

日本標準商品分類番号
87449

持続性選択H<sub>1</sub>受容体拮抗剤

日本薬局方 エバスタチン錠

**エバスタチン錠5mg「科研」**  
**エバスタチン錠10mg「科研」**

Ebastine Tab.

日本薬局方 エバスタチン口腔内崩壊錠

**エバスタチンOD錠5mg「科研」**  
**エバスタチンOD錠10mg「科研」**

Ebastine O.D. Tab.

貯法
気密容器、室温保存 (5mg錠、10mg錠)
遮光、気密容器、室温保存 (5mgOD錠、10mgOD錠)
使用期限
外箱に表示

承認番号	5mg錠	22000AMX01154
	10mg錠	22000AMX01149
	5mgOD錠	22000AMX01142
	10mgOD錠	22000AMX01143
薬価収載	2008年7月	
販売開始	2008年7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】**

販売名	エバスタチン錠5mg「科研」	エバスタチン錠10mg「科研」
成分・含量 (1錠中)	日本薬局方エバスタチン 5mg	日本薬局方エバスタチン 10mg
添加物	乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ	乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ
剤形	白色のフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠(カプレット型)
外形		
大きさ	直径 6.6mm 厚さ 3.2mm	長径 10.1mm 短径 5.1mm 厚さ 3.2mm
識別コード	KC75	KC76
平均重量	108mg	144mg

販売名	エバスタチンOD錠5mg「科研」	エバスタチンOD錠10mg「科研」
成分・含量 (1錠中)	日本薬局方エバスタチン 5mg	日本薬局方エバスタチン 10mg
添加物	D-マンニトール、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスボピドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、赤色106号、精製ステビア抽出物、香料	D-マンニトール、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスボピドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、精製ステビア抽出物
剤形	薄い紅色の素錠	白色の素錠(割線入り)
外形		
大きさ	直径 6.5mm 厚さ 2.6mm	直径 8.0mm 厚さ 3.6mm
識別コード	KC77	KC78
平均重量	100mg	200mg

**【効能・効果】**

蕁麻疹、  
 湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚掻痒症、  
 アレルギー性鼻炎

**【用法・用量】**

通常、成人には、エバスタチンとして1回5~10mg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】**

**1.慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**

肝障害またはその既往歴のある患者  
 (肝機能異常があらわれるおそれがある。)

**2.重要な基本的注意**

- (1)眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には**自動車の運転など危険を伴う機械の操作に注意させること**。
- (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行うこと。
- (3)本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考えて、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。
- (4)OD錠(口腔内崩壊錠)は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜からは吸収されないため、唾液または水で飲み込むこと。

**3.相互作用**

本剤は、主として代謝酵素CYP2J2及びCYP3A4で代謝される。  
**併用注意(併用に注意すること)**

薬剤名	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エリスロマイシン	本剤の代謝物カレバスタチンの血漿中濃度が約2倍に上昇することが報告されている。	カレバスタチンの代謝が抑制されると考えられる。
イトラコナゾール	本剤の代謝物カレバスタチンの血漿中濃度が上昇することが報告されている。	
リファンピシン	本剤の代謝物カレバスタチンの血漿中濃度が低下することが報告されている。	カレバスタチンの代謝が促進されると考えられる。

**4.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。

**(1)重大な副作用(頻度不明)**

**1)ショック、アナフィラキシー**

ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、喉頭浮腫等の症状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)肝機能障害、黄疸**

AST(GOT)、ALT(GPT)、LDH、γ-GTP、ALP、ビリルビンの上昇等を伴う肝機能障害、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、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

**(2)重大な副作用(類薬)**

類薬(テルフェナジン等)で、QT延長、心室性不整脈(Torsades de pointesを含む)があらわれるとの報告がある。

※※

(3)その他の副作用

頻度	頻度不明
過 敏 症 <sup>(注)</sup>	発疹、浮腫、蕁麻疹
循 環 器	動悸、血圧上昇
精 神 神 経 系	眠気、倦怠感、頭痛、めまい、しびれ感、不眠
消 化 器	口渇、胃部不快感、嘔気・嘔吐、腹痛、鼻・口腔内乾燥、下痢、舌炎
肝 臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、LDH、 $\gamma$ -GTPの上昇、ALP、ビリルビンの上昇
泌 尿 器	排尿障害、頻尿
そ の 他	好酸球増多、胸部圧迫感、ほてり、体重増加、月経異常、脱毛、味覚異常、BUNの上昇、尿糖

注：このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

5.高齢者への投与

1日1回5mgから投与するなど注意すること。  
〔一般に高齢者では生理機能が低下している。〕

6.妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1)妊婦また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。〕
- (2)本剤投与中は授乳を避けさせること。  
〔動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。〕

7.小児等への投与

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

8.臨床検査結果に及ぼす影響

本剤はアレルギー皮内反応を抑制するため、アレルギー皮内反応検査を実施する前は、本剤を投与しないこと。

9.適用上の注意

(1)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、更には穿孔を起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。）

(2)服用時

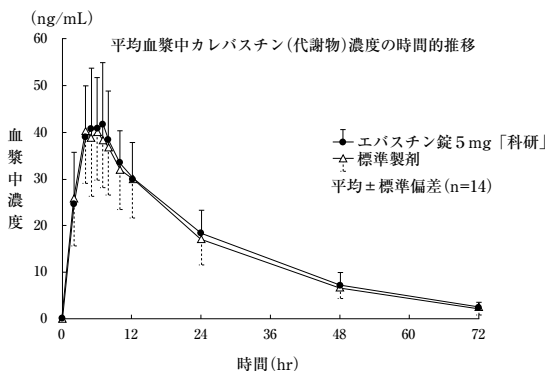
（OD錠：口腔内崩壊錠）OD錠は舌の上のにせ唾液を湿潤させ、唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

【薬物動態】

1.生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

(1)エバスチン錠5mg「科研」

健康成人男子にエバスチン錠5mg「科研」と標準製剤のそれぞれ1錠（エバスチンとして5mg）を、絶食時に単回経口投与して血漿中代謝物のカレバスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された（クロスオーバー法）。



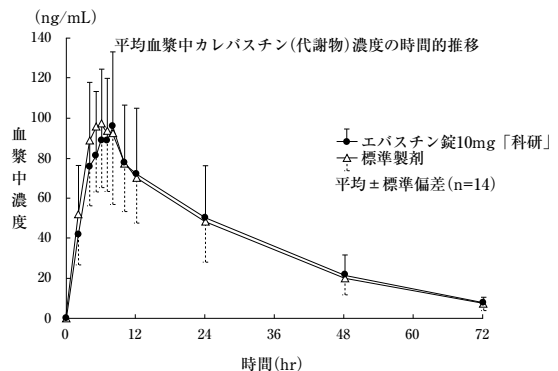
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エバスチン錠5mg「科研」	1099.5±271.2	45.0±13.0	6.1±1.4	16.9±2.7
標準製剤（錠剤、5mg）	1052.2±278.6	45.8±11.1	5.4±1.4	16.7±2.3

平均±標準偏差（n=14）

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2)エバスチン錠10mg「科研」

健康成人男子にエバスチン錠10mg「科研」と標準製剤のそれぞれ1錠（エバスチンとして10mg）を、絶食時に単回経口投与して血漿中代謝物のカレバスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された（クロスオーバー法）。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エバスチン錠10mg「科研」	2790.2±1168.8	102.4±39.7	7.0±2.1	18.7±3.2
標準製剤（錠剤、10mg）	2760.6±953.8	105.8±30.8	5.9±1.3	18.9±2.8

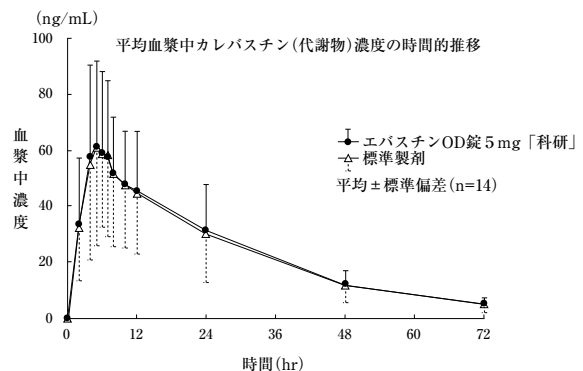
平均±標準偏差（n=14）

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3)エバスチンOD錠5mg「科研」

1)水で服用の試験

健康成人男子にエバスチンOD錠5mg「科研」と標準製剤のそれぞれ1錠（エバスチンとして5mg）を、絶食時に単回経口投与して血漿中代謝物のカレバスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された（クロスオーバー法）。



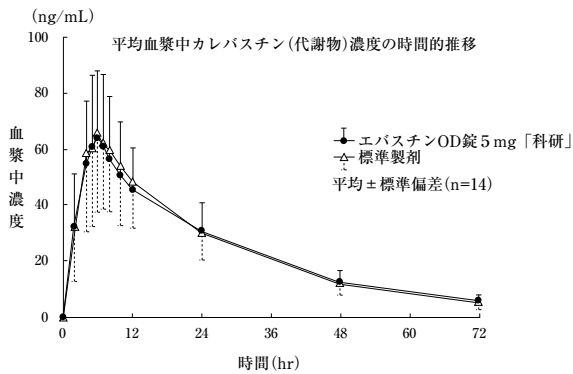
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠5mg「科研」	1733.9±811.9	65.7±30.7	5.7±1.1	18.5±2.7
標準製剤(OD錠、5mg)	1712.0±856.0	65.5±34.6	5.4±1.0	20.0±4.0

平均±標準偏差 (n=14)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## 2) 水なしで服用の試験

健康成人男子にエバスタチンOD錠5mg「科研」と標準製剤のそれぞれ1錠(エバスタチンとして5mg)を、絶食時に単回経口投与して血漿中代謝物のカレバスタチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(クロスオーバー法)。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠5mg「科研」	1749.8±568.4	69.5±24.9	6.1±1.4	19.4±3.2
標準製剤(OD錠、5mg)	1773.9±577.9	70.3±27.5	6.9±2.3	18.9±2.8

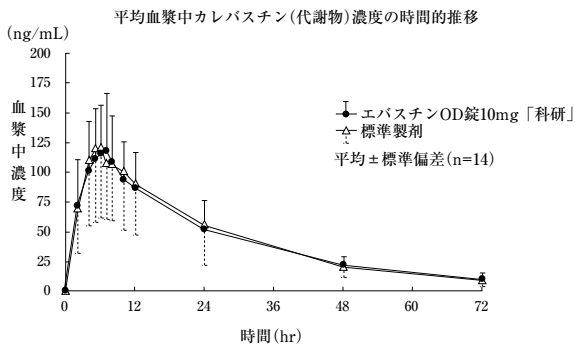
平均±標準偏差 (n=14)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## (4) エバスタチンOD錠10mg「科研」

### 1) 水で服用の試験

健康成人男子にエバスタチンOD錠10mg「科研」と標準製剤のそれぞれ1錠(エバスタチンとして10mg)を、絶食時に単回経口投与して血漿中代謝物のカレバスタチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(クロスオーバー法)。



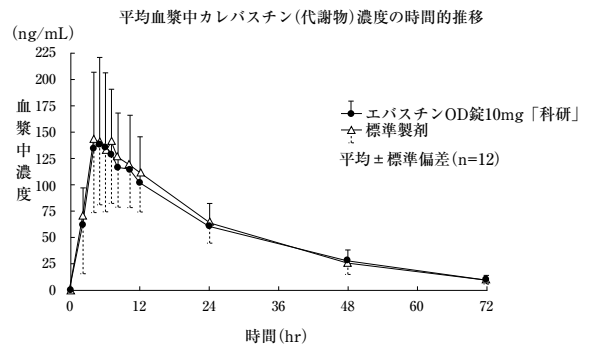
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠10mg「科研」	3224.3±1094.2	124.5±45.8	6.0±1.8	20.5±4.6
標準製剤(OD錠、10mg)	3328.7±1674.0	131.4±63.8	6.1±1.4	20.1±3.8

平均±標準偏差 (n=14)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## 2) 水なしで服用の試験

健康成人男子にエバスタチンOD錠10mg「科研」と標準製剤のそれぞれ1錠(エバスタチンとして10mg)を、絶食時に単回経口投与して血漿中代謝物のカレバスタチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(クロスオーバー法)。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠10mg「科研」	3674.1±1360.6	157.8±83.2	6.0±1.7	18.1±3.2
標準製剤(OD錠、10mg)	3868.1±1243.0	155.7±58.4	6.7±2.7	18.3±3.1

平均±標準偏差 (n=12)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## 2. 溶出挙動<sup>2)</sup>

エバスタチン錠5mg「科研」、エバスタチン錠10mg「科研」、エバスタチンOD錠5mg「科研」及びエバスタチンOD錠10mg「科研」は、日本薬局方医薬品各条に定められたエバスタチン錠及びエバスタチン口腔内崩壊錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

## 【薬効薬理】<sup>3)</sup>

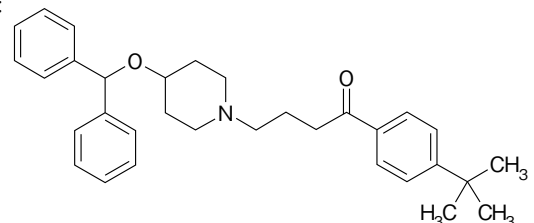
ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体遮断薬。H<sub>1</sub>受容体を介するヒスタミンによるアレルギー性反応(毛細血管の拡張と透過性亢進、気管支平滑筋の収縮、知覚神経終末刺激による掻痒、など)を抑制する。これに加えて、ケミカルメディエーター遊離抑制作用を有する点が、古典的抗ヒスタミン薬とは異なる。なお、本薬の作用の大部分は活性代謝物のカレバスタチンの作用である。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エバスタチン (Ebastine)

化学名：1-[4-(1,1-Dimethylethyl)phenyl]-4-[4-(diphenylmethoxy)piperidin-1-yl]butan-1-one

構造式：



分子式：C<sub>32</sub>H<sub>39</sub>NO<sub>2</sub>

分子量：469.66

性状：白色の結晶または結晶性の粉末である。

酢酸(100)に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

光によって徐々に帯黄白色となる。

融点：84～87℃

### 【取扱い上の注意】

#### 安定性試験<sup>\*)</sup>

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃・60%RH、3年間)の結果、外観、溶出挙動及び含量等は規格の範囲内であり、エバスチン錠5mg「科研」、エバスチン錠10mg「科研」、エバスチンOD錠5mg「科研」、エバスチンOD錠10mg「科研」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

### 【包装】

※エバスチン錠5mg「科研」

(PTP) 100錠

※エバスチン錠10mg「科研」

(PTP) 100錠

※エバスチンOD錠5mg「科研」

(PTP) 100錠

※エバスチンOD錠10mg「科研」

(PTP) 100錠

### 【主要文献及び文献請求先】

#### 〈主要文献〉

- 1)ダイト株式会社 社内資料(生物学的同等性試験)
  - 2)ダイト株式会社 社内資料(溶出挙動)
- ※3)第十七改正日本薬局方解説書
- 4)ダイト株式会社 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ください。

科研製薬株式会社 医薬品情報サービス室

〒113-8650 東京都文京区本駒込2丁目28-8

電話 0120-519-874



発売元

**科研製薬株式会社**

東京都文京区本駒込2丁目28-8

製造販売元

**DAITO** **ダイト株式会社**

富山県富山市八日町326番地