

## 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 エバスチン錠

エバスチン錠5mg「サワイ」

エバスチン錠10mg「サワイ」

日本薬局方 エバスチン口腔内崩壊錠

エバスチンOD錠5mg「サワイ」

エバスチンOD錠10mg「サワイ」

EBASTINE Tablets, OD Tablets [SAWAI]

|                               |   |
|-------------------------------|---|
| 剤形                            | 錠5mg : フィルムコーティング錠<br>錠10mg : 割線入りフィルムコーティング錠<br>OD錠5mg : 素錠(口腔内崩壊錠)<br>OD錠10mg : 素錠(口腔内崩壊錠)  |
| 製剤の規制区分                       | 該当しない   |
| 規格・含量                         | 錠5mg : 1錠中日局エバスチン5mg含有<br>錠10mg : 1錠中日局エバスチン10mg含有<br>OD錠5mg : 1錠中日局エバスチン5mg含有<br>OD錠10mg : 1錠中日局エバスチン10mg含有                                    |
| 一般名                           | 和名 : エバスチン(JAN)<br>洋名 : Ebastine (JAN)  |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載<br>・発売年月日 | 製造販売承認年月日 : 2008年3月6日(錠5mg/錠10mg)<br>2008年3月14日(OD錠5mg/OD錠10mg)<br>薬価基準収載年月日 : 2008年7月4日<br>発売年月日 : 2008年7月4日                                   |
| 開発・製造販売(輸入)・提携<br>・販売会社名      | 製造販売元 : 沢井製薬株式会社  |
| 医薬情報担当者の連絡先                   |   |
| 問い合わせ窓口                       | 沢井製薬株式会社 医薬品情報センター<br>TEL : 0120-381-999、FAX : 06-7708-8966<br>医療関係者向け総合情報サイト : <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a> |

本IFは2022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。

## 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

### 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)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)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFは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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIF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IF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。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「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」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

### 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIF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IFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IF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、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、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、IF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「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、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

IFを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。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や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、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

# 目次

|                       |    |  |    |
|-----------------------|----|--|----|
| I. 概要に関する項目           | 1  | VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目                 | 27 |
| 1. 開発の経緯              | 1  | 1. 警告内容とその理由                             | 27 |
| 2. 製品の治療学的特性          | 1  | 2. 禁忌内容とその理由                             | 27 |
| 3. 製品の製剤学的特性          | 1  | 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由                    | 27 |
| 4. 適正使用に関して周知すべき特性    | 1  | 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由                    | 27 |
| 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項  | 1  | 5. 重要な基本的注意とその理由                         | 27 |
| 6. RMPの概要             | 1  | 6. 特定の背景を有する患者に関する注意                     | 27 |
| II. 名称に関する項目          | 2  | 7. 相互作用                                  | 28 |
| 1. 販売名                | 2  | 8. 副作用                                   | 29 |
| 2. 一般名                | 2  | 9. 臨床検査結果に及ぼす影響                          | 29 |
| 3. 構造式又は示性式           | 2  | 10. 過量投与                                 | 29 |
| 4. 分子式及び分子量           | 2  | 11. 適用上の注意                               | 30 |
| 5. 化学名(命名法)又は本質       | 3  | 12. その他の注意                               | 30 |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号     | 3  | IX. 非臨床試験に関する項目                          | 31 |
| III. 有効成分に関する項目       | 4  | 1. 薬理試験                                  | 31 |
| 1. 物理化学的性質            | 4  | 2. 毒性試験                                  | 31 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性  | 4  | X. 管理的事項に関する項目                           | 32 |
| 3. 有効成分の確認試験法、定量法     | 4  | 1. 規制区分                                  | 32 |
| IV. 製剤に関する項目          | 5  | 2. 有効期間                                  | 32 |
| 1. 剤形                 | 5  | 3. 包装状態での貯法                              | 32 |
| 2. 製剤の組成              | 6  | 4. 取扱い上の注意                               | 32 |
| 3. 添付溶解液の組成及び容量       | 6  | 5. 患者向け資材                                | 32 |
| 4. 力価                 | 6  | 6. 同一成分・同効薬                              | 32 |
| 5. 混入する可能性のある夾雑物      | 6  | 7. 国際誕生年月日                               | 32 |
| 6. 製剤の各種条件下における安定性    | 7  | 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準<br>収載年月日、販売開始年月日 | 33 |
| 7. 調製法及び溶解後の安定性       | 9  | 9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等<br>の年月日及びその内容    | 33 |
| 8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)  | 9  | 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその<br>内容           | 33 |
| 9. 溶出性                | 10 | 11. 再審査期間                                | 33 |
| 10. 容器・包装             | 14 | 12. 投薬期間制限に関する情報                         | 33 |
| 11. 別途提供される資材類        | 15 | 13. 各種コード                                | 34 |
| 12. その他               | 15 | 14. 保険給付上の注意                             | 34 |
| V. 治療に関する項目           | 16 | XI. 文献                                   | 35 |
| 1. 効能又は効果             | 16 | 1. 引用文献                                  | 35 |
| 2. 効能又は効果に関連する注意      | 16 | 2. その他の参考文献                              | 36 |
| 3. 用法及び用量             | 16 | XII. 参考資料                                | 37 |
| 4. 用法及び用量に関連する注意      | 16 | 1. 主な外国での発売状況                            | 37 |
| 5. 臨床成績               | 16 | 2. 海外における臨床支援情報                          | 37 |
| VI. 薬効薬理に関する項目        | 18 | XIII. 備考                                 | 38 |
| 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 | 18 | 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ<br>たっての参考情報      | 38 |
| 2. 薬理作用               | 18 | 2. その他の関連資料                              | 40 |
| VII. 薬物動態に関する項目       | 19 |  |    |
| 1. 血中濃度の推移            | 19 |  |    |
| 2. 薬物速度論的パラメータ        | 23 |  |    |
| 3. 母集団(ポピュレーション)解析    | 24 |  |    |
| 4. 吸収                 | 24 |  |    |
| 5. 分布                 | 24 |  |    |
| 6. 代謝                 | 25 |  |    |
| 7. 排泄                 | 25 |  |    |
| 8. トランスポーターに関する情報     | 25 |  |    |
| 9. 透析等による除去率          | 26 |  |    |
| 10. 特定の背景を有する患者       | 26 |  |    |
| 11. その他               | 26 |  |    |

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

エバスチン錠 5 mg/錠10mg/OD錠 5 mg/OD錠10mg「サワイ」は、日局エバスチンを含有する持続性選択H<sub>1</sub>受容体拮抗剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

|                |                         |
|----------------|-------------------------|
| 承認申請に際し準拠した通知名 | 平成17年3月31日 薬食発第0331015号 |
| 承認             | 2008年3月                 |
| 上市             | 2008年7月                 |

### 2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤は、「蕁麻疹」、「湿疹・皮膚炎、痒疹、皮膚瘙癢症」、「アレルギー性鼻炎」の効能又は効果を有する。(V. -1. 参照)
- 2) 本剤の用法は、「1日1回経口投与」である。(V. -3. 参照)
- 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. 参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

- 1) ストロベリー様芳香、添加剤由来の甘みを有する。(IV. -1. -2) 参照 [OD錠 5 mg/OD錠10mg]

### 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  |

(2023年2月6日時点)

### 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

---

### II. 名称に関する項目

---

#### 1. 販売名 .....

##### 1) 和名

エバスチン錠 5mg「サワイ」  
エバスチン錠10mg「サワイ」  
エバスチンOD錠 5mg「サワイ」  
エバスチンOD錠10mg「サワイ」

##### 2) 洋名

EBASTINE

##### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

#### 2. 一般名 .....

##### 1) 和名(命名法)

エバスチン(JAN)

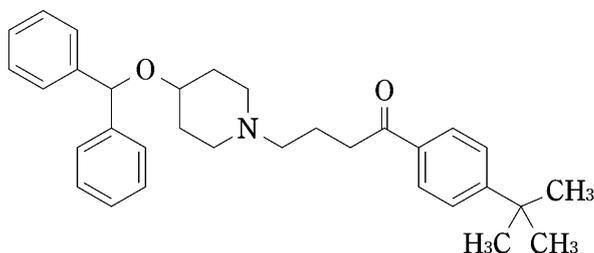
##### 2) 洋名(命名法)

Ebastine(JAN、INN)

##### 3) ステム(stem)

－astine : antihistaminics

#### 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.....  
特になし

---

### 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  
乾燥減量：0.5%以下(1g、減圧、酸化リン(V)、60℃、2時間)
- 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……………
- ＜確認試験法＞  
日局「エバスチン」の確認試験に準ずる。  
1) 1, 3-ジニトロベンゼン試液及び水酸化ナトリウム試液による呈色反応  
2) 紫外可視吸光度測定法による確認  
3) 赤外吸収スペクトル測定法による確認
- ＜定量法＞  
日局「エバスチン」の定量法に準ずる。(電位差滴定法)

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### 1) 剤形の区別

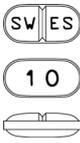
エバスチン錠 5mg「サワイ」：フィルムコーティング錠

エバスチン錠 10mg「サワイ」：割線入りフィルムコーティング錠

エバスチンOD錠 5mg「サワイ」：素錠(口腔内崩壊錠)

エバスチンOD錠 10mg「サワイ」：素錠(口腔内崩壊錠)

#### 2) 製剤の外観及び性状

| 品名     | エバスチン錠<br>5mg「サワイ」  | エバスチン錠<br>10mg「サワイ」   | エバスチンOD<br>錠 5mg「サワイ」   | エバスチンOD<br>錠 10mg「サワイ」  |
|--------|---|---|---|---|
| 外形     |  |  |  |  |
| 性状     | 白色  |   | 淡紅色   | 白色  |
| 直径(mm) | 6.1   | 5.1×10.1  | 6.5   | 8.0   |
| 厚さ(mm) | 3.0   | 3.2   | 2.3   | 3.1   |
| 重量(mg) | 約80   | 約140  | 約100  | 約200  |

#### ●エバスチンOD錠 5mg/OD錠 10mg「サワイ」

ストロベリー様芳香、添加剤由来の甘みを有する。

#### 3) 識別コード

##### ●エバスチン錠 5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体、PTPシート

表示内容：SW ES 5

##### ●エバスチン錠 10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体、PTPシート

表示内容：SW ES 10

##### ●エバスチンOD錠 5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体、PTPシート

表示内容：SW E 5

##### ●エバスチンOD錠 10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体、PTPシート

表示内容：SW E10

IV. 製剤に関する項目

4) 製剤の物性

●エバスチン錠 5mg/錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局エバスチン錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局エバスチン錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

●エバスチンOD錠 5mg/OD錠10mg「サワイ」

製剤均一性：日局エバスチン口腔内崩壊錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局エバスチン口腔内崩壊錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

| 品名            | エバスチン錠<br>5mg「サワイ」   | エバスチン錠<br>10mg「サワイ」 | エバスチンOD錠<br>5mg「サワイ」  | エバスチンOD錠<br>10mg「サワイ」 |
|---------------|--|---------------------|---|-----------------------|
| 有効成分<br>[1錠中] | 日局エバスチン  |                     |   |                       |
|               | 5mg  | 10mg                | 5mg   | 10mg                  |
| 添加剤           | カルナウバロウ、カルメロースCa、<br>軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸<br>化チタン、ステアリン酸Mg、乳糖、<br>ヒドロキシプロピルセルロース、ヒ<br>プロメロース、マクロゴール6000 |                     | カルメロース、軽質無水ケイ酸、ステ<br>アリン酸Mg、タウマチン、トウモロ<br>コシデンピン、ヒドロキシプロピル<br>セルロース、D-マンニトール、香料 |                       |
|               |  |                     | 三二酸化鉄   | —                     |

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

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

該当資料なし

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

## ●エバスチン錠5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>1)</sup>

エバスチン錠5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

| 保存条件  | イニシャル              | 40°C75%RH・遮光<br>6ヵ月 |
|-------|--------------------|---------------------|
| 性状    | 白色のフィルムコーティング錠であった | 同左                  |
| 確認試験  | 規格に適合              | 同左                  |
| 溶出試験  | 規格に適合              | 同左                  |
| 定量試験※ | 99.4               | 98.4                |

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>2)</sup>

エバスチン錠5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、光及び室温散光下の条件下で性状変化が観察された。

| 保存条件   | イニシャル          | 温度<br>(40°C3ヵ月) | 湿度<br>(25°C75%RH<br>3ヵ月) | 光<br>(総照射量<br>60万lx・hr) | 室温散光下<br>(なりゆき<br>3ヵ月) |
|--------|----------------|-----------------|--------------------------|-------------------------|------------------------|
| 性状     | 白色のフィルムコーティング錠 | 変化なし            | 変化なし                     | 褐色に変化                   | 部分的に褐色に変化              |
| 硬度(kg) | 4.4            | 5.0             | 3.4                      | 4.1                     | 3.7                    |
| 純度試験   | 問題なし           | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 溶出試験   | 問題なし           | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 定量試験※  | 100.0          | 100.8           | 100.6                    | 99.6                    | 99.7                   |

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## ●エバスチン錠10mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>3)</sup>

エバスチン錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

| 保存条件  | イニシャル                  | 40°C75%RH・遮光<br>6ヵ月 |
|-------|------------------------|---------------------|
| 性状    | 白色の割線入りフィルムコーティング錠であった | 同左                  |
| 確認試験  | 規格に適合                  | 同左                  |
| 溶出試験  | 規格に適合                  | 同左                  |
| 定量試験※ | 99.8                   | 99.4                |

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>4)</sup>

エバスチン錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、光及び室温散光下の条件下で性状変化が観察された。

IV. 製剤に関する項目

| 保存条件   | イニシャル              | 温度<br>(40°C3ヵ月) | 湿度<br>(25°C75%RH<br>3ヵ月) | 光<br>(総照射量<br>60万lx・hr) | 室温散光下<br>(なりゆき<br>3ヵ月) |
|--------|--------------------|-----------------|--------------------------|-------------------------|------------------------|
| 性状     | 白色の割線入りフィルムコーティング錠 | 変化なし            | 変化なし                     | 褐色に変化                   | 部分的に褐色に変化              |
| 硬度(kg) | 9.0                | 9.4             | 7.2                      | 8.7                     | 7.9                    |
| 純度試験   | 問題なし               | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 溶出試験   | 問題なし               | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 定量試験*  | 100.0              | 98.1            | 100.5                    | 99.8                    | 100.1                  |

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●エバスチンOD錠5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>5)</sup>

エバスチンOD錠5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

| 保存条件  | イニシャル      | 40°C75%RH・遮光<br>6ヵ月 |
|-------|------------|---------------------|
| 性状    | 淡紅色の素錠であった | 同左                  |
| 確認試験  | 規格に適合      | 同左                  |
| 純度試験  | 規格に適合      | 同左                  |
| 崩壊試験  | 規格に適合      | 同左                  |
| 溶出試験  | 規格に適合      | 同左                  |
| 定量試験* | 98.7       | 98.9                |

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>6)</sup>

エバスチンOD錠5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で性状変化、光の条件下で性状変化、硬度低下及び不純物増加、室温散光下の条件下で性状変化が観察された。

| 保存条件   | イニシャル  | 温度<br>(40°C3ヵ月) | 湿度<br>(25°C75%RH<br>3ヵ月) | 光<br>(総照射量<br>60万lx・hr) | 室温散光下<br>(なりゆき<br>3ヵ月) |
|--------|--------|-----------------|--------------------------|-------------------------|------------------------|
| 性状     | 淡紅色の素錠 | 変化なし            | わずかに退色                   | わずかに退色                  | わずかに退色                 |
| 硬度(kg) | 4.6    | 4.9             | 3.4                      | 2.6                     | 3.9                    |
| 純度試験   | 問題なし   | 問題なし            | 問題なし                     | 不純物増加                   | 問題なし                   |
| 崩壊試験   | 問題なし   | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 溶出試験   | 問題なし   | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 定量試験*  | 100.0  | 100.5           | 103.0                    | 98.0                    | 100.8                  |

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## ●エバスチンOD錠10mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>7)</sup>

エバスチンOD錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

| 保存条件  | イニシャル     | 40°C75%RH・遮光<br>6ヵ月 |
|-------|-----------|---------------------|
| 性状    | 白色の素錠であった | 同左                  |
| 確認試験  | 規格に適合     | 同左                  |
| 純度試験  | 規格に適合     | 同左                  |
| 崩壊試験  | 規格に適合     | 同左                  |
| 溶出試験  | 規格に適合     | 同左                  |
| 定量試験※ | 98.3      | 97.6                |

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>8)</sup>

エバスチンOD錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、光の条件下で性状変化、硬度低下及び不純物増加、室温散光下の条件下で性状変化が観察された。

| 保存条件   | イニシャル | 温度<br>(40°C3ヵ月) | 湿度<br>(25°C75%RH<br>3ヵ月) | 光<br>(総照射量<br>60万lx・hr) | 室温散光下<br>(なりゆき<br>3ヵ月) |
|--------|-------|-----------------|--------------------------|-------------------------|------------------------|
| 性状     | 白色の素錠 | 変化なし            | 変化なし                     | 黄色を帯びた                  | 黄色を帯びた                 |
| 硬度(kg) | 8.6   | 9.4             | 6.1                      | 5.6                     | 7.9                    |
| 純度試験   | 問題なし  | 問題なし            | 問題なし                     | 不純物増加                   | 問題なし                   |
| 崩壊試験   | 問題なし  | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 溶出試験   | 問題なし  | 問題なし            | 問題なし                     | 問題なし                    | 問題なし                   |
| 定量試験※  | 100.0 | 100.3           | 101.6                    | 97.5                    | 98.8                   |

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 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)

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

9. 溶出性

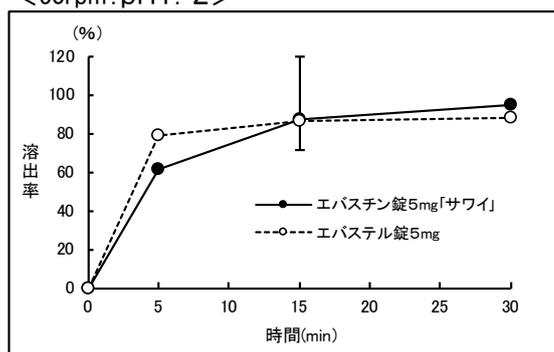
本剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

<溶出挙動における同等性及び類似性>

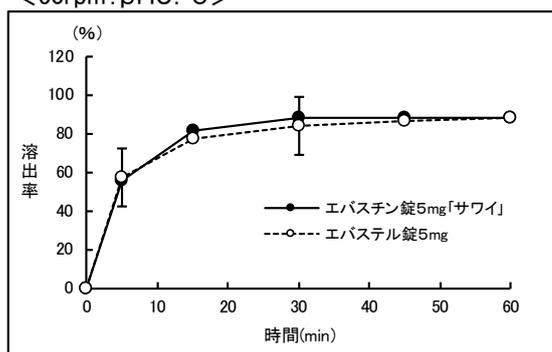
●エバスチン錠5mg「サワイ」<sup>9,10)</sup>

|        |   |                                      |
|--------|---|--------------------------------------|
| 通知等    | 「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<br>医薬審発第786号   |                                      |
| 試験条件   | パドル法  | 50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0) |
| 試験回数   | 12ベッセル  |                                      |
| 試験製剤   | エバスチン錠5mg「サワイ」  |                                      |
| 標準製剤   | エバステル錠5mg   |                                      |
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm：pH1.2&gt;<br/>両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm：pH5.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40%（5分）及び85%（30分）付近の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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm：pH6.8&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間（360分）における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点（5分）及び規定された試験時間（360分）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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm：水&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間（360分）における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点（5分）及び規定された試験時間（360分）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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm：pH5.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が60%（5分）及び85%（30分）付近の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%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p> |                                      |

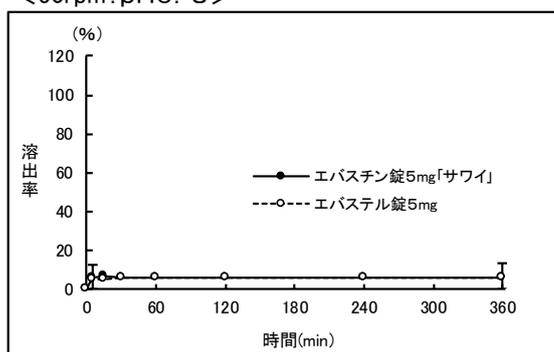
<50rpm:pH1.2>



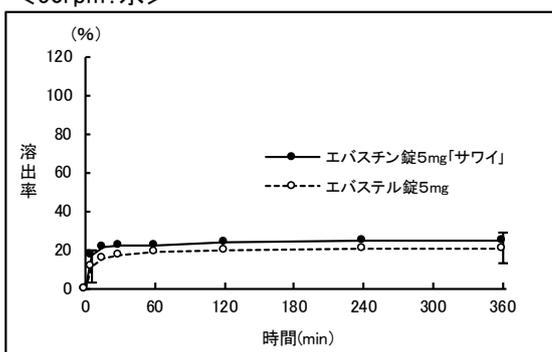
<50rpm:pH5.0>



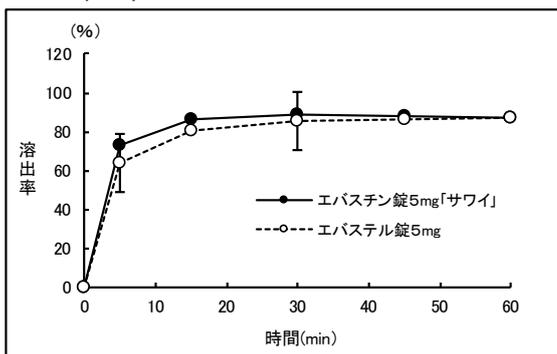
<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>



<100rpm:pH5.0>

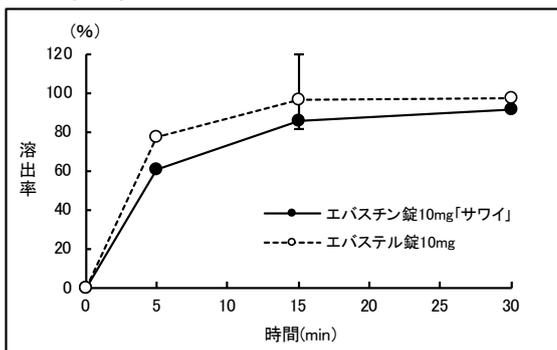


( [ ] : 判定基準の適合範囲)

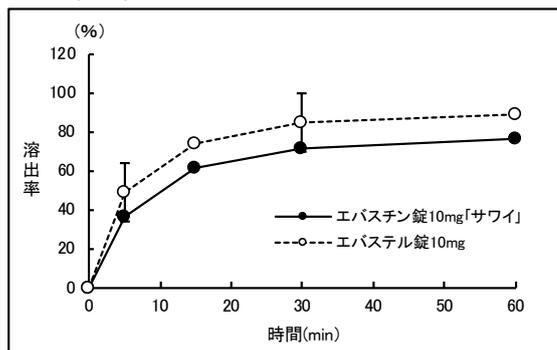
●エバステチン錠10mg「サワイ」<sup>9,11)</sup>

|        |   |                                      |
|--------|---|--------------------------------------|
| 通知等    | 「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<br>医薬審発第786号   |                                      |
| 試験条件   | パドル法  | 50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0) |
| 試験回数   | 12 ベッセル   |                                      |
| 試験製剤   | エバステチン錠10mg「サワイ」  |                                      |
| 標準製剤   | エバステル錠10mg  |                                      |
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm : pH1.2&gt;<br/>両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : pH5.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(30分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : 水&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH5.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(60分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p> |                                      |

<50rpm:pH1.2>

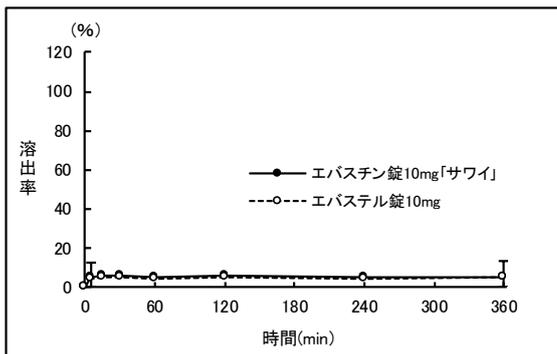


<50rpm:pH5.0>

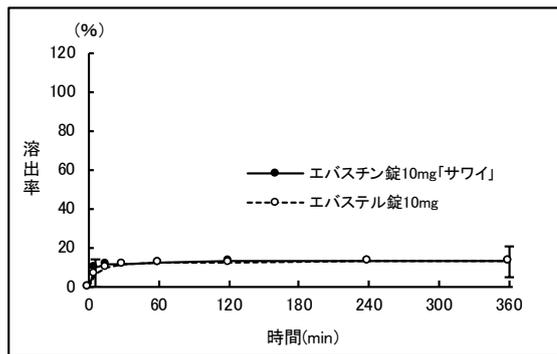


IV. 製剤に関する項目

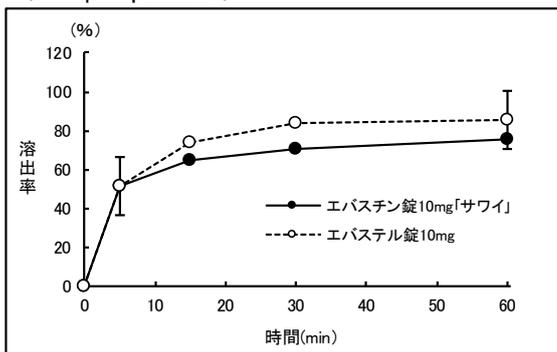
<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>



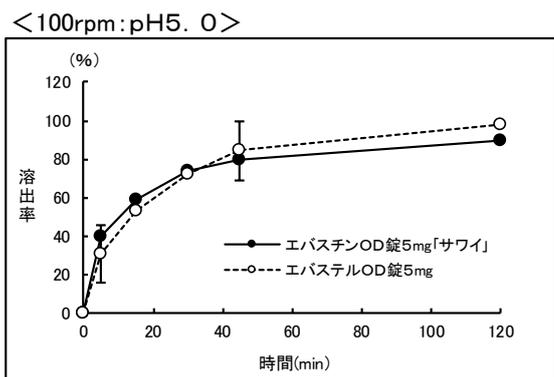
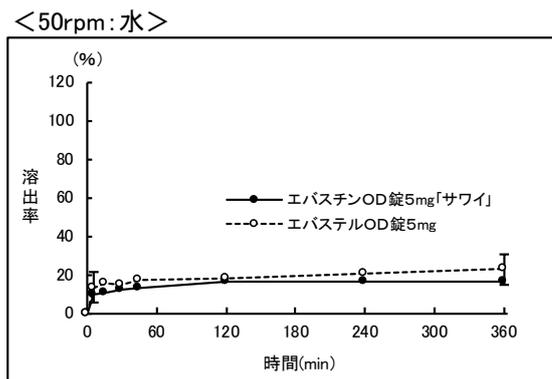
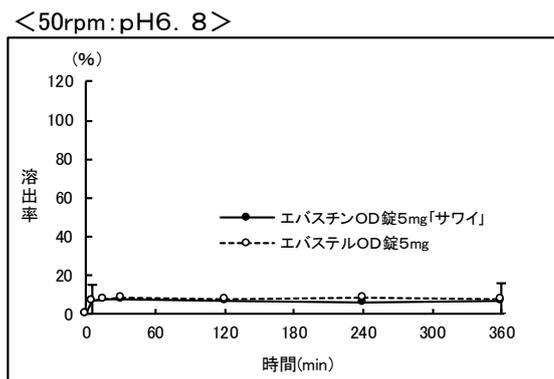
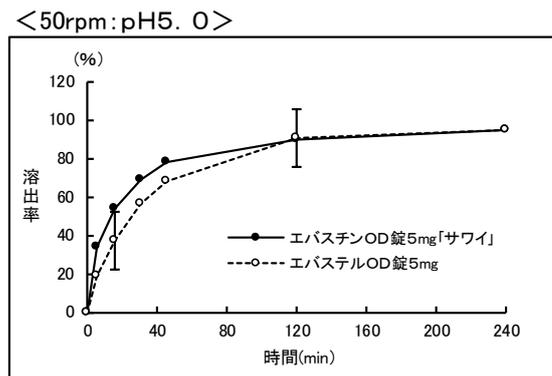
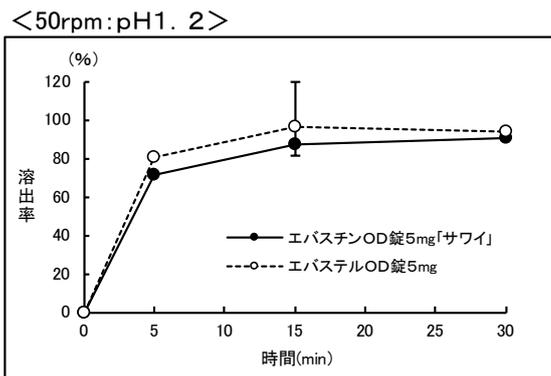
<100rpm:pH5.0>



( I : 判定基準の適合範囲)

●エバスチンOD錠5mg「サワイ」<sup>12,13)</sup>

|        |  |                                      |
|--------|--|--------------------------------------|
| 通知等    | 「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<br>医薬審発第786号  |                                      |
| 試験条件   | パドル法   | 50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0) |
| 試験回数   | 12ベッセル   |                                      |
| 試験製剤   | エバスチンOD錠5mg「サワイ」   |                                      |
| 標準製剤   | エバステルOD錠5mg  |                                      |
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm：pH1.2&gt;<br/>両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm：pH5.0&gt;<br/>両製剤の溶出挙動に差異が認められた。</p> <p>&lt;50rpm：pH6.8&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm：水&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm：pH5.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(45分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は非同等であると判断した。しかしながら血中濃度比較試験において同等であることが確認されたため、両製剤は治療学的に同等であると判断した。</p> |                                      |



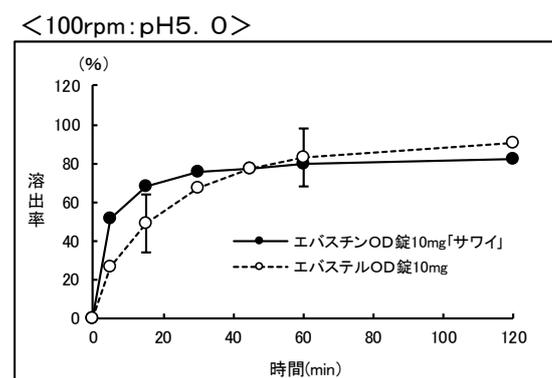
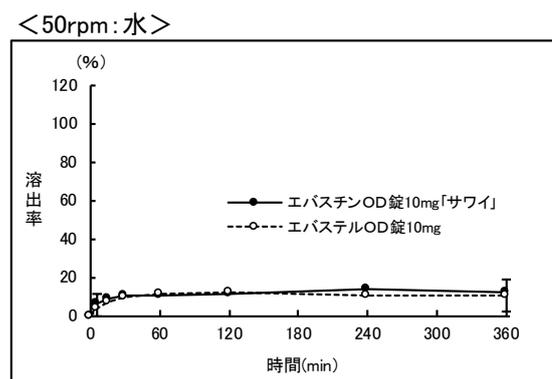
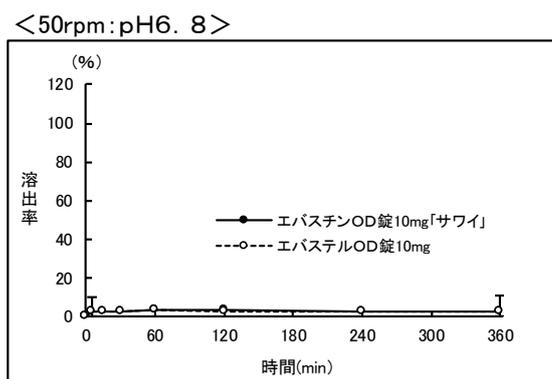
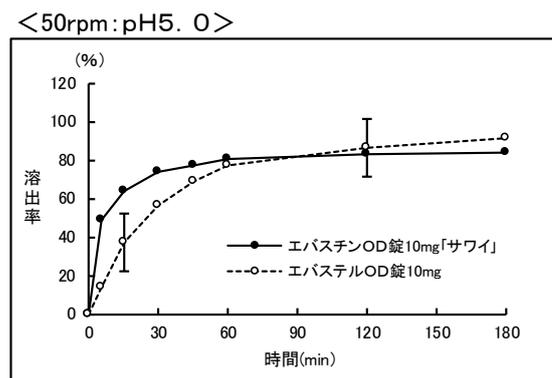
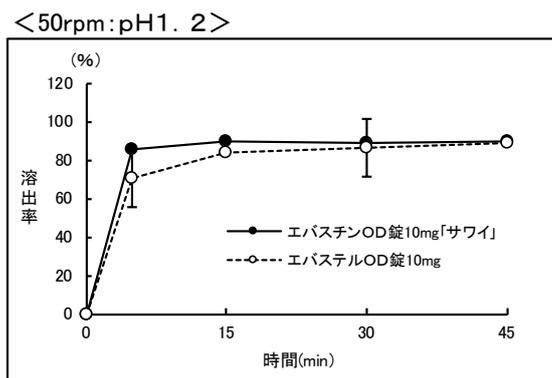
( [ ] : 判定基準の適合範囲)

●エバスチンOD錠10mg「サワイ」<sup>12, 14)</sup>

|        |   |                                      |
|--------|---|--------------------------------------|
| 通知等    | 「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<br>医薬審発第786号   |                                      |
| 試験条件   | パドル法  | 50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0) |
| 試験回数   | 12ベッセル  |                                      |
| 試験製剤   | エバスチンOD錠10mg「サワイ」   |                                      |
| 標準製剤   | エバステルOD錠10mg  |                                      |
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm:pH1.2&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が60%(5分)及び85%(30分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm:pH5.0&gt;<br/>両製剤の溶出挙動に差異が認められた。</p> <p>&lt;50rpm:pH6.8&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)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%の範囲にあった。</p> |                                      |

IV. 製剤に関する項目

|        |   |
|--------|---|
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm : 水&gt;<br/>標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH5.0&gt;<br/>両製剤の溶出挙動に差異が認められた。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は非同等であると判断した。しかしながら血中濃度比較試験において同等であることが確認されたため、両製剤は治療学的に同等であると判断した。</p> |
|--------|---|



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

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

該当資料なし

## 2) 包装

|  |
|--|
| 22. 包装<br>〈エバスチン錠 5mg「サワイ」〉<br>PTP : 100錠 (10錠×10)<br>〈エバスチン錠10mg「サワイ」〉<br>PTP : 100錠 (10錠×10)、500錠 (10錠×50)<br>〈エバスチンOD錠 5mg「サワイ」〉<br>PTP : 100錠 (10錠×10)<br>〈エバスチンOD錠10mg「サワイ」〉<br>PTP : 100錠 (10錠×10)、500錠 (10錠×50) |
|--|

## 3) 予備容量

該当しない

## 4) 容器の材質

## ●エバスチン錠 5mg/錠10mg「サワイ」

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔  
[ピロー]アルミラミネートフィルム

## ●エバスチンOD錠 5mg/OD錠10mg「サワイ」

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔  
[ピロー]アルミ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 .....

該当資料なし

---

## V. 治療に関する項目

---

1. 効能又は効果

4. 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

6. 用法及び用量

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

## 17.1.1 国内臨床試験

エバステル錠(普通錠)の二重盲検比較試験<sup>15~18)</sup>及び一般臨床試験<sup>19~25)</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

抗ヒスタミン作用：ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩等<sup>26)</sup>

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

##### 18.1 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<sub>1</sub>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(*in vitro*)。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 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>27)</sup>。

##### 18.3 ヒスタミンH<sub>1</sub>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<sub>1</sub>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>27)</sup> (*in vitro*)。

##### 18.4 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>27)</sup> (*in vitro*)。

##### 18.5 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>28)</sup>。

#### 3) 作用発現時間・持続時間

VI. -2. -2) 参照

## VII. 薬物動態に関する項目

エバスチン製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

## 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

## 16.1.1 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。健康成人にエバステル錠(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>29)</sup>。

注)本剤の承認された1日通常用量は5～10mgである。

## &lt;生物学的同等性試験&gt;

●エバスチン錠5mg「サワイ」<sup>9, 30)</sup>

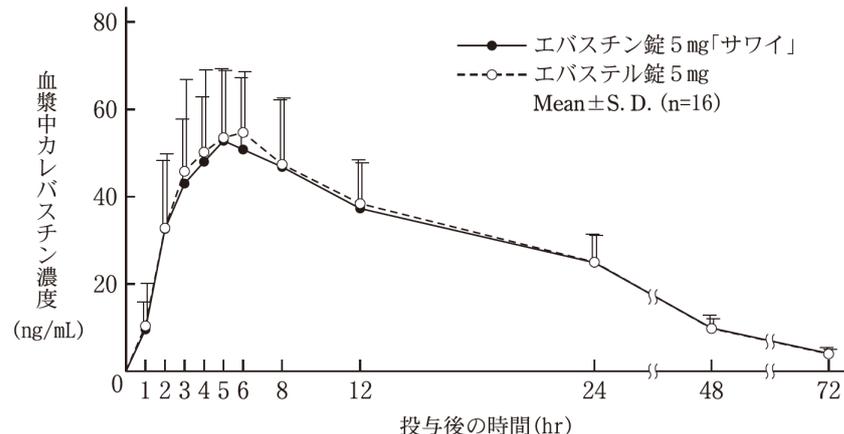
|      |  |
|------|--|
| 通知等  | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：<br>平成13年5月31日 医薬審発第786号 |
| 採血時点 | 0、1、2、3、4、5、6、8、12、24、48、72hr                    |
| 休薬期間 | 7日間  |
| 測定方法 | LC/MS法   |
| 試験製剤 | エバスチン錠5mg「サワイ」                                   |
| 標準製剤 | エバステル錠5mg  |

エバスチン錠5mg「サワイ」とエバステル錠5mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(エバスチンとして5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、活性代謝物であるカレバスチンの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|                | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | T <sub>max</sub><br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>t</sub><br>(ng・hr/mL) |
|----------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|--------------------------------|
| エバスチン錠5mg「サワイ」 | 54.5±16.0                   | 5.0±0.9                  | 19.4±3.8                 | 1435±373                       |
| エバステル錠5mg      | 58.4±16.1                   | 5.0±1.3                  | 18.7±2.7                 | 1457±346                       |

(Mean±S.D.)



Ⅶ. 薬物動態に関する項目

|                  |                     |
|------------------|---------------------|
|                  | 対数値の平均値の差の90%信頼区間   |
| AUC <sub>t</sub> | log(0.90)～log(1.07) |
| Cmax             | log(0.85)～log(1.02) |

●エバスチン錠10mg「サワイ」<sup>9, 31)</sup>

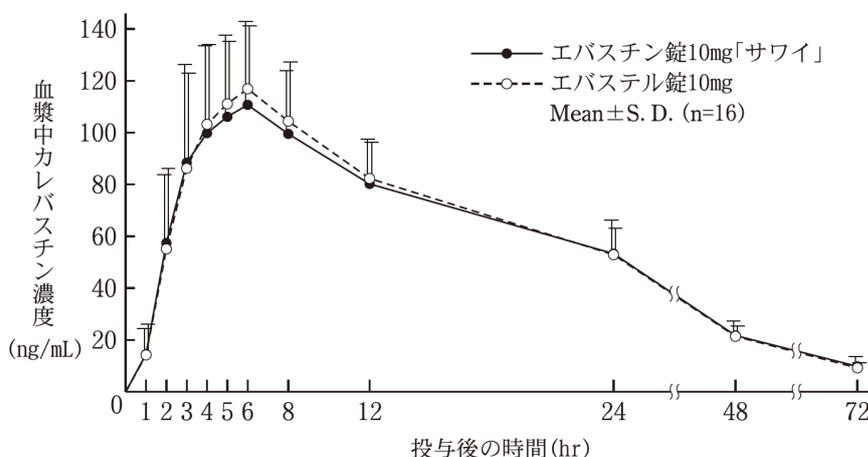
|      |  |
|------|--|
| 通知等  | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：<br>平成13年5月31日 医薬審発第786号 |
| 採血時点 | 0、1、2、3、4、5、6、8、12、24、48、72hr                    |
| 休薬期間 | 7日間  |
| 測定方法 | LC/MS法   |
| 試験製剤 | エバスチン錠10mg「サワイ」                                  |
| 標準製剤 | エバステル錠10mg                                       |

エバスチン錠10mg「サワイ」とエバステル錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(エバスチンとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、活性代謝物であるカレバスチンの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>, Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|                 | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>t</sub><br>(ng・hr/mL) |
|-----------------|-----------------|--------------|--------------------------|--------------------------------|
| エバスチン錠10mg「サワイ」 | 113.0±31.1      | 5.9±1.3      | 19.1±2.0                 | 3071±740                       |
| エバステル錠10mg      | 119.7±25.4      | 5.3±1.2      | 18.7±1.9                 | 3093±558                       |

(Mean±S.D.)



|                  |                     |
|------------------|---------------------|
|                  | 対数値の平均値の差の90%信頼区間   |
| AUC <sub>t</sub> | log(0.89)～log(1.09) |
| Cmax             | log(0.81)～log(1.08) |

●エバスチンOD錠5mg「サワイ」<sup>12, 32)</sup>

|      |  |
|------|--|
| 通知等  | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：<br>平成13年5月31日 医薬審発第786号 |
| 採血時点 | 0、1、2、3、4、5、6、8、12、24、48、72hr                    |
| 休薬期間 | 7日間  |
| 測定方法 | LC/MS法   |
| 試験製剤 | エバスチンOD錠5mg「サワイ」                                 |
| 標準製剤 | エバステルOD錠5mg                                      |

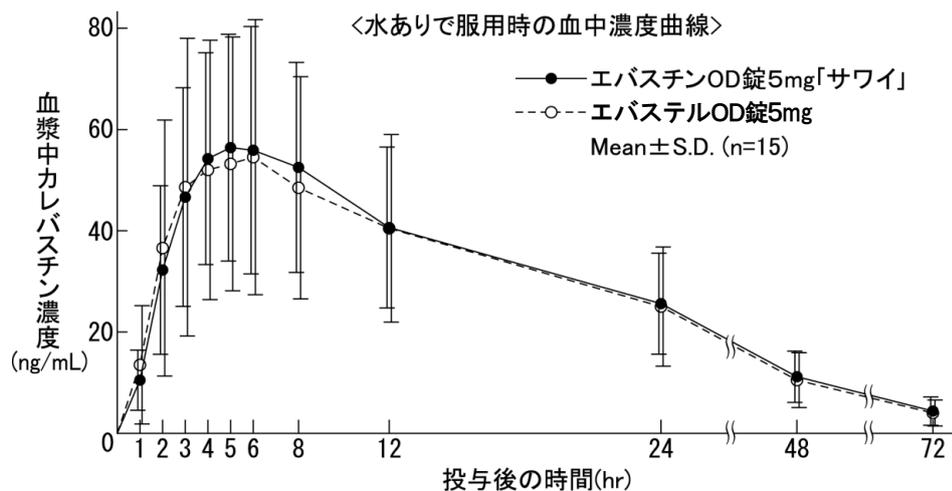
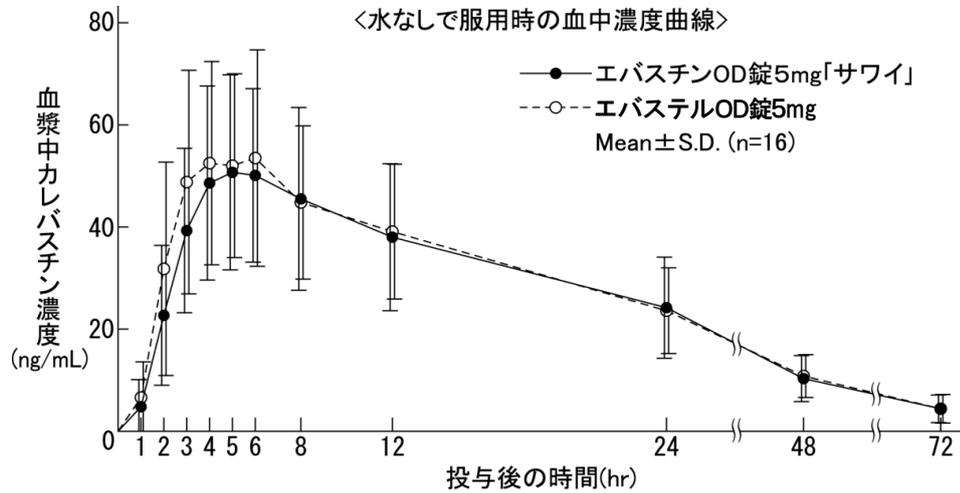
VII. 薬物動態に関する項目

エバスチンOD錠 5mg「サワイ」とエバステルOD錠 5mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(エバスチンとして5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、活性代謝物であるカレバステチンの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>, C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)~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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|     |                   | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | T <sub>max</sub><br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>t</sub><br>(ng・hr/mL) |
|-----|-------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|--------------------------------|
| 水なし | エバスチンOD錠 5mg「サワイ」 | 53.5±17.4                   | 4.7±1.0                  | 20.4±8.1                 | 1419±525                       |
|     | エバステルOD錠 5mg      | 57.3±20.6                   | 4.6±1.3                  | 19.3±3.0                 | 1455±497                       |
| 水あり | エバスチンOD錠 5mg「サワイ」 | 61.0±22.3                   | 5.0±1.5                  | 19.6±2.7                 | 1548±612                       |
|     | エバステルOD錠 5mg      | 58.6±29.9                   | 5.6±2.2                  | 18.4±3.5                 | 1504±716                       |

(Mean±S.D.)



|     |                  | 対数値の平均値の差の90%信頼区間   |
|-----|------------------|---------------------|
| 水なし | AUC <sub>t</sub> | log(0.86)~log(1.12) |
|     | C <sub>max</sub> | log(0.81)~log(1.13) |
| 水あり | AUC <sub>t</sub> | log(0.97)~log(1.15) |
|     | C <sub>max</sub> | log(0.99)~log(1.21) |

VII. 薬物動態に関する項目

●エバスチンOD錠10mg「サワイ」<sup>12, 33)</sup>

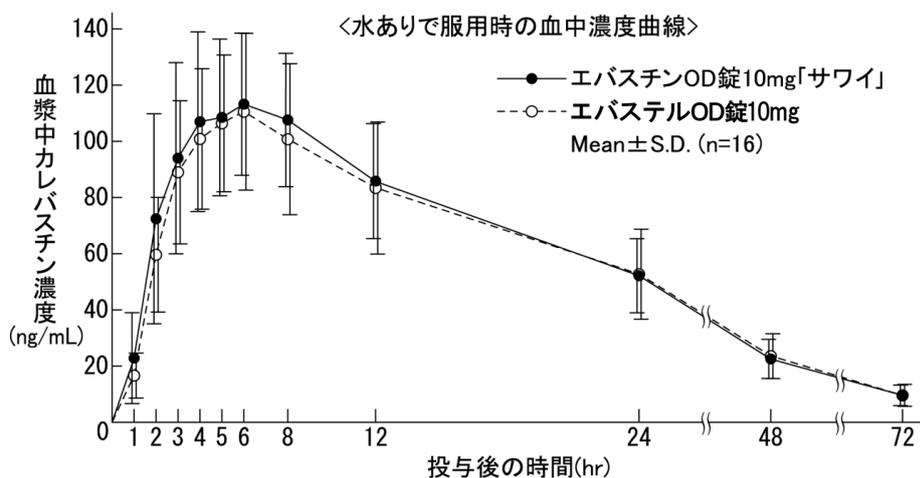
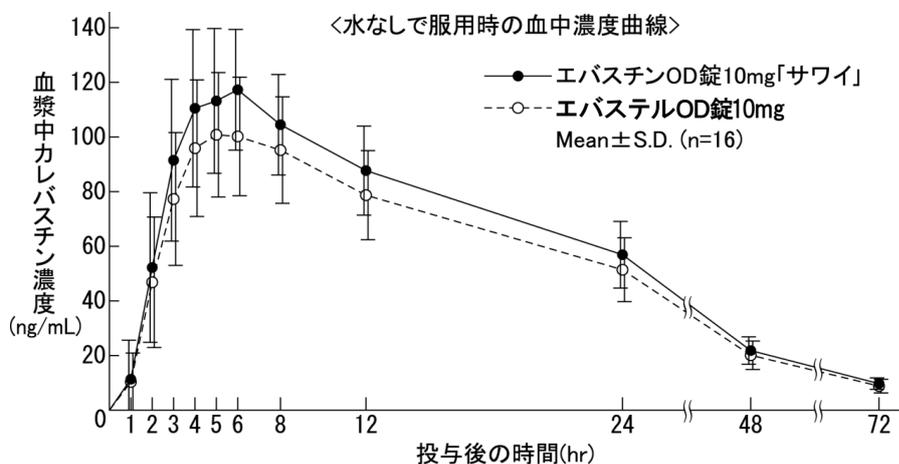
|      |  |
|------|--|
| 通知等  | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：<br>平成13年5月31日 医薬審発第786号 |
| 採血時点 | 0、1、2、3、4、5、6、8、12、24、48、72hr                    |
| 休薬期間 | 7日間  |
| 測定方法 | LC/MS法   |
| 試験製剤 | エバスチンOD錠10mg「サワイ」                                |
| 標準製剤 | エバステルOD錠10mg                                     |

エバスチンOD錠10mg「サワイ」とエバステルOD錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(エバスチンとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、活性代謝物であるカレバスチンの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>, C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|     |                   | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | T <sub>max</sub><br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>t</sub><br>(ng・hr/mL) |
|-----|-------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|--------------------------------|
| 水なし | エバスチンOD錠10mg「サワイ」 | 121.6±25.2                  | 5.4±1.2                  | 17.9±2.1                 | 3234±615                       |
|     | エバステルOD錠10mg      | 105.2±22.0                  | 5.5±1.3                  | 18.3±2.1                 | 2912±604                       |
| 水あり | エバスチンOD錠10mg「サワイ」 | 118.0±27.2                  | 5.7±2.3                  | 19.0±3.1                 | 3176±750                       |
|     | エバステルOD錠10mg      | 114.1±28.2                  | 5.7±1.4                  | 20.1±3.0                 | 3139±881                       |

(Mean±S.D.)



|     |                  | 対数値の平均値の差の90%信頼区間   |
|-----|------------------|---------------------|
| 水なし | AUC <sub>t</sub> | log(1.05)～log(1.18) |
|     | C <sub>max</sub> | log(1.08)～log(1.24) |
| 水あり | AUC <sub>t</sub> | log(0.94)～log(1.11) |
|     | C <sub>max</sub> | log(0.94)～log(1.16) |

血漿中濃度ならびにAUC、C<sub>max</sub>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

|   |                             |                         |                         |                                  |
|---|-----------------------------|-------------------------|-------------------------|----------------------------------|
| 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) <sup>34)</sup> [10.2参照] |                             |                         |                         |                                  |
| 測定日   | カレバスチン                      |                         |                         |                                  |
|   | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | T <sub>max</sub><br>(h) | t <sub>1/2</sub><br>(h) | AUC <sub>0~24</sub><br>(ng・h/mL) |
| 試験7日目<br>(単独投与最終日)  | 244±15                      | 5±1                     | 17.2±0.4                | 4,092±181                        |
| 試験14日目<br>(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  |                             |                         |                         |                                  |

VIII. -7. 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

- エバスチン錠5mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(エバスチンとして5mg)空腹時単回経口投与した場合の活性代謝物であるカレバスチンの消失速度定数<sup>9,30)</sup>  
0.037±0.007hr<sup>-1</sup>
- エバスチン錠10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(エバスチンとして10mg)空腹時単回経口投与した場合の活性代謝物であるカレバスチンの消失速度定数<sup>9,31)</sup>  
0.037±0.004hr<sup>-1</sup>
- エバスチンOD錠5mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(エバスチンとして5mg)空腹時単回経口投与した場合の活性代謝物であるカレバスチンの消失速度定数<sup>12,32)</sup>  
[水なし]0.037±0.007hr<sup>-1</sup>、[水あり]0.036±0.005hr<sup>-1</sup>

## VII. 薬物動態に関する項目

- エバスチンOD錠10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(エバスチンとして10mg)空腹時単回経口投与した場合の活性代謝物であるカレバスチンの消失速度定数<sup>12, 33)</sup>  
[水なし]0.039±0.004hr<sup>-1</sup>、[水あり]0.037±0.006hr<sup>-1</sup>

### 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 .....

### 16.2 吸収

#### 16.2.1 吸収率

約90%(ラット)<sup>35)</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

<参考>動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。

### 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

## 16.3 分布

## 16.3.1 血漿・血清蛋白結合率

エバスチン：99.9%以上 (*in vitro*、ヒト血清、平衡透析法)<sup>35)</sup>

カレバスチン：97.4～97.7% (*in vitro*、ヒト血漿、限外ろ過法)<sup>29)</sup>

## 6. 代謝

## 1) 代謝部位及び代謝経路

## 16.4.1 主な代謝産物

カレバスチン(活性あり)<sup>29)</sup>

## 16.4.2 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>36)</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

## 16.4.3 代謝酵素

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>37,38)</sup>。[10. 参照]

## 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>36)</sup>

## 4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

本薬の作用の大部分は活性代謝物のカレバスチンの作用である。<sup>36)</sup>

VII. -6. -1) 参照

## 7. 排泄

## 16.5 排泄

(健康成人、1回経口投与)<sup>29)</sup>

| 投与量<br>(mg) | 試料採取時間<br>(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>36)</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

VII. 薬物動態に関する項目

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. 参照

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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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<br>[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、 $\gamma$ -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。

## 10. 過量投与

設定されていない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

11. 適用上の注意 .....

|   |
|---|
| <p>14. 適用上の注意</p> <p>14.1 薬剤交付時の注意</p> <p>〈製剤共通〉</p> <p>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。</p> <p>〈OD錠〉</p> <p>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。</p> |
|---|

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

---

エバスチンの非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

1. 薬理試験……………
  - 1) 薬効薬理試験  
「VI. 薬効薬理に関する項目」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 .....

| 規制区分 |       |
|------|-------|
| 製剤   | 該当しない |
| 有効成分 | 該当しない |

2. 有効期間 .....

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法 .....

室温保存

4. 取扱い上の注意 .....

|   |
|---|
| 20. 取扱い上の注意<br>〈OD錠〉<br>アルミピロー開封後は遮光して保存すること。 |
|---|

5. 患者向け資材 .....

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬 .....

同一成分：エバステル錠 5 mg/錠10mg/OD錠 5 mg/OD錠10mg

同効薬：抗ヒスタミン作用

ベポタスチンベシル酸塩、オロパタジン塩酸塩、フェキソフェナジン塩酸塩等<sup>26)</sup>

7. 国際誕生年月日 .....

該当しない

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……………

●エバスチン錠5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2008年3月6日、承認番号：22000AMX00394000

薬価基準収載年月日：2008年7月4日

販売開始年月日：2008年7月4日

●エバスチン錠10mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2008年3月6日、承認番号：22000AMX00391000

薬価基準収載年月日：2008年7月4日

販売開始年月日：2008年7月4日

●エバスチンOD錠5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2008年3月14日、承認番号：22000AMX01160000

薬価基準収載年月日：2008年7月4日

販売開始年月日：2008年7月4日

●エバスチンOD錠10mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2008年3月14日、承認番号：22000AMX01161000

薬価基準収載年月日：2008年7月4日

販売開始年月日：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。

X. 管理的事項に関する項目

13. 各種コード

| 製品名                   | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | 個別医薬品コード<br>(YJコード) | HOT番号     | レセプト電算処理<br>システム用コード |
|-----------------------|-----------------------|---------------------|-----------|----------------------|
| エバスチン錠 5mg<br>「サワイ」   | 4490019F1010          | 4490019F1117        | 118622201 | 620007971            |
| エバスチン錠10mg<br>「サワイ」   | 4490019F2016          | 4490019F2113        | 118629101 | 620007984            |
| エバスチンOD錠 5mg<br>「サワイ」 | 4490019F3012          | 4490019F3101        | 118608601 | 620007950            |
| エバスチンOD錠10mg<br>「サワイ」 | 4490019F4019          | 4490019F4108        | 118616101 | 620007961            |

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) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] エバスチン錠 5 mg「サワイ」
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] エバスチン錠 5 mg「サワイ」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] エバスチン錠10mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] エバスチン錠10mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] エバスチンOD錠 5 mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] エバスチンOD錠 5 mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] エバスチンOD錠10mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] エバスチンOD錠10mg「サワイ」
- 9) 水山和之他, 医学と薬学, 59(5), 821(2008).
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] エバスチン錠 5 mg「サワイ」
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] エバスチン錠10mg「サワイ」
- 12) 水山和之, 医学と薬学, 59(6), 975(2008).
- 13) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] エバスチンOD錠 5 mg「サワイ」
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] エバスチンOD錠10mg「サワイ」
- 15) 久木田淳他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 55-72
- 16) 馬場駿吉他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 125-145
- 17) 久木田淳他 : 臨床医薬, 1994 ; 10 : 895-912
- 18) 馬場駿吉他 : 臨床医薬, 1994 ; 10 : 1143-1162
- 19) 久木田淳他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 43-53
- 20) 久木田淳他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 89-102
- 21) 久木田淳他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 73-88
- 22) 馬場駿吉他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 113-124
- 23) 馬場駿吉他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 177-188
- 24) 馬場駿吉他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 163-176
- 25) 馬場駿吉他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 147-161
- 26) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>  
(2023/2/6 アクセス)
- 27) 薬王郁久他 : 日本薬理学雑誌, 1994 ; 103 : 121-135
- 28) 久木田淳他 : 臨床医薬, 1994 ; 10(Suppl. 1) : 103-111
- 29) Yamaguchi, T. et al. : *Arzneim. -Forsch. /Drug Res.*, 1994 ; 44 : 59-64
- 30) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] エバスチン錠 5 mg「サワイ」
- 31) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] エバスチン錠10mg「サワイ」
- 32) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] エバスチンOD錠 5 mg「サワイ」
- 33) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] エバスチンOD錠10mg「サワイ」
- 34) 長澤紘一他 : 臨床医薬, 1995 ; 11 : 1213-1226
- 35) Fujii, T. et al. : *Arzneim. -Forsch. /Drug Res.*, 1994 ; 44 : 527-538
- 36) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十八改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021, C-993-C-997.
- 37) 橋爪孝典 : *Progress in Medicine*, 2003 ; 23 : 282-287
- 38) Hashizume, T. et al. : *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 2002 ; 300 : 298-304

## X I. 文献

- 39) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] エバスチン錠 5 mg「サワイ」
- 40) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] エバスチン錠10mg「サワイ」
- 41) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] エバスチンOD錠 5 mg「サワイ」
- 42) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] エバスチンOD錠10mg「サワイ」
- 43) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] エバスチン錠 5 mg「サワイ」
- 44) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] エバスチン錠10mg「サワイ」
- 45) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] エバスチンOD錠 5 mg「サワイ」
- 46) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] エバスチンOD錠10mg「サワイ」

## 2. その他の参考文献 .....

(社)日本病院薬剤師会“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”西岡豊他.錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報.改訂6版,医薬ジャーナル社,2009,p441-444

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
  
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。

##### 1) 粉砕

###### ●エバスチン錠5mg「サワイ」<sup>39)</sup>

エバスチン錠5mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

| 保存条件              | イニシャル | 褐色瓶密栓<br>(室温、30日) |
|-------------------|-------|-------------------|
| 性状                | 白色の粉末 | 変化なし              |
| 定量試験 <sup>※</sup> | 100.0 | 100.9             |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

###### ●エバスチン錠10mg「サワイ」<sup>40)</sup>

エバスチン錠10mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

| 保存条件              | イニシャル | 褐色瓶密栓<br>(室温、30日) |
|-------------------|-------|-------------------|
| 性状                | 白色の粉末 | 変化なし              |
| 定量試験 <sup>※</sup> | 100.0 | 99.8              |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

###### ●エバスチンOD錠5mg「サワイ」<sup>41)</sup>

エバスチンOD錠5mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

| 保存条件              | イニシャル  | 褐色瓶密栓<br>(室温、30日) |
|-------------------|--------|-------------------|
| 性状                | 淡紅色の粉末 | 変化なし              |
| 定量試験 <sup>※</sup> | 100.0  | 101.7             |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

###### ●エバスチンOD錠10mg「サワイ」<sup>42)</sup>

エバスチンOD錠10mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

| 保存条件              | イニシャル | 褐色瓶密栓<br>(室温、30日) |
|-------------------|-------|-------------------|
| 性状                | 白色の粉末 | 変化なし              |
| 定量試験 <sup>※</sup> | 100.0 | 101.1             |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### ●エバスチン錠5mg「サワイ」<sup>43)</sup>

#### 試験方法

1. エバスチン錠5mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55°C)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

#### 結果

|         |                            |
|---------|----------------------------|
| 懸濁状態    | 錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった |
| チューブ通過性 | 通過した                       |

### ●エバスチン錠10mg「サワイ」<sup>44)</sup>

#### 試験方法

1. エバスチン錠10mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55°C)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

#### 結果

|         |                            |
|---------|----------------------------|
| 懸濁状態    | 錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった |
| チューブ通過性 | 通過した                       |

### ●エバスチンOD錠5mg「サワイ」<sup>45)</sup>

#### 試験方法

1. エバスチンOD錠5mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55°C)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

#### 結果

|         |                           |
|---------|---------------------------|
| 懸濁状態    | 錠剤は5分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった |
| チューブ通過性 | 通過した                      |

### ●エバスチンOD錠10mg「サワイ」<sup>46)</sup>

#### 試験方法

1. エバスチンOD錠10mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55°C)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

#### 結果

|         |                           |
|---------|---------------------------|
| 懸濁状態    | 錠剤は5分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった |
| チューブ通過性 | 通過した                      |

## 2. その他の関連資料 .....

### 患者向け資料

- ・気になる皮膚のかゆみ じんましん
- ・花粉症のセルフケアと治療法
- ・自動車運転等は注意してください・お知らせ指導箋
- ・OD錠を服用される患者さんへ OD錠という選択肢

### 医療関係者向け資料

該当資料なし

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照







