶ月                   | 3 ヶ月                   | 6 ヶ月                   |
| 性状 n=3 <sup>※1</sup><br><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 <sup>※1</sup><br>(沈殿反応, 紫外可視吸収スペクトル)       | 適合                     | 適合                     | 適合                     | 適合                     |
| 崩壊性 (分) n=3 <sup>※1</sup><br><60 分以内>               | 2~4                    | 2~4                    | 2~4                    | 2~4                    |
| 含量 (%) <sup>※2</sup> n=3 <sup>※1</sup><br><95~105%> | 99.9±0.3 <sup>※3</sup> | 99.9±0.3 <sup>※3</sup> | 99.9±0.3 <sup>※3</sup> | 99.9±0.3 <sup>※3</sup> |

※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 (SD)

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

| 試験項目<br><規格>                         | ロット<br>番号 | 保存期間       |           |            |
|--------------------------------------|-----------|------------|-----------|------------|
|                                      |           | 開始時        | 3 ヶ月      | 6 ヶ月       |
| 性状 n=3<br><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<br><3%以下>                       | MZZR      | 適合         | 適合        | 適合         |
| 溶出性 (%) n=6<br><30 分, 85%以上>         | MZZR      | 99.8~101.1 | 90.2~99.9 | 99.2~102.0 |
| 含量 (%) <sup>*</sup> n=3<br><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

長期保存試験 (25°C, 60%RH, 2 年 1 ヶ月) の結果, エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」 は通常の市場流通下において 2 年間安定であることが確認された。

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

| 試験項目<br><規格>                                | ロット<br>番号            | 保存期間                                   |                                     |                                     |                                     |                                     |
|---|----------------------|--|-------------------------------------|-------------------------------------|-------------------------------------|-------------------------------------|
|   |                      | 開始時                                    | 6 ヶ月                                | 12 ヶ月                               | 24 ヶ月                               | 25 ヶ月                               |
| 性状<br><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<br>5WWQ<br>6WWQ | 適合                                     | 適合                                  | 適合                                  | 適合                                  | 適合                                  |
| pH<br><3.0~4.0>                             | 2WWQ<br>5WWQ<br>6WWQ | 3.60~3.61<br>3.59~3.60<br>3.59~3.60    | 3.55~3.57<br>3.55~3.56<br>3.55~3.56 | 3.56<br>3.56<br>3.56                | 3.54<br>3.53~3.54<br>3.54           | 3.54<br>3.52~3.53<br>3.53~3.54      |
| 密度 (g/mL)<br><1.14~1.18g/mL>                | 2WWQ<br>5WWQ<br>6WWQ | 1.159<br>1.159<br>1.160                | 1.162<br>1.162<br>1.162             | 1.166<br>1.166<br>1.165             | 1.167<br>1.166<br>1.166             | 1.166<br>1.168<br>1.167             |
| 純度試験<br><総類縁物質: 2%以下>                       | 2WWQ<br>5WWQ<br>6WWQ | 適合                                     | 適合                                  | 適合                                  | 適合                                  | 適合                                  |
| 含量 (%) <sup>*</sup><br><93~107%>            | 2WWQ<br>5WWQ<br>6WWQ | 96.9~100.5<br>96.4~ 99.8<br>98.4~100.5 | 98.7~99.1<br>98.4~98.8<br>98.2~99.3 | 97.6~98.0<br>97.3~99.4<br>97.8~98.4 | 96.5~96.7<br>96.9~98.1<br>95.3~97.3 | 95.5~98.4<br>95.6~97.8<br>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°C [遮光, 気密容器]

| 試験項目<br><規格>                 | 保存期間           |                |
|------------------------------|----------------|----------------|
|                              | 開始時            | 3 ヶ月           |
| 性状<br><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<br><30 分, 85%以上> | 100.0～102.8    | 100.3～102.2    |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95～105%>    | 99.8           | 98.4～98.7      |
| (参考値)<br>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°C・75%RH [遮光, 開放]

| 試験項目<br><規格>                 | 保存期間           |                |
|------------------------------|----------------|----------------|
|                              | 開始時            | 3 ヶ月           |
| 性状<br><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<br><30 分, 85%以上> | 100.0～102.8    | 98.6～102.3     |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95～105%>    | 99.8           | 99.4～99.7      |
| (参考値)<br>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°C・曝光 [気密容器]

| 試験項目<br><規格>                 | 保存期間           |                |
|------------------------------|----------------|----------------|
|                              | 開始時            | 3 ヶ月           |
| 性状<br><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<br><30 分, 85%以上> | 100.0～102.8    | 98.7～101.2     |
| 含量 (%) ※ n=3<br><95～105%>    | 99.8           | 97.0～97.8      |
| (参考値)<br>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℃ [遮光, 気密容器]

| 試験項目<br><規格>                | 保存期間           |                |
|-----------------------------|----------------|----------------|
|                             | 開始時            | 3 ヶ月           |
| 性状<br><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 (%)<br><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℃・75%RH [遮光, 開放]

| 試験項目<br><規格>                | 保存期間           |                |
|-----------------------------|----------------|----------------|
|                             | 開始時            | 3 ヶ月           |
| 性状<br><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 (%)<br><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℃・曝光 [気密容器]

| 試験項目<br><規格>                | 総曝光量           |                |
|-----------------------------|----------------|----------------|
|                             | 開始時            | 60 万 Lx・hr     |
| 性状<br><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 (%)<br><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 (%)

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)

該当資料なし

## 7. 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<sup>2)</sup>

<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

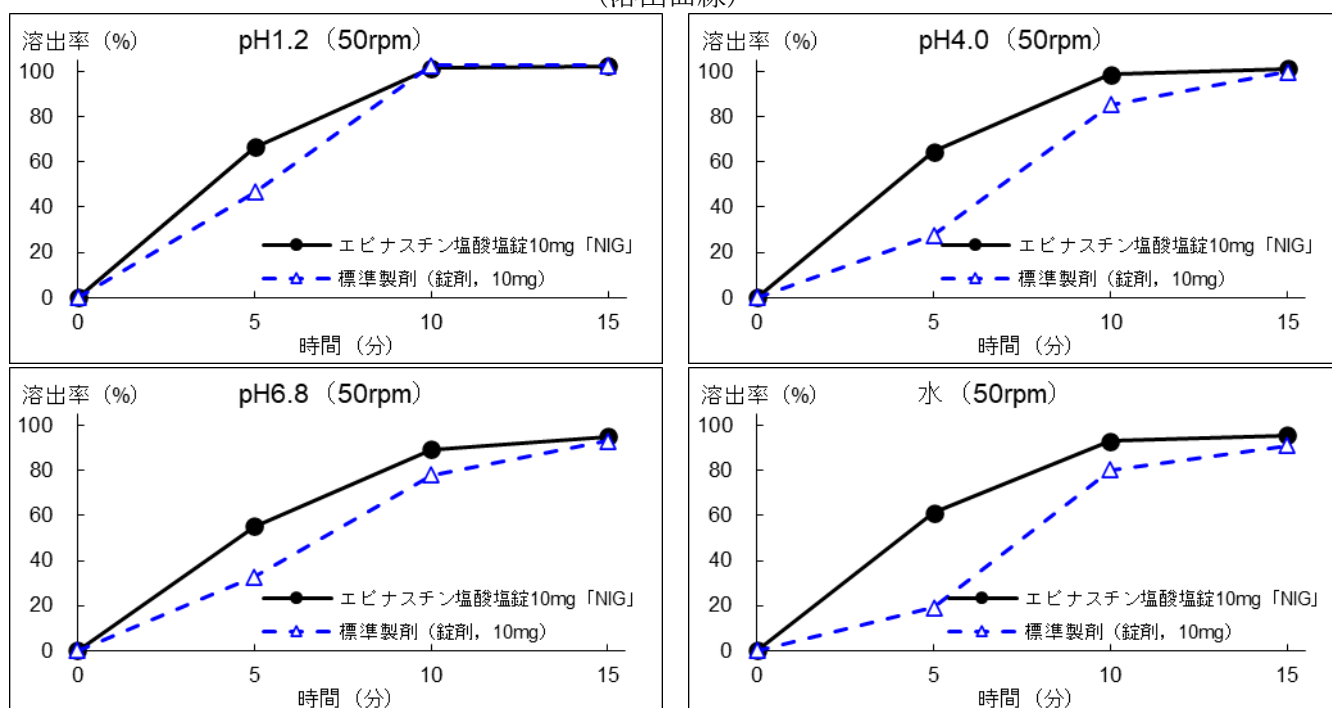
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水)

[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)



## <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

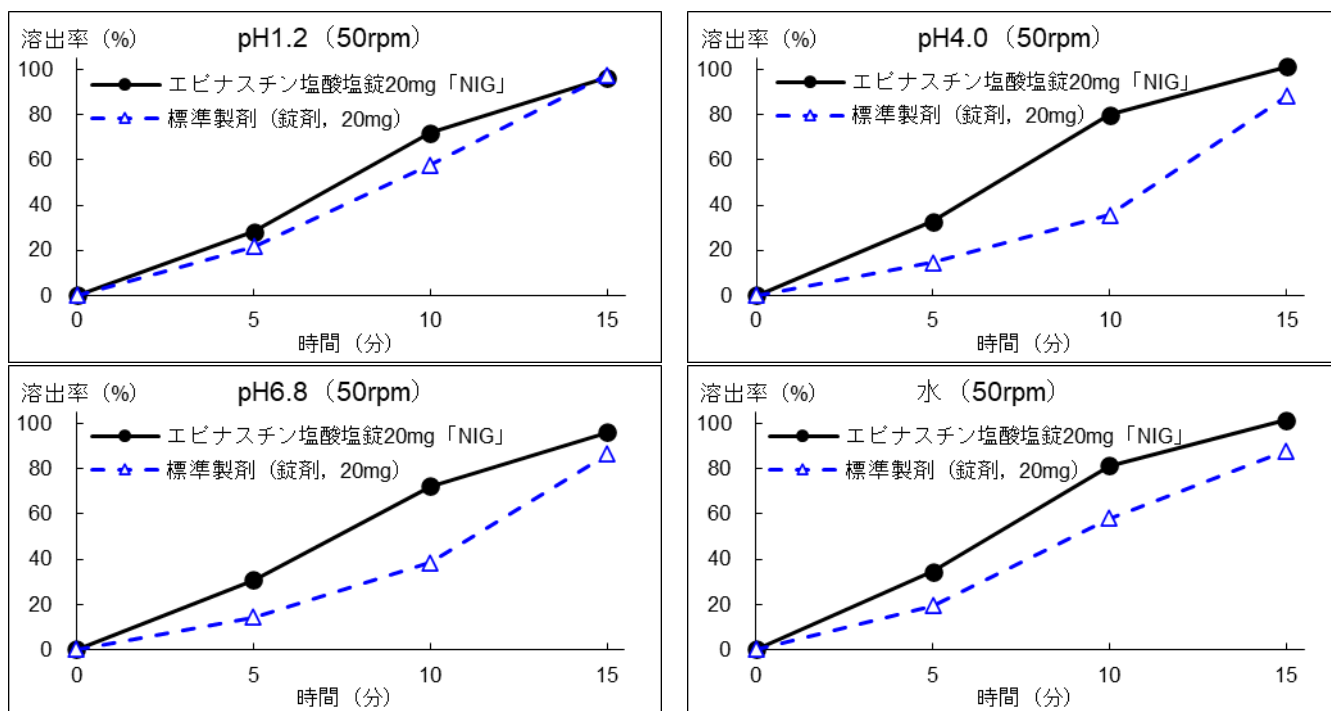
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水）

### [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）



## 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

<錠 10mg/錠 20mg>

### (1) ドラーゲンドルフ試液による沈殿反応

本品をジクロロメタンに浸し、ゆるく振り混ぜフィルムを除去し、風乾する。乾燥した錠剤を粉末とし、水を加えよく振り混ぜ遠心分離する。上澄液をろ過し、そのろ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

本品をジクロロメタンに浸し、ゆるく振り混ぜフィルムを除去し、風乾する。乾燥した錠剤を粉末とし、水を加えよく振り混ぜろ過する。ろ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。

<内用液 0.2%>

### (1) 紫外可視吸光度測定法

本品に、水酸化ナトリウム試液及びジエチルエーテルを加えて振り混ぜ、遠心分離する。ジエチルエーテル層を分取し、減圧乾固する。残留物に塩酸試液を加えて溶かした液につき、紫外可視吸光度測定法により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。

### (2) アルミニウム塩

本品に、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。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

<錠 10mg/錠 20mg>

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：1-ヘプタンスルホン酸ナトリウム，水，リン酸，アセトニトリル混液

<内用液 0.2%>

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸塩緩衝液，アセトニトリル，テトラヒドロフラン混液

## 11. 力価

該当資料なし

## 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

気管支喘息

アレルギー性鼻炎

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

### 2. 用法及び用量

<錠 10mg/錠 20mg>

(1) 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。

(2) 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。

<内用液 0.2%>

(1) 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。

(2) 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。

### 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）**

該当しない

**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. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ケトチフェンフマル酸塩, アゼラスチン塩酸塩, メキタジン, フェキソフェナジン塩酸塩, エバスチン, セチリジン塩酸塩, ベポタスチンベシル酸塩, エメダスチンフマル酸塩, オロパタジン塩酸塩, ロラタジン 等

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>3)</sup>

エピナスチンは、第二世代ヒスタミン (H<sub>1</sub>) 拮抗薬であり、アレルギー反応過程においてヒスタミン、ロイコトリエン、血小板活性化因子 (PAF) 等に対する抗メディエーター作用と遊離抑制作用を示す。

#### (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

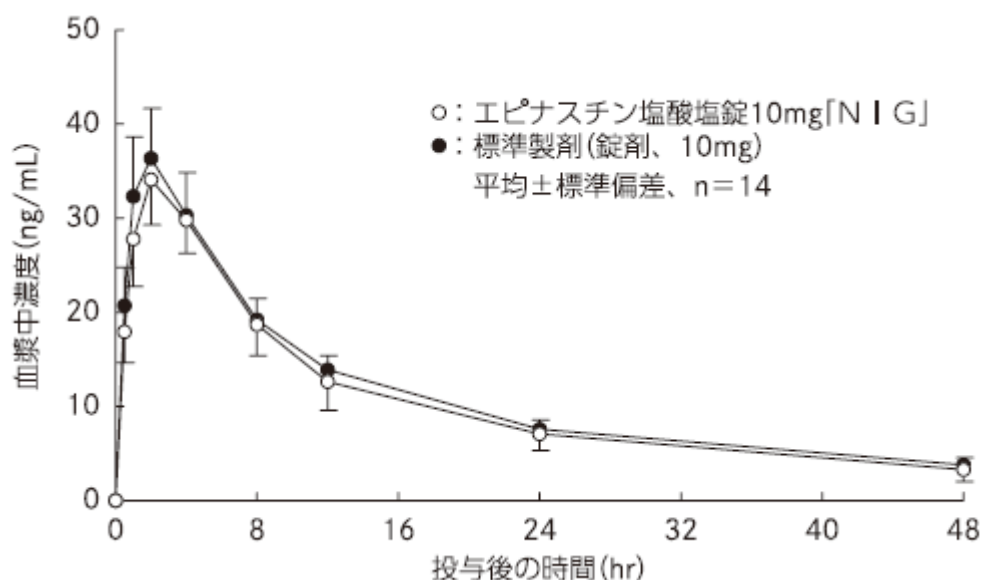
(「VII. 1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>4)</sup>

<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。



[薬物速度論的パラメータ]

|                          | 投与量<br>(mg) | AUC <sub>t</sub><br>(ng·hr/mL) | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
|--------------------------|-------------|--------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
| エピナスチン塩酸塩錠<br>10mg 「NIG」 | 20          | 514.4±84.3                     | 34.8±3.6        | 2.3±0.7      | 18.4±2.7                 |
| 標準製剤<br>(錠剤、10mg)        | 20          | 548.2±51.0                     | 37.3±6.1        | 1.9±0.7      | 20.1±3.0                 |

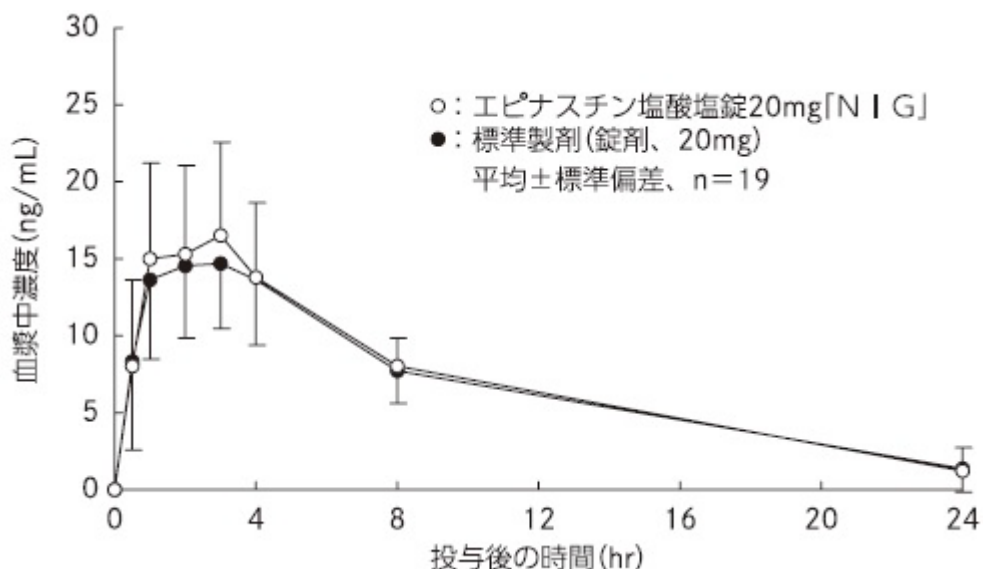
(mean±S.D. , n=14)

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。



[薬物速度論的パラメータ]

|                       | 投与量 (mg) | AUC <sub>t</sub> (ng·hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | T <sub>1/2</sub> (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               |
| 標準製剤 (錠剤, 20mg)       | 20       | 166.5±46.9                  | 16.13±5.05   | 2.2±1.0   | 7.4±3.5               |

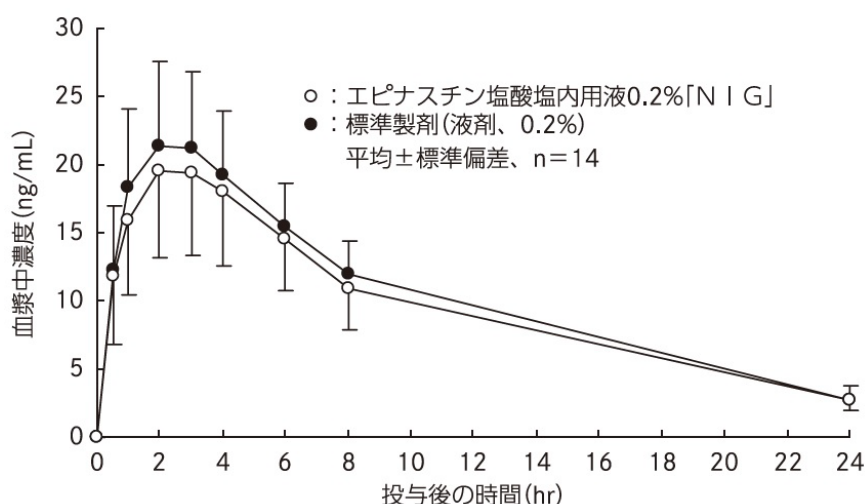
(mean±S.D. , n=19)

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」と標準製剤を、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。



[薬物速度論的パラメータ]

|                         | 投与量 (mg) | AUC <sub>t</sub> (ng·hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | T <sub>1/2</sub> (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             |
| 標準製剤 (液剤, 0.2%)         | 20       | 252.7 ± 49.0                | 22.7 ± 5.9   | 2.4 ± 0.9 | 7.5 ± 1.0             |

(mean ± S.D. , 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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

(「Ⅷ. 15. その他の注意」の項参照)

(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

(「X. 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦への投与」の項参照)

### (3) 乳汁への移行性

(「X. 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦への投与」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**

該当しない

**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）】

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〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 本剤は、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。
- (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は、好発季節を考慮して、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。

### 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）， $\gamma$ -GTP，Al-P，LDHの上昇等の肝機能障害（初期症状：全身倦怠感，食欲不振，発熱，嘔気・嘔吐等），黄疸があらわれることがあるので，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あらわれた場合には，症状に応じて適切な処置を行うこと。

|                           | 頻度不明   |
|---------------------------|--|
| <b>過敏症</b> <sup>注1)</sup> | 浮腫（顔面，手足等），発疹，蕁麻疹，かゆみ，そう痒性紅斑                           |
| <b>精神神経系</b>              | 眠気，倦怠感，頭痛，めまい，不眠，悪夢，しびれ感，頭がボーとした感じ，幻覚，幻聴               |
| <b>消化器</b>                | 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 |
| <b>腎臓</b>                 | 蛋白尿  |
| <b>泌尿器</b> <sup>注2)</sup> | 頻尿，血尿等の膀胱炎様症状，尿閉                                       |
| <b>循環器</b>                | 心悸亢進   |
| <b>呼吸器</b>                | 呼吸困難，去痰困難，鼻閉   |
| <b>血液</b> <sup>注2)</sup>  | 白血球数増加，血小板減少   |
| <b>その他</b>                | 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                        |

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**：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。

## 9. 高齢者への投与

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。

## 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

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。

## 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

**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，更には穿孔をお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)

## 15. その他の注意

本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)

## 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 「NIG」<br>エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」<br>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 |

### 2. 有効期間又は使用期限

錠 10mg/錠 20mg：3年（外装に表示の使用期限内に使用すること）

内用液 0.2%：2年（外装に表示の使用期限内に使用すること）

### 3. 貯法・保存条件

錠 10mg/錠 20mg：室温・気密容器保存

内用液 0.2%：しゃ光・気密容器保存（開栓後汚染に注意）

### 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

（「X. 3. 貯法・保存方法」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）

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」の項参照）

#### (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 「NIG」   | PTP包装：100錠（10錠×10）   |
| エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」   | PTP包装：100錠（10錠×10）、600錠（10錠×60）<br>140錠（14錠×10）、700錠（14錠×50） |
| エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」 | 70mL   |

### 7. 容器の材質

|                         |                            |
|-------------------------|----------------------------|
| 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」 | 褐色ガラス容器                    |

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：アレジオン錠 10/20/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                     | 製造承認年月日    | 承認番号             |
|-------------------------|------------|------------------|
| エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」   | 2014年2月3日  | 22600AMX00126000 |
| エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」   | 2014年1月17日 | 22600AMX00043000 |
| エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」 | 2009年4月28日 | 22100AMX00681000 |

| 旧販売名                     | 製造承認年月日    | 承認番号             |
|--------------------------|------------|------------------|
| エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「テバ」     | 2014年2月3日  | 22600AMX00126000 |
| エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「テバ」     | 2014年1月17日 | 22600AMX00043000 |
| 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 |

| 旧販売名                   | 製造承認年月日    | 承認番号             |
|------------------------|------------|------------------|
| エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「タイヨー」 | 2011年7月15日 | 22300AMX00745000 |
| エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「タイヨー」 | 2009年4月28日 | 22100AMX00680000 |
| アプラチン内服液 0.2%          | 2006年3月15日 | 21800AMZ10307000 |

| 旧販売名        | 製造承認年月日    | 承認番号             |
|-------------|------------|------------------|
| アプラチン錠 20mg | 2002年3月14日 | 21400AMZ00323000 |

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 「NIG」   | 2022年12月9日 |
| エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「NIG」   | 2022年12月9日 |
| エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「NIG」 | 2022年5月25日 |

| 旧販売名                     | 薬価基準収載年月日  |
|--------------------------|------------|
| エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「テバ」     | 2015年6月19日 |
| エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「テバ」     | 2015年6月19日 |
| エピナスチン塩酸塩内用液 0.2% 「タイヨー」 | 2009年9月25日 |

| 旧販売名                   | 薬価基準収載年月日   |
|------------------------|-------------|
| エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「タイヨー」 | 2011年11月28日 |
| エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「タイヨー」 | 2009年9月25日  |
| アプラチン内服液 0.2%          | 2006年7月7日   |

| 旧販売名        | 薬価基準収載年月日 |
|-------------|-----------|
| アプラチン錠 20mg | 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. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

#### 16. 各種コード

| 販売名                       | 薬価基準収載<br>医薬品コード          | レセプト<br>電算コード | HOT(9桁)<br>コード |
|---------------------------|---------------------------|---------------|----------------|
| エピナスチン塩酸塩錠<br>10mg「NIG」   | 4490014F1017<br>(統一収載コード) | 622103503     | 121035403      |
| エピナスチン塩酸塩錠<br>20mg「NIG」   | 4490014F2013<br>(統一収載コード) | 621486203     | 114862603      |
| エピナスチン塩酸塩内用液<br>0.2%「NIG」 | 4490014S1058              | 621730503     | 117305503      |

| 旧販売名                       | 薬価基準収載<br>医薬品コード          | レセプト<br>電算コード | HOT(9桁)<br>コード |
|----------------------------|---------------------------|---------------|----------------|
| エピナスチン塩酸塩錠<br>10mg「テバ」     | 4490014F1017<br>(統一収載コード) | 622103502     | 121035402      |
| エピナスチン塩酸塩錠<br>20mg「テバ」     | 4490014F2013<br>(統一収載コード) | 621486202     | 114862602      |
| エピナスチン塩酸塩内用液<br>0.2%「タイヨー」 | 4490014S1040              | 621730501     | 117305502      |

#### 17. 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) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 3) 宮下：薬局, 51 (10) , 2225 (2000)
- 4) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)

### **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

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<br>アレルギー性鼻炎<br>蕁麻疹，湿疹・皮膚炎，皮膚そう痒症，痒疹，<br>そう痒を伴う尋常性乾癬 | <錠10mg/錠20mg><br>(1) 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：<br>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。<br>(2) アレルギー性鼻炎：<br>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。<br><内用液0.2%><br>(1) 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：<br>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。<br>(2) アレルギー性鼻炎：<br>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。 |

<FDA (USA) , 2022年12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                          |
| <b>INDICATIONS AND USAGE</b>  |  |
| Epinastine HCl Ophthalmic Solution 0.05% is indicated for the prevention of itching associated with allergic conjunctivitis.  |  |
| <b>DOSAGE AND ADMINISTRATION</b>  |  |
| 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) 粉碎

##### 粉碎物の安定性試験

##### エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「NIG」

エピナスチン塩酸塩錠 10mg「NIG」の粉碎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°C・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。

#### ● 粉碎物 25°C・75%RH [遮光・開放]

| 試験項目<br><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<br><95~105%> | 99.4~100.0 | 99.3~99.7 |

※：表示量に対する含有率 (%)

#### ● 粉碎物 25°C・60%RH・曝光量 60 万 Lx・hr [遮光・開放]

| 試験項目<br><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<br><95~105%> | 99.4~100.0 | <b>93.1~93.8</b> |

※：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<br><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<br><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<br><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、<br>一部塊があった※2 | 白色の粉末で、<br>一部塊があった※2 |
| 含量 (%) *1 n=3<br><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<br><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<br><93~107%> | 911491 | 97.1~97.3 | <b>92.5~92.8</b> |

※：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の通過性

### 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℃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<br>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℃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<br>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

なし