

\*\*2021年2月改訂（第6版、〰〰参照）  
\*2017年11月改訂

日本標準商品分類番号  
871319

抗アレルギー点眼剤

# アレジオン<sup>®</sup>点眼液0.05%

## ALESION<sup>®</sup> Ophthalmic Solution 0.05%

エピナスチン塩酸塩点眼液

承認番号	22500AMX01802000
薬価収載	2013年11月
販売開始	2013年11月
国際誕生	1994年4月
**再審査結果	2020年12月

貯法：気密容器、室温保存  
使用期限：外箱及びラベルに記載（3年）

Santen

### 〔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	アレジオン点眼液0.05%
有効成分	エピナスチン塩酸塩
含量(1mL中)	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
pH	6.7~7.3
浸透圧比	0.9~1.1
性状	無色澄明、無菌水性点眼剤

### 〔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

国内長期投与試験において、安全性解析対象130例中3例（2.3%）に副作用（臨床検査値異常変動を含む）が認められた。副作用は、眼刺激感2件（1.5%）、眼の異物感1件（0.8%）、羞明1件（0.8%）であった。（承認時）

使用成績調査において、総症例3,928例中52例（1.32%）に副作用が認められた。主な副作用は、眼瞼炎12件（0.31%）、眼刺激感9件（0.23%）、眼脂6件（0.15%）、眼の異物感6件（0.15%）等であった。

なお、小児に対する使用例数1,100例中11例（1.00%）に副作用が認められた。その内訳は、7歳未満が376例中2例（0.53%）、7歳以上15歳未満が724例中9例（1.24%）であり、その主な副作用は、眼刺激感4件、眼瞼炎4件等であった。（再審査終了時）

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。

種類	頻度	頻度不明	0.1~5%未満
眼	眼瞼炎、眼痛、流涙、点状角膜炎、そう痒感、結膜充血、眼脂		刺激感、異物感、羞明

発現頻度は承認時までの臨床試験の結果に基づき算出した。

#### 3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 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。〕
- 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

- 投与経路：点眼用のみ使用すること。
- 投与时：
  - 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。
  - 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。
  - 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〕

#### 1. 血漿中濃度<sup>1)</sup>

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7日間点眼したときの血漿中エピナスチン濃度は、点眼後10分において、すべての被験者で定量下限値（1ng/mL）未満であった。（本剤が承認されている濃度は0.05%である。）

### 〔臨床成績〕

#### 1. 第Ⅲ相試験（抗原誘発試験）<sup>2)</sup>

- 無症状期のアレルギー性結膜炎患者（87例）を対象に、3群（両眼本剤、片眼本剤/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、本剤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。

表1.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)

	本剤 (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(片眼本剤/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、本剤の有効性は0.1%オロパタジン点眼液と同程度であった。

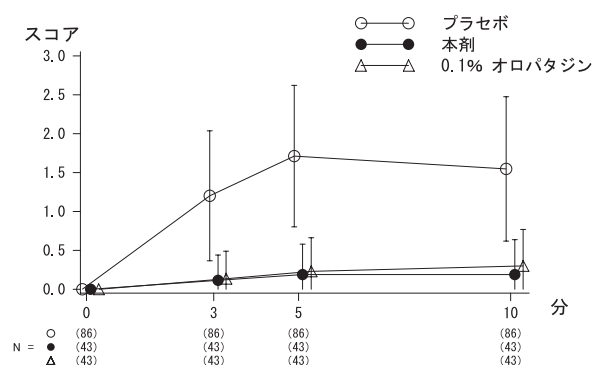


図1.点眼4時間後に抗原誘発を行ったときの眼そう痒感スコア(被験者間比較、3時点別スコア、平均±標準偏差)

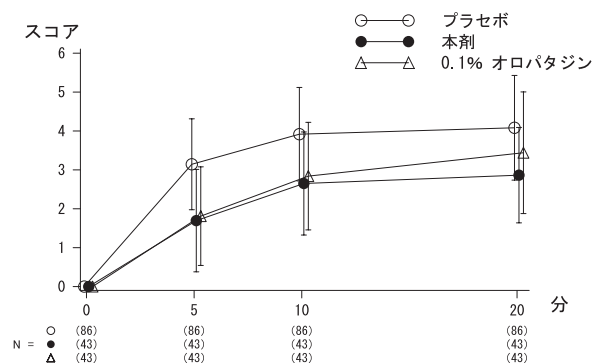


図2.点眼4時間後に抗原誘発を行ったときの結膜充血スコア(被験者間比較、3時点別スコア、平均±標準偏差)

## 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、環境下で本剤を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、眼そう痒感スコア(平均値±標準偏差)はベースライン2.8±0.5(130例)、7日目2.2±0.9(130例)、14日目1.9±1.0(126例)、28日目1.5±0.9(125例)、42日目1.2±0.9(125例)、56日目0.6±0.7(124例)であった<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。

## 〔薬効薬理〕

### 1.作用機序<sup>4)~7)</sup>

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。

### 2.抗ヒスタミン作用<sup>4),5)</sup>

- 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。
- 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。

### 3.メディエーター遊離抑制作用<sup>6),7)</sup>

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。

### 4.実験的アレルギー性結膜炎モデルに対する効果<sup>8)</sup>

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。

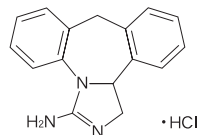
## 〔有効成分に関する理化学的知見〕

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

構造式：



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

分子量：285.78

性状：本品は、白色の結晶性の粉末である。

本品は、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。

## 〔包装〕

プラスチック点眼容器：5mL×10本

## 〔主要文献及び文献請求先〕

### <主要文献>

- 1)DE-114点眼液 臨床第Ⅰ相試験-連続投与試験-, 社内資料 (63630)
- 2)Fujishima H. et al. : Ann. Allergy Asthma Immunol., **113**, 476 (2014) (64375)
- 3)中川やよい他：あたらしい眼科 **31**, 97(2014) (63628)
- 4)Fügner A. et al. : Arzneimittel-Forschung/Drug Research., **38**, 1446(1988) (63635)
- 5)モルモットにおけるDE-114点眼液のヒスタミン誘発アレルギー性結膜炎モデルに対する効果, 社内資料 (63636)
- 6)Antiinflammatory activity. Effects on inflammatory cell accumulation and pathological findings in the conjunctivae of normal and allergic rats, 社内資料 (63637)
- 7)Histamine release into the conjunctivae after antigen challenge in rats, 社内資料 (63638)
- 8)マウス能動感作アレルギー性結膜炎モデルの血管透過性亢進に対するDE-114点眼液の効果, 社内資料 (63639)

**<文献請求先・製品に関するお問い合わせ先>**

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ください。

参天製薬株式会社 製品情報センター

〒530-8552(個別郵便番号) 大阪市北区大深町4-20

TEL 0120-921-839 06-7664-8624

受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

製造販売元 **参天製薬株式会社**  
大阪市北区大深町4-20

提 携 **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2-1-1