

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019年更新版）に準拠して作成

持続性選択 H<sub>1</sub> 受容体拮抗剤  
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 5mg 「ZE」  
エバスタチン OD 錠 10mg 「ZE」  
EBASTINE OD TABLETS

剤形	素錠（口腔内崩壊錠）			
製剤の規制区分	—			
規格・含量	エバスタチン OD 錠 5mg「ZE」：1錠中日局エバスタチン 5mg を含有 エバスタチン OD 錠 10mg「ZE」：1錠中日局エバスタチン 10mg を含有			
一般名	和名：エバスタチン（JAN） 洋名：Ebastine（JAN）			
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日		製造販売承認 年月日	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
	OD 錠 5mg	2008年3月6日	2008年7月4日	2008年7月4日
	OD 錠 10mg	2008年3月6日	2008年7月4日	2008年7月4日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	発売元：全星薬品株式会社 製造販売元：全星薬品工業株式会社			
医薬情報担当者の連絡先				
問い合わせ窓口	全星薬品工業株式会社 医薬情報部 ☎ 0120-189-228 TEL 06-6630-8820 FAX 06-6630-8990 受付時間：9:00～17:00（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://zensei-med.jp/">https://zensei-med.jp/</a>			

本 IF は 2023 年 12 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。  
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I Fは紙媒体の冊子としての提供方式からPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDAと略す）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されて入手可能となっている。日病薬では、2008年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

この度、2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、新たに日病薬医薬情報委員会が記載要領を改め、「I F記載要領2018」として公表された。

## 2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I Fに記載する項目及び配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠する。ただし、医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律（以下、薬機法と略す）に基づく承認事項を逸脱するもの、製薬企業の機密等に関わるもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたI Fは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I Fの提供は、電子媒体を基本とし、必要に応じて薬剤師が印刷して使用する。製薬企業での製本は必須ではない。

### **3. I Fの利用にあたって**

電子媒体の I F は、PMDA の医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の M R 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

### **4. 利用に際しての留意点**

I F を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。しかし、薬機法の広告規制や医療用医薬品プロモーションコード等により、製薬企業が提供できる情報の範囲には自ずと限界がある。I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

(2018 年 10 月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	21
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	21
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	21
3. 製品の製剤学的特性	1		
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	22
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	22
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	22
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	22
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	22
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	22
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	22
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	23
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	23
5. 化学名(命名法)又は本質	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	24
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 過量投与	24
		11. 適用上の注意	24
III. 有効成分に関する項目	3	12. その他の注意	24
1. 物理化学的性質	3		
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	IX. 非臨床試験に関する項目	25
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 薬理試験	25
		2. 毒性試験	25
IV. 製剤に関する項目	4		
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	26
2. 製剤の組成	5	1. 規制区分	26
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	2. 有効期間	26
4. 力価	5	3. 包装状態での貯法	26
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	4. 取扱い上の注意	26
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	5. 患者向け資材	26
7. 調製法及び溶解後の安定性	8	6. 同一成分・同効薬	26
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	7. 国際誕生年月日	26
9. 溶出性	8	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	26
10. 容器・包装	12	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	26
11. 別途提供される資材類	13	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	26
12. その他	13	11. 再審査期間	26
		12. 投薬期間制限に関する情報	26
V. 治療に関する項目	14	13. 各種コード	27
1. 効能又は効果	14	14. 保険給付上の注意	27
2. 効能又は効果に関連する注意	14		
3. 用法及び用量	14	XI. 文献	28
4. 用法及び用量に関連する注意	14	1. 引用文献	28
5. 臨床成績	14	2. その他の参考文献	28
VI. 薬効薬理に関する項目	16	XII. 参考資料	29
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	16	1. 主な外国での発売状況	29
2. 薬理作用	16	2. 海外における臨床支援情報	29
VII. 薬物動態に関する項目	17	XIII. 備考	30
1. 血中濃度の推移	17	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	30
2. 薬物速度論的パラメータ	19	2. その他の関連資料	30
3. 母集団(ポピュレーション)解析	20		
4. 吸収	20		
5. 分布	20		
6. 代謝	20		
7. 排泄	21		
8. トランスポーターに関する情報	21		

## 略語表

略語	略語内容
ALP	Alkaline phosphatase アルカリホスファターゼ
ALT	Alanine aminotransferase アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	Aspartate aminotransferase アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	Area under the concentration-time curve 濃度-時間曲線下面積
AUC <sub>0~24</sub>	Area under the concentration-time curve from zero to 24 hr 投与0時から24時間までの濃度-時間曲線下面積
AUC <sub>(0→72)</sub>	Area under the concentration-time curve from zero to 72 hr 投与0時から72時間までの濃度-時間曲線下面積
BUN	Blood urea nitrogen 血中尿素窒素
C <sub>max</sub>	Maximum blood concentration 最高血中濃度
CYP	Cytochrome P450 シトクロム P450
γ-GTP	γ-Glutamyl transpeptidase ガンマ-グルタミルトランスペプチダーゼ
IgE	Immunoglobulin E 免疫グロブリン E
LDH	Lactate dehydrogenase 乳酸脱水素酵素
OD	Orally disintegrating 口腔内崩壊
PCA	Passive cutaneous anaphylaxis 受動皮膚アナフィラキシー
PTP	Press through package
RMP	Risk management plan 医薬品リスク管理計画
S. D.	Standard deviation 標準偏差
t <sub>1/2</sub>	Elimination half-life 消失半減期
T <sub>max</sub>	Time to maximum concentration 最高血中濃度到達時間

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

エバスチンは、選択  $H_1$  受容体拮抗作用を有し、第二世代のヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗剤として、本邦においては、1996年に上市され、また、口腔内崩壊錠（OD錠）も2005年2月に上市されている。

エバスチン OD錠 5mg「ZE」・OD錠 10mg「ZE」は、全星薬品工業が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2008年3月に承認を取得、2008年7月に上市した。

また、第十六改正日本薬局方で日本薬局方製剤とされたことから、2011年4月に規格等が日本薬局方に適合していることを確認し、「日本薬局方 エバスチン口腔内崩壊錠」としている。

その後、厚生労働省告示第377号（平成25年12月20日）により規制区分が変更（「処方箋医薬品」指定解除）となった。

なお、本剤は後発医薬品として、全星薬品工業株式会社、ニプロ株式会社、沢井製薬株式会社の3社で共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) エバスチンを有効成分とする第二世代のヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗剤である。
- (2) 1日1回の服用で持続的に効果を発揮する。
- (3) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、肝機能障害、黄疸が報告されている。  
（「Ⅷ. 8. 副作用」の項参照）

### 3. 製品の製剤学的特性

水あり・水なしでも服用可能なストロベリー風味の口腔内崩壊錠である。

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

- (1) 承認条件  
該当しない
- (2) 流通・使用上の制限事項  
該当しない

### 6. RMPの概要

該当しない

## II. 名称に関する項目

## 1. 販売名

## (1) 和名

エバスタチン OD 錠 5mg 「ZE」  
エバスタチン OD 錠 10mg 「ZE」

## (2) 洋名

EBASTINE OD TABLETS 5mg 「ZE」  
EBASTINE OD TABLETS 10mg 「ZE」

## (3) 名称の由来

医薬発第 935 号（平成 12 年 9 月 19 日）に従う「一般名+剤形+含量+屋号」販売名である

## 2. 一般名

## (1) 和名（命名法）

エバスタチン（JAN）

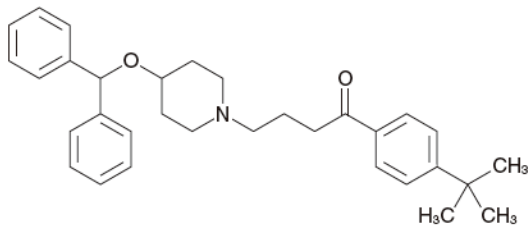
## (2) 洋名（命名法）

Ebastine（JAN）

## (3) ステム

抗ヒスタミン薬：-astine

## 3. 構造式又は示性式



## 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>32</sub>H<sub>39</sub>NO<sub>2</sub>

分子量：469.66

## 5. 化学名（命名法）又は本質

1-[4-(1,1-Dimethylethyl)phenyl]-4-[4-(diphenylmethoxy)piperidin-1-yl]butan-1-one (IUPAC)

## 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

### 1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：84～87℃

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に帯黄白色となる。

### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

日局「エバスチン」の確認試験

(1) 呈色反応

(2) 紫外可視吸光度測定法

(3) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

日局「エバスチン」の定量法

電位差滴定法





## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

## (1) 剤形の区別

錠剤：素錠（口腔内崩壊錠）

## (2) 製剤の外観及び性状

販売名		エバスタチン OD 錠 5mg 「ZE」	エバスタチン OD 錠 10mg 「ZE」
性状	色調	淡紅色	白色
	剤形	素錠（口腔内崩壊錠）	
外形			
規格	錠径 (mm)	6.5	8.0
	厚み (mm)	2.3	3.1
	重量 (mg)	100	200
識別コード		ZE15、5	ZE16、10

## (3) 識別コード

販売名		エバスタチン OD 錠 5mg 「ZE」	エバスタチン OD 錠 10mg 「ZE」
本体		ZE15、5	ZE16、10
包材 (PTP)	表	色調	無色透明／水色
		耳	エバスタチン OD 5mg「ZE」
	シート	ZE15	ZE16
裏	色調	白色	銀色
	耳	EBASTINE OD 5mg	EBASTINE OD 10mg
シート		エバスタチン OD5／エバスタチン OD／5mg ／プラマーク／取り出しケアマーク ／GS1 コード	エバスタチン OD／10mg／プラマーク／ 取り出しケアマーク／GS1 コード

## (4) 製剤の物性

製剤均一性

日局「エバスタチン口腔内崩壊錠」に記載の含量均一性試験に適合する。

崩壊性

日局一般試験法・崩壊試験に適合する。ただし、試験時間は1分間とする。

硬度

エバスタチン OD 錠 5mg 「ZE」：平均値 30N 以上

エバスタチン OD 錠 10mg 「ZE」：平均値 50N 以上

## (5) その他

該当しない

## 2. 製剤の組成

## (1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	エバスチン OD 錠 5mg 「ZE」	エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」
成分・分量 (1錠中)	日局 エバスチン 5mg	日局 エバスチン 10mg
添加剤	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、カルメロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、タウマチン、香料、三二酸化鉄	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、カルメロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、タウマチン、香料

## (2) 電解質等の濃度

該当しない

## (3) 熱量

該当しない

## 3. 添付溶解液の組成及び容量

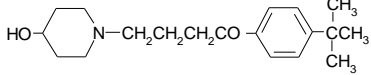
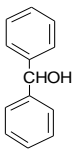
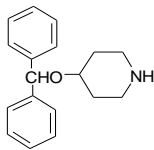
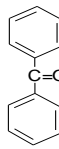
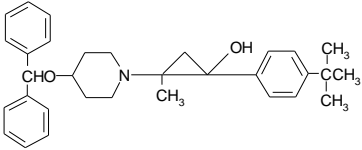
該当しない

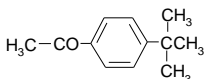
## 4. 力価

該当しない

## 5. 混入する可能性のある夾雑物

類縁物質として次の6種類が確認されている。

構造式	化学名
	1-[3-(4- <i>tert</i> -butylbenzoyl)propyl]-4-hydroxypiperidine
	Benzhydrol
	4-(diphenylmethoxy)piperidine
	benzophenone
	1-(4- <i>tert</i> -butylphenyl)-2-[4-(diphenylmethoxy)piperidino]-2-methylcyclopropane-1-ol

構造式	化学名
	4- <i>tert</i> -butylacetophenone

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

## (1) 加速試験

エバスチン OD 錠 5mg 「ZE」<sup>1)</sup>

包装形態：PTP 包装（ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔）した後、アルミニウム箔製の袋に入れ密閉したもの

試験条件：40±1°C/75±5%RH

試験項目	開始時	1 箇月	3 箇月	6 箇月
性状（淡紅色の素錠）	規格内	規格内	規格内	規格内
確認試験	適合	適合	適合	適合
純度試験（類縁物質）	規格内	規格内	規格内	規格内
崩壊性（1 分間）	規格内	規格内	規格内	規格内
溶出性（15 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内
定量（%）（95.0～105.0）	97.6～ 100.1	97.6～ 98.9	97.1～ 99.5	98.1～ 99.9

1 ロット n=3 3 ロット

エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」<sup>2)</sup>

包装形態：PTP 包装（ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔）した後、アルミニウム箔製の袋に入れ密閉したもの

試験条件：40±1°C/75±5%RH

試験項目	開始時	1 箇月	3 箇月	6 箇月
性状（白色の素錠）	規格内	規格内	規格内	規格内
確認試験	適合	適合	適合	適合
純度試験（類縁物質）	規格内	規格内	規格内	規格内
崩壊性（1 分間）	規格内	規格内	規格内	規格内
溶出性（15 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内
定量（%）（95.0～105.0）	97.9～ 98.5	97.1～ 98.0	98.2～ 99.4	97.3～ 97.9

1 ロット n=3 3 ロット

## (2) 無包装安定性試験

エバスチン OD 錠 5mg 「ZE」<sup>3)</sup>

保存条件		試験項目	開始時	2 週間	1 箇月	2 箇月	3 箇月
温度	40±2°C 遮光・ 気密容器	性状（淡紅色の素錠）	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%） （合計、1.0%未満）	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		（個々の最大、0.5%未満）	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		崩壊性（秒）（1 分以内）	20～22	20～23	20～25	23～33	25～35
		溶出性（15 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量（%）（95.0～105.0）	99.0	99.5	99.6	99.4	99.8
		硬度*1（N）（30N 以上）	37.2	37.2	39.1	38.8	39.8
湿度	25±2°C 75±5%RH 遮光・ 開放	性状（淡紅色の素錠）	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質（%） （合計、1.0%未満）	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		（個々の最大、0.5%未満）	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		崩壊性（秒）（1 分以内）	20～22	22～28	22～26	24～34	27～38
		溶出性（15 分 80%以上）	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内

IV. 製剤に関する項目

保存条件		試験項目	開始時	2週間	1箇月	2箇月	3箇月
		定量 (%) (95.0~105.0)	99.0	99.6	99.7	100.2	99.2
		硬度*1 (N) (30N以上)	37.2	27.7*2	28.5*2	29.8*2	29.0*2

保存条件		試験項目	開始時	40万lx・hr	80万lx・hr	120万lx・hr
光	1200lx 気密容器	性状 (淡紅色の素錠)	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質 (%)				
		(合計、1.0%未満)	<0.05	0.31	1.02*3	1.56*3
		(個々の最大、0.5%未満)	<0.05	0.26	0.75*3	1.07*3
		崩壊性 (秒) (1分以内)	20~22	25~28	23~26	24~26
		溶出性 (15分80%以上)	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量 (%) (95.0~105.0)	99.0	99.3	98.7	97.0
	硬度*1 (N) (30N以上)	37.2	35.8	34.4	34.7	

\*1：参考値

\*2：工程管理値である30Nを下回ったが、「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日、日本病院薬剤師会)の硬度の評価基準より、硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kg重以上の場合、規格内の変化である

\*3：規格外

エバスチンOD錠10mg「ZE」<sup>4)</sup>

保存条件		試験項目	開始時	2週間	1箇月	2箇月	3箇月
温度	40±2℃ 遮光・ 気密容器	性状 (白色の素錠)	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質 (%)					
		(合計、1.0%未満)	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		(個々の最大、0.5%未満)	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		崩壊性 (秒) (1分以内)	25~33	32~40	33~43	33~44	35~43
		溶出性 (15分80%以上)	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量 (%) (95.0~105.0)	99.7	99.9	99.7	98.7	99.1
	硬度*1 (N) (50N以上)	60.8	60.5	64.2	61.3	61.4	
湿度	25±2℃ 75±5%RH 遮光・ 開放	性状 (白色の素錠)	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内
		類縁物質 (%)					
		(合計、1.0%未満)	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		(個々の最大、0.5%未満)	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05	<0.05
		崩壊性 (秒) (1分以内)	25~33	36~49	36~44	37~48	37~47
		溶出性 (15分80%以上)	規格内	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量 (%) (95.0~105.0)	99.7	100.1	100.3	99.0	99.3
	硬度*1 (N) (50N以上)	60.8	52.8	54.4	53.6	54.1	

保存条件		試験項目	開始時	40万lx・hr	80万lx・hr	120万lx・hr
光	1200lx 気密容器	性状 (白色の素錠)	規格内	規格内	規格内 (僅かに黄ばむ)	規格内 (僅かに黄ばむ)
		類縁物質 (%)				
		(合計、1.0%未満)	<0.05	1.02*2	1.40*2	1.48*2
		(個々の最大、0.5%未満)	<0.05	0.73*2	0.89*2	0.95*2
		崩壊性 (秒) (1分以内)	25~33	36~40	39~45	35~42
		溶出性 (15分80%以上)	規格内	規格内	規格内	規格内
		定量 (%) (95.0~105.0)	99.7	98.2	98.1	97.0
	硬度*1 (N) (50N以上)	60.8	61.1	59.5	59.5	

\*1：参考値

\*2：規格外

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

## 9. 溶出性

## (1) 日本薬局方医薬品各条の規格に対する適合性

溶出試験法

日本薬局方一般試験法・溶出試験 パドル法

試験条件：回転数：50rpm

試験液：pH1.2（溶出試験第1液）

試験液量：900mL

測定法：紫外可視吸光度測定法（測定波長：258nm）

結果：本剤は以下の規格に適合した<sup>5), 6)</sup>。

販売名	規定時間	溶出率
エバスチン OD錠 5mg 「ZE」	15分	80%以上
エバスチン OD錠 10mg 「ZE」		

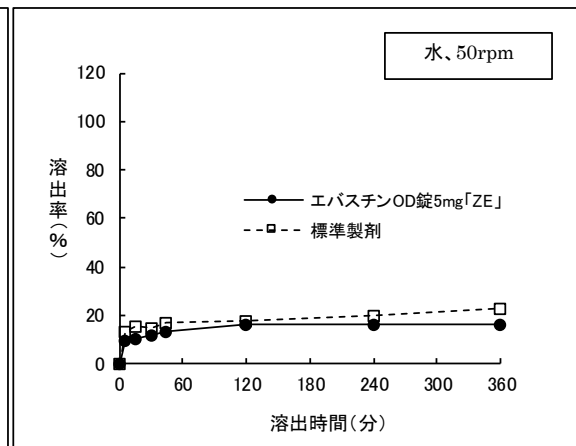
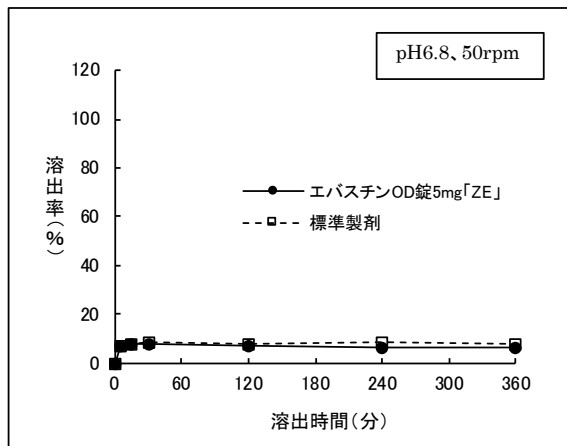
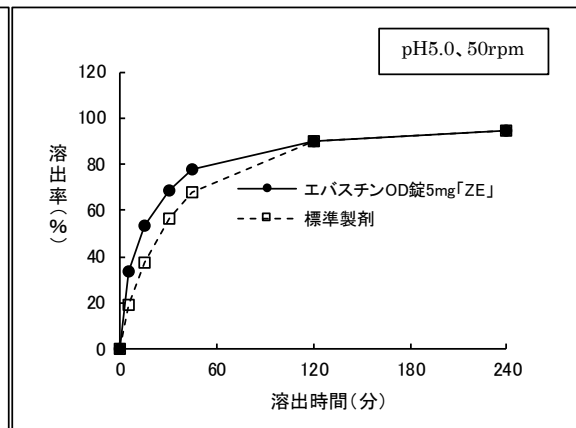
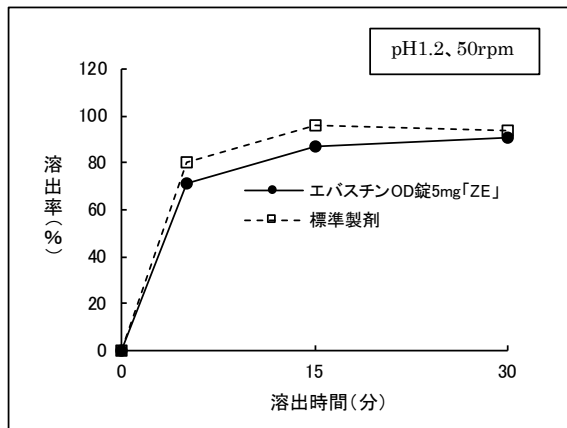
## (2) 溶出挙動における類似性

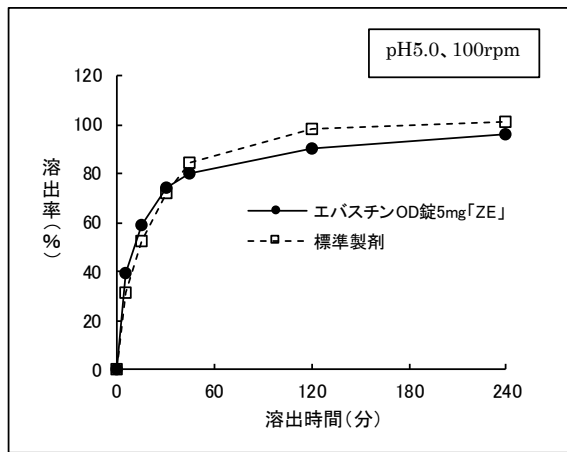
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成13年5月31日付医薬審第786号)に従い、製剤比較試験を行った。

エバスチン OD錠 5mg 「ZE」<sup>5)</sup>

試験製剤	エバスチン OD錠 5mg 「ZE」	
標準製剤	エバステル OD錠 5mg	
試験方法	装置	日本薬局方一般試験法・溶出試験 パドル法
	試験液量	900mL
	温度	37±0.5℃
	回転数	50rpm (pH1.2、pH5.0、pH6.8、水)、100rpm (pH5.0)
	試験液	pH1.2: 日本薬局方の溶出試験第1液
		pH5.0: 0.05mol/L リン酸水素二ナトリウム溶液と 0.025mol/L クエン酸溶液を用いて pHを5.0としたもの
		pH6.8: 日本薬局方の溶出試験第2液
		水
界面活性剤添加	なし	
標準製剤の平均溶出率が85%を超えた時点で終了とする。		

判定基準	<p>●pH1.2 標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合で、試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率<math>\pm 15\%</math>の範囲にある。</p> <p>●pH5.0 標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に85%に達する場合で、標準製剤の溶出に明確なラグ時間がなく、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率<math>\pm 15\%</math>の範囲にある。</p> <p>●pH6.8・水 標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に85%に達しない場合で、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び、規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率<math>\pm 8\%</math>（50%未満の場合）の範囲にある。</p>
------	---





溶出挙動における類似性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件				標準製剤 (錠剤、5mg)	エバスタチン OD 錠 5mg 「ZE」	判定
試験方法	回転数	試験液	溶出時間	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50rpm	pH1.2	15分	96.2	86.9	適合
			pH5.0	15分	37.3	
		120分		90.3	89.8	
		pH6.8	5分	7.0	7.2	適合
	360分		8.0	6.5		
	水	5分	13.2	9.9	適合	
		360分	22.6	16.0		
	100rpm	pH5.0	5分	31.2	39.8	適合
45分	84.4		80.2			

(n=12)

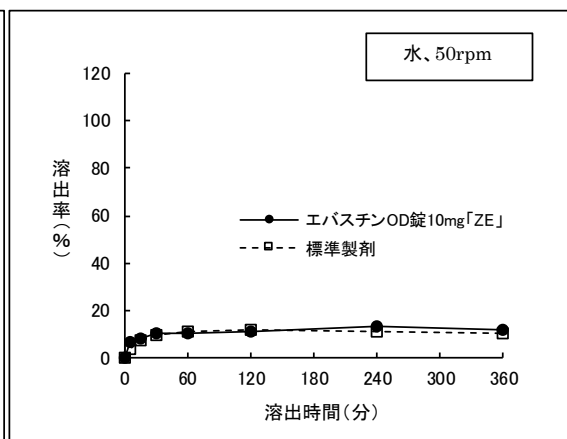
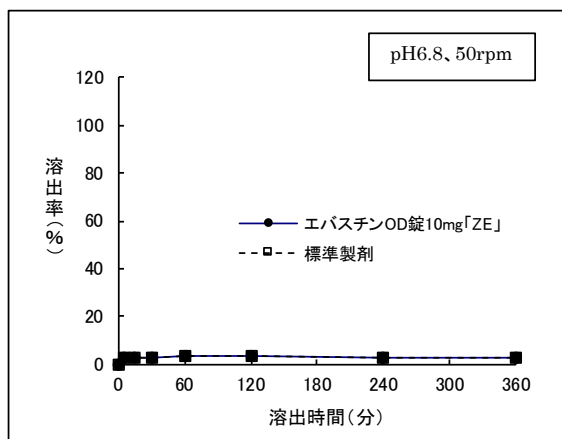
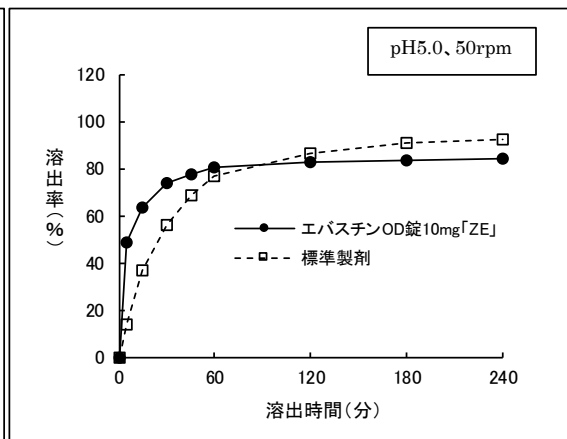
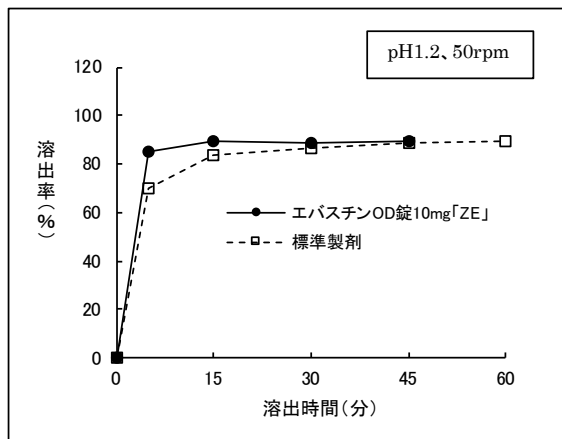
## &lt;結果&gt;

試験液 pH1.2、pH5.0 (100rpm)、pH6.8 及び水では標準製剤と溶出挙動の類似性が認められ、試験液 pH5.0 (50rpm) では15分値で溶出の立ち上がりやや速く類似性は認められなかった。なお、健康成人男子を対象とした生物学的同等性試験では、両製剤は生物学的に同等であることが確認されている。

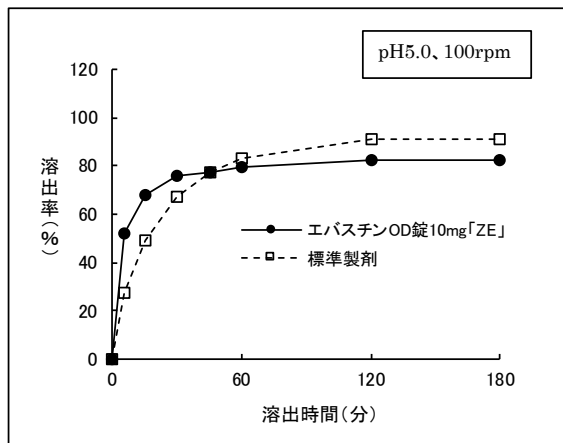
エバスタチン OD 錠 10mg 「ZE」<sup>6)</sup>

試験製剤	エバスタチン OD 錠 10mg 「ZE」	
標準製剤	エバステル OD 錠 10mg	
試験方法	装置	日本薬局方一般試験法・溶出試験 パドル法
	試験液量	900mL
	温度	37±0.5℃
	回転数	50rpm (pH1.2、pH5.0、pH6.8、水)、100rpm (pH5.0)
	試験液	pH1.2: 日本薬局方の溶出試験第1液
		pH5.0: 0.05mol/L リン酸水素二ナトリウム溶液と 0.025mol/L クエン酸溶液を用いて pH を 5.0 としたもの
		pH6.8: 日本薬局方の溶出試験第2液
		水
界面活性剤添加	なし	
標準製剤の平均溶出率が 85% を超えた時点で終了とする。		

判定基準	<p>●pH1.2 標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に85%に達する場合で、標準製剤の溶出に明確なラグ時間がなく、標準製剤が15分～30分に平均85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。</p> <p>●pH5.0 標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に85%に達する場合で、標準製剤の溶出に明確なラグ時間がなく、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。</p> <p>●pH6.8・水 標準製剤の平均溶出率が規定された試験時間以内に85%に達しない場合で、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び、規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%（50%未満の場合）の範囲にある。</p>
------	--







溶出挙動における類似性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件				標準製剤 (錠剤、10mg)	エバステン OD 錠 10mg 「ZE」	判定
試験方法	回転数	試験液	溶出時間	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50rpm	pH1.2	5分	70.2	85.1	適合
			30分	86.5	88.7	
		pH5.0	15分	37.0	63.9	不適合
			120分	86.5	83.0	
		pH6.8	5分	2.4	2.9	適合
			360分	3.0	2.9	
	水	5分	3.5	6.5	適合	
		360分	10.4	11.8		
100rpm	pH5.0	15分	49.4	68.3	不適合	
60分		83.0	79.7			

(n=12)

<結果>

試験液 pH1.2、pH6.8 及び水では標準製剤と溶出挙動の類似性が認められ、試験液 pH5.0 (50・100rpm) では15分値で溶出の立ち上がりやや速く類似性は認められなかった。なお、健康成人男子を対象とした生物学的同等性試験では、両製剤は生物学的に同等であることが確認されている。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報  
該当しない

(2) 包装

〈エバステン OD 錠 5mg 「ZE」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [10錠 (PTP) ×50]

〈エバステン OD 錠 10mg 「ZE」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [10錠 (PTP) ×50]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

包装	容器	材質
PTP 包装	PTP	ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミニウム箔
	ピロー包装	アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

- 蕁麻疹
- 湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症
- アレルギー性鼻炎

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

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。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### 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]

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

該当資料なし

##### 2) 安全性試験

該当資料なし

#### (5) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6) 治療的使用

##### 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

##### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

## (7) その他

## 国内臨床試験

エバスチン錠（普通錠）の二重盲検比較試験<sup>7)-10)</sup>及び一般臨床試験<sup>11)-17)</sup>における有効性についての承認用量における評価症例数は934例であり、これらの臨床成績は次のとおりである。

対象疾患	改善率
慢性じん麻疹	75% (277/369)
湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚そう痒症	71% (188/264)
アレルギー性鼻炎	
通年性アレルギー性鼻炎	54% (137/253)
スギ花粉症	50% (24/48)

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、オロパタジン塩酸塩、ケトチフェン fumarate 塩酸塩、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン等  
注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

エバスチンのアレルギー反応に対する抑制作用は、主代謝物であるカレバスチンによる末梢性のヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗作用を主体とする。また、高濃度でヒスタミン遊離抑制作用も認められる<sup>18)</sup> (*in vitro*)。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 抗アレルギー作用

エバスチンは、経口投与により、ヒスタミン誘発皮膚反応(ラット)、受動皮膚アナフィラキシー(PCA) 反応(モルモット)、実験的アレルギー性鼻炎(ラット)を抑制し、その PCA 反応抑制作用は長時間持続した<sup>18)</sup>。

##### 2) ヒスタミン $H_1$ 受容体拮抗作用

エバスチンの活性代謝物であるカレバスチンは、モルモット摘出気管標本及び回腸標本におけるヒスタミン誘発収縮を濃度依存的に抑制し、ヒスタミン  $H_1$  受容体拮抗作用を示した。エバスチンは、モルモット摘出気管標本で作用を示さなかった<sup>18)</sup> (*in vitro*)。

##### 3) ヒスタミン遊離抑制作用

カレバスチンは、高濃度で感作ラットの腹腔肥満細胞からの抗原誘発ヒスタミン遊離及びヒト末梢血好塩基球からの抗ヒト IgE 抗体誘発ヒスタミン遊離を抑制した<sup>18)</sup> (*in vitro*)。

##### 4) ヒスタミン誘発皮内反応試験

健康成人を対象としたヒスタミン誘発皮内反応試験において、エバスチン 5、10mg の経口投与で、膨疹及び紅斑を用量依存的に抑制し、投与後 24 時間においてもプラセボに比し有意に抑制した<sup>19)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

## 1. 血中濃度の推移

## (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

## (2) 臨床試験で確認された血中濃度

## 1) 単回投与

エバスチンは、経口投与後、初回通過効果を強く受け、ほとんどがカレバスチンに代謝される。健康成人にエバスチン錠（普通錠）5mg（5例）、10、20<sup>注)</sup>、40mg<sup>注)</sup>（各6例）を空腹時1回経口投与後、未変化体であるエバスチンは、40mg<sup>注)</sup>投与1時間後にのみ14ng/mLが検出された<sup>20)</sup>。

注) 本剤の承認された1日通常用量は5~10mgである。

## 2) 生物学的同等性試験

## 〈エバスチンOD錠5mg「ZE」〉

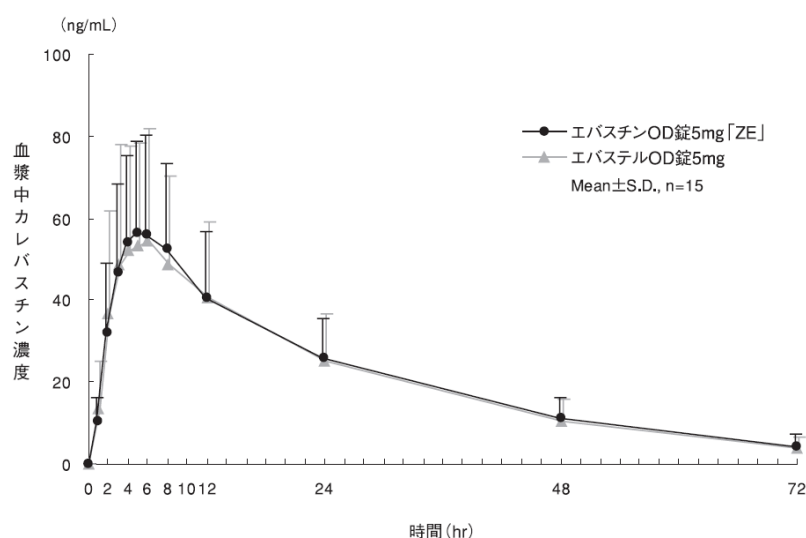
エバスチンOD錠5mg「ZE」とエバステルOD錠5mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エバスチンとして5mg）健康成人男子に絶食後、水あり及び水なし単回経口投与して血漿中カレバスチン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 $C_{max}$ ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>21)</sup>。

薬物動態パラメータ

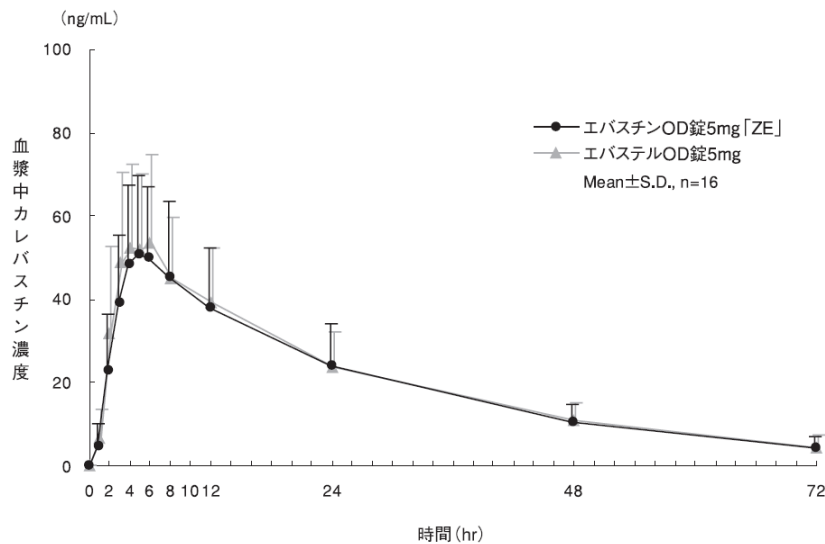
		判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC <sub>(0→72)</sub> (ng・hr/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$T_{max}$ (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
水あり投与	エバスチンOD錠 5mg「ZE」	1547.7±611.9	61.0±22.3	5.0±1.5	19.6±2.7
	エバステルOD錠5mg	1504.4±715.9	58.6±29.9	5.6±2.2	18.4±3.5
水なし投与	エバスチンOD錠 5mg「ZE」	1418.6±525.3	53.5±17.4	4.7±1.0	20.4±8.1
	エバステルOD錠5mg	1454.7±497.2	57.3±20.6	4.6±1.3	19.3±3.0

(水あり投与：Mean±S.D., n=15)

(水なし投与：Mean±S.D., n=16)



水あり投与時の血漿中カレバスチン濃度推移



水なし投与時の血漿中カレバステチン濃度推移

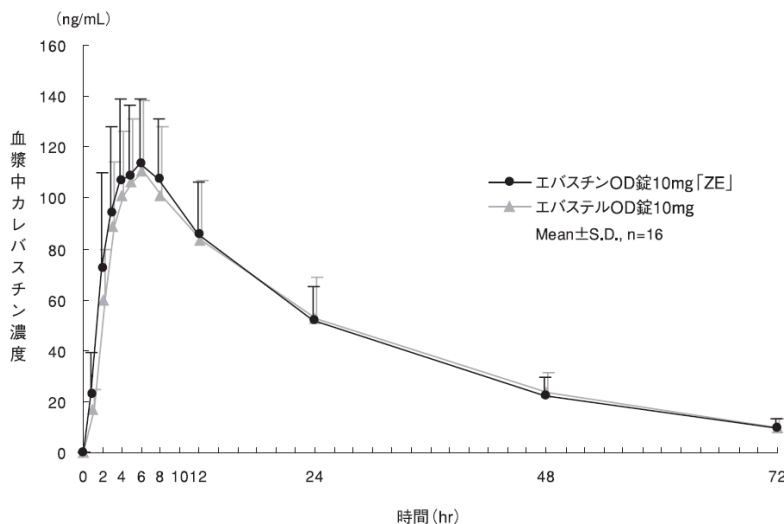
〈エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」〉

エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」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後、水あり及び水なし単回経口投与して血漿中カレバステチン濃度を測定し、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<sup>22)</sup>。

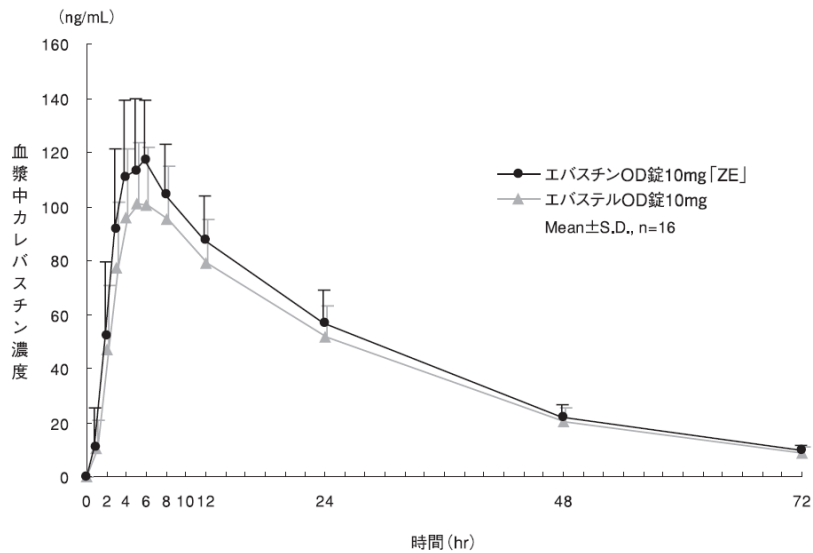
薬物動態パラメータ

		判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC <sub>(0→72)</sub> (ng・hr/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$T_{max}$ (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
水あり投与	エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」	3175.9±750.2	118.0±27.2	5.7±2.3	19.0±3.1
	エバステル OD 錠 10mg	3139.4±880.9	114.1±28.2	5.7±1.4	20.1±3.0
水なし投与	エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」	3233.9±614.7	121.6±25.2	5.4±1.2	17.9±2.1
	エバステル OD 錠 10mg	2911.6±603.9	105.2±22.0	5.5±1.3	18.3±2.1

(Mean±S.D., n=16)



水あり投与時の血漿中カレバステチン濃度推移



水なし投与時の血漿中カレバステチン濃度推移

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 併用薬の影響

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)<sup>23)</sup>

測定日	カレバステチン			
	$C_{max}$ (ng/mL)	$T_{max}$ (h)	$t_{1/2}$ (h)	AUC <sub>0~24</sub> (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

2) その他併用薬の影響

「VIII. 7. 相互作用」の項参照

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし



- (5) 分布容積  
該当資料なし
- (6) その他  
該当資料なし

### 3. 母集団（ポピュレーション）解析

- (1) 解析方法  
該当資料なし
- (2) パラメータ変動要因  
該当資料なし

### 4. 吸収

吸収率：約 90%（ラット）<sup>24)</sup>

### 5. 分布

- (1) 血液－脳関門通過性  
該当資料なし
- (2) 血液－胎盤関門通過性  
該当資料なし
- (3) 乳汁への移行性  
「VIII. 6. (6) 授乳婦」の項参照
- (4) 髄液への移行性  
該当資料なし
- (5) その他の組織への移行性  
該当資料なし
- (6) 血漿蛋白結合率  
エバスチン：99.9%以上（*in vitro*、ヒト血清、平衡透析法）<sup>24)</sup>  
カレバスチン：97.4～97.7%（*in vitro*、ヒト血漿、限外ろ過法）<sup>20)</sup>

### 6. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路  
エバスチンは *tert*-ブチル基の逐次酸化でカルボン酸体であるカレバスチンに代謝され、さらに、フェニル基の 4 位の水酸化とそれに続く 3 位のメトキシ化、酸化的 N-脱アルキル化、エーテル結合の切断及び抱合を受けることが認められている<sup>25)</sup>（外国人データ）。
- (2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率  
カレバス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<sup>26), 27)</sup>。
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合  
初回通過効果を強く受ける<sup>20)</sup>。
- (4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率  
主な代謝産物：カレバスチン（活性あり）<sup>20)</sup>

## 7. 排泄

(健康成人、1回経口投与)<sup>20)</sup>

投与量 (mg)	試料採取時間 (h)	尿中排泄率 (投与量に対する%)	
		エバスチン	カレバスチン
5	0~72	0.1	1.7
10	0~72	0.0	1.8

また、エバスチン (methoxy-<sup>14</sup>C) 10mg を1回経口投与後、放射能は72時間までの尿中に投与量の63%、48時間までの糞便中に投与量の16%が排泄された<sup>25)</sup> (外国人データ)。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

該当資料なし

## 10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

## 11. その他

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

## 1. 警告内容とその理由

設定されていない

## 2. 禁忌内容とその理由

## 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. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

## 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

## 5. 重要な基本的注意とその理由

## 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、好発季節を考えて、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。

## 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

## (1) 合併症・既往歴等のある患者

## 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。

## (2) 腎機能障害患者

設定されていない

## (3) 肝機能障害患者

## 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。

## (4) 生殖能を有する者

設定されていない

## (5) 妊婦

## 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。

## (6) 授乳婦

## 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。

## (7) 小児等

## 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。

## (8) 高齢者

## 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]

## 7. 相互作用

## 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. 3 参照]

## (1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

## (2) 併用注意とその理由

## 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テ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。	カレバステ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テ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テチンの血漿中濃度が低下することが報告されている。	カレバステチンの代謝が促進されると考えられる。

## 8. 副作用

## 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。

## (1) 重大な副作用と初期症状

## 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、 $\gamma$ -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。

(2) その他の副作用

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

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤はアレルゲン皮内反応を抑制するため、アレルゲン皮内反応検査を実施する前は、本剤を投与しないこと。

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

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 本剤は舌の上に乗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。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験  
「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照
- (2) 安全性薬理試験  
該当資料なし
- (3) その他の薬理試験  
該当資料なし

### 2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験  
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験  
該当資料なし
- (3) 遺伝毒性試験  
該当資料なし
- (4) がん原性試験  
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験  
該当資料なし
- (7) その他の特殊毒性  
該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

## 1. 規制区分

製剤：－  
有効成分：－

## 2. 有効期間

有効期間：3年

## 3. 包装状態での貯法

貯法：室温保存

## 4. 取扱い上の注意

## 20. 取扱い上の注意

アルミピロー開封後は遮光して保存すること。

## 5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：なし  
くすりのしおり：あり  
その他の患者向け資料：なし

## 6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：エバステル錠 5mg・10mg、エバステル OD 錠 5mg・10mg（住友ファーマ）  
同効薬：アゼラスチン塩酸塩、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、オロパタジン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、ロラタジン等

## 7. 国際誕生年月日

1996年1月1日

## 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
エバスチン OD 錠 5mg「ZE」	2008年3月6日	22000AMX00393000	2008年7月4日	2008年7月4日
エバスチン OD 錠 10mg「ZE」	2008年3月6日	22000AMX00392000	2008年7月4日	2008年7月4日

## 9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

## 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

## 11. 再審査期間

該当しない

## 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

## 13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
エバスチン OD 錠 5mg「ZE」	4490019F3012	4490019F3071	118609302	620007951
エバスチン OD 錠 10mg「ZE」	4490019F4019	4490019F4078	118617802	620007962

## 14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。



## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料：加速試験 (OD錠 5mg)
- 2) 社内資料：加速試験 (OD錠 10mg)
- 3) 社内資料：無包装状態における安定性試験 (OD錠 5mg)
- 4) 社内資料：無包装状態における安定性試験 (OD錠 10mg)
- 5) 社内資料：溶出試験 (OD錠 5mg)
- 6) 社内資料：溶出試験 (OD錠 10mg)
- 7) 久木田淳 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 55-72
- 8) 馬場駿吉 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 125-145
- 9) 久木田淳 他：臨床医薬. 1994; 10: 895-912
- 10) 馬場駿吉 他：臨床医薬. 1994; 10: 1143-1162
- 11) 久木田淳 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 43-53
- 12) 久木田淳 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 89-102
- 13) 久木田淳 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 73-88
- 14) 馬場駿吉 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 113-124
- 15) 馬場駿吉 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 177-188
- 16) 馬場駿吉 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 163-176
- 17) 馬場駿吉 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 147-161
- 18) 薬王郁久 他：日本薬理学雑誌. 1994; 103: 121-135
- 19) 久木田淳 他：臨床医薬. 1994; 10 (Suppl 1) : 103-111
- 20) Yamaguchi T, et al.: Arzneimittel-Forsch/Drug Res. 1994; 44: 59-64 (PMID: 7907873)
- 21) 水山和之 他：新薬と臨床. 2008; 57 (7) : 1212-1219
- 22) 水山和之 他：新薬と臨床. 2008; 57 (7) : 1220-1227
- 23) 長澤紘一 他：臨床医薬. 1995; 11: 1213-1226
- 24) Fujii T, et al.: Arzneimittel-Forsch/Drug Res. 1994; 44: 527-538 (PMID: 7912071)
- 25) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店; 2021: C-993-997
- 26) 橋爪孝典: Progress in Medicine. 2003; 23: 282-287
- 27) Hashizume T, et al.: J Pharmacol Exp Ther. 2002; 300: 298-304 (PMID: 11752129)
- 28) 社内資料：粉碎後の安定性試験 (OD錠 5mg)
- 29) 社内資料：粉碎後の安定性試験 (OD錠 10mg)
- 30) 社内資料：懸濁及びチューブ通過性試験 (OD錠 5mg)
- 31) 社内資料：懸濁及びチューブ通過性試験 (OD錠 10mg)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

海外での主な販売名は以下のとおりである。(2023年12月時点)

国名	販売名
欧州	EBASTEL、KESTIN、KESTINE、ESTIVAN

注) 上記品目については、ライセンス関係のない企業が販売している。

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XIII. 備考

## 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について（その 3）」  
（令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

## (1) 粉砕

エバスチン OD 錠 5mg 「ZE」<sup>28)</sup>

保存条件：25±2°C/75±5%RH、遮光・開放

試験項目	開始時	2 週間	1 箇月	2 箇月	3 箇月
外観	淡紅色の粉末	淡紅色の粉末	淡紅色の粉末	淡紅色の粉末	淡紅色の粉末
定量 (%) (95.0~105.0)	99.2	99.3	100.6	99.2	99.4
類縁物質	適合	適合	適合	適合	適合

エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」<sup>29)</sup>

保存条件：25±2°C/75±5%RH、遮光・開放

試験項目	開始時	2 週間	1 箇月	2 箇月	3 箇月
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
定量 (%) (95.0~105.0)	99.7	99.5	100.8	100.6	99.6
類縁物質	適合	適合	適合	適合	適合

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて下記手順に従い実施した<sup>30),31)</sup>。

## 1) 試験方法

[崩壊懸濁試験]

- ・ 30mL のディスポシリンジに錠剤 1 錠を入れる。
- ・ 55°C に温めた水道水を 20mL 吸入する。
- ・ 5 分間放置後ディスポシリンジを手で 90 度 15 往復横転する。

[通過性試験]

- ・ 得られた懸濁液を 8Fr. カテーテルの注入端より、約 2~3mL/sec の速度で注入する。

## 2) 試験結果

販売名	崩壊懸濁試験	通過性試験
エバスチン OD 錠 5mg 「ZE」	5 分間放置後、崩壊懸濁した	8Fr. カテーテルを通過した
エバスチン OD 錠 10mg 「ZE」	5 分間放置後、崩壊懸濁した	8Fr. カテーテルを通過した

(n=3)

## 2. その他の関連資料

該当資料なし