

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 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

抗アレルギー点眼剤
エピナスチン塩酸塩点眼液

エピナスチン塩酸塩LX点眼液0.1%「わかもと」

EPINASTINE HYDROCHLORIDE LX OPHTHALMIC SOLUTION「WAKAMOTO」

剤形	点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL中エピナスチン塩酸塩1mg
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：2025 年 2 月 17 日 薬価基準収載年月日：薬価基準未収載 販売開始年月日：
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：わかもと製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション TEL：03-3279-0379 FAX：03-3279-1272 医療関係者向けホームページ： https://www.wakamoto-pharm.co.jp/

本 I F は 2025 年 8 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

(2020年4月改訂)

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはP D F等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、I F記載要領2018が公表され、今般「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」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はI F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I Fは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

I Fの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMD Aの医療用医薬品情報検索の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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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利用者自らが内容を充実させ、I F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、I Fが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMD Aの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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

I Fを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いただきたい。I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	10. 特定の背景を有する患者	12
1. 開発の経緯	1	11. その他	12
2. 製品の治療学的特性	1		
3. 製品の製剤学的特性	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	13
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	1. 警告内容とその理由	13
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	2. 禁忌内容とその理由	13
6. RMPの概要	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	13
		4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	13
II. 名称に関する項目	2	5. 重要な基本的注意とその理由	13
1. 販売名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	13
2. 一般名	2	7. 相互作用	14
3. 構造式又は示性式	2	8. 副作用	14
4. 分子式及び分子量	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	14
5. 化学名（命名法）又は本質	2	10. 過量投与	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	11. 適用上の注意	14
		12. その他の注意	15
III. 有効成分に関する項目	3		
1. 物理化学的性質	3	IX. 非臨床試験に関する項目	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	1. 薬理試験	16
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	2. 毒性試験	16
IV. 製剤に関する項目	4	X. 管理的事項に関する項目	17
1. 剤形	4	1. 規制区分	17
2. 製剤の組成	4	2. 有効期間	17
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	3. 包装状態での貯法	17
4. 力価	4	4. 取扱い上の注意	17
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	5. 患者向け資材	17
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	6. 同一成分・同効薬	17
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	7. 国際誕生年月日	17
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	17
9. 溶出性	5	9. 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	17
10. 容器・包装	5	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	17
11. 別途提供される資材類	5	11. 再審査期間	17
12. その他	5	12. 投薬期間制限に関する情報	17
		13. 各種コード	17
V. 治療に関する項目	6	14. 保険給付上の注意	17
1. 効能又は効果	6		
2. 効能又は効果に関連する注意	6	XI. 文献	18
3. 用法及び用量	6	1. 引用文献	18
4. 用法及び用量に関連する注意	6	2. その他の参考文献	18
5. 臨床成績	6		
		XII. 参考資料	19
VI. 薬効薬理に関する項目	9	1. 主な外国での発売状況	19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	2. 海外における臨床支援情報	19
2. 薬理作用	9		
		XIII. 備考	19
VII. 薬物動態に関する項目	10	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	19
1. 血中濃度の推移	10	2. その他の関連資料	19
2. 薬物速度論的パラメータ	10		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	10		
4. 吸収	10		
5. 分布	11		
6. 代謝	11		
7. 排泄	11		
8. トランスポーターに関する情報	11		
9. 透析等による除去率	11		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

エピナスチン塩酸塩LX点眼液0.1%「わかもと」は、ヒスタミンH₁受容体拮抗作用とアレルギー反応に関与する細胞のケミカルメディエーターの遊離抑制作用を有する抗アレルギー薬である。

本剤はエピナスチン塩酸塩を0.1%含有する1日2回点眼の持続性のアレルギー性結膜炎治療剤であり、後発医薬品として2025年2月に製造販売承認を取得した。

なお、本剤は、後発医薬品として、わかもと製薬株式会社、東和薬品株式会社、テイカ製薬株式会社、ロートニッテン株式会社らで共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

2. 製品の治療学的特性

- (1) エピナスチン塩酸塩は、ヒスタミンH₁受容体拮抗作用を主作用とし、更に肥満細胞からのメディエーター遊離抑制作用を有する。

(VI. 2. 薬理作用の項参照)

- (2) エピナスチン塩酸塩LX点眼液0.1%「わかもと」は1日2回の持続性抗ヒスタミン点眼剤で、アレジオンLX点眼液0.1%の後発医薬品である。

- (3) 無症状期のアレルギー性結膜炎患者を対象にした類似性確認試験（抗原誘発試験）により、眼そう痒感及び結膜充血に対する改善効果について本剤とアレジオンLX点眼液0.1%との臨床効果の類似性が確認された。

(V. 5. 臨床成績の項参照)

- (4) モルモットヒスタミン誘発結膜炎モデルを用いた薬理作用の同等性を評価する試験において、漏出抑制作用に対する本剤とアレジオンLX点眼液0.1%との同等性が確認された。

(VI. 2. 薬理作用の項参照)

- (5) 主な副作用として、結膜充血、眼刺激、眼の異物感、羞明などがあらわれることがある。

(VIII. 8. (2) その他の副作用の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

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LX点眼液0.1%「わかもと」

(2) 洋名

EPINASTINE HYDROCHLORIDE LX OPHTHALMIC SOLUTION 0.1%「WAKAMOTO」

(3) 名称の由来

有効成分名、剤形、濃度及び社名

(平成17年9月22日付け薬食審査発第0922001号に基づく)

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

エピナスチン塩酸塩 (JAN)

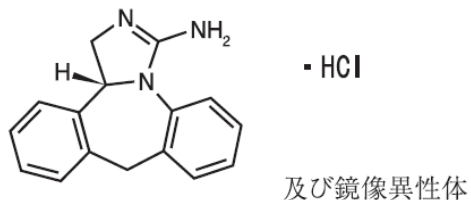
(2) 洋名(命名法)

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: $C_{16}H_{15}N_3 \cdot HCl$

分子量: 285.77

5. 化学名(命名法)又は本質

(R, S)-3-Amino-9,13b-dihydro-1H-dibenz[c,f]imidazo[1,5-a]azepine hydrochloride

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

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～微黄色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

該当資料なし

(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℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(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。

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、定量法

確認試験法

(1) ドラージェンドルフ試薬による沈殿反応（だいだい色の沈殿）

(2) 紫外可視吸光度測定法（吸収極大波長：261～265nm）

(3) 赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法

（波数1662cm⁻¹、1588cm⁻¹、1554cm⁻¹、774cm⁻¹及び760cm⁻¹付近に吸収を認める。）

(4) 塩化物の定性反応（2）

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

点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

無色澄明の水性の液

(3) 識別コード

該当しない

＜参考＞ キャップ：濃橙 キャップ天面：

(4) 製剤の物性

pH：6.7～7.3

浸透圧比：0.9～1.1

(5) その他

無菌製剤である

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分	1mL中エピナスチン塩酸塩1mg
添加剤	リン酸二水素ナトリウム水和物、リン酸水素ナトリウム水和物、塩化ナトリウム、ベンザルコニウム塩化物、pH調節剤

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験¹⁾、苛酷試験（光²⁾、熱³⁾）、長期保存試験⁴⁾

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40±2℃、20±5%RH 暗所	6 ヶ月	ポリエチレン製点眼容器	規格内
苛酷試験 （光）	25±2℃、60±5%RH 白色蛍光灯 3000lx 又は 近紫外線 10W/m ²	120 万 lx・hr ＋ 200W・h/m ²	ポリエチレン製点眼容器 （シュリンクなし）、容器横転	規格内
苛酷試験 （熱）	50±2℃ 暗所	30 日	ポリエチレン製点眼容器	規格内
長期保存試験	25±2℃、40±5%RH 暗所	36 ヶ月	ポリエチレン製点眼容器	規格内

測定項目：含量、性状、確認試験*、浸透圧比**、pH、純度試験（類縁物質）、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験*、無菌試験*

*：加速試験、長期保存試験のみ実施

**：加速試験、苛酷試験（光）、長期保存試験のみ実施

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

プラスチック点眼容器：5mL×5本、5mL×10本

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ボトル：ポリエチレン

中栓：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

ラベル：ポリエチレンテレフタレート

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

1滴：約35～41μL

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

アレルギー性結膜炎

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

通常、1回1滴、1日2回（朝、夕）点眼する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

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

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

国内第Ⅲ相試験（抗原誘発試験）

無症状期のアレルギー性結膜炎患者（68例）を対象に、片眼に0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液（以下、0.05%製剤。34例）、0.1%エピナスチン塩酸塩点眼液（以下、0.1%製剤。34例）、他眼にプラセボ点眼液を無作為に割付け、各眼に各点眼液を1回1滴点眼した。各点眼液点眼4時間後又は8時間後にスギ花粉抗原溶液を点眼し、症状について評価した。その結果、眼そう痒感スコア及び結膜充血スコアにおいて、0.1%製剤のプラセボ点眼液に対する優越性が示された（表1）。休薬期間を設けた後、片眼に前回とは異なるエピナスチン塩酸塩点眼液（0.05%製剤34例、0.1%製剤34例）、他眼にプラセボ点眼液を、1回1滴点眼し、各点眼液点眼4時間後又は8時間後にスギ花粉抗原溶液を点眼し、クロスオーバー比較を行った。その結果、眼そう痒感スコアにおいて、0.1%製剤（1日2回点眼相当）の0.05%製剤（1日4回点眼相当）に対する非劣性が示された（表2）。0.1%製剤群及び0.05%製剤群のいずれも副作用は認められなかった⁵⁾。

V. 治療に関する項目

表1. プラセボとの比較：抗原誘発を行ったときの眼そう痒感スコア及び結膜充血スコア

(被験者間比較、3時点平均スコア)

	0.1%製剤 (34例)	プラセボ (34例)	群間差 [95%信頼区間] P値 ^{注1)}
眼そう痒感スコア	0.4±0.6	2.0±0.7	-1.6 [-1.87, -1.27] P<0.001
結膜充血スコア	2.5±1.4	4.2±1.2	-1.7 [-2.30, -1.01] P<0.001

平均値±標準偏差

注1) 有意水準両側5%、t検定

表2. 0.05%製剤との比較：抗原誘発を行ったときの眼そう痒感スコア

(被験者内比較、3時点平均スコア)

	0.1%製剤 (1日2回点眼相当) (68例)	0.05%製剤 (1日4回点眼相当) (68例)	0.1%製剤-0.05%製剤 群間差 [95%信頼区間] ^{注2)}
眼そう痒感スコア	0.4±0.5	0.3±0.4	0.1 [-0.07, 0.23]

平均値±標準偏差

注2) 投与順序、治験薬、時点を固定効果、被験者を変量効果とした線形混合効果モデル

2) 安全性試験

国内第Ⅲ相試験（環境試験）

アレルギー性結膜炎患者（121例）を対象に、環境下で0.1%エピナスチン塩酸塩点眼液を1回1滴、1日2回（朝、夕）8週間点眼する非盲検非対照試験（長期投与試験）を実施した結果、眼そう痒感スコア（平均値±標準偏差）はベースライン3.1±0.4（121例）、7日目2.0±1.0（121例）、14日目1.8±1.0（120例）、28日目1.5±0.9（120例）、42日目0.8±0.8（120例）、56日目0.6±0.8（120例）であった。眼瞼結膜充血スコア（平均値±標準偏差）はベースライン1.4±0.7（117例）、7日目1.1±0.8（117例）、14日目1.1±0.7（116例）、28日目0.9±0.7（116例）、42日目0.8±0.7（116例）、56日目0.5±0.6（116例）であった。眼球結膜充血スコア（平均値±標準偏差）はベースライン1.2±0.7（103例）、7日目0.8±0.5（103例）、14日目0.7±0.5（103例）、28日目0.4±0.5（103例）、42日目0.4±0.5（103例）、56日目0.3±0.5（103例）であった。

副作用は、眼充血0.8%（1/121例）であった⁶⁾。

(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

該当しない

V. 治療に関する項目

(7) その他

臨床効果の類似性を確認する試験（抗原誘発試験）

無症状期のアレルギー性結膜炎患者（130例）を対象に、本剤65例とアレジオンLX点眼液0.1%65例を無作為に割付け、各点眼液を1回1滴点眼した。各点眼液点眼8時間後にスギ花粉抗原溶液を点眼し、眼そう痒感スコアについて評価した。その結果、本剤及びアレジオンLX点眼液0.1%の眼そう痒感スコアの平均値の差の点推定値は ± 0.5 の範囲内であり、両剤の臨床効果の類似性が確認された。

本剤群で副作用は認められなかった⁷⁾。

眼そう痒感スコア（被験者間比較、3時点平均スコア）

	エピナスチン塩酸塩LX 点眼液0.1%「わかもと」 (65例)	アレジオンLX点眼液0.1% (65例)	平均値の差の点推定値
眼そう痒感スコア	0.7 ± 0.66	0.6 ± 0.69	0.1 ± 0.67

平均値 $\pm$ 標準偏差

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

ケトチフェンフマル酸塩、アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、エメダスチンフマル酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、レボカバスチン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、フェキシソフェナジン塩酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン、レボセチリジン塩酸塩、デスロラタジン、ビラスチン、ルパタジンフマル酸塩等の抗ヒスタミン薬

注意：関連のある化合物の効能・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

エピナスチン塩酸塩は、ヒスタミンH₁受容体拮抗作用を主作用とし、更に肥満細胞からのメディエーター遊離抑制作用を有する^{8) -11)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 抗ヒスタミン作用

- ラット脳-膜標本を用いた受容体結合実験でヒスタミンH₁受容体に対する高い親和性を示した⁸⁾ (*in vitro*)。
- モルモットでのヒスタミン誘発による結膜の血管透過性亢進を抑制した⁹⁾。

2) メディエーター遊離抑制作用

ラットのアレルギー性結膜炎モデルで肥満細胞の脱顆粒及びヒスタミンの遊離を抑制した^{10)、11)}。

3) 実験的アレルギー性結膜炎モデルに対する効果

モルモットのアレルギー性結膜炎モデルで結膜の血管透過性亢進を抑制した¹²⁾。

4) 薬理効果の同等性を評価する試験

モルモットヒスタミン誘発結膜炎モデルを用いて、静脈内投与したエバンスブルー色素の結膜への漏出色素量から算出した漏出色素量抑制率を指標とし、本剤とアレジオンLX点眼液0.1%の薬理効果の同等性を90%信頼区間法にて統計解析を行った。その結果、平均値の差の90%信頼区間は同等性の許容域としたアレジオンLX点眼液0.1%群の平均値の±20%である±13.334%の範囲内であったことから、両剤の薬理効果の同等性が確認された¹³⁾。

非臨床同等性判定パラメータ（漏出色素量抑制率）

	エピナスチン塩酸塩LX 点眼液0.1%「わかもと」 (18例)	アレジオンLX点眼液0.1% (18例)	平均値の差の 90%信頼区間
漏出色素量 抑制率 (%)	68.22±10.10	66.67±10.09	-4.1394～7.2416

平均値±標準偏差

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人男性6例に0.3%エピナスチン塩酸塩点眼液を片眼に1回2滴、1日4回^{注)} 7日間反復点眼したときの血漿中エピナスチン濃度は、最終点眼後10分において、すべての被験者で定量下限(1ng/mL)未満であった¹⁴⁾。

注) 本剤が承認されている濃度は0.1%であり、用法及び用量は「1回1滴、1日2回(朝、夕)点眼する。」である。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 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

該当資料なし

(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

- ・サル の両眼に0.05% ^{14}C -エピナスチン塩酸塩点眼液を単回点眼したとき、主に外眼部組織に高濃度で分布し、その濃度は眼瞼、虹彩、結膜、角膜、強膜、毛様体の順であった。また、メラニン含有組織である虹彩、毛様体及び網脈絡膜中濃度の経時的な減少は、点眼後24時間以内において認められなかった¹⁵⁾。
- ・ラット の両眼に0.05%及び0.1%エピナスチン塩酸塩点眼液を単回点眼したとき、結膜中エピナスチン濃度はいずれも最初の測定時点である点眼後1時間に $C_{\max}$ を示した後、時間経過とともに低下した。結膜中エピナスチンの $C_{\max}$ は用量依存的に増加した¹⁶⁾。

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

健康成人男性に経口投与した場合の尿及び糞抽出物中の代謝物量を検討したところ、ほとんど未変化体であった¹⁷⁾ (外国人データ)。

(2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

エピナスチンの代謝にCYP3A4、CYP2D6及びCYP2B6の関与が示唆された¹⁸⁾ (*in vitro*)。

(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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

健康成人男性に経口投与したとき、主に尿中及び糞中に排泄され、排泄率はそれぞれ25.4%及び70.4%であった¹⁹⁾ (外国人データ)。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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）

2.1 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

8.1 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注意すること。

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

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(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：経口）では受胎率の低下が、器官形成期試験（ウサギ：経口）では胎児致死作用が、いずれも高用量で認められている²⁰⁾。

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

9.7 小児等

12歳未満の小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(8) 高齢者

設定されていない

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

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～1%未満	頻度不明
眼	結膜充血	眼刺激、眼の異物感、羞明、眼瞼炎、眼痛、流涙、点状角膜炎、眼のそう痒感、眼脂

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

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- ・患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- ・点眼したときに液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物は、ソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、ソフトコンタクトレンズを装用している場合は、点眼前にレンズを外し、点眼5分以上経過後に再装用すること。

(解説)

- ・容器の先端が直接目に触れると、眼脂や雑菌等により薬液が汚染される可能性がある。
- ・閉瞼及び涙嚢部の圧迫を行うことにより、薬液の鼻涙管への流出による鼻粘膜からの吸収を防ぎ、全身性の副作用発現の可能性を軽減するとともに、治療効果を高めるためである。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

- ・エピナスチン塩酸塩点眼液において眼瞼炎等の副作用が報告されている。
- ・複数の点眼剤を短い間隔で点眼すると、初めに点眼した薬剤が後から点眼した薬剤によって結膜囊から流され、薬剤の有効性が低下する可能性がある。
- ・ベンザルコニウム塩化物がコンタクトレンズに影響する可能性がある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

眼刺激性試験

雄性ウサギ (n=5) の左眼に、エピナスチン塩酸塩LX点眼液0.1%「わかもと」、アレジオンLX点眼液0.1%及び生理食塩液を1回50μL、30分間隔で1日15回投与し、最終投与後1、3、24、48及び72時間に刺激性の強さを評価した。その結果、エピナスチン塩酸塩LX点眼液0.1%「わかもと」は前眼部に一過性のごく軽度な刺激性がみられたが、アレジオンLX点眼液0.1%と同様の変化であり、Kay and Calandraの眼刺激性評価法において「刺激性なし」と評価された²¹⁾。

(7) 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：該当しない（処方箋医薬品以外の医薬品である）

有効成分：劇薬

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：あり（準備中）

その他の患者向け資材：患者指導箋（準備中）

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：アレジオンLX点眼液0.1%

7. 国際誕生年月日

1994年4月1日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
2025年2月17日	30700AMX00050000	薬価基準未収載	

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理 システム用コード
エピナスチン塩酸塩LX 点眼液0.1%「わかもと」				

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) わかもと製薬株式会社 社内資料 [加速試験]
- 2) わかもと製薬株式会社 社内資料 [苛酷試験 (光)]
- 3) わかもと製薬株式会社 社内資料 [苛酷試験 (熱)]
- 4) わかもと製薬株式会社 社内資料 [長期保存試験]
- 5) 国内第Ⅲ相試験 (アレジオンLX点眼液0.1% : 2019年9月20日承認、審査報告書)
- 6) 国内長期投与試験 (アレジオンLX点眼液0.1% : 2019年9月20日承認、審査報告書)
- 7) わかもと製薬株式会社 社内資料 [臨床効果の類似性確認試験 (抗原誘発試験)]
- 8) Fügner A, et al. : Arzneimittel-Forschung/Drug Research.1988 ; 38 : 1446-1453
- 9) モルモットのヒスタミン誘発による結膜炎モデルの血管透過性亢進に対する作用 (アレジオン点眼液0.05% : 2013年9月20日承認、申請資料概要2.6.2.2)
- 10) 正常又は受動感作アレルギー性結膜炎モデルラットの結膜肥満細胞の脱顆粒に対する作用 (アレジオン点眼液0.05% : 2013年9月20日承認、申請資料概要2.6.2.2)
- 11) ラット受動感作アレルギー性結膜炎モデルの摘出結膜からのヒスタミン遊離に対する作用 (アレジオン点眼液0.05% : 2013年9月20日承認、申請資料概要2.6.2.2)
- 12) 能動感作アレルギー性結膜炎モデルにおける血管透過性亢進抑制作用 (アレジオンLX点眼液0.1% : 2019年9月20日承認、審査報告書)
- 13) わかもと製薬株式会社 社内資料 [薬理効果の非臨床同等性試験]
- 14) 臨床第Ⅰ相試験ー連続投与試験ー (アレジオン点眼液0.05% : 2013年9月20日承認、申請資料概要2.7.6.2)
- 15) 薬物動態試験概要ーサル単回投与試験ー (アレジオン点眼液0.05% : 2013年9月20日承認、申請資料概要2.6.4.4)
- 16) 眼組織分布試験 (アレジオンLX点眼液0.1% : 2019年9月20日承認、審査報告書)
- 17) 代謝 (アレジオンドライシロップ1% : 2005年1月19日承認、申請資料概要へ.3.1.1、3.1.3)
- 18) Kishimoto W, et al. : Res Commun Mol Pathol Pharmacol.1997 ; 98 : 273-292
- 19) 排泄 単回投与 (アレジオンドライシロップ1% : 2005年1月19日承認、申請資料概要へ.3.1.1、3.1.4)
- 20) Niggeschulze A, et al. : 応用薬理.1991 ; 41 : 355-369
- 21) わかもと製薬株式会社 社内資料 [眼刺激性試験]

2. その他の参考文献

該当資料なし

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

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉砕

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし