

2024年10月改訂（第8版）

日本標準商品分類番号  
87449

## 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2008に準拠して作成（一部2018に準拠）

アレルギー性疾患治療剤

**エピナスチン塩酸塩錠10mg「VTRS」**  
**エピナスチン塩酸塩錠20mg「VTRS」**  
**EPINASTINE Hydrochloride Tablets**  
エピナスチン塩酸塩錠

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「VTRS」 1錠中 エピナスチン塩酸塩 10mg エピナスチン塩酸塩錠20mg「VTRS」 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：2011年 7月15日 薬価基準収載年月日：2022年 6月 1日 販売開始年月日：2011年12月 6日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販売元：ヴィアトリス製薬合同会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 <a href="https://www.viatris-e-channel.com/">https://www.viatris-e-channel.com/</a>

本IFは2024年7月改訂の電子化された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、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

## 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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

### 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 判、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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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。

(2008 年 9 月)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>
1. 開発の経緯 .....	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>
1. 販売名 .....	2
2. 一般名 .....	2
3. 構造式又は示性式 .....	2
4. 分子式及び分子量 .....	2
5. 化学名（命名法） .....	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3
7. CAS登録番号 .....	3
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>
1. 物理化学的性質 .....	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4
3. 有効成分の確認試験法 .....	4
4. 有効成分の定量法 .....	4
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>
1. 剤形 .....	5
2. 製剤の組成 .....	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	6
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	6
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	8
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	8
7. 溶出性 .....	8
8. 生物学的試験法 .....	11
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	11
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	11
11. 力価 .....	11
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	11
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 .....	12
14. その他 .....	12

<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>13</b>
1. 効能又は効果 .....	13
2. 効能又は効果に関連する注意 .....	13
3. 用法及び用量 .....	13
4. 用法及び用量に関連する注意 .....	13
5. 臨床成績 .....	13
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>19</b>
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 .....	19
2. 薬理作用 .....	19
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>20</b>
1. 血中濃度の推移・測定法 .....	20
2. 薬物速度論的パラメータ .....	22
3. 吸収 .....	22
4. 分布 .....	23
5. 代謝 .....	23
6. 排泄 .....	23
7. 透析等による除去率 .....	24
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>25</b>
1. 警告内容とその理由 .....	25
2. 禁忌内容とその理由 .....	25
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 .....	25
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 .....	25
5. 重要な基本的注意とその理由 .....	25
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....	25
7. 相互作用 .....	27
8. 副作用 .....	27
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	28
10. 過量投与 .....	28
11. 適用上の注意 .....	28
12. その他の注意 .....	28
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>29</b>
1. 薬理試験 .....	29
2. 毒性試験 .....	29

<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>30</b>
1. 規制区分 .....	30
2. 有効期間又は使用期限 .....	30
3. 貯法・保存条件 .....	30
4. 薬剤取扱い上の注意点 .....	30
5. 承認条件等 .....	30
6. 包装 .....	30
7. 容器の材質 .....	30
8. 同一成分・同効薬 .....	31
9. 国際誕生年月日 .....	31
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 .....	31
11. 薬価基準収載年月日 .....	31
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.....	31
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	31
14. 再審査期間 .....	31
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 .....	31
16. 各種コード .....	31
17. 保険給付上の注意 .....	32
<b>XI. 文献</b> .....	<b>33</b>
1. 引用文献 .....	33
2. その他の参考文献 .....	34
<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>35</b>
1. 主な外国での発売状況 .....	35
2. 海外における臨床支援情報 .....	35
<b>XIII. 備考</b> .....	<b>36</b>
その他の関連資料 .....	36

---

## 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、選択的なヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用に加え、種々の抗メディエーター作用とメディエーター遊離抑制作用とを併せ持つ。また、中枢神経抑制作用は弱く、抗アレルギー作用は持続的である。

エピナスチン塩酸塩錠 10mg・20mg「ファイザー」は、ファイザー株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく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 月に承認を得た製剤である。

2022 年 6 月、マイラン製薬株式会社からマイラン EPD 合同会社（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社）へ製造販売移管したため、販売名をエピナスチン塩酸塩錠 10mg・20mg「V T R S」に変更した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

#### 1. ケミカルメディエーター抑制作用を持つアレルギー性疾患治療剤

エピナスチン塩酸塩は選択的ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体拮抗作用を示し、アレルギー反応におけるロイコトリエン C<sub>4</sub> や PAF（血小板活性化因子）などに対する抗メディエーター作用及びヒスタミン、SRS-A といったメディエーターの遊離抑制作用も併せ持つ。これらの作用により、1 日 1 回投与で、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に効果を示す。また、抗アレルギー作用は持続的で、中枢神経抑制作用は弱い。

（「VI. 薬効薬理に関する項目 2. 薬理作用」の項参照）

#### 2. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み

- 1) 包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント\*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている<sup>1)~3)</sup>。
- 2) 規格取り違えを防ぐための試みとして複数規格ある含量表示に上下の記号（△▽）をラベル・小函に表記した。上の規格（高用量）がある場合は、記載含量の上に△を配置し、下の規格（低用量）がある場合は、記載含量の下に▽を配置した。単一規格のみの場合、記載含量を△▽で囲んだ。

#### 3. 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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 8. 副作用」の項参照）

\*「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

---

## 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 「V T R S」

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」

#### (2) 洋名

EPINASTINE Hydrochloride Tablets

#### (3) 名称の由来

有効成分であるエピナスチン塩酸塩に剤形、含量及び「V T R S」を付した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

エピナスチン塩酸塩（JAN）

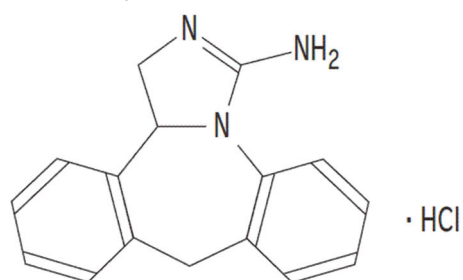
#### (2) 洋名（命名法）

Epinastine Hydrochloride（JAN）

#### (3) ステム

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<sub>16</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub> · 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

該当資料なし

7. CAS 登録番号

108929-04-0

---

### 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

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

分配係数： $9.2 \times 10^{-2}$ （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

ドラーゲンドルフ試液による定性反応

紫外可視吸光度測定法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

塩化物の定性反応







#### 4. 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、規格及び性状

販売名	外 形			色調等
	上面	下面	側面	
エピナスチン 塩酸塩錠 10mg 「V T R S」				白色～微黄色 フィルムコーティング錠
	直径 6.6mm	厚さ 3.2mm	重量 103mg	
エピナスチン 塩酸塩錠 20mg 「V T R S」				
	直径 8.1mm	厚さ 3.7mm	重量 175mg	

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」 ET 10  
VLE  
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」 ET 20  
VLE

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」

1錠中 エピナスチン塩酸塩 10mg

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」

1錠中 エピナスチン塩酸塩 20mg

#### (2) 添加物

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、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、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマーエマルジョン、タルク、酸化チタン

(3) その他

該当資料なし

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

加速試験<sup>4)、5)</sup>

試験条件：40±1℃、75±5%RH

<エピナスチン塩酸塩錠 10mg「V T R S」>

包装形態：PTP 包装

項目及び規格	試験開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
溶出試験（85%以上）	100.8～101.2	98.5～99.8	99.5～100.4	97.3～100.4
定量試験（93.0～107.0%）	99.0～99.7	98.4～98.9	98.4～99.0	100.0～100.8
純度試験（総類縁物質 1.0%以下）	0.17～0.20	0.10	0.10～0.12	0.11～0.20
硬度（30N 以上）	55.0～60.7	59.0～61.7	58.3～63.3	58.3～61.7

ロット数：3

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、エピナスチン塩酸塩錠 10mg「V T R S」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 20mg「V T R S」>

包装形態：PTP 包装

項目及び規格	試験開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
溶出試験（85%以上）	100.1～102.3	98.2～99.7	98.4～101.3	100.7～102.1
定量試験（93.0～107.0%）	98.9～102.1	98.6～101.9	98.1～101.1	99.7～102.8
純度試験（総類縁物質 1.0%以下）	0.12～0.16	0.09～0.11	0.10	0.15～0.17
硬度（30N 以上）	68.3～74.7	72.7～75.7	75.0～80.0	68.7～73.3

ロット数：3

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、エピナスチン塩酸塩錠 20mg「V T R S」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。

無包装状態での安定性<sup>6)</sup>

試験条件：温度：40℃、75%RH（褐色ガラス瓶・気密）

湿度：25℃、75%RH（褐色ガラス瓶・開放）

光：25℃、45%RH、2500Lux（シャーレ開放）

測定時期：①、②開始時、1、2、3ヵ月後

③開始時、5日（30万Lux・hr）、10日（60万Lux・hr）、20日（120万Lux・hr）

試験項目：性状、含量、溶出性

試験回数：性状3回、含量3回、溶出性1回（6ベッセル）

<エピナスチン塩酸塩錠 10mg「VTR S」>

①温度に対する安定性試験 [40℃/75%RH]

試験項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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	白色の フィルムコーティング錠
含量 (%) [残存率 (%)]	99.7 [100.0]	99.3 [99.6]	99.6 [99.9]	101.0 [101.3]
溶出性 (%)	100.5	100.1	100.2	99.9

②湿度に対する安定性試験 [25℃/75%RH]

試験項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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	白色の フィルムコーティング錠
含量 (%) [残存率 (%)]	99.7 [100.0]	99.8 [100.1]	101.3 [101.6]	99.6 [99.9]
溶出性 (%)	100.5	100.5	98.9	99.7

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

試験項目	測定時期			
	開始時	30万Lux・hr	60万Lux・hr	120万Lux・hr
性状	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	白色の フィルムコーティング錠
含量 (%) [残存率 (%)]	99.7 [100.0]	99.0 [99.3]	99.1 [99.4]	98.9 [99.2]
溶出性 (%)	100.5	100.2	101.0	99.9

<エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」>

①温度に対する安定性試験 [40°C/75%RH]

試験項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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	白色の フィルムコーティング錠
含量 (%) [残存率 (%) ]	99.1 [100.0]	99.0 [99.9]	100.6 [101.5]	100.8 [101.7]
溶出性 (%)	100.2	100.5	97.5	98.7

②湿度に対する安定性試験 [25°C/75%RH]

試験項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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	白色の フィルムコーティング錠
含量 (%) [残存率 (%) ]	99.1 [100.0]	98.5 [99.4]	99.6 [100.5]	101.5 [102.4]
溶出性 (%)	100.2	100.4	98.6	98.6

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

試験項目	測定時期			
	開始時	30万Lux・hr	60万Lux・hr	120万Lux・hr
性状	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	白色の フィルムコーティング錠
含量 (%) [残存率 (%) ]	99.1 [100.0]	99.8 [100.7]	99.5 [100.4]	98.7 [99.6]
溶出性 (%)	100.2	98.6	100.0	100.8

※本剤の無包装状態での保存は弊社としては推奨していない。

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）

該当しない

7. 溶出性

溶出挙動<sup>7)、8)</sup>

①エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」

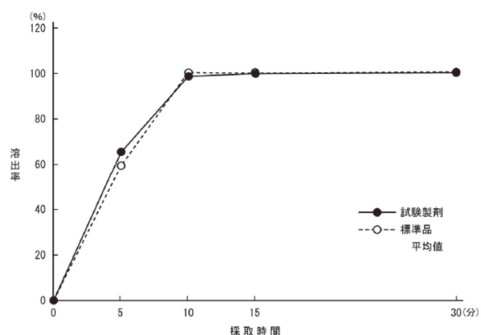
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」と標準品の溶出試験を実施した結果、エピナスチン塩酸塩錠 10mg はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

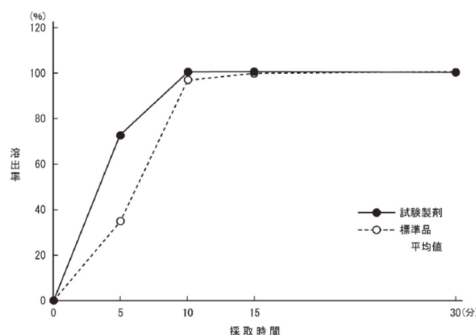
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液) pH4.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液) pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液) 水	900mL	50rpm

n=6

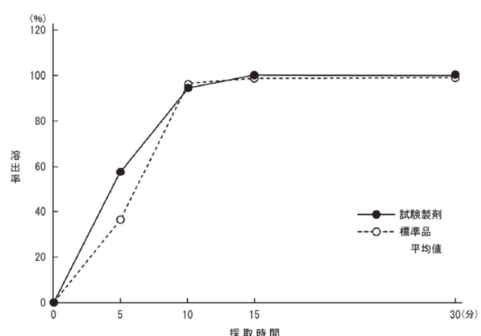
pH1.2 (50rpm)



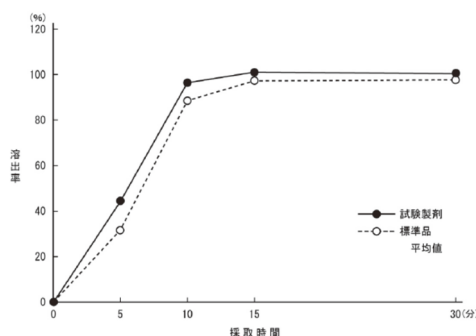
pH4.0 (50rpm)



pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)			
		5分	10分	15分	30分
pH1.2 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 10mg「VTRS」	65.4	99.3	100.5	100.5
	標準品	59.5	100.6	100.7	100.6
pH4.0 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 10mg「VTRS」	73.1	101.4	101.3	101.3
	標準品	34.9	97.6	100.7	101.0
pH6.8 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 10mg「VTRS」	57.9	95.2	100.6	100.7
	標準品	36.5	96.2	99.3	99.4
水 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 10mg「VTRS」	44.4	96.4	101.0	100.9
	標準品	31.7	88.5	97.2	97.7

平均値 n=6

## 公的溶出試験

エピナスチン塩酸塩錠 10mg「V T R S」は、日本薬局方外医薬品規格第三部に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。

(規格：30分で85%以上)

試験液	判定時点	溶出率 (%)		
		ロット A	ロット B	ロット C
水	30分	99.1~102.6	97.9~103.0	99.3~103.5
判定		適合	適合	適合

n=6

## ②エピナスチン塩酸塩錠 20mg「V T R S」

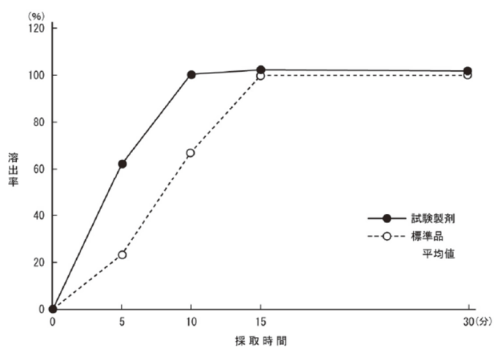
エピナスチン塩酸塩錠 20mg「V T R S」と標準品の溶出試験を実施した結果、エピナスチン塩酸塩錠 20mg はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

### 試験条件

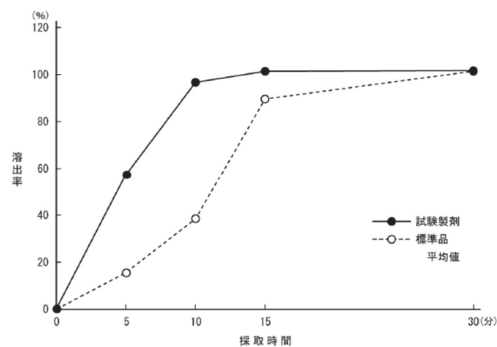
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液) pH4.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液) pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液) 水	900mL	50rpm

n=6

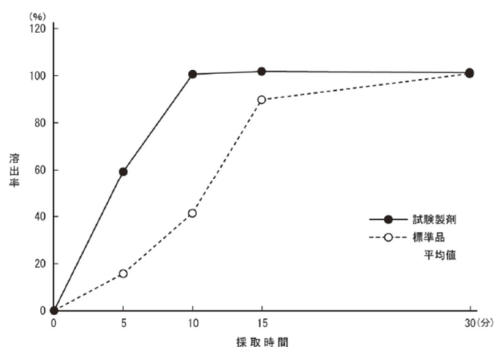
pH1.2 (50rpm)



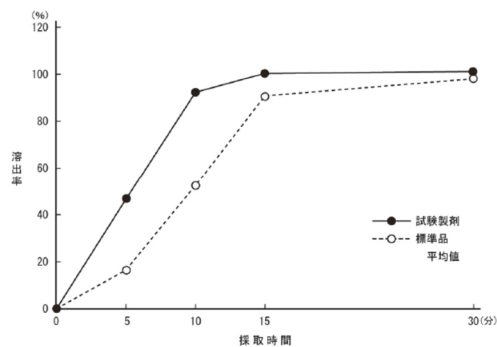
pH4.0 (50rpm)



pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)





試験条件	薬剤	溶出率 (%)			
		5分	10分	15分	30分
pH1.2 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 20mg「VTRS」	62.4	101.2	103.0	102.9
	標準品	23.2	67.5	100.7	100.8
pH4.0 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 20mg「VTRS」	57.3	97.7	101.4	101.6
	標準品	15.1	38.4	89.6	101.4
pH6.8 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 20mg「VTRS」	59.3	101.2	102.5	102.3
	標準品	15.4	41.2	90.6	102.1
水 50rpm	エピナスチン塩酸塩錠 20mg「VTRS」	46.9	93.2	101.2	102.3
	標準品	16.1	52.6	91.5	99.3

平均値 n=6

#### 公的溶出試験

エピナスチン塩酸塩錠 20mg「VTRS」は、日本薬局方外医薬品規格第三部に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。

(規格：30分で85%以上)

試験液	判定時点	溶出率 (%)		
		ロットA	ロットB	ロットC
水	30分	100.8~103.3	97.7~104.1	98.0~101.7
判定		適合	適合	適合

n=6

#### 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

ドラーゲンドルフ試液による定性反応  
紫外可視吸光度測定法

#### 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

#### 11. 力価

該当しない

#### 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. 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

#### 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、皮膚掻痒症、痒疹、瘙癢を伴う尋常性乾癬

### 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

#### 6. 用法及び用量

〈気管支喘息、蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚掻痒症、痒疹、瘙癢を伴う尋常性乾癬〉

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

「V-5. (3) 用量反応探索試験」の項参照

### 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

該当しない

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

### (3) 用量反応探索試験

〈気管支喘息〉

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<sup>9)</sup>。

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)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

〈アレルギー性鼻炎〉

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錠 5mg、10mg、20mg1 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<sup>10)</sup>。

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錠 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。

〈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〉

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錠 5mg、10mg、20mg1 日 1 回及び 20mg1 日 2 回を 7 日間経口投与した結果、10mg 又は 20mg1 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<sup>11)</sup>。

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錠 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。

### (4) 検証的試験

#### 1) 有効性検証試験

〈気管支喘息〉

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を対象とし、エピナスチン塩酸塩錠 10mg 又は 20mg1 日 1 回を経口投与した長期投与試験の結果、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<sup>12), 13)</sup>。

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錠 20mg の副作用発現割合は 7.2% (7/97 例) で、ALT 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)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 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錠 20mg を 1 日 1 回あるいはケトチフェン 1mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>14)</sup>。

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錠 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)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

#### 〈アレルギー性鼻炎〉

### 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錠 10mg 又は 20mg1 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<sup>15)</sup>。

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錠 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)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

### 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錠 10mg1 日 1 回又はアゼラスチン 1mg1 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錠 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<sup>16)</sup>。

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錠 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)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

〈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〉

#### 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錠 10mg 又は 20mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>17)</sup>。

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錠 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)</sup>。

注) 1 例に複数の副作用がある。

#### 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錠 20mg1 日 1 回又はケトチフェン 1mg1 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錠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<sup>18)</sup>。

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錠 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。

## 2) 安全性試験

〈気管支喘息〉

#### 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錠 10mg 又は 20mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>13)</sup>。

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錠 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。

#### 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錠 20mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>19)</sup>。

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〉

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錠 10mg 又は 20mg1 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錠 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<sup>20)</sup>。

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錠 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。

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錠 10mg1 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錠 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<sup>21)</sup>。

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錠 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〉

国内第Ⅲ相試験

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の患者 64 例を対象とし、エピナスチン塩酸塩錠 20mg1 日 1 回を 2～14 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試験成績は次のとおりであった<sup>22)</sup>。

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錠 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。

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錠 20mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>23)</sup>。

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錠 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) 1 例に複数の副作用がある。

### 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錠 20mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>24)</sup>。

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錠 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。

### 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錠 20mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>25)</sup>。

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錠 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。

### 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錠 20mg1 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試験成績は次のとおりであった<sup>26)</sup>。

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。

### (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

該当資料なし

### (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

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、ロラタジン等のヒスタミン H<sub>1</sub> 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 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<sup>27)~29)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 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>。

##### 2) 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>。

##### 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<sup>29)</sup>。

##### 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<sup>30)</sup>。

##### 5) その他の薬理試験

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>。

#### (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<sup>32), 33)</sup>

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」

2.79±0.79 (hr)

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」

2.24±0.92 (hr)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人にエピナスチン塩酸塩 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>34)</sup>。

生物学的同等性試験

〈エピナスチン塩酸塩 10mg 「V T R S」〉

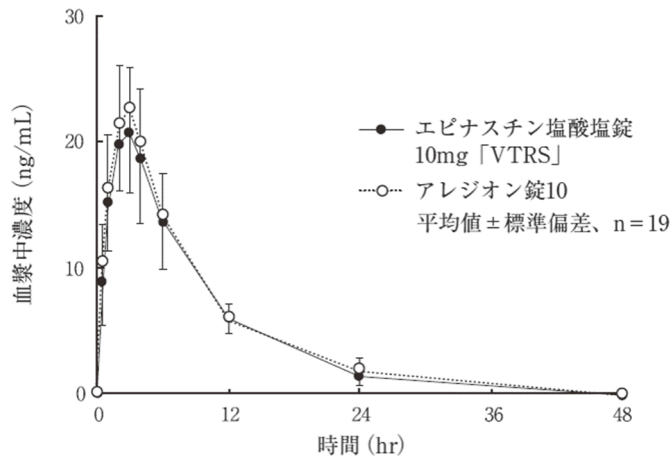
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」とアレジオン錠 10 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2 錠 (エピナスチン塩酸塩として 20mg) 健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中エピナスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、 $C_{max}$ ) について 90% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log (0.80) \sim \log (1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>32)</sup>。

血漿中エピナスチンの薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>t</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」	219.5±59.6	21.93±5.29	2.79±0.79	7.06±2.30
アレジオン錠 10	236.3±61.3	23.72±6.50	2.84±0.69	6.61±1.74

(平均値±標準偏差、n=19)

血漿中エピナスチンの濃度推移



血漿中濃度並びに AUC、 $C_{max}$  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 「VTRS」〉

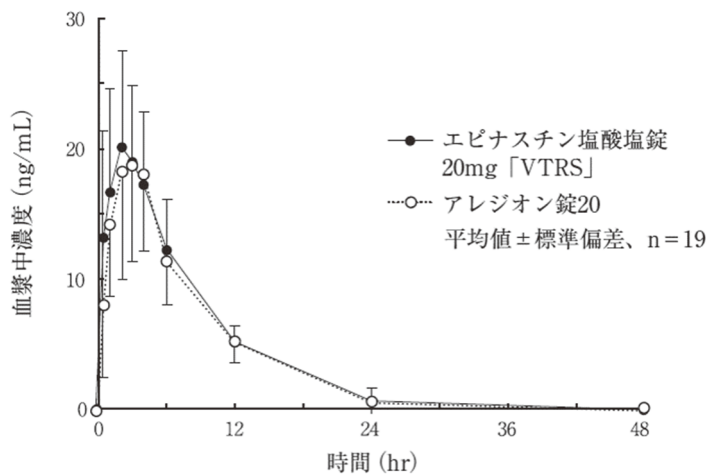
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「VTRS」とアレジオン錠 20 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (エピナスチン塩酸塩として 20mg) 健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中エピナスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、 $C_{max}$ ) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>33)</sup>。

血漿中エピナスチンの薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>t</sub> (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 「VTRS」	188.8±63.4	21.43±7.51	2.24±0.92	5.611±1.836
アレジオン錠 20	183.2±69.3	20.28±8.07	2.71±1.05	5.625±1.547

(平均値±標準偏差、n=19)

血漿中エピナスチンの濃度推移



血漿中濃度並びに AUC、 $C_{max}$  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

該当資料なし

(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) コンパートメントモデル

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<sup>32), 33)</sup>

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」

0.1075±0.0341 (/hr)

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」

0.1349±0.0377 (/hr)

(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

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>35)</sup>（外国人データ）。

#### 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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

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>36), 37)</sup>。

(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

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>35)</sup>（外国人データ）。

(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

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>35)</sup>（外国人データ）。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 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

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。

##### 〈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、 $\gamma$ -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）

### (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」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 「V T R S」 該当しない  
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」 該当しない  
有効成分：エピナスチン塩酸塩 劇薬

### 2. 有効期間又は使用期限

有効期間：3年

（「IV. 製剤に関する項目」の「4. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照。）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱いについて

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「11. 適用上の注意」の項を参照。

#### (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「11. 適用上の注意」の項を参照。

患者向医薬品ガイド：有り くすりのしおり：有り

### 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 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

〈エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

### 7. 容器の材質

PTPシート：ポリプロピレン、アルミニウム箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アレジオン錠 10・20（日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社）等

同効薬：エバスタチン、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

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2011年7月15日

承認番号：エピナスチン塩酸塩錠 10mg「VTRS」：22300AMX00905

エピナスチン塩酸塩錠 20mg「VTRS」：22300AMX00906

11. 薬価基準収載年月日

2022年6月1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、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算処理 システムコード
エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「VTRS」	120881803	統一名：4490014F1017 個別：4490014F1343	統一名：622311200 個別：622088103
エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「VTRS」	120882503	統一名：4490014F2013 個別：4490014F2382	統一名：622311300 個別：622088203

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (1) –明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較–」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009 ; 25
- 2) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (2) –低視力状態での可視性の比較–」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009 ; 29
- 3) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (3) –低コントラスト状態での可視性の比較–」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009 ; 33
- 4) 社内資料：安定性試験 (加速試験) (エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」)
- 5) 社内資料：安定性試験 (加速試験) (エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」)
- 6) 社内資料：無包装状態の安定性 (エピナスチン塩酸塩錠 10mg・20mg 「V T R S」)
- 7) 社内資料：溶出試験 (エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」)
- 8) 社内資料：溶出試験 (エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」)
- 9) 瀧島任ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 97-126
- 10) 奥田稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補2) : 61-79
- 11) 久木田淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 25-41
- 12) 瀧島任ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 157-184
- 13) 吉田稔ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 185-214
- 14) 瀧島任ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 : 169-197
- 15) 奥田稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補4) : 269-288
- 16) 奥田稔ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補4) : 289-312
- 17) 久木田淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 43-57
- 18) 久木田淳ほか：臨床医薬. 1991 ; 7 : 2303-2320
- 19) 三浦一樹ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 215-231
- 20) 遠藤朝彦ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補6) : 447-467
- 21) 高坂知節ほか：耳鼻咽喉科展望. 1992 ; 35 (補5) : 409-422
- 22) 久木田淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 59-71
- 23) 久木田淳ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (Suppl. 1) : 73-86
- 24) 吉川邦彦ほか：皮膚. 1992 ; 34 (1) : 105-118
- 25) 宮内俊次ほか：西日本皮膚. 1992 ; 54 (1) : 143-152
- 26) 増谷衛ほか：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 : 365-373
- 30) 河野茂勝ほか：応用薬理. 1991 ; 42 : 189-195
- 31) Schilling JC, et al. : Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol. 1990 ; 28 : 493-497
- 32) 社内資料：生物学的同等性試験 (エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」)
- 33) 社内資料：生物学的同等性試験 (エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」)
- 34) 東純一ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 (suppl. 1) : 3-24
- 35) 吸収・分布・代謝・排泄 (アレジオン錠：2005. 1. 19 承認、申請概要添付資料へ. 3)
- 36) 大岩陽子ほか：薬理と治療. 1992 ; 20 (2) : 483-506
- 37) 大岩陽子ほか：薬理と治療. 1992 ; 20 (2) : 507-525

## 2. その他の参考文献

参考文献 1) 藤島 一郎 監修：内服薬経管投与ハンドブック第2版 p37、東京、じほう、2006



---

## XII. 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

該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

### その他の関連資料

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

本剤を粉砕しての投与は、承認された剤形での投与ではなく、適正使用の観点から、弊社としては推奨していない。

参考として本剤の粉砕後の安定性を検討した報告を以下に示す。

なお、錠剤を粉砕しての本剤の投与については、各医療従事者の裁量と判断により行うこと。

#### 【試験方法】

試料の調整方法：粉砕機にて粉砕する

保存条件：①温度：40℃、75%RH（褐色ガラス瓶・気密）

②湿度：25℃、75%RH（褐色ガラス瓶・開放）

③光：25℃、75%RH、2500Lux（シャーレ開放）

測定時期：①②：開始時、7日、14日、30日

③：開始時、5日、10日、20日

試験項目：外観、含量

試験回数：3回

【試験結果】

エピナスチン塩酸塩錠 10mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40°C/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	98.9 [100.0]	99.2 [100.3]	99.0 [100.1]	98.9 [100.0]

②湿度に対する安定性試験 [25°C/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	98.9 [100.0]	99.2 [100.3]	99.0 [100.1]	98.9 [100.0]

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	5日 (30万Lux・hr)	10日 (60万Lux・hr)	20日 (120万Lux・hr)
外観	白色の粉末	白色の粉末	照射面が 微黄白色に着色	照射面が 微黄白色に着色
含量(%) [対開始時(%)]	98.9 [100.0]	96.3 [97.4]	96.0 [97.1]	92.7 [93.7]

エピナスチン塩酸塩錠 20mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [40°C/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	97.6 [100.0]	97.2 [99.6]	97.5 [99.9]	97.2 [99.6]

②湿度に対する安定性試験 [25°C/75%RH]

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量(%) [対開始時(%)]	97.6 [100.0]	96.3 [98.7]	96.3 [98.7]	96.3 [98.7]

③光に対する安定性試験 [2500Lux]

測定項目	測定時期			
	開始時	5日 (30万Lux・hr)	10日 (60万Lux・hr)	20日 (120万Lux・hr)
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	照射面が 微黄白色に着色
含量(%) [対開始時(%)]	97.6 [100.0]	96.2 [98.6]	95.6 [98.0]	95.4 [97.7]

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの透過性

本剤の簡易懸濁法での投与は、承認された剤形での投与ではなく、適正使用の観点から、弊社としては推奨していない。

参考として本剤の簡易懸濁法試験（崩壊懸濁試験および通過性試験）の報告を以下に示す。

なお、本剤を簡易懸濁しての投与については、各医療担当者の裁量と判断により行うこと。

【試験方法】 「内服薬経管投与ハンドブック第2版」<sup>参考文献1)</sup> に準じて実施。

①崩壊懸濁試験

- ・ディスペンサー内に薬剤を入れ 55°Cの温湯 20 mL を吸い取り、5 分間自然放置する。
- ・5 分後にディスペンサーを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。
- ・5 分後に崩壊しない場合、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊・懸濁の状況を観察する。

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、経管栄養チューブの注入端より 2 ～3mL/秒の速度で注入し、チューブサイズ 8Fr.（フレンチ）による通過性を観察する。

【試験結果】

剤型	簡易懸濁法				通過性試験
	水(約55°C)		破壊→水		通過サイズ
	5分	10分	5分	10分	
エピナスチン塩酸塩錠10mg「VTRS」	○	/	/	/	8Fr.
エピナスチン塩酸塩錠20mg「VTRS」	×	○	/	/	8Fr.

○：完全崩壊 ×：完全に崩壊せず

### 文献請求先・製品情報お問い合わせ先

---

ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号  
フリーダイヤル 0120-419-043

### 製造販売元

---

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号

### 販売元

---

ヴィアトリス製薬合同会社  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号

