2026 年 4 月改訂（第 3 版）

日本標準商品分類番号
871319

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%「ニットー」

Epinastine Hydrochloride LX Ophthalmic Solution 0.1%「NITTO」

剤形	水性点眼剤
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 含有
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：2022 年 2 月 15 日 薬価基準収載年月日：2024 年 12 月 6 日 販売開始年月日：2025 年 1 月 20 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：東亜薬品株式会社 発売元：日東メディック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日東メディック株式会社 おくすり相談窓口 TEL：03-3523-0345 FAX：03-6264-4086 医療関係者向けホームページ https://www.nittomedic.co.jp/info/

本 IF は 2024 年 8 月作成の電子添文の記載に基づき改訂した。
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、ＩＦ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ＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ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ＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦはＰＤＦ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ＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦ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ＩＦ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ＩＦ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、IF 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．ＩＦとは

ＩＦ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。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ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ＩＦ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ＩＦ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。

ＩＦ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．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡ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ＩＦを作成・提供するが、ＩＦの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やＩＦ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、ＩＦ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、ＩＦ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、ＩＦの使用にあたっては、最新の添付文書をＰＭＤＡ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

ＩＦ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。ＩＦ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ＩＦ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、ＩＦ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
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的特性 …… 1
3. 製品の製剤学的特性 …… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
6. RMP の概要 …… 1

Ⅱ.名称に関する項目 …… 2
1. 販売名 …… 2
2. 一般名 …… 2
3. 構造式又は示性式 …… 2
4. 分子式及び分子量 …… 2
5. 化学名(命名法)又は本質 …… 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 …… 2

Ⅲ.有効成分に関する項目 …… 3
1. 物理化学的性質 …… 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …… 3
3. 有効成分の確認試験法、定量法 …… 3

Ⅳ.製剤に関する項目 …… 4
1. 剤形 …… 4
2. 製剤の組成 …… 4
3. 添付溶解液の組成及び容量 …… 4
4. 力価 …… 4
5. 混入する可能性のある夾雑物 …… 4
6. 製剤の各種条件下における安定性 …… 5
7. 調製法及び溶解後の安定性 …… 5
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化) …… 6
9. 溶出性 …… 7
10. 容器・包装 …… 7
11. 別途提供される資材類 …… 7
12. その他 …… 7

Ⅴ.治療に関する項目 …… 8
1. 効能又は効果 …… 8
2. 効能又は効果に関連する注意 …… 8
3. 用法及び用量 …… 8
4. 用法及び用量に関連する注意 …… 8
5. 臨床成績 …… 8

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 …… 11
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 11
2. 薬理作用 …… 11

Ⅶ.薬物動態に関する項目 …… 12
1. 血中濃度の推移 …… 12
2. 薬物速度論的パラメータ …… 12
3. 母集団(ポピュレーション)解析 …… 12
4. 吸収 …… 12
5. 分布 …… 12
6. 代謝 …… 13
7. 排泄 …… 13
8. トランスポーターに関する情報 …… 13
9. 透析等による除去率 …… 13
10. 特定の背景を有する患者 …… 13
11. その他 …… 13

Ⅷ.安全性(使用上の注意等)に関する項目 …… 14
1. 警告内容とその理由 …… 14
2. 禁忌内容とその理由 …… 14
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 14
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 14
5. 重要な基本的注意とその理由 …… 14
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 …… 14
7. 相互作用 …… 14
8. 副作用 …… 15
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 …… 15
10. 過量投与 …… 15
11. 適用上の注意 …… 15
12. その他の注意 …… 15

Ⅸ.非臨床試験に関する項目 …… 16
1. 薬理試験 …… 16
2. 毒性試験 …… 16

Ⅹ.管理的事項に関する項目 …… 17
1. 規制区分 …… 17
2. 有効期間 …… 17
3. 包装状態での貯法 …… 17
4. 取扱い上の注意 …… 17
5. 患者向け資材 …… 17
6. 同一成分・同効薬 …… 17
7. 国際誕生年月日 …… 17
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. 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. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 …… 17
11. 再審査期間 …… 17
12. 投薬期間制限に関する情報 …… 17
13. 各種コード …… 18
14. 保険給付上の注意 …… 18

XI.文献 …… 19
1. 引用文献 …… 19
2. その他の参考文献 …… 19

XII.参考資料 …… 20
1. 主な外国での発売状況 …… 20
2. 海外における臨床支援情報 …… 20

XIII.備考 …… 21
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 …… 21
2. その他の関連資料 …… 21

Ⅰ.概要に関する項目

1. 開発の経緯

エピナスチン塩酸塩は、ヒスタミン H_1 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し、日本においては、アレルギー性結膜炎の治療薬として2013年11月に発売されている。また、2019 年 11 月にはエピナスチン塩酸塩の高濃度化により効果に持続性を持たせた 1 日 2 回点眼の持続性製剤が発売されている。

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、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2022年 2 月に製造販売承認を取得し、2025 年 1 月発売に至った。

2. 製品の治療学的特性

(1) ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用とメディエーター遊離抑制作用を併せ持つ、1 日 2 回持続性抗ヒスタミン点眼剤である。

(2) 臨床効果の類似性を確認する試験（抗原誘発試験）において、アレルギー性結膜炎の眼そう痒感、結膜充血に対する改善効果について、アレジオン LX 点眼液 0.1%と本剤の臨床効果の類似性が確認された。

(3) 薬理効果の同等性を評価する試験（モルモット）において、アレジオン LX 点眼液 0.1%と本剤の血管透過性亢進抑制作用（抑制率）は同等であった。

(4) 主な副作用として、結膜充血（0.1～1%未満）が報告されている（「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
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

1. 販売名

(1) 和名

エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」

(2) 洋名

Epinastine Hydrochloride LX Ophthalmic Solution 0.1%「NITTO」

(3) 名称の由来

有効成分の一般名による

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

エピナスチン塩酸塩(JAN)

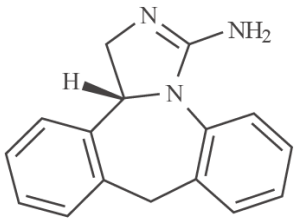
(2) 洋名(命名法)

Epinastine Hydrochloride(JAN)
Epinastine(INN)

(3) ステム

抗ヒスタミン剤:-astine

3. 構造式又は示性式



・HCl

及び鏡像異性体

4. 分子式及び分子量

分子式:$C_{16}H_{15}N_3$・HCl
分子量:285.77

5. 化学名(命名法)又は本質

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

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

該当資料なし

(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

pH:本品 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) 紫外可視吸光度測定法
(2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)
(3) 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

水性点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

無色澄明、無菌水性点眼剤

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH:6.7～7.3

浸透圧比:0.9～1.1

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販 売 名	エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」
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、ベンザルコニウム塩化物、塩化ナトリウム、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

エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」において、各種条件下における安定性試験の結果を以下に示す[1)]。

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40℃ 75%RH	6 箇月	ポリエチレン容器	規格内※1
長期保存試験	25℃ 60%RH	36 箇月	ポリエチレン容器	規格内※1
苛酷試験	50℃ 湿度成り行き	60 日	ポリエチレン容器	規格内※2
低温試験	5℃ 湿度成り行き	6 箇月	ポリエチレン容器	規格内※3
サイクル試験	5℃ 湿度成り行き ⇔40℃、75%RH	2 サイクル （各温度条件で 1 週間ずつ保管して 1 サイクル）	ポリエチレン容器	規格内※4
	-20℃ 湿度成り行き ⇔25℃、60%RH	2 サイクル （各温度条件で 1 週間ずつ保管して 1 サイクル）	ポリエチレン容器	規格内※4
光安定性試験	3000lx 25℃ 60%RH	120 万 lx・hr	ポリエチレン容器 （無包装）	規格内※5
開封後試験	25℃ 60%RH	30 日間	ポリエチレン容器	規格内※3

※1 試験項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌、定量法
※2 試験項目：性状、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、不溶性微粒子、定量法
※3 試験項目：性状、浸透圧比、pH、純度試験、定量法
※4 試験項目：性状、定量法
※5 試験項目：性状、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、定量法

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（物理化学的変化）

エピナスチン塩酸塩LX点眼液0.1%「ニットー」において、併用又は配合が予想される点眼剤との配合変化試験の結果を以下に示す[2)]。なお、配合相手製品は、2022年1月時点のものであり、変更に留意すること。

【試験方法】

1) 検体

試験検体：エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」

配合製剤：アイファガン点眼液 0.1%、アイベータ配合点眼液、アイラミド配合懸濁性点眼液、アゾルガ配合懸濁性点眼液、エイゾプト懸濁性点眼液 1%、エイベリス点眼液 0.002%、カルテオロール塩酸塩点眼液 2%「ニットー」、カルテオロール塩酸塩 LA 点眼液 2%「わかもと」、キサラタン点眼液 0.005%、グラナテック点眼液 0.4%、コソプト配合点眼液、ザラカム配合点眼液、タプコム配合点眼液、タプロス点眼液 0.0015%、チモプトール点眼液 0.5%、チモプトール XE 点眼液 0.5%、チモロール点眼液 0.5%「ニットー」、チモロール XE 点眼液 0.5%「ニットー」、デュオトラバ配合点眼液、トラチモ配合点眼液「ニットー」、トラバタンズ点眼液 0.004%、トラボプロスト点眼液 0.004%「ニットー」、トルソプト点眼液 1%、ブリモニジン酒石酸塩点眼液 0.1%「NIT」、ブリンゾラミド懸濁性点眼液 1%「ニットー」、ミケラン点眼液 2%、ミケラン LA 点眼液 2%、ミケルナ配合点眼液、ラタノプロスト点眼液 0.005%「ニットー」、ラタノプロスト点眼液 0.005%「TOA」、リズモン TG 点眼液 0.5%、ルミガン点眼液 0.03%、レスキュラ点眼液 0.12%、ジクアス点眼液 3%、ティアバランス点眼液 0.3%、ヒアルロン酸 Na 点眼液 0.3%「ニットー」、ヒアレイン点眼液 0.3%、ムコスタ点眼液 UD2%、ガチフロ点眼液 0.3%、クラビット点眼液 0.5%、クラビット点眼液 1.5%、トスフロ点眼液 0.3%、ベガモックス点眼液 0.5%、モキシフロキサシン点眼液 0.5%「ニットー」、レボフロキサシン点眼液 0.5%「ニットー」、レボフロキサシン点眼液 1.5%「ニットー」、ジクロード点眼液 0.1%、ジクロフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」、ニフラン点眼液0.1%、ネバナック懸濁性点眼液0.1%、プラノプロフェン点眼液 0.1%「ニットー」、ブロナック点眼液 0.1%、ブロムフェナクNa点眼液0.1%「ニットー」、D･E･X 点眼液 0.1%「ニットー」、サンテゾーン点眼液（0.02%）、サンテゾーン点眼液（0.1%）、フルメトロン点眼液 0.02%、フルメトロン点眼液 0.1%、フルオロメトロン点眼液 0.1%「ニットー」、リンデロン点眼液 0.01%、タリムス点眼液 0.1%、パピロックミニ点眼液 0.1%、サンコバ点眼液 0.02%、シアノコバラミン点眼液 0.02%「ニットー」、ピレノキシン懸濁性点眼液 0.005%「参天」*、人工涙液マイティア点眼液、ソフトサンティア、ヒアレイン S、ピュラクルなみだ液 EYE

＊名称変更あり、変更前のものを使用した。（変更前：カリーユニ点眼液 0.005%）

2) 試験項目及び測定時点

試験項目	配合直後	1 時間後
性状※1	○	○
pH※2	○	○

○：n=1

※1 性状：外観を確認する。

※2 pH：pH を測定する。

3) 試験方法

試験製剤 2mL と配合製剤 2mL を配合した液を試料とし、試験製剤及び配合製剤それぞれ 4mL を対照液とする。

試料 4mL について、配合直後及び室温で 1 時間静置後の外観確認及び pH 測定を実施する。外観については、対照液と比較する。

【試験結果】

以下の 6 製剤で配合による変化を認めた。

<u>配合変化を認めた製剤</u>

チモプトール XE 点眼液 0.5%、トスフロ点眼液 0.3%、D･E･X 点眼液 0.1%「ニットー」、サンテゾーン点眼液（0.02%）、サンテゾーン点眼液（0.1%）、ピレノキシン懸濁性点眼液 0.005%「参天」

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×10 本

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

容　　器: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

11. 別途提供される資材類

「X. 5. 患者向け資材」を参照すること。

12. その他

該当しない

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

1. 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、エピナスチン塩酸塩点眼液(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、エピナスチン塩酸塩点眼液(0.1%製剤、1 日 2 回点眼相当)のエピナスチン塩酸塩点眼液(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)。

エピナスチン塩酸塩点眼液の 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[3)]。

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)]
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

注)有意水準両側 5%、t 検定　　(平均±標準偏差)

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)]
眼そう痒感スコア	0.4±0.5	0.3±0.4	0.1 [-0.07, 0.23]

(平均±標準偏差)

注)投与順序、治療薬、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. 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、環境下でエピナスチン塩酸塩点眼液(0.1%製剤)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[4)]。

2) 安全性試験

該当資料なし

(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

(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(60 例)を対象に、両眼にエピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」又はアレジオン LX 点眼液 0.1%を左右眼で異なる点眼液が点眼されるよう無作為に割付け、部分遮蔽、クロスオーバー法により、各眼に各点眼液を 1 期あたり 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、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、製剤間差の点推定値は類似性の許容域±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。

臨床効果の類似性を確認する試験(60 例)において、副作用は認められなかった[5)]。

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の比較(3 時点平均スコア)

	治療薬未投与時 (n=120)	治療薬投与時		
		エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」(n=120)	アレジオン LX 点眼液 0.1%(n=120)	群間差
眼そう痒感スコア	2.6±0.6	0.7±0.6	0.7±0.6	-0.03
結膜充血スコア	4.4±1.0	2.1±1.3	2.1±1.3	0.04

(平均±標準偏差、n:眼数)

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 等の抗ヒスタミン薬

注意：関連のある化合物の効能・効果は最新の電子添文を参照すること。

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 H_1 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[6)~9)]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1. 抗ヒスタミン作用

・ラット脳ー膜標本を用いた受容体結合実験でヒスタミン H_1 受容体に対する高い親和性を示した[6)]（*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[7)]。

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[8), 9)]。

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[10)]。

4. 薬理効果の同等性を評価する試験

モルモット（Hartley 系/雄性）の片眼にエピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」又はアレジオン LX 点眼液 0.1%を、対眼に生理食塩液を単回点眼投与し、その 24 又は 28 時間後に色素溶液を静脈内投与した。続いてヒスタミンを点眼投与し、その 30 分後に結膜を採取し、両眼の結膜組織中に漏出した色素量測定値を基に血管透過性亢進抑制率（抑制率）を算出して比較した。その結果、製剤投与後 24 及び 28 時間時点における抑制率の平均値の差の割合は、いずれも 90%信頼区間で許容域の範囲内にあり、両剤の血管透過性亢進抑制作用は同等であった[11)]。

モルモット結膜炎モデルにおける血管透過性亢進抑制作用の比較

評価時点	血管透過性亢進抑制作用（抑制率；%）*1		平均値の差の割合の90%信頼区間*2
	エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」	アレジオン LX 点眼液 0.1%	
製剤投与後 24 時間（N=45/群）	62.23±16.55	61.97±16.29	-8.86～9.72
製剤投与後 28 時間（N=49/群）	56.08±15.68	57.01±17.64	-11.46～8.19

*1：平均±標準偏差

*2：許容域（±20%）の範囲内にある場合に同等と判定

(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[注)]を片眼に 1 回 2 滴、1 日 4 回 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[12)]。

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

＜サルにおける組織移行＞

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[13)]。

＜ラットにおける組織移行＞

ラットの両眼にエピナスチン塩酸塩点眼液（0.05%製剤）及びエピナスチン塩酸塩点眼液（0.1%製剤）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[14)]。

(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[15)]。

(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[16)]（*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[15)]。

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

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、漠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
妊娠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[17]。

(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。

(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。

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」を参照すること。

(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

ウサギの左眼結膜嚢内にエピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」あるいはアレジオン LX 点眼液 0.1%を 1 回 50μL、30 分間隔で 10 回投与し、最終点眼後 1、24、48 及び 72 時間に眼刺激性の判定を行った。その結果、エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」及びアレジオン LX 点眼液 0.1%は KAY&CALANDRA の眼刺激評価基準において、「Practically nonirritating（ほとんど刺激性はない）」に分類され、眼刺激性に差はみられなかった[18)]。

(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
有効成分:エピナスチン塩酸塩　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:無
くすりのしおり:有
その他の患者向け資材:エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」を使用される方へ

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬:アレジオン点眼液 0.05%、アレジオン LX 点眼液 0.1%
同　効　薬:アシタザノラスト水和物、イブジラスト、オロパタジン塩酸塩、クロモグリク酸ナトリウム、ケトチフェンフマル酸塩、トラニラスト、ペミロラストカリウム、レボカバスチン塩酸塩

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

販売名	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
エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」	2022 年 2 月 15 日	30400AMX00073000	2024 年 12 月 6 日	2025 年 1 月 20 日

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、療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等（平成 18 年厚生労働省告示第 107 号）の一部を改正した平成 20 年厚生労働省告示第 97 号（平成 20 年 3 月 19 日付）の「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

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%「ニットー」	1319762Q2040	1319762Q2040	129789801	622978901

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬における後発医薬品である。

XI.文献

1. 引用文献

1) 社内資料:エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」の安定性試験
2) 社内資料:エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」の配合変化試験
3) 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)
4) 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)
5) 社内資料:臨床効果の類似性を確認する試験(抗原誘発試験)
6) Fügner A. et al.:Arzneimittel-Forschung/Drug Research. 1988;38:1446-1453
7) 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)
8) 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)
9) 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)
10) 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)
11) 社内資料:エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」の生物学的同等性試験
12) 臨床第 I 相試験－連続投与試験－(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)
13) 薬物動態試験概要－サル単回投与試験－(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)
14) 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)
15) 健康成人における成績(アレジオンドライシロップ:2005 年 1 月 19 日承認、申請資料概要へ.3.1)
16) Kishimoto, W. et al.:Res. Commun. Mol. Pathol. Pharmacol. 1997;98:273-292
17) Niggeschulze A, et al.:応用薬理.1991;41:355-369
18) 社内資料:エピナスチン塩酸塩 LX 点眼液 0.1%「ニットー」の眼刺激性試験

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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉砕

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし