

貯法：気密容器で室温保存，遮光保存（OD錠のみ）  
使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること

	錠5mg	錠10mg	OD錠5mg	OD錠10mg
承認番号	22000AMX 00506000	22000AMX 00500000	22000AMX 00503000	22000AMX 00539000
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H<sub>1</sub>受容体拮抗剤







日本薬局方 エバスチン錠  
エバスチン錠5mg「日医工」  
エバスチン錠10mg「日医工」  
Ebastine

日本薬局方 エバスチン口腔内崩壊錠  
エバスチンOD錠5mg「日医工」  
エバスチンOD錠10mg「日医工」  
Ebastine OD

【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		エバスチン錠5mg 「日医工」	エバスチン錠10mg 「日医工」
剤形・色調		白色のフィルムコーティング錠	片面に割線を有する白色のフィルムコーティング錠
有効成分の名称		エバスチン	
含量（1錠中）		5mg	10mg
添加物		セルロース，乳糖，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，ステアリン酸マグネシウム，無水ケイ酸，ヒプロメロース，マクロゴール，タルク，酸化チタン，カルナウバロウ	
外形	表面	 質量：83mg	 質量：135mg
	裏面	 直径：6.1mm	 直径：10.1×5.1mm
	側面	 厚さ：2.9mm	 厚さ：3.6mm
本体コード		㊦ 028 5	㊦ 029 10
包装コード		㊦ 028	㊦ 029

販売名		エバスチンOD錠5mg 「日医工」	エバスチンOD錠10mg 「日医工」
剤形・色調		薄い紅色の素錠（口腔内崩壊錠）	白色の素錠（口腔内崩壊錠）
有効成分の名称		エバスチン	
含量（1錠中）		5mg	10mg
添加物		D-マンニトール，キシリトール，セルロース，クロスポビドン，メタケイ酸アルミン酸マグネシウム，リン酸水素カルシウム，クロスカルメロースナトリウム，サッカリンナトリウム，フマル酸ステアリルナトリウム，カルミン，香料	
外形	表面	 質量：125mg	 質量：250mg
	裏面	 直径：7.5mm	 直径：9.1mm
	側面	 厚さ：2.4mm	 厚さ：3.4mm
本体コード		㊦ 043 5	㊦ 044 10
包装コード		㊦ 043	㊦ 044

【効能・効果】

蕁麻疹  
湿疹・皮膚炎，痒疹，皮膚瘙癢症  
アレルギー性鼻炎

**【用法・用量】**

通常、成人には、エバスチンとして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。〕

**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。
- (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、唾液又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、 $\gamma$ -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。

**(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、けん怠感、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、 $\gamma$ -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：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。〕
- (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。）

**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**

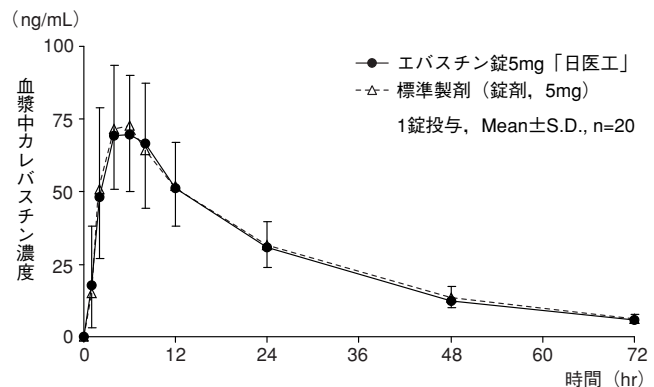
**(1) エバスチン錠5mg「日医工」**

エバスチン錠5mg「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エバスチンとして5mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して活性代謝物であるカレバスタチンの血漿中濃度を測定し、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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

**<エバスチン錠5mg「日医工」>**

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→72</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エバスチン錠 5mg「日医工」	1899.6± 530.3	76.2± 23.5	5.5±1.8	19.8±3.0
標準製剤 (錠剤, 5mg)	1950.4± 458.2	76.7± 23.9	5.5±2.2	19.7±2.1

(1錠投与, Mean±S.D., n=20)



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。

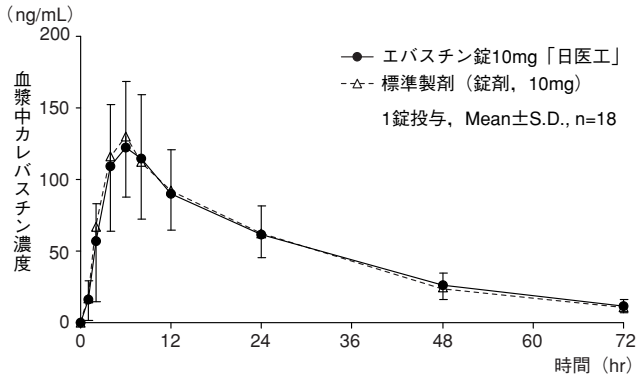
**(2) エバスチン錠10mg「日医工」**

エバスチン錠10mg「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エバスチンとして10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して活性代謝物であるカレバスタチンの血漿中濃度を測定し、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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

<エバスタチン錠10mg「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチン錠 10mg「日医工」	3501.5± 1104.7	126.9± 49.2	5.6±1.5	19.9±3.0
標準製剤 (錠剤, 10mg)	3529.0± 995.8	135.1± 46.7	5.7±1.2	19.3±2.7

(1錠投与, Mean±S.D., n=18)



血漿中濃度並びにAUC, C<sub>max</sub>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。

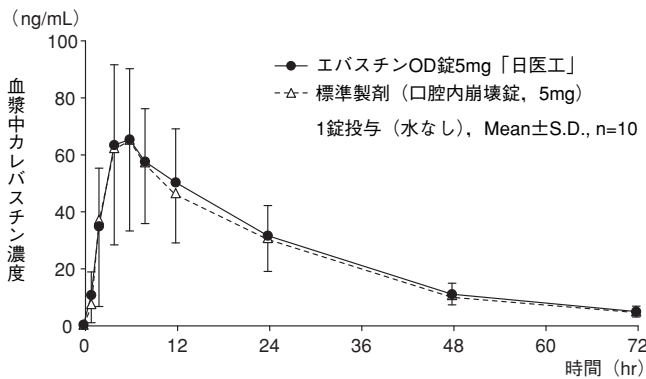
(3) エバスタチンOD錠5mg「日医工」

エバスタチンOD錠5mg「日医工」及び標準製剤を, クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(エバスタチンとして5mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して活性代謝物であるカレバスタチンの血漿中濃度を測定し, 得られた薬物動態パラメータ(AUC, C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果, log(0.8)~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。<sup>2)</sup>

<エバスタチンOD錠5mg「日医工」:水なし>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠 5mg「日医工」	1762.4± 586.4	68.6± 24.3	5.4±1.6	17.3±2.8
標準製剤 (口腔内崩壊錠, 5mg)	1710.2± 636.6	69.1± 32.6	5.8±1.1	18.2±4.2

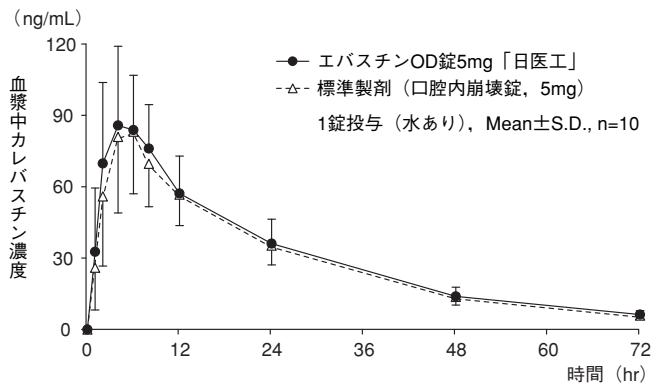
(1錠投与, 水なし, Mean±S.D., n=10)



<エバスタチンOD錠5mg「日医工」:水あり>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠 5mg「日医工」	2220.5± 619.3	90.8± 30.0	5.2±2.1	19.0±2.7
標準製剤 (口腔内崩壊錠, 5mg)	2134.7± 496.1	87.3± 30.3	5.4±1.3	18.9±3.4

(1錠投与, 水あり, Mean±S.D., n=10)



血漿中濃度並びにAUC, C<sub>max</sub>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。

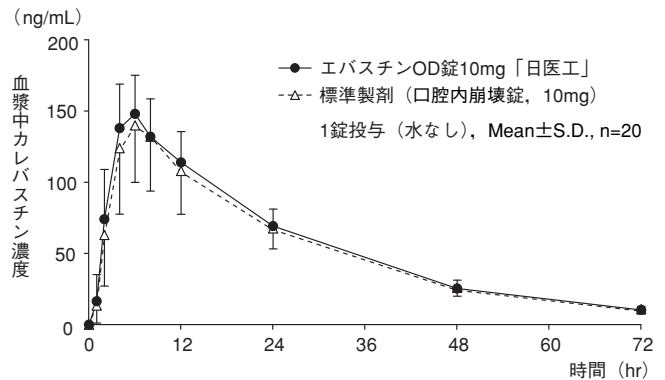
(4) エバスタチンOD錠10mg「日医工」

エバスタチンOD錠10mg「日医工」及び標準製剤を, クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(エバスタチンとして10mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して活性代謝物であるカレバスタチンの血漿中濃度を測定し, 得られた薬物動態パラメータ(AUC, C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果, log(0.8)~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。<sup>2)</sup>

<エバスタチンOD錠10mg「日医工」:水なし>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠 10mg「日医工」	3988.0± 669.8	150.1± 27.8	5.6±1.0	17.4±1.9
標準製剤 (口腔内崩壊錠, 10mg)	3858.9± 857.8	141.5± 40.0	6.4±1.7	18.3±2.8

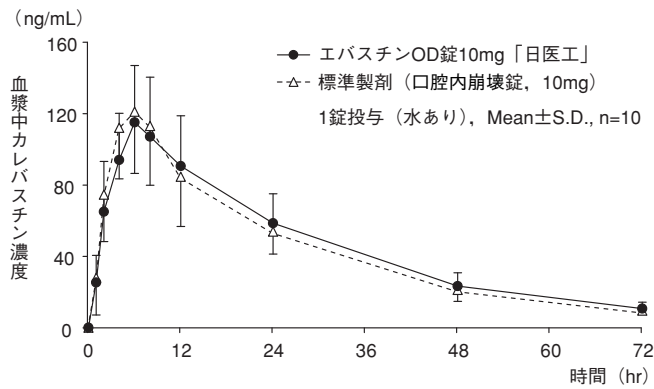
(1錠投与, 水なし, Mean±S.D., n=20)



<エバスタチンOD錠10mg「日医工」:水あり>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-72</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エバスタチンOD錠 10mg「日医工」	3325.0± 865.2	121.1± 32.7	6.8±2.1	19.9±3.2
標準製剤 (口腔内崩壊錠, 10mg)	3213.5± 808.7	127.2± 32.1	6.4±1.3	19.5±2.8

(1錠投与, 水あり, Mean±S.D., n=10)



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

- (1) エバスタチン錠5mg「日医工」、エバスタチン錠10mg「日医工」  
エバスタチン錠5mg「日医工」及びエバスタチン錠10mg「日医工」は、日本薬局方医薬品各条に定められたエバスタチン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>3)</sup>
- (2) エバスタチンOD錠5mg「日医工」、エバスタチンOD錠10mg「日医工」  
エバスタチンOD錠5mg「日医工」及びエバスタチンOD錠10mg「日医工」は、日本薬局方医薬品各条に定められた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。<sup>4)</sup>

## 【薬効薬理】

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そう痒、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で、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。<sup>5)</sup>

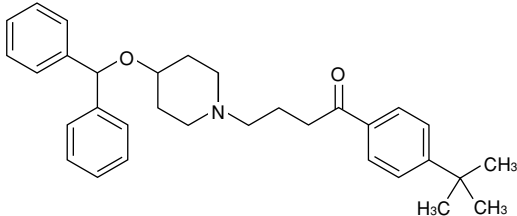
## 【有効成分に関する理化学的知見】

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。

本品は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

本品につき加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）を行った結果、エバスタチン錠5mg「日医工」、エバスタチン錠10mg「日医工」、エバスタチンOD錠5mg「日医工」及びエバスタチンOD錠10mg「日医工」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。<sup>6)</sup>

## 【包装】

エバスタチン錠5mg「日医工」

100錠（10錠×10；PTP）

エバスタチン錠10mg「日医工」

100錠（10錠×10；PTP）

500錠（10錠×50；PTP）

エバスタチンOD錠5mg「日医工」

100錠（10錠×10；PTP）

500錠（10錠×50；PTP）

エバスタチンOD錠10mg「日医工」

100錠（10錠×10；PTP）

500錠（10錠×50；PTP）

## 【主要文献】

- 1) 水山和之 他：医学と薬学, 60(1), 99(2008)
- 2) 中道 昇 他：医学と薬学, 60(1), 109(2008)
- 3) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験（錠）
- 4) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験（OD錠）
- 5) 第十七改正日本薬局方解説書 C-938, 廣川書店, 東京 (2016)
- 6) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

## 【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948