

アレルギー性疾患治療剤

*エピナスチン塩酸塩DS小児用1%「サワイ」

EPINASTINE HYDROCHLORIDE

エピナスチン塩酸塩ドライシロップ

貯法：遮光室温保存
開封後は湿気を避けて保存すること
使用期限：外箱等に表示

日本標準商品分類番号

8 7 4 4 9

* 承認番号	22500AMX00368000
薬価収載	2013年6月
販売開始	2010年5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

エピナスチン塩酸塩DS小児用1%「サワイ」は、1g中にエピナスチン塩酸塩10mgを含有する。

添加物として、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、D-マンニトール、ラウリル硫酸Na、リン酸水素2Na、香料を含有する。

・製剤の性状

剤形	性状
ドライシロップ	白色～帯黄白色の顆粒状の粉末

【効能・効果】

アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚痒症)に伴う痒痒

【用法・用量】

1. 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 7歳未満	14kg以上 24kg未満	0.5～1g (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)

2. 蕁麻疹、皮膚疾患(湿疹・皮膚炎、皮膚痒症)に伴う痒痒：

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 7歳未満	14kg以上 24kg未満	1g (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)

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

1) 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。〕

**2) フェニルケトン尿症の患者〔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)を含有する。〕

2. 重要な基本的注意

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。

2) 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。

3) 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、AI-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)}	顔面浮腫、発疹、蕁麻疹、かゆみ、浮腫(手足等)、痒痒性紅斑
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、頭がぼーとした感じ、幻覚、幻聴
消化器	嘔気、腹痛、腹鳴、下痢、咽頭痛、嘔吐、便秘、胃部不快感、口渇、口内炎、食欲不振、胃重感、胃もたれ感、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(GPT)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 ^{注2)}	頻尿、血尿等の膀胱炎様症状、尿閉
循環器	心悸亢進
血液 ^{注2)}	白血球数減少、血小板減少、白血球数増加
眼	眼痛

	頻度不明
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

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、口渴、胃部不快感等)の観察を行い、異常が認められた場合には、減量又は休業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。〕

6. 小児等への投与

- 低出生体重児、新生児、乳児に対する安全性は確立していない。〔低出生体重児、新生児には使用経験がない。乳児には使用経験は少ない。〕
- 小児気管支喘息に対する本剤の有効性及び安全性は確立していない。

7. 適用上の注意

- 調製時**：本剤は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。
- 配合変化**：本剤は、他剤と配合した場合に、本剤の含量低下等の変化が起こることがあるので、原則として他剤との配合は行わないこと。

8. その他の注意

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ことが報告されている。(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、安全性が確認されている。)

【薬物動態】

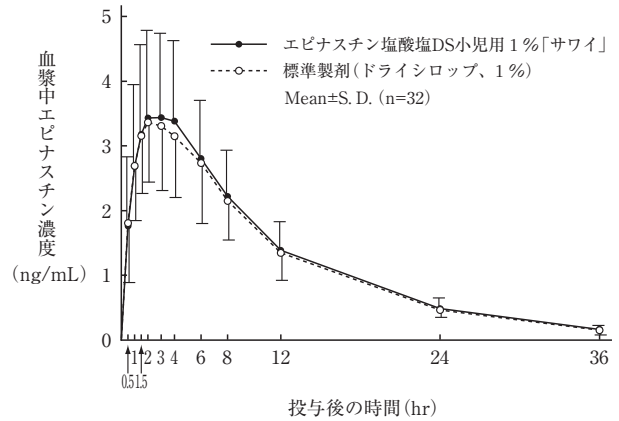
生物学的同等性試験

エピナスチン塩酸塩DS小児用1%「サワイ」と標準製剤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、C_{max})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

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (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
標準製剤(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、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。

【薬効薬理】

エピナスチンは、細胞外からのCa²⁺流入抑制及び細胞内Ca²⁺放出抑制並びに細胞内Ca²⁺濃度の上昇抑制(アデニル酸シクラーゼ活性化により)、肥満細胞からのヒスタミン、SRS-Aの遊離を抑制する。また、遊離されたヒスタミンのほか、PAF、セロトニン、ブラジキニン、ロイコトリエンC₄等のメディエーターに対して拮抗作用を示し、アレルギー反応を抑制する。

【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)

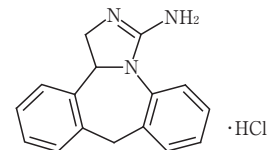
化学名：(±)-3-Amino-9,13b-dihydro-1H-dibenzo[*c,f*]imidazo[1,5-*a*]azepine hydrochloride

分子式：C₁₆H₁₅N₃ · HCl

分子量：285.77

融点：約270℃(分解)

構造式：



性状：エピナスチン塩酸塩は白色～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い。メタノール溶液(1→20)は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

分包包装及びバラ包装(ポリエチレン瓶(乾燥剤入り))したものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、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⁾

【包装】

100包(1包0.5g)、100g(バラ)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

1)陶易王他, 新薬と臨床, 59(3), 438(2010).

2)沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

・文献請求先〔主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい〕

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: 06-6394-7355

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

K06 A141206