

# 東京クリニック

## 医薬品情報

---

TEL 03-5287-5532

Web <http://www.tokyo-clinic.jp>

Mail [info@tokyo-clinic.jp](mailto:info@tokyo-clinic.jp)

\*\* 2003年 1月改訂 (第 5 版)  
\* 200年 1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	199年 5月	
販売開始	199年 6月	
国際誕生	199年 4月	
再審査結果	2003年 1月	

アレルギー性疾患治療剤  
指定医薬品

# アレジオン®錠10

# アレジオン®錠20

## Alesion® Tablets 10・20

(塩酸エピナスチン製剤)

R = 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錠中塩酸エピナスチン 10mg	1錠中塩酸エピナスチン 20mg
添加物	軽質無水ケイ酸、ポビドンK 25、ステアリン酸マグネシウム、乳糖、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルメチルセルロース 291Q、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 600Q、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、皮膚癢痒症、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、皮膚癢痒症、痒疹、痒疹を伴う尋常性乾癬：  
通常、成人には塩酸エピナスチンとして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、成人には塩酸エピナスチンとして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  
(1)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。  
(2)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すること。  
(3)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)、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 <sup>注1)</sup>		浮腫 (顔面、手足等)、発疹、蕁麻疹、かゆみ、痒疹性紅斑	
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛	めまい、不眠、悪夢、しびれ感、頭がぼーっとした感じ	
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 <sup>注2)</sup>		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 <sup>注2)</sup>		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。
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、痒癬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  
健康成人に塩酸エピナスチン 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>1)</sup>  
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>2)</sup>  
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>2)</sup>  
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。<sup>2)</sup>  
〔2)は外国人でのデータ〕
2. 分布（参考）  
<sup>14</sup>C-塩酸エピナスチン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（ラット<sup>3,4)</sup>）。

#### 【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。<sup>5,6,7)</sup>  
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。

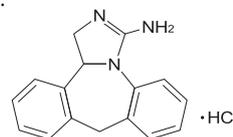
投与対象	有効例数/効果判定例数	有効率 (中等度改善以上)
気管支喘息	133/ 283	47.0%
通年性アレルギー性鼻炎	195/ 409	47.7%
痒疹性皮膚疾患	610/ 822	74.2%
計	938/1,514	62.0%

#### 【薬効薬理】

1. 選択的H受容体拮抗作用  
H受容体に対する結合親和性は、H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<sup>8)</sup>、ラット<sup>8)</sup>）。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腫脹を用量依存的に抑制した（モルモット<sup>8)</sup>、ラット<sup>8,9)</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<sup>9)</sup>）。
3. ヒスタミン及びSRS-A遊離抑制作用  
抗原、compound 48/80 A 23187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<sup>10)</sup>、ラット<sup>10)</sup>）。
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<sup>11)</sup>）。
5. 臨床薬理  
健康成人におけるヒスタミン誘発の皮膚腫脹を1日1回10mg 20mgの経口投与で、投与2時間後においてもプラセボに比し、有意に抑制した。<sup>12)</sup>

#### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：塩酸エピナスチン（JAN）  
Epinastine Hydrochloride（JAN）  
Epinastine（INN）  
化学名：(±)-3-amino-9,13-dihydro-1H-dibenz[f,h]imidazo[1,5-a]azepine hydrochloride  
化学構造式：



分子式：C<sub>14</sub>H<sub>14</sub>N<sub>3</sub>・HCl  
分子量：285.78  
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く、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。  
・本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは3.0～5.5である。  
融点：約270（分解）  
分配係数：9.2×10<sup>2</sup>（pH7.0、n-オクタノール/水）

#### 【包装】

アレジオン錠10：10錠（1錠×10）PTP  
30錠（1錠×30）PTP  
アレジオン錠20：10錠（1錠×10）PTP  
30錠（1錠×30）PTP  
70錠（1錠×50）PTP  
100錠（1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(11)：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】

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社 学術情報部  
〒101-0064 東京都千代田区猿楽町2丁目8番8号  
住友不動産猿楽町ビル

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社  
兵庫県川西市矢間3丁目10番1号