

持続性選択H₁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「トワ」

エバスタチン錠10mg「トワ」

EBASTINE TABLETS 5mg “TOWA”/TABLETS 10mg “TOWA”

貯 法：室温保存（開封後は湿気に注意）







使用期限：外箱に記載

日本標準商品分類番号 87449			
	承認番号	薬価収載	販売開始
錠5mg	22000AMX00910	2008年7月	2008年7月
錠10mg	22000AMX00911	2008年7月	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】

		エバスタチン錠5mg「トワ」	エバスタチン錠10mg「トワ」
1錠中の有効成分		日局 エバスタチン5mg	日局 エバスタチン10mg
添加物		乳糖水和物、クロスポビドン、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、マクロゴール6000、タルク、酸化チタン	乳糖水和物、クロスポビドン、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、マクロゴール6000、タルク、酸化チタン
性状		白色のフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠
識別コード	本体	Tw733	Tw734
外形	表		
	裏		
	側面		
錠径(mm)		6.1	10.1/5.1(長径/短径)
厚さ(mm)		2.8	3.2
質量(mg)		73	125

【効能・効果】

蕁麻疹

湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症

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。

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	エバスタチン製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	エバスタチン製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	エバスタチン製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、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（頻度不明）

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1)}	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、 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1)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

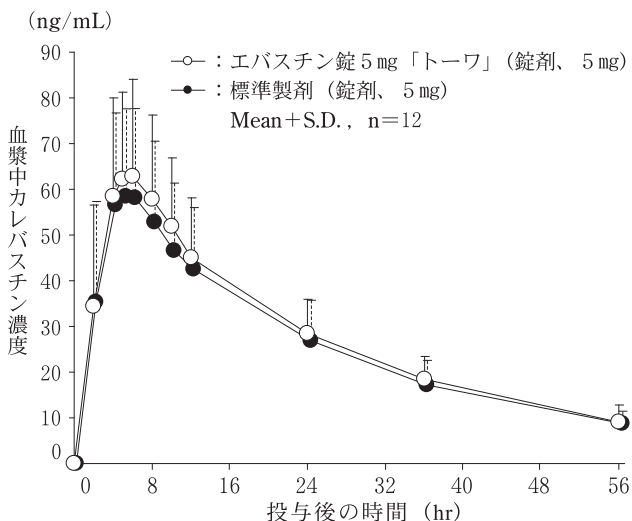
薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

1) エバスチン錠5mg「トーワ」

エバスチン錠5mg「トーワ」と標準製剤を、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(n=12)に絶食単回経口投与して代謝物であるカレバステ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(0.80)~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¹⁾。



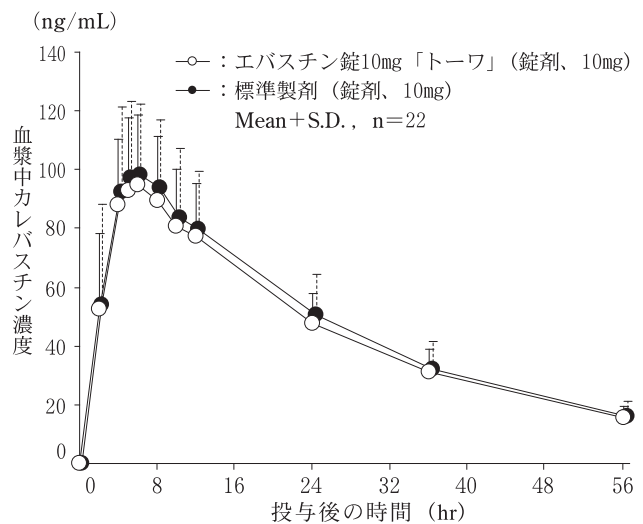
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₅₆ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エバスチン錠5mg「トーワ」 (錠剤、5mg)	1574±452	65.17±20.85	5.3±0.8	19.63±3.25
標準製剤 (錠剤、5mg)	1478±482	60.10±20.00	5.3±1.2	20.07±2.00

(Mean±S.D., 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) エバスチン錠10mg「トーワ」

エバスチン錠10mg「トーワ」と標準製剤を、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(n=22)に絶食単回経口投与して代謝物であるカレバステ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(0.80)~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¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₅₆ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エバスチン錠10mg「トーワ」 (錠剤、10mg)	2583±572	97.50±25.04	5.5±1.6	19.98±2.85
標準製剤 (錠剤、10mg)	2686±714	102.76±26.29	5.4±1.3	19.48±2.52

(Mean±S.D., n=22)

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

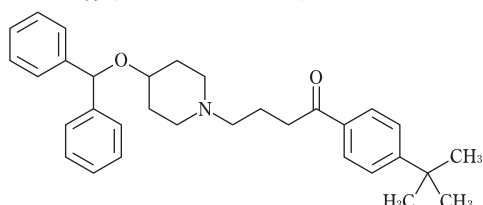
エバスチン錠5mg「トーワ」及びエバスチン錠10mg「トーワ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたエバスチン錠の溶出規格に適合していることが確認されている²⁾³⁾。

【薬効薬理】

H₁受容体に可逆的かつ競合的に結合し、ヒスタミンの作用を遮断する。中枢神経系への影響が少ない。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



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

分子式：C₂₂H₂₉NO₂

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

1) エバスタチン錠5mg「トーワ」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、エバスタチン錠5mg「トーワ」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⁴⁾。

2) エバスタチン錠10mg「トーワ」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度60%、4年）の結果、エバスタチン錠10mg「トーワ」は通常の市場流通下において4年間安定であることが確認された⁵⁾。

【包装】

エバスタチン錠5mg「トーワ」：100錠（PTP）

エバスタチン錠10mg「トーワ」：100錠、500錠（PTP）

【主要文献】

- 1) 水山 和之ほか：新薬と臨牀, 57(6), 261, 2008
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験(錠5mg)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験(錠10mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験(錠5mg)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験(錠10mg)

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献（社内資料を含む）は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター（24時間受付対応）

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



製造販売元
東和薬品株式会社
大阪府門真市新橋町2番11号