



※ 2016年4月改訂(第8版)

※ 2015年3月改訂

日本標準商品分類番号 87449

貯法：気密容器に入れ、室温保存(錠)
遮光した気密容器に入れ、室温保存(OD錠)
使用期限：外箱等に表示(3年)

	錠5mg	錠10mg	OD錠5mg	OD錠10mg
承認番号	22000AMX00836	22000AMX00837	22000AMX00838	22000AMX00839
薬価収載	2008年7月	2008年7月	2008年7月	2008年7月
販売開始	2008年7月	2008年7月	2008年7月	2008年7月

持続性選択H₂受容体拮抗剤

エバスタチン錠5mg「タカタ」

エバスタチン錠10mg「タカタ」

日本薬局方 エバスタチン錠

エバスタチンOD錠5mg「タカタ」

エバスタチンOD錠10mg「タカタ」

日本薬局方 エバスタチン口腔内崩壊錠

EBASTINE



【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

品名	エバスタチン錠5mg「タカタ」	エバスタチン錠10mg「タカタ」
成分・分量	1錠中 エバスタチン 5mg	1錠中 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6000、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ	

品名	エバスタチンOD錠5mg「タカタ」	エバスタチンOD錠10mg「タカタ」
成分・分量	1錠中 エバスタチン 5mg	1錠中 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、クロスポビドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、赤色106号、ステビア抽出精製物、香料	

2. 製剤の性状

品名	エバスタチン錠5mg「タカタ」	エバスタチン錠10mg「タカタ」
性状	白色のフィルムコーティング錠	片面に二分割線のある白色のフィルムコーティング錠
外形	表面径	約6.6mm 長径：約10.1mm 短径：約5.1mm
	裏面径	約0.108g 約0.144g
	側面径	約3.2mm 約3.2mm
識別コード	TTS-411	TTS-412

品名	エバスタチンOD錠5mg「タカタ」	エバスタチンOD錠10mg「タカタ」
性状	薄い紅色の裸錠	白色の裸錠
外形	表面径	約6.5mm 約8.0mm
	裏面径	約0.1g 約0.2g
	側面径	約2.6mm 約3.6mm
識別コード	TTS-414	TTS-415

【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】

- 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[肝機能異常があらわれるおそれがある。]
- 重要な基本的注意
 - 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。
 - 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。
 - 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。
 - 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、唾液又は水で飲み込むこと。
- 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)

薬剤名等	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テ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。	カレバステ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テ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テチンの血漿中濃度が低下することが報告されている。	カレバステチンの代謝が促進されると考えられる。

- 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。
 - 重大な副作用(頻度不明)
 - 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。
 - 肝機能障害、黄疸 AST(GOT)、ALT(GPT)、LDH、 γ -GTP、Al-P、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。
 - 類薬による重大な副作用
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

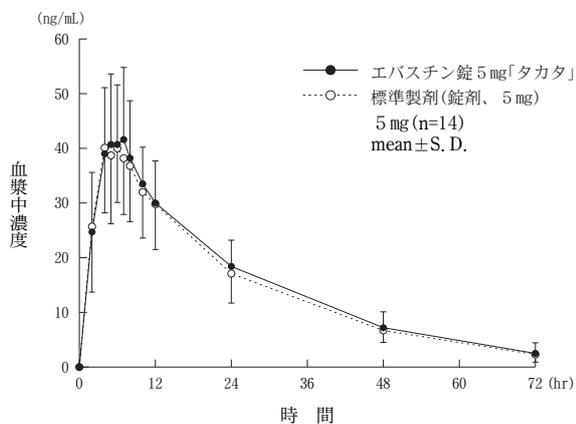
	頻度不明
過敏症 ^(注)	発疹、浮腫、蕁麻疹
循環器	動悸、血圧上昇
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、めまい、しびれ感、不眠
消化器	口渇、胃部不快感、嘔気・嘔吐、腹痛、鼻・口腔内乾燥、下痢、舌炎
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、LDH上昇、 γ -GTP上昇、Al-P上昇、ビリルビン上昇
泌尿器	排尿障害、頻尿
その他	好酸球増多、胸部圧迫感、ほてり、体重増加、月経異常、脱毛、味覚異常、BUN上昇、尿糖

注)症状があらわれた場合には、投与を中止すること。(太字)

- 高齢者への投与
一般に高齢者では、生理機能が低下しているので、1日1回5mgから投与するなど注意すること。
- 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。]
 - 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。]
- 小児等への投与
低出生体重児、新生児、乳児又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。)
- 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。
- 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。]
 - 服用時(OD錠：口腔内崩壊錠)：OD錠は舌の上のせ唾液を湿潤させ、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】

- 生物学的同等性試験
 - エバスチン錠5mg「タカタ」¹⁾
本剤と標準製剤(錠剤、5mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子14名にそれぞれ1錠(エバスチンとして5mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後2、4、5、6、7、8、10、12、24、48及び72時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MSにより測定したカレバステチン(エバスチンの代謝物)の血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差はlog0.8~log1.25の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



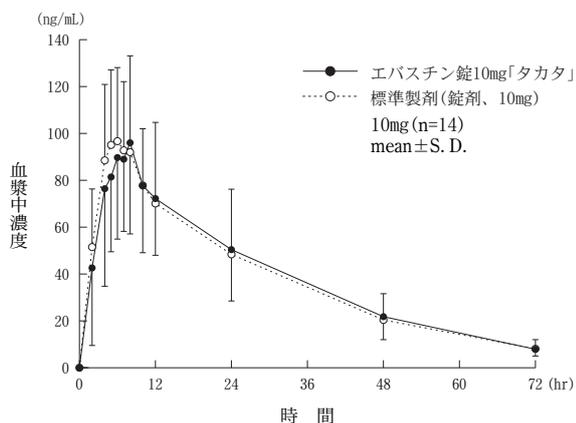
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
エバステン錠 5 mg 「タカタ」	1099.5±271.2	45.0±13.0	6.1±1.4	16.9±2.7
標準製剤 (錠剤、5 mg)	1052.2±278.6	45.8±11.1	5.4±1.4	16.7±2.3

(mean±S. D.)

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) エバステン錠10mg「タカタ」¹⁾

本剤と標準製剤(錠剤、10mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子14名にそれぞれ1錠(エバステンとして10mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後2、4、5、6、7、8、10、12、24、48及び72時間に前腕静脈から採血した。LC/MS/MSにより測定したカレバステン(エバステンの代謝物)の血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの対数値の平均値の差はlog0.8~log1.25の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
エバステン錠10mg 「タカタ」	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

(mean±S. D.)

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) エバステンOD錠 5mg「タカタ」²⁾

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、本剤と旧処方製剤[ヒトを対象とした生物学的同等性試験により同等性が確認されている。]の溶出挙動を比較したところ、両剤の溶出挙動は同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

(4) エバステンOD錠10mg「タカタ」³⁾

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、本剤と旧処方製剤[ヒトを対象とした生物学的同等性試験により同等性が確認されている。]の溶出挙動を比較したところ、両剤の溶出挙動は同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

2. 溶出挙動^{4~7)}

本剤は、日本薬局方医薬品各条に定められたエバステン錠及びエバステ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】

エバステンの主代謝物であるカルボン酸体(カレバステン)がヒスタミンH₁受容体拮抗作用を示し、その作用は持続的である。

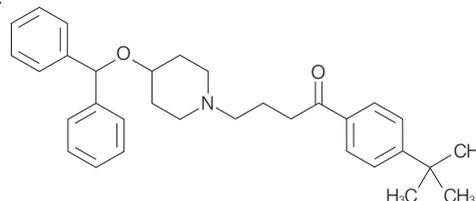
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エバステン[日局]

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：C₃₂H₃₉NO₂

分子量：469.66

性状：白色の結晶又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。

光により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^{8~11)}

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、60%RH、36ヵ月)の結果、3年間安定であることが確認された。

【包装】

エバステン錠 5mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

エバスチン錠10mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

500錠(10錠×50)

エバスチンOD錠5mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

500錠(10錠×50)

エバスチンOD錠10mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

500錠(10錠×50)

【主要文献】

- 1) 高野和彦：高田製薬株式会社内資料(錠：生物学的同等性)
- 2) 高田製薬株式会社内資料(5mgOD錠：生物学的同等性)
- 3) 高田製薬株式会社内資料(10mgOD錠：生物学的同等性)
- 4) 高田製薬株式会社内資料(5mg錠：溶出性)
- 5) 高田製薬株式会社内資料(10mg錠：溶出性)
- 6) 高田製薬株式会社内資料(5mgOD錠：溶出性)
- 7) 高田製薬株式会社内資料(10mgOD錠：溶出性)
- 8) 高田製薬株式会社内資料(5mg錠：安定性)
- 9) 高田製薬株式会社内資料(10mg錠：安定性)
- 10) 高田製薬株式会社内資料(5mgOD錠：安定性)
- 11) 高田製薬株式会社内資料(10mgOD錠：安定性)

【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。

高田製薬株式会社 学術部

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

今回
改訂
→

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1