

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

有効期間：3年（錠5mg）

4年（錠10mg）

	錠5mg	錠10mg
承認番号	22000AMX00910	22000AMX00911
販売開始	2008年7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
添加剤	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、ステアリン酸マグネシウム、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、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、タルク、酸化チタン

3.2 製剤の性状

販売名	エバスタチン錠5mg「トワ」	エバスタチン錠10mg「トワ」	
性状・剤形	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
	包装		
外形	表		
	裏		
	側面		
直径(mm)	6.1	10.1/5.1（長径/短径）	
厚さ(mm)	2.8	3.2	
質量(mg)	73	125	

4. 効能又は効果

○蕁麻疹

○湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症

○アレルギー性鼻炎

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

	1%以上	0.1~1%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器	口渇	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、尿糖

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

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。

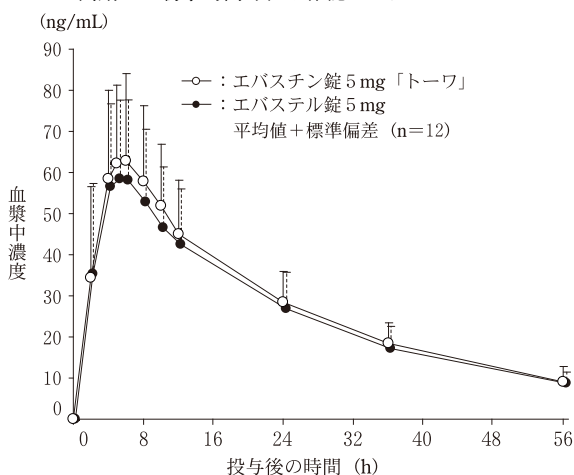
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

〈エバステチン錠5mg「トーワ」〉

エバステチン錠5mg「トーワ」とエバステル錠5mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エバステチンとして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_{max} ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾



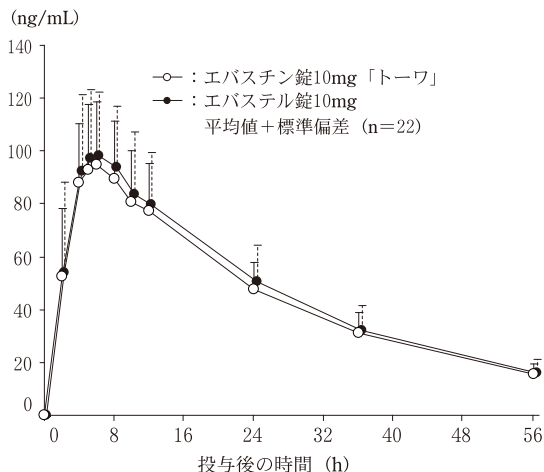
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0~56} (ng·h/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)
エバステチン錠5mg「トーワ」	1574±452	65.17±20.85	5.3±0.8	19.63±3.25
エバステル錠5mg	1478±482	60.10±20.00	5.3±1.2	20.07±2.00

平均値±標準偏差 (n=12)

血漿中濃度並びにAUC、 C_{max} 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。

〈エバステチン錠10mg「トーワ」〉

エバステチン錠10mg「トーワ」とエバステル錠10mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エバステチンとして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_{max} ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0~56} (ng·h/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)
エバステチン錠10mg「トーワ」	2583±572	97.5±25.0	5.5±1.6	19.98±2.85
エバステル錠10mg	2686±714	102.8±26.3	5.4±1.3	19.48±2.52

平均値±標準偏差 (n=22)

血漿中濃度並びにAUC、 C_{max} 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

カレバスタチ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。^{2),3)} [10. 参照]

16.7 薬物相互作用

16.7.1 エリスロマイシン

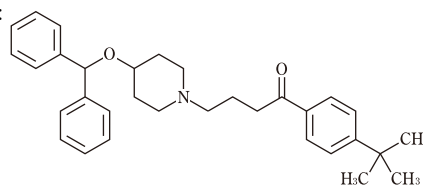
(健康成人8例にエバステチン10mgを1日1回14日間反復経口投与、8日目よりエリスロマイシン1,200mg/日を併用経口投与)⁴⁾ [10.2参照]

測定日	カレバスタチン			
	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±標準偏差

19. 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：エバステチン (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

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

アルミピロー開封後は湿気を避けて保存すること。

22. 包装

〈エバステチン錠5mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

〈エバステチン錠10mg「トーワ」〉


100錠 [10錠×10：PTP]

500錠 [10錠×50：PTP]

23. 主要文献

- 1) 水山和之ほか：新薬と臨牀. 2008；57(6)：971-985
- 2) 橋爪孝典：Progress in Medicine. 2003；23：282-287
- 3) Hashizume T., et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther. 2002；300：298-304
- 4) 長澤絨一ほか：臨床医薬. 1995；11：1213-1226

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号
 0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 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