

* * 2011年9月改訂 (第8版)
* 2007年10月改訂

日本標準商品分類番号
87449

貯 法	気密容器
使用期限	外箱に使用期限を表示 (アルミビロー開封後はなるべく早く使用すること。)

	錠10	錠20
承認番号	6AMY-129	6AMY-130
薬価収載	1994年5月	
販売開始	1994年6月	
国際誕生	1994年4月	
再審査結果	2003年1月	

アレルギー性疾患治療剤

アレジオン®錠10

アレジオン®錠20

Alesion® Tablets 10・20

(エピナスチン塩酸塩製剤)

® = 登録商標



【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】

販売名	アレジオン錠10	アレジオン錠20
成分・含量	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
添加物	軽質無水ケイ酸、ポビドンK25、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、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、マクロゴール6000、タルク、酸化チタン、シリコーン樹脂	
剤形	白色～微黄色のフィルムコート錠	
外形		
直径	6.0mm	8.0mm
厚さ	2.8mm	3.2mm
重さ	0.088g	0.175g
識別コード	1P	2P

【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、皮膚痒痒症、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、皮膚痒痒症、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。

- (4) 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。
- (5) 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

臨床試験及び市販後の使用成績調査での調査症例8,443例中副作用が報告された症例は263例(3.12%)であった。主な副作用は眠気102件(1.21%)、口渇28件(0.33%)、倦怠感27件(0.32%)、胃部不快感17件(0.20%)、嘔気15件(0.18%)等であった。また、臨床検査値においては特に一定の傾向を示す変動は認められていない(再審査終了時)。

(1) 重大な副作用

- 1) 肝機能障害、黄疸(頻度不明)：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(頻度不明)：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。

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注1)}		浮腫(顔面、手足等)、発疹、蕁麻疹、かゆみ、痒痒性紅斑	
** 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(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

- (1)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。]
- (2)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、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、皮膚掻痒症、痒疹、痒疹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. 吸収・代謝・排泄

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。¹⁾

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。²⁾

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。²⁾

また、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。²⁾

[2)は外国人でのデータ]

2. 分布(参考)

¹⁴C-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、膵、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(ラット^{3,4)})。

【臨床成績】

気管支喘息、通年性アレルギー性鼻炎、慢性蕁麻疹を対象とした二重盲検比較試験の結果、本剤の有用性が認められた。^{5,6,7)}

これらの二重盲検比較試験を含む国内延べ438施設、総計2,372例について臨床試験が実施された。承認された効能・効果及び用法・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	133/ 283	47.0%
通年性アレルギー性鼻炎	195/ 409	47.7%
痒疹性皮膚疾患	610/ 822	74.2%
計	938/1,514	62.0%

【薬効薬理】

1. 選択的H₁受容体拮抗作用

H₁受容体に対する結合親和性は、H₂受容体及びムスカリン受容体に比べ非常に高かった(モルモット⁸⁾、ラット⁸⁾)。

また、ヒスタミンで誘発した気管支収縮、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(モルモット⁸⁾、ラット^{8,9)})。

2. ロイコトリエンC₄(LTC₄)及びPAF拮抗作用

LTC₄及びPAF誘発の気管平滑筋の収縮反応を用量依存的に抑制した(モルモット⁹⁾)。

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、その作用はケトフェンより強かった(モルモット¹⁰⁾、ラット¹⁰⁾)。

4. 実験的抗炎症作用

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フェンと同等かそれ以上に抑制した(ラット¹¹⁾)。

5. 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。¹²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

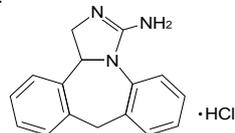
一般名：エピナスチン塩酸塩(JAN)

Epinastine Hydrochloride(JAN)

Epinastine(INN)

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

化学構造式：



分子式：C₁₆H₁₅N₃・HCl

分子量：285.77

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い。
- ・本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは3.0～5.5である。

融点：約270°C(分解)

分配係数：9.2×10⁻²(pH7、n-オクタノール/水)

【包装】

アレジオン錠10：100錠(10錠×10)PTP

300錠(10錠×30)PTP

アレジオン錠20：100錠(10錠×10)PTP

300錠(10錠×30)PTP

700錠(14錠×50)PTP

1000錠(10錠×100)PTP

【主要文献】

- 1) 東 純一ほか：臨床医薬 8(suppl.1)：3,1992
- 2) Häselbarth et al：社内資料
- 3) 大岩 陽子ほか：薬理と治療 20(2)：483,1992
- 4) 大岩 陽子ほか：薬理と治療 20(2)：507,1992
- 5) 滝島 任ほか：臨床医薬 8：169,1992
- 6) 奥田 稔ほか：耳鼻咽喉科展望 35(補4)：289,1992
- 7) 久木田 淳ほか：臨床医薬 7：2303,1991
- 8) Fügner A et al：Arzneimittelforschung 38(II)：1446,1988
- 9) Kamei C et al：Immunopharmacology & Immunotoxicology 14(1&2)：207,1992
- 10) Tasaka K et al：応用薬理 39：365,1990
- 11) 河野 茂勝ほか：応用薬理 42：189,1991
- 12) Schilling JC et al：Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. Toxicol. 28：493,1990

*【文献請求先】

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。

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社

DIセンター

〒141-6017 東京都品川区大崎2丁目1番1号

ThinkPark Tower

フリーダイヤル：0120-189-779

(受付時間) 9:00～18:00

(土・日・祝日・弊社休業日を除く)

製造販売

*日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
東京都品川区大崎2丁目1番1号

