

抗アレルギー点眼剤

# エピナスチン塩酸塩点眼液0.05%「日点」

Epinastine Hydrochloride Ophthalmic Solution 0.05% [NITTEN]

## エピナスチン塩酸塩点眼液

貯法 気密容器、室温保存  
使用期限 外箱及びラベルに表示  
注意 【取扱い上の注意】の項参照

承認番号	30300AMX00114000
薬価収載	2021年6月
販売開始	2021年6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】

#### 1. 組成

有効成分	1 mL中 エピナスチン塩酸塩 0.5mg
添加物	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、ホウ酸、塩化ナトリウム、エデト酸ナトリウム水和物、pH調節剤

#### 2. 製剤の性状

色・剤形	無色澄明の無菌水性点眼剤
pH	6.7~7.3
浸透圧比	0.9~1.1

### 【効能・効果】

アレルギー性結膜炎

### 【用法・用量】

通常、1回1滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

### 【使用上の注意】

#### 1. 重要な基本的注意

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。

#### 2. 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。

副作用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。

	頻度不明
眼	刺激感、異物感、羞明、眼瞼炎、眼痛、流涙、点状角膜炎、そう痒感、結膜充血、眼脂

#### 3. 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。なお、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。〕

(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：経口）で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

#### 4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対する安全性は確立していない（低出生体重児、新生児に対しては使用経験がない。乳児、幼児に対しては使用経験が少ない）。

#### 5. 適用上の注意

(1)投与経路：点眼用のみ使用すること。

(2)投与時：1)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よう指導すること。

2)点眼したときに液が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取るよう指導すること。

3)他の点眼剤と併用する場合には、少なくとも5分間以上の間隔をあけて点眼するよう指導すること。

### 【薬物動態】

#### 〈生物学的同等性試験〉

エピナスチン塩酸塩点眼液0.05%「日点」は、標準製剤の分析結果に基づき添加剤の種類及び含量（濃度）が標準製剤と同一となるよう処方設計を行ったものであり、pH、粘度、浸透圧などの物理化学的性質が近似することから、生物学的に同等とみなされた。

### 【臨床成績】

#### 1. 第Ⅲ相試験（抗原誘発試験）

(1)無症状期のアレルギー性結膜炎患者（87例）を対象に、3群（両眼0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液、片眼0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液/他眼プラセボ点眼液、両眼プラセボ点眼液）に無作為に割付け、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、0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液はプラセボ点眼液に比較して、眼そう痒感スコア及び結膜充血スコアを有意に抑制した。<sup>1) 2)</sup>

表. 点眼4時間後に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（眼単位比較、3時点平均スコア）

	0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液 (87例)	プラセボ (87例)	群間差 [95%信頼区間] P値
眼そう痒感スコア	0.4±0.7	1.7±0.7	-1.3 [-1.52, -1.11] P<0.001
結膜充血スコア	2.7±1.1	4.1±1.5	-1.3 [-1.71, -0.92] P<0.001

(平均±標準偏差)

(2)無症状期のアレルギー性結膜炎患者（86例）を対象に、2群（片眼0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液/他眼プラセボ点眼液、片眼0.1%オロパタジン点眼液/他眼プラセボ点眼液）に無作為に割付け、各眼に各点眼液を1回1滴点眼した。各点眼液点眼4時間後にスギ花粉抗原溶液を点眼し、症状について評価した結果、0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液の有効性は0.1%オロパタジン点眼液と同程度であった。<sup>1)</sup>

## 2. 第Ⅲ相試験（環境試験）

アレルギー性結膜炎患者（130例）を対象に、環境下で0.05%エピナスチン塩酸塩点眼液を1回1滴、1日4回（朝、昼、夕方、就寝前）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、眼そう痒感を含むすべての自覚症状スコアは、点眼開始1週間後より有意な減少を認め、点眼期間の経過に伴いスコアは減少した。<sup>3)</sup> なお、アレルギー性結膜炎患者を対象に環境下で実施したプラセボ対照無作為化二重盲検並行群間比較試験では、有効性についてプラセボに対する優越性は示されなかった。<sup>4)</sup>

## 【薬効薬理】

### 1. 作用機序

エピナスチン塩酸塩は、ヒスタミンH<sub>1</sub>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。<sup>5)</sup>

### 2. 抗ヒスタミン作用

(1)ラット脳-膜標本を用いた受容体結合実験（in vitro）でヒスタミンH<sub>1</sub>受容体に対する高い親和性を示した。<sup>5)</sup>

(2)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。<sup>6)</sup>

### 3. 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。<sup>7)</sup>

### 4. 実験的アレルギー性結膜炎モデルに対する効果

マウス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。<sup>8)</sup>

## 【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)

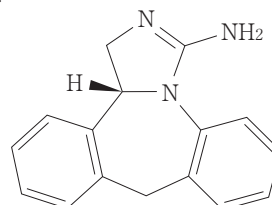
化学名：(R,S)-3-Amino-9,13b-dihydro-1H-dibenz[c,f]imidazo[1,5-a]azepine hydrochloride

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>・HCl

分子量：285.77

性状：白色～微黄色の結晶性の粉末である。水、エタノール（99.5）、メタノール又は酢酸（100）に溶けやすい。

構造式：



・ HCl

及び鏡像異性体

## 【取扱い上の注意】

### 〈安定性試験〉

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度25%以下、6ヵ月）の結果、エピナスチン塩酸塩点眼液0.05%「日点」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。<sup>9)</sup>

## 【包装】

5 mL×10

## ※【主要文献及び文献請求先】

### 〈主要文献〉

- 1) Fujishima H. et al. : Ann. Allergy Asthma Immunol., 113, 476 (2014)
- 2) アレジオン点眼液0.05%：2013年9月20日承認、審査報告書
- 3) 中川やよい他：あたらしい眼科 31, 97 (2014)
- 4) 第Ⅲ相試験外国参考（アレジオン点眼液0.05%：2013年9月20日承認、申請資料概要2.7.6.9）
- 5) Fügner A. et al. : Arzneimittel-Forschung/Drug Research., 38, 1446 (1988)
- 6) ヒスタミン誘発による結膜炎モデル動物に対する作用（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）
- 7) 結膜からのメディエーター遊離抑制作用（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）
- 8) 血管透過性亢進に対する抑制作用（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）
- 9) ロートニッテン株式会社 社内資料（安定性試験）

### 〈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。  
株式会社フェルゼンファーマ 安全管理部  
〒105-0001 東京都港区虎ノ門1-1-18 ヒューリック虎ノ門ビル  
TEL：03-6368-5160 FAX：03-3580-1522



販売元  
**株式会社フェルゼンファーマ**  
札幌市中央区北10条西24丁目3番地

製造販売元

**RN** ロートニッテン株式会社  
名古屋市南区桜本町40番地の2