

貯 法：室温保存
有効期間：3年

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 5 mg「NS」
エバスタチンOD錠 10mg「NS」

Ebastine OD Tablets 5mg・10mg “NS”

	OD錠5mg	OD錠10mg
承認番号	22100AMX01965	22100AMX01966
販売開始	2009年11月	



2. 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

3. 組成・性状**3.1 組成**

販売名	エバスタチンOD錠5mg「NS」	エバスタチンOD錠10mg「NS」
有効成分	1錠中 日本薬局方エバスタチン5mg	1錠中 日本薬局方エバスタチン10mg
添加剤	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、ステアリン酸マグネシウム、カルミン、香料	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、ステアリン酸マグネシウム、タウマチン、香料

3.2 製剤の性状

販売名	エバスタチンOD錠5mg「NS」	エバスタチンOD錠10mg「NS」
性状	淡赤色の素錠	白色の素錠
外形		
大きさ	錠径：6.0mm 錠厚：2.2mm 重量：85mg	錠径：7.5mm 錠厚：3.2mm 重量：170mg
識別コード	NS 414	NS 415

4. 効能又は効果

- 蕁麻疹
- 湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚痒疹症
- アレルギー性鼻炎

6. 用法及び用量

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。

7. 用法及び用量に関連する注意

高齢者では、1日1回5mgから投与するなど注意すること。[9.8参照]

8. 重要な基本的注意**〈効能共通〉**

8.1 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。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.2 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意**9.1 合併症・既往歴等のある患者****9.1.1 長期ステロイド療法を受けている患者**

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。

9.3 肝機能障害患者**9.3.1 肝機能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。

9.5 妊婦

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。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

患者の状態を十分に観察しながら投与すること。一般に生理機能が低下している。[7.参照]

10. 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。[16.4.1参照]

10.2 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 [16.7.1参照]	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。

11. 副作用

次の副作用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。

11.1 重大な副作用**11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）**

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。

11.1.2 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

AST、ALT、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。

11.2 その他の副作用

	1%以上	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症				発疹、浮腫、じん麻疹
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	口喝	胃部不快感、鼻・口腔内乾燥	下痢、舌炎	嘔気・嘔吐、腹痛
肝臓				AST、ALT、LDH、γ-GTP、ALP、ビリルビンの上昇
泌尿器				排尿障害、頻尿
その他		胸部圧迫感	ほてり	好酸球増多、体重増加、月経異常、脱毛、味覚異常、BUNの上昇、尿酸

12. 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。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

14.1.2 本剤は舌の上のせて唾液を湿潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

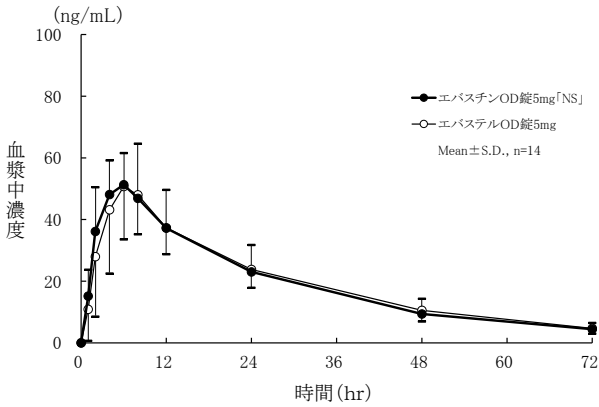
(エバスチンOD錠5mg「NS」)

エバスチンOD錠5mg「NS」とエバステルOD錠5mg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時単回経口投与(水で服用及び水なしで服用)して活性代謝物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、両製剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

(1) OD錠5mg、水で服用

	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「NS」	1397.8±295.8	53.0±10.1	5.6±1.6	19.8±2.8
エバステルOD錠 5mg	1419.9±474.3	51.5±17.5	6.0±1.1	20.3±3.0

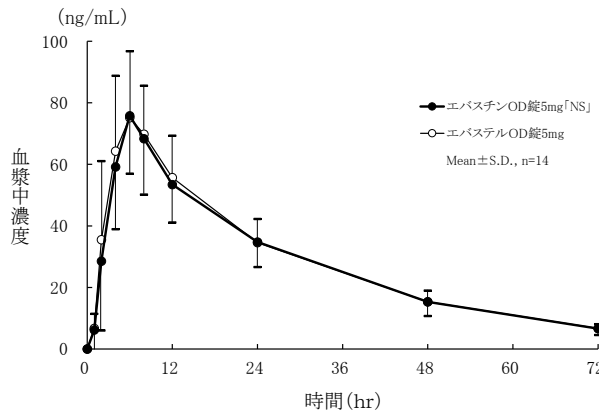
(Mean±S.D., n=14)



(2) OD錠5mg、水なしで服用

	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「NS」	2024.5±452.2	77.1±20.0	6.4±1.8	20.2±2.8
エバステルOD錠 5mg	2064.4±458.5	77.0±18.9	5.9±1.2	20.6±2.9

(Mean±S.D., 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。

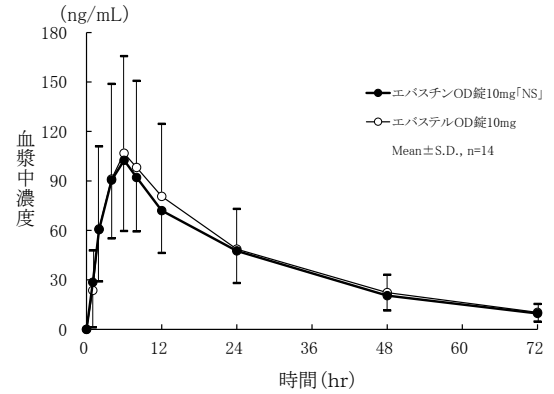
(エバスチンOD錠10mg「NS」)

エバスチンOD錠10mg「NS」とエバステルOD錠10mg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時単回経口投与(水で服用及び水なしで服用)して活性代謝物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、両製剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

(3) OD錠10mg、水で服用

	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 10mg「NS」	2818.8±1096.5	103.6±42.2	5.7±1.3	20.6±1.8
エバステルOD錠 10mg	2981.5±1566.4	108.3±59.9	6.1±0.9	21.4±1.8

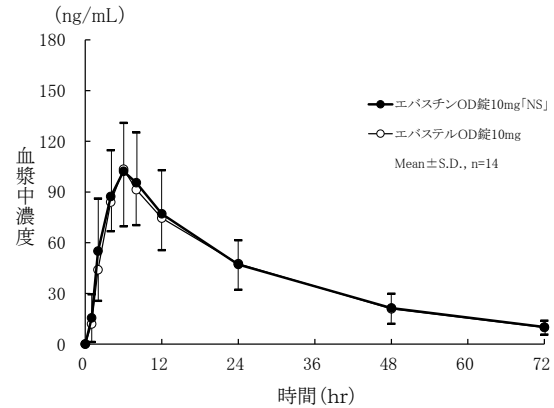
(Mean±S.D., n=14)



(4) OD錠10mg、水なしで服用

	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 10mg「NS」	2862.4±932.4	102.9±32.7	6.3±0.7	21.2±1.8
エバステルOD錠 10mg	2795.8±734.5	103.8±27.2	6.0±0.8	20.8±3.0

(Mean±S.D., 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。

16.4 代謝

16.4.1 代謝酵素

カレバステンへの代謝には主としてCYP2J2、CYP3A4が、また未変化体の酸化的N-脱アルキル化にはCYP3A4が関与する^{3)、4)}。[10.参照]

16.7 薬物相互作用

16.7.1 エリスロマイシン

(健康成人8例にエバスチン10mgを1日1回14日間反復経口投与、8日目よりエリスロマイシン1,200mg/日を併用経口投与)⁵⁾ [10.2参照]

測定日	カレバステン			
	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)	AUC ₀₋₂₄ (ng・h/mL)
試験7日目 (単独投与最終日)	244±15	5±1	17.2±0.4	4,092±181
試験14日目 (併用投与最終日)	514±27	5±1	21.6±0.9	9,492±581

平均値±標準誤差

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

エバスタチンはH₁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痒痒、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、エバスタチン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⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

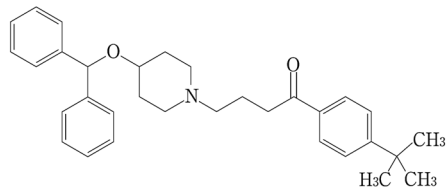
一般的名称：エバスタチン (Ebastine)

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

分子式：C₂₂H₃₂N₂O₂

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。

融点：84~87℃

20. 取扱い上の注意

アルミビロー開封後は遮光して保存すること。

22. 包装

〈エバスタチンOD錠5mg「NSJ」〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

〈エバスタチンOD錠10mg「NSJ」〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

23. 主要文献

- 1) 社内資料：生物学的同等性試験 (OD錠5mg)
- 2) 社内資料：生物学的同等性試験 (OD錠10mg)
- 3) 橋爪孝典：Progress in Medicine. 2003 ; 23 : 282-287
- 4) Hashizume T., et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 2002 ; 300 : 298-304
- 5) 長澤紘一ほか：臨床医薬. 1995 ; 11 : 1213-1226
- 6) 第十八改正日本薬局方解説書. 東京：廣川書店；2021. C993-997

24. 文献請求先及び問い合わせ先

共創未来ファーマ株式会社 お客様相談室
〒155-8655 東京都世田谷区代沢5-2-1
TEL 050-3383-3846

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



日新製薬株式会社

山形県天童市清池東二丁目3番1号

26.2 販売元



共創未来ファーマ株式会社

東京都品川区広町1-4-4