

アレルギー性疾患治療剤

エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」 エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」

Epinastine Hydrochloride Tab.
(エピナスチン塩酸塩製剤)

貯法：気密容器、室温保存
使用期限：容器に表示の使用期限内
に使用すること

	10mg	20mg
承認番号	22300AMX00368	22300AMX00369
※薬価収載	2011年6月	2011年6月
※販売開始	2011年6月	2011年6月

【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

【組成・性状】
〈組成〉

販売名	エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」	エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」
成分・含量 (1錠中)	エピナスチン塩酸塩 10 mg 20 mg	
添加物	乳糖水和物、結晶セルロース、部分アルファ- 化デンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、 ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、 マクロゴール、酸化チタン	

〈製剤の性状〉

エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」：白色～微黄白色のフィルム
コーティング錠である。
エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」：白色～微黄白色のフィルム
コーティング錠である。

	外 形	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)	識別コード
錠10mg		6.1	3.0	88	CHO25
錠20mg		8.1	3.5	176	CHO26

【効能・効果】

気管支喘息
アレルギー性鼻炎
蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬

【用法・用量】

- 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。

※※【使用上の注意】

- 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。〕
- 重要な基本的注意
 - 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。
 - 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。
 - 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。
 - 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。
 - 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。

3. 副作用

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。

1) 重大な副作用（頻度不明）

(1) 肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、Al-P、LDHの上昇等の肝機能障害（初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気・嘔吐等）、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) 血小板減少：血小板減少があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

2) 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
過敏症 ^{注1)}	浮腫（顔面、手足等）、発疹、蕁麻疹、かゆみ、掻痒性紅斑
※※精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、めまい、不眠、悪夢、しびれ感、頭がボーッとした感じ、幻覚、幻聴
消化器	嘔気、胃部不快感、腹痛、口渇、口内炎、食欲不振、嘔吐、胃重感、胃もたれ感、下痢、便秘、口唇乾燥感、腹部膨満感
腎臓	蛋白尿
泌尿器 ^{注2)}	頻尿、血尿等の膀胱炎様症状、尿閉
循環器	心悸亢進
呼吸器	呼吸困難、去痰困難、鼻閉
血液 ^{注2)}	白血球数増加、血小板減少
その他	月経異常、ほてり、にがみ、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. 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。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 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。〕
- 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。〕

6. 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。

7. 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。）

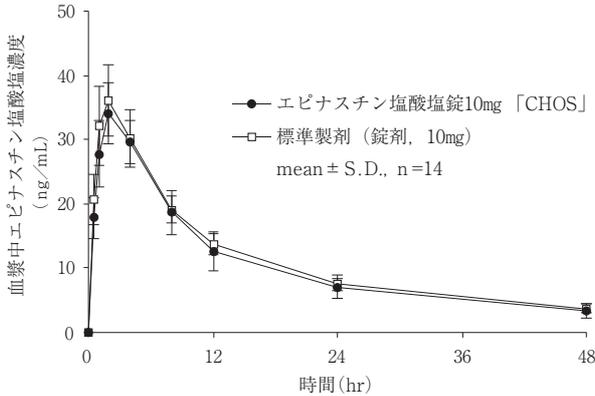
8. その他の注意

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。)

【薬物動態】¹⁾²⁾³⁾⁴⁾

1. 生物学的同等性試験

- 1) エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」
 エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」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)を健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中エピナスチン塩酸塩濃度を測定し、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)~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。

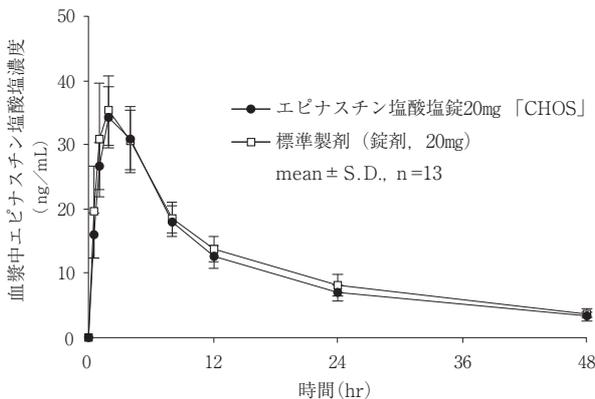


血漿中濃度並びにAUC, Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	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「CHOS」	514.4 ± 84.3	34.8 ± 3.6	2.3 ± 0.7	18.4 ± 2.7
標準製剤(錠剤, 10mg)	548.2 ± 51.0	37.3 ± 6.1	1.9 ± 0.7	20.1 ± 3.0

(mean ± S.D., n=14)

- 2) エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」
 エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」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)を健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中エピナスチン塩酸塩濃度を測定し、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)~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。



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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	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20mg「CHOS」	509.7 ± 54.0	34.7 ± 4.6	2.3 ± 0.8	18.9 ± 2.2
標準製剤(錠剤, 20mg)	552.9 ± 68.7	37.2 ± 6.3	2.0 ± 1.0	19.8 ± 2.0

(mean ± S.D., n=13)

2. 溶出挙動

- 1) エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」
 エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたエピナスチン塩酸塩10mg錠の溶出規格に適合していることが確認されている。
- 2) エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」
 エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたエピナスチン塩酸塩20mg錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エピナスチン塩酸塩

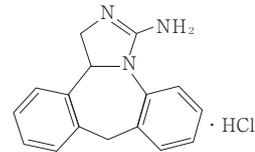
(Epinastine Hydrochloride)

化学名：(±)-3-Amino-9,13b-dihydro-1*H*-dibenz[*c,f*]imidazo[1,5-*a*]azepine hydrochloride

分子式：C₁₆H₁₃N₃·HCl

分子量：285.77

構造式：



性状：エピナスチン塩酸塩は白色～微黄色の粉末である。

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。エタノール(95)溶液(1→100)は旋光性を示さない。

融点：約270℃(分解)

【取扱い上の注意】⁵⁾⁶⁾

安定性試験

- 1) エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」
 最終包装製品を用いた加速試験(40℃, 相対湿度75%, 6ヵ月)の結果、エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」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。
- 2) エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」
 最終包装製品を用いた加速試験(40℃, 相対湿度75%, 6ヵ月)の結果、エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」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。

【包装】

エピナスチン塩酸塩錠10mg「CHOS」

……………PTP100錠(10錠×10)・500錠(10錠×50)

エピナスチン塩酸塩錠20mg「CHOS」

……………PTP100錠(10錠×10)・500錠(10錠×50)

【主要文献】

- 1) シー・エイチ・オー新薬(株) 社内資料(生物学的同等性試験に関する資料)
- 2) シー・エイチ・オー新薬(株) 社内資料(生物学的同等性試験に関する資料)
- 3) シー・エイチ・オー新薬(株) 社内資料(溶出試験に関する資料)
- 4) シー・エイチ・オー新薬(株) 社内資料(溶出試験に関する資料)
- 5) シー・エイチ・オー新薬(株) 社内資料(安定性試験に関する資料)
- 6) シー・エイチ・オー新薬(株) 社内資料(安定性試験に関する資料)

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

マイラン製薬株式会社 カスタマーサポートセンター

〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

フリーダイヤル：0120-066-720 FAX：0120-996-185

(9:00~17:00/土日祝日を除く)

発売元

マイラン製薬株式会社

大阪市中央区本町2丁目6番8号

製造販売元

シー・エイチ・オー新薬株式会社

徳島市国府町府中439番地