

貯 法：室温保存
有効期間：3年アレルギー性疾患治療剤
エピナスチン塩酸塩ドライシロップエピナスチン塩酸塩DS小児用1%「サワイ」
EPINASTINE HYDROCHLORIDE DS for Pediatric [SAWAI]

日本標準商品分類番号

87449

承認番号 22500AMX00368000

販売開始 2010年5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

有効成分 [1g中]	エピナスチン塩酸塩 10mg
添加剤	アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、エチルセルロース、エリスリトール、クエン酸トリエチル、軽質無水ケイ酸、サッカリンNa、セタノール、タウマチン、バニリン、ヒドロキシプロピルセルロース、没食子酸プロピル、D-マンニトール、ラウリル硫酸Na、リン酸水素2Na、香料

3.2 製剤の性状

剤形	ドライシロップ
性状	白色～帯黄白色の顆粒状の粉末

4. 効能又は効果

- アレルギー性鼻炎
- 蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒

6. 用法及び用量

〈アレルギー性鼻炎〉

通常、小児には1日1回0.025～0.05g/kg(エピナスチン塩酸塩として0.25～0.5mg/kg)を用時懸濁して経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。

ただし、1日投与量はドライシロップとして2g(エピナスチン塩酸塩として20mg)を超えないこと。年齢別の標準投与量は、通常、下記の用量を1日量とし、1日1回用時懸濁して経口投与する。

年齢	標準体重	1日用量
3歳以上	14kg以上	0.5～1g
7歳未満	24kg未満	(エピナスチン塩酸塩として5～10mg)
7歳以上	24kg以上	1～2g
		(エピナスチン塩酸塩として10～20mg)

〈蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症)に伴うそう痒〉

通常、小児には1日1回0.05g/kg(エピナスチン塩酸塩として0.5mg/kg)を用時懸濁して経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。

ただし、1日投与量はドライシロップとして2g(エピナスチン塩酸塩として20mg)を超えないこと。年齢別の標準投与量は、通常、下記の用量を1日量とし、1日1回用時懸濁して経口投与する。

年齢	標準体重	1日用量
3歳以上	14kg以上	1g
7歳未満	24kg未満	(エピナスチン塩酸塩として10mg)
7歳以上	24kg以上	2g
		(エピナスチン塩酸塩として20mg)

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危険を伴う機械の操作に注意させること。また、保護者に対しても注意を与えること。

8.2 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。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.3 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。

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 フェニルケトン尿症の患者

フェニルケトン尿症を悪化させるおそれがある。本剤は1g中85mgのアスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)を含有している。

9.3 肝機能障害患者

肝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

9.7.1 低出生体重児、新生児、乳児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。

9.7.2 小児気管支喘息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

定期的な副作用・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、 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)

11.2 その他の副作用

	0.5%以上	0.5%未満	頻度不明
過敏症		顔面浮腫	浮腫(手足等)、発疹、じん麻疹、かゆみ、そう痒性紅斑
精神神経系	眠気、頭痛	倦怠感、不快気分	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		腹痛、腹鳴、下痢、嘔気、咽頭痛、嘔吐	胃部不快感、口渇、口内炎、食欲不振、胃重感、胃もたれ感、便秘、口唇乾燥感、腹部膨満感
呼吸器		鼻出血、鼻閉	呼吸困難、去痰困難
肝臓		肝機能異常、ALT上昇	
腎臓	尿蛋白	BUN上昇、尿中赤血球、尿中白血球陽性	
泌尿器			頻尿、血尿等の膀胱炎様症状、尿閉

	0.5%以上	0.5%未満	頻度不明
循環器			心悸亢進
血液		白血球数減少	血小板減少、白血球数増加
眼		眼痛	
その他	にがみ		女性型乳房、乳房腫大、月経異常、ほてり、味覚低下、胸痛

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

14.1.1 用時調製の製剤であるので、調製後の保存は避け、水に懸濁した後は速やかに使用すること。やむを得ず保存を必要とする場合は、冷蔵庫内に保存し、できるかぎり速やかに使用すること。

14.1.2 他剤と配合した場合に、本剤の含量低下等の変化が認められているので、原則として他剤との配合は行わないこと。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

成人に錠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との報告がある。アレルギー性鼻炎患児に対しては就寝前投与、湿疹・皮膚炎の代表的疾患であるアトピー性皮膚炎患児に対しては朝食後投与で有効性、安全性が確認された。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

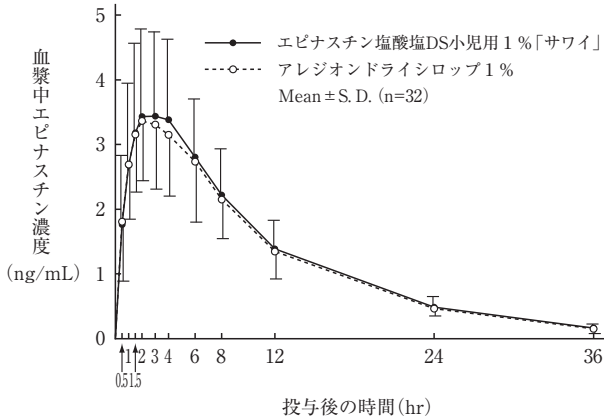
16.1.1 生物学的同等性試験

エピナスチン塩酸塩DS小児用1%「サワイ」とアレジオンドライシロップ1%を健康成人男子にそれぞれ0.5g(エピナスチン塩酸塩として5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中エピナスチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)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¹⁾。

各製剤0.5g投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-36hr} (ng·hr/mL)
エピナスチン塩酸塩DS小児用1%「サワイ」	3.75±1.42	3.0±1.3	7.9±1.3	45.06±14.29
アレジオンドライシロップ1%	3.59±1.01	2.5±1.1	8.0±1.3	43.54±11.50

(Mean±S. D.)



血漿中濃度ならびに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。

18. 薬効薬理

18.1 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)のメディエーターに対する抗メディエーター作用やヒスタミン及びSRS-Aのメディエーター遊離抑制作用を示す²⁾⁻⁴⁾。

19. 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)

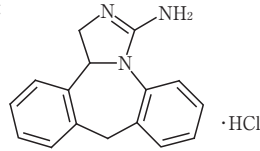
化学名：(±)-3-Amino-9,13b-dihydro-1H-dibenz[c,f]imidazo[1,5-a]azepine hydrochloride

分子式：C₁₆H₁₅N₃·HCl

分子量：285.77

融点：約270℃(分解)

構造式：



性状：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い。メタノール溶液(1→20)は旋光性を示さない。

20. 取扱い上の注意

開封後は湿気を避けて遮光して保存すること。

22. 包装

分包：0.5g×100包

バラ[乾燥剤入り]：100g

23. 主要文献

- 1) 陶易王他：新薬と臨床, 2010；59(3)：438-447
- 2) Fügner, A. et al.：Arzneim.-Forsch., 1988；38(II)：1446-1453
- 3) Kamei, C. et al.：Immunopharmacology & Immunotoxicology, 1992；14(1&2)：207-218
- 4) Tasaka, K. et al.：応用薬理, 1990；39：365-373

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30