

エバスタチン口腔内崩壊錠

エバスタチンOD錠5mg「YD」

エバスタチンOD錠10mg「YD」

EBASTINE OD TABLETS

貯法：室温保存、遮光保存、気密容器
 使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。
 注意：取扱い上の注意の項参照。

	OD錠5mg	OD錠10mg
承認番号	22100AMX01967	22100AMX01968
薬価収載	2009年11月	2009年11月
販売開始	2009年11月	2009年11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]

1. 組成

エバスタチンOD錠5mg「YD」

1錠中、エバスタチン5mgを含有する。
 添加物として、D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、無水リン酸水素カルシウム、クロスポビドン、タウマチン、ステアリン酸Mg、カルミン、香料を含有する。

エバスタチンOD錠10mg「YD」

1錠中、エバスタチン10mgを含有する。
 添加物として、D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、無水リン酸水素カルシウム、クロスポビドン、ステアリン酸Mg、タウマチン、香料を含有する。

2. 性状

エバスタチンOD錠5mg「YD」

淡赤色の素錠である。

エバスタチンOD錠10mg「YD」

白色の素錠である。

	外形			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)	識別 コード (PTP)
	表	裏	側面				
エバスタチンOD錠5mg「YD」	YD 572	5	—	約6	約2.2	85	YD 572
エバスタチンOD錠10mg「YD」	YD 573	10	—	約7.5	約3.2	170	YD 573

[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) 本剤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

※1) ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)
 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(いずれも頻度不明)

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

	頻度不明
過敏症 ^{※1)}	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、γ-GTP、ALP、ビリルビンの上昇
泌尿器	排尿障害、頻尿

	頻度不明
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

P T P包装の薬剤はP T Pシートから取り出して服用するよう指導すること。(P T Pシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をお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

本剤は舌の上の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]

エバスチンOD錠5mg[YD]

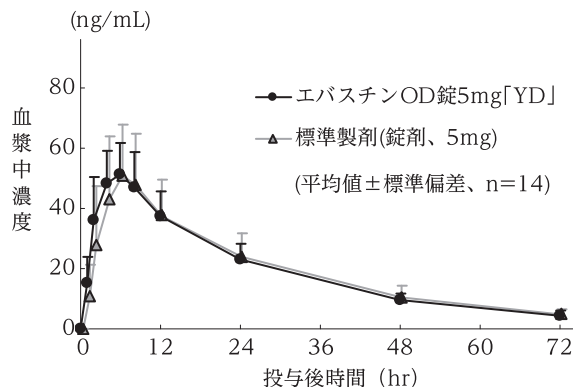
(1) 生物学的同等性試験

1) 水で服用した場合

エバスチンOD錠5mg[YD]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14名に絶食単回経口投与して血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、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 ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
エバスチンOD錠5mg[YD]	1397.8±295.8	53.01±10.09	5.6±1.6	19.8±2.8
標準製剤(錠剤、5mg)	1419.9±474.3	51.50±17.52	6.0±1.1	20.3±3.0

(平均値±標準偏差、n=14)



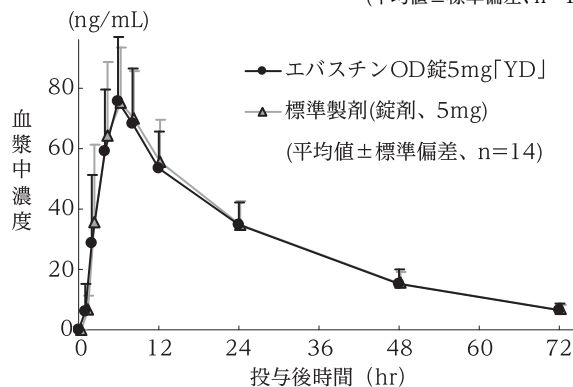
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2) 水なしで服用した場合

エバスチンOD錠5mg[YD]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14名に絶食単回経口投与して血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、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 ₀₋₇₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
エバスチンOD錠5mg[YD]	2024.5±452.2	77.12±20.00	6.4±1.8	20.2±2.8
標準製剤(錠剤、5mg)	2064.4±458.5	77.01±18.92	5.9±1.2	20.6±2.9

(平均値±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) 溶出挙動

エバスチンOD錠5mg[YD]は、日本薬局方医薬品各条に定められたエバス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。

エバスチンOD錠10mg[YD]

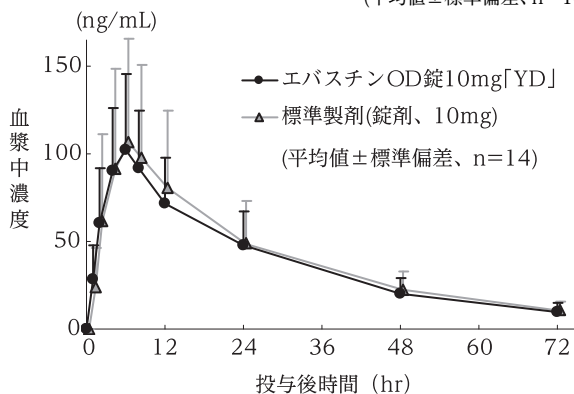
(1) 生物学的同等性試験

1) 水で服用した場合

エバスチンOD錠10mg[YD]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14名に絶食単回経口投与して血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
エバスタチン OD錠10mg [YD]	2818.8±1096.5	103.6±42.2	5.7±1.3	20.6±1.8
標準製剤 (錠剤,10mg)	2981.5±1566.4	108.3±59.9	6.1±0.9	21.4±1.8

(平均値±標準偏差, n=14)



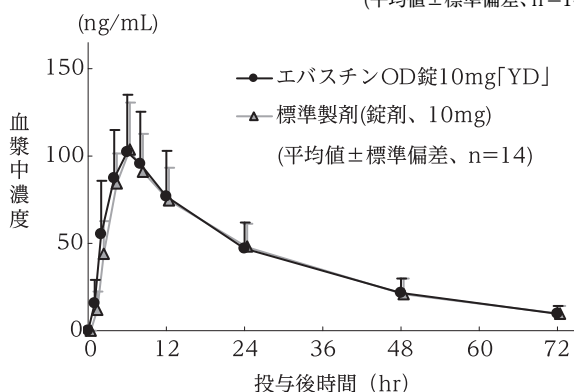
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2) 水なしで服用した場合

エバスタチンOD錠10mg[YD]と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠(エバスタチンとして10mg)、健康成人男子14名に絶食単回経口投与して血漿中の活性代謝物カレバスタチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
エバスタチン OD錠10mg [YD]	2862.4±932.4	102.9±32.7	6.3±0.7	21.2±1.8
標準製剤 (錠剤,10mg)	2795.8±734.5	103.8±27.2	6.0±0.8	20.8±3.0

(平均値±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) 溶出挙動

エバスタチンOD錠10mg[YD]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。

[有効成分に関する理化学的知見]

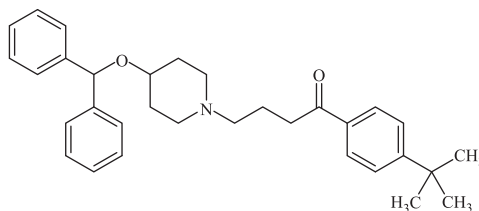
一般名：エバスタチン(Ebastine)

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

分子式：C₃₂H₃₉NO₂

分子量：469.66

構造式：



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。

[取扱い上の注意]

エバスタチンOD錠5mg[YD]

(1) 保管方法

光、湿気を避けて保存して下さい。

使用期限内であっても開封後はお早めに使用して下さい。

(2) 安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヶ月)の結果、エバスタチンOD錠5mg[YD]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。³⁾

エバスタチンOD錠10mg[YD]

(1) 保管方法

光、湿気を避けて保存して下さい。

使用期限内であっても開封後はお早めに使用して下さい。

(2) 安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヶ月)の結果、エバスタチンOD錠10mg[YD]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⁾

[包装]

エバスタチンOD錠5mg[YD]

PTP：100錠

エバスタチンOD錠10mg[YD]

PTP：100錠、500錠

[主要文献]

- 1) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験
- 2) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験
- 3) (株)陽進堂社内資料：安定性試験
- 4) (株)陽進堂社内資料：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下さい。

株式会社 陽進堂 お客様相談室
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号
☎ 0120-647-734

製造販売元

 株式会社 陽進堂
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号