

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「イワキ」

# エピナスチン塩酸塩錠20mg「イワキ」

Epinastine Hydrochloride Tablets 10mg・20mg "IWAKI"

貯法：室温保存

有効期間：3年

	錠10mg	錠20mg
承認番号	30200AMX00709	30200AMX00710
販売開始	2011年11月	2002年7月

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

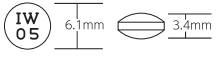
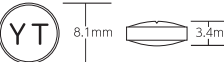
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

販売名	エピナスチン塩酸塩錠10mg 「イワキ」	エピナスチン塩酸塩錠20mg 「イワキ」
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	プロピレングリコール、乳糖水和物、結晶セルロース、低置換度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、酸化チタン、青色2号	

### 3.2 製剤の性状

販売名	エピナスチン塩酸塩錠10mg 「イワキ」	エピナスチン塩酸塩錠20mg 「イワキ」
剤形	白色のフィルムコーティング錠	
外形		
識別コード (PTP)	YT10	YT20
識別コード (錠剤)	IW05	YT

## 4. 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

## 6. 用法及び用量

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症、痒疹、そう痒を伴う尋常性乾癬〉

通常、成人にはエピナスチン塩酸塩として1回20mgを1日1回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈アレルギー性鼻炎〉

通常、成人にはエピナスチン塩酸塩として1回10～20mgを1日1回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

## 8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

- 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。
- 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、すでに起き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。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

### 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。

### 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。

### 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。

### 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。

### 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。

### 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。

## 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。

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 肝機能障害、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、 $\gamma$ -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。

11.1.2 血小板減少（頻度不明）

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、頭がぼーっとした感じ	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

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。

15. その他の注意

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

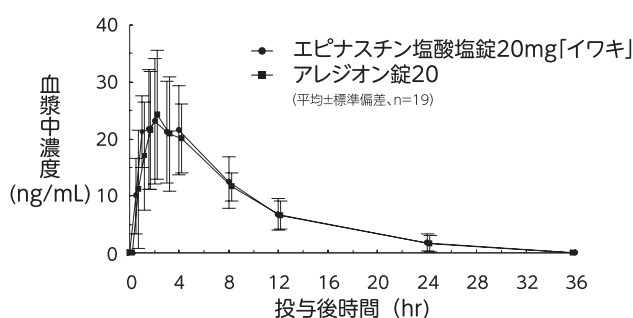
16.1.1 健康成人にエピナスチン塩酸塩錠 20mg を経口投与した場合、1.9 時間で最高血漿中濃度に達する。血漿中濃度消失半減期は 9.2 時間である<sup>1)</sup>。

16.1.2 生物学的同等性試験

〈エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「イワキ」〉

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「イワキ」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 19 名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）90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.8）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>2)</sup>。

血漿中エピナスチン塩酸塩濃度の推移



薬物動態パラメータ

	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-36hr</sub> (ng·hr/mL)
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「イワキ」	2.0±1.0	27.72±8.90	7.0±2.7	243.39±77.81
アレジオン錠 20	2.3±1.0	27.90±10.53	6.1±1.3	231.50±67.59

(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。

16.2 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<sup>3)</sup>。

16.3 分布

動物実験（ラット）で<sup>14</sup>C-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<sup>4)、5)</sup>。

16.4 代謝

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<sup>6)</sup>。

16.5 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<sup>7)</sup>。

16.8 その他

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」〉

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」はエピナスチン塩酸塩錠 20mg 「イワキ」と成分組成比が類似しており、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査発第 1124004 号）」に基づく溶出挙動の比較により、10mg 錠は 20mg 錠と同等とみなされた<sup>2)</sup>。

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」及びエピナスチン塩酸塩錠 20mg 「イワキ」は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたエピナスチン塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている<sup>8)</sup>。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈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錠 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錠 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。

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錠 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<sup>注 1)、9)</sup>。

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錠 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錠 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。

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<sup>注1),10)</sup>。

### 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 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。

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<sup>注1),11)</sup>。

注1) 1 例に複数の副作用がある。

### 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 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。

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<sup>12)</sup>。

### 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 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。

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<sup>13)</sup>。

### 〈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、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。

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<sup>14)</sup>。

### 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 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。

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<sup>注2),15)</sup>。

### 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 10mg 1 日 1 回又はアゼラスチン 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。

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<sup>注2),16)</sup>。

注2) 1 例に複数の副作用がある。

### 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 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。

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<sup>17)</sup>。

### 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 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。

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<sup>18)</sup>。



〈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〉

17.1.11 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 日 1 回及び 20mg 日 2 回を 7 日間経口投与した結果、10mg 又は 20mg 日 1 回投与群では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。

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<sup>注3) 19)</sup>。

17.1.12 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 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。

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<sup>注3) 20)</sup>。

17.1.13 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 日 1 回又はケトチフェン 1mg 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。

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<sup>注3) 21)</sup>。

17.1.14 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 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。

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<sup>22)</sup>。

17.1.15 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 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。

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<sup>注3) 23)</sup>。

17.1.16 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 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。

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<sup>注3) 24)</sup>。

注3) 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 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。

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<sup>25)</sup>。

17.1.18 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 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。

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<sup>26)</sup>。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

選択的ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用を主作用とし、ロイコトリエン C<sub>4</sub> (LTC<sub>4</sub>)、血小板活性化因子 (PAF) 等に対する抗メデイエーター作用やヒスタミン及び SRS-A のメデイエーター遊離抑制作用を示す<sup>27)、28)、29)</sup>。

18.2 選択的 H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用

モルモット、ラット H<sub>1</sub> 受容体に対する結合親和性は、H<sub>2</sub> 受容体及びムスカリン受容体に比べ非常に高かった<sup>27)</sup>。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<sup>27)、28)</sup>。

### 18.3 ロイコトリエン C<sub>4</sub> (LTC<sub>4</sub>) 及び PAF 拮抗作用

LTC<sub>4</sub> 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<sup>28)</sup>。

### 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<sup>29)</sup>。

### 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<sup>30)</sup>。

### 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<sup>31)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：エピナスチン塩酸塩

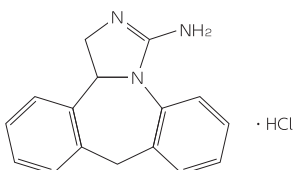
(Epinastine Hydrochloride)

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

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub> · HCl

性状：白色～微黄色の粉末で、においはなく、味は苦い。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。水溶液 (1→10) は旋光性を示さない。

化学構造式：



融点：約 270°C (分解)

## 22. 包装

〈エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「イワキ」〉

100 錠[10 錠(PTP)×10]

〈エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「イワキ」〉

100 錠[10 錠(PTP)×10]

500 錠[10 錠(PTP)×50]

## 23. 主要文献

- 1) 東純一 他：臨床医薬. 1992；8(suppl.1)：3-24
- 2) 岩城製薬株式会社 社内資料 (生物学的同索性)
- 3) 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)
- 4) 大岩陽子 他：薬理と治療. 1992；20(2)：483-506
- 5) 大岩陽子 他：薬理と治療. 1992；20(2)：507-525
- 6) 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)
- 7) 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)
- 8) 岩城製薬株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 9) 瀧島任 他：臨床医薬. 1992；8(Suppl.1)：97-126
- 10) 瀧島任 他：臨床医薬. 1992；8(Suppl.1)：157-184
- 11) 瀧島任 他：臨床医薬. 1992；8(1)：169-197
- 12) 吉田稔 他：臨床医薬. 1992；8(Suppl.1)：185-214
- 13) 三浦一樹 他：臨床医薬. 1992；8(Suppl.1)：215-231
- 14) 奥田稔 他：耳鼻咽喉科展望. 1992；35(補2)：61-79

- 15) 奥田稔 他：耳鼻咽喉科展望. 1992；35(補4)：269-288
- 16) 奥田稔 他：耳鼻咽喉科展望. 1992；35(補4)：289-312
- 17) 遠藤朝彦 他：耳鼻咽喉科展望. 1992；35(補6)：447-467
- 18) 高坂知節 他：耳鼻咽喉科展望. 1992；35(補5)：409-422
- 19) 久木田淳 他：臨床医薬. 1992；8(Suppl.1)：25-41
- 20) 久木田淳 他：臨床医薬. 1992；8(Suppl.1)：43-57
- 21) 久木田淳 他：臨床医薬. 1991；7(10)：2303-2320
- 22) 久木田淳 他：臨床医薬. 1992；8(Suppl.1)：59-71
- 23) 久木田淳 他：臨床医薬. 1992；8(suppl.1)：73-86
- 24) 秋元隆道 他：皮膚. 1992；34(1)：105-118
- 25) 宮内俊次 他：西日本皮膚科. 1992；54(1)：143-152
- 26) 増谷衛 他：臨床医薬. 1992；8(suppl.1)：87-95
- 27) Fügner, A. et al. : Arzneimittelforschung. 1988；38(II)：1446-1453
- 28) Kamei, C. et al. : Immunopharmacology & Immunotoxicology. 1992；14(1&2)：207-218
- 29) Tasaka, K. et al. : 応用薬理. 1990；39(4)：365-373
- 30) 河野茂勝 他：応用薬理. 1991；42(2)：189-195
- 31) Schilling, J. C. et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. Toxicol. 1990；28：493-497

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

岩城製薬株式会社 マーケティング部 学術グループ  
〒103-8434 東京都中央区日本橋本町 4-8-2  
TEL 03-6626-6251 FAX 03-6626-6261

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元



**岩城製薬株式会社**

東京都中央区日本橋本町4-8-2