

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2018. 4. 25 初版

有効成分	エバスチン		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	エバスチン錠 5mg 「CH」	長生堂製薬
	2	エバスチン錠 5mg 「JG」	日本ジェネリック
	3	エバスチン錠 5mg 「NS」	日新製薬（山形）
	4	エバスチン錠 5mg 「TCK」	辰巳化学
	5	エバスチン錠 5mg 「YD」	陽進堂
	6	エバスチン錠 5mg 「科研」	ダイト
	7	エバスチン錠 5mg 「ケミファ」	日本ケミファ
	8	エバスチン錠 5mg 「サワイ」	沢井製薬
	9	エバスチン錠 5mg 「タカタ」	高田製薬
	10	エバスチン錠 5mg 「トーワ」	東和薬品
	11	エバスチン錠 5mg 「日医工」	日医工
	12	エバスチン錠 5mg 「アメル」	共和薬品工業
	13	エバスチン錠 5mg 「ファイザー」	ファイザー
	14	エバスチン錠 10mg 「CH」	長生堂製薬
	15	エバスチン錠 10mg 「JG」	日本ジェネリック
	16	エバスチン錠 10mg 「NS」	日新製薬（山形）
	17	エバスチン錠 10mg 「TCK」	辰巳化学
	18	エバスチン錠 10mg 「YD」	陽進堂
	19	エバスチン錠 10mg 「科研」	ダイト
	20	エバスチン錠 10mg 「ケミファ」	日本ケミファ
	21	エバスチン錠 10mg 「サワイ」	沢井製薬
	22	エバスチン錠 10mg 「タカタ」	高田製薬
	23	エバスチン錠 10mg 「トーワ」	東和薬品
	24	エバスチン錠 10mg 「日医工」	日医工
	25	エバスチン錠 10mg 「アメル」	共和薬品工業
	26	エバスチン錠 10mg 「ファイザー」	ファイザー
	27	エバスチンOD錠 5mg 「DK」	大興製薬
	28	エバスチンOD錠 5mg 「NP」	ニプロ
	29	エバスチンOD錠 5mg 「ZE」	全星薬品工業
	30	エバスチンOD錠 5mg 「科研」	ダイト
	31	エバスチンOD錠 5mg 「ケミファ」	日本ケミファ
	32	エバスチンOD錠 5mg 「サワイ」	沢井製薬
	33	エバスチンOD錠 5mg 「タイヨー」	武田テバファーマ
	34	エバスチンOD錠 5mg 「タカタ」	高田製薬
	35	エバスチンOD錠 5mg 「日医工」	日医工
	36	エバスチンOD錠 5mg 「NS」	日新製薬（山形）

	その他	試験項目：性状、確認試験、融点、類縁物質、乾燥減量、含量					
		試験	保存条件	保存形態	期間	結果	
		長期 保存試験	室温 (9~28℃)、 29~78%RH	褐色ガラス瓶 (密栓)	36 ヶ月	変化なし	
		苛酷 試験	温度	40℃	褐色ガラス瓶 (密栓)	12 ヶ月	変化なし
				50℃		6 ヶ月	変化なし
湿度	25℃、93%RH	褐色ガラス瓶 (開栓)	6 ヶ月	変化なし			
	40℃、75%RH						
膜透過性	なし						
BCS・Biowaiver option	なし						
薬効分類	449 その他のアレルギー用薬						
規格単位	5mg 1錠 10mg 1錠						

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	BE	品質 再評価	溶出	検査
1	エバステチン錠5mg「CH」	長生堂製薬	○			○
2	エバステチン錠5mg「JG」	日本ジェネリック	○			○
3	エバステチン錠5mg「NS」	日新製薬（山形）	○			○
4	エバステチン錠5mg「TCK」	辰巳化学	○			
5	エバステチン錠5mg「YD」	陽進堂	○			○
6	エバステチン錠5mg「科研」	ダイト	○			○
7	エバステチン錠5mg「ケミファ」	日本ケミファ	○			○
8	エバステチン錠5mg「サワイ」	沢井製薬	○			○
9	エバステチン錠5mg「タカタ」	高田製薬	○			
10	エバステチン錠5mg「トーワ」	東和薬品	○			○
11	エバステチン錠5mg「日医工」	日医工	○			○
12	エバステチン錠5mg「アメル」	共和薬品工業	○			○
13	エバステチン錠5mg「ファイザー」	ファイザー	○			
14	エバステチン錠10mg「CH」	長生堂製薬	○		No. 10	○
15	エバステチン錠10mg「JG」	日本ジェネリック	○		No. 11	○
16	エバステチン錠10mg「NS」	日新製薬（山形）	○		No. 12	○
17	エバステチン錠10mg「TCK」	辰巳化学	○		No. 8	○
18	エバステチン錠10mg「YD」	陽進堂	○		No. 9	○
19	エバステチン錠10mg「科研」	ダイト	○		No. 2	○
20	エバステチン錠10mg「ケミファ」	日本ケミファ	○		No. 3	○
21	エバステチン錠10mg「サワイ」	沢井製薬	○		No. 13	○
22	エバステチン錠10mg「タカタ」	高田製薬	○		No. 4	○
23	エバステチン錠10mg「トーワ」	東和薬品	○		No. 15	○
24	エバステチン錠10mg「日医工」	日医工	○		No. 7	○
25	エバステチン錠10mg「アメル」	共和薬品工業	○		No. 5	○
26	エバステチン錠10mg「ファイザー」	ファイザー	○		No. 6	○
27	エバステチンOD錠5mg「DK」	大興製薬	○			○
28	エバステチンOD錠5mg「NP」	ニプロ	○			○
29	エバステチンOD錠5mg「ZE」	全星薬品工業	○			○
30	エバステチンOD錠5mg「科研」	ダイト	○			○
31	エバステチンOD錠5mg「ケミファ」	日本ケミファ	○			○
32	エバステチンOD錠5mg「サワイ」	沢井製薬	○			○
33	エバステチンOD錠5mg「タイヨー」	武田テバファーマ	○			○
34	エバステチンOD錠5mg「タカタ」	高田製薬	○			○
35	エバステチンOD錠5mg「日医工」	日医工	○			○
36	エバステチンOD錠5mg「NS」	日新製薬（山形）	○			○
37	エバステチンOD錠5mg「YD」	陽進堂	○			○

38	エバステチンOD錠5mg「アメル」	共和薬品工業	○			○
39	エバステチンOD錠5mg「ファイザー」	ファイザー	○			○
40	エバステチンOD錠10mg「DK」	大興製薬	○			○
41	エバステチンOD錠10mg「NP」	ニプロ	○			○
42	エバステチンOD錠10mg「ZE」	全星薬品工業	○			○
43	エバステチンOD錠10mg「科研」	ダイト	○			○
44	エバステチンOD錠10mg「ケミファ」	日本ケミファ	○			○
45	エバステチンOD錠10mg「サワイ」	沢井製薬	○			○
46	エバステチンOD錠10mg「タイヨー」	武田テバファーマ	○			○
47	エバステチンOD錠10mg「タカタ」	高田製薬	○			○
48	エバステチンOD錠10mg「日医工」	日医工	○			○
49	エバステチンOD錠10mg「NS」	日新製薬（山形）	○			○
50	エバステチンOD錠10mg「YD」	陽進堂	○			○
51	エバステチンOD錠10mg「アメル」	共和薬品工業	○			○
52	エバステチンOD錠10mg「ファイザー」	ファイザー	○			○

注)「BE」は、生物学的同等性(BE)試験結果を示し、○印がついているものは本情報集にデータを掲載している。【6~19 ページ】

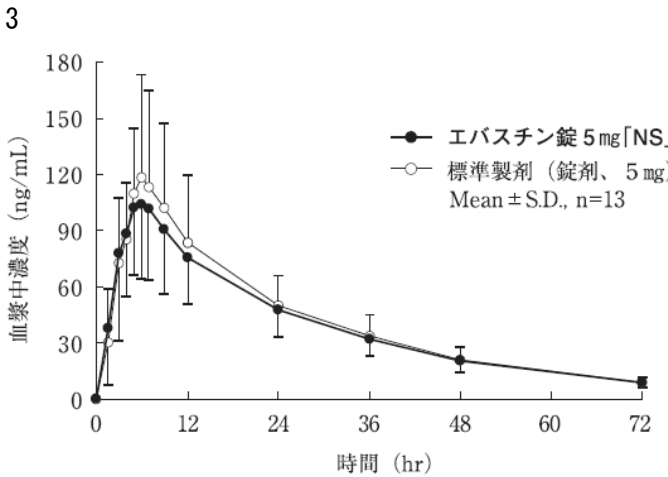
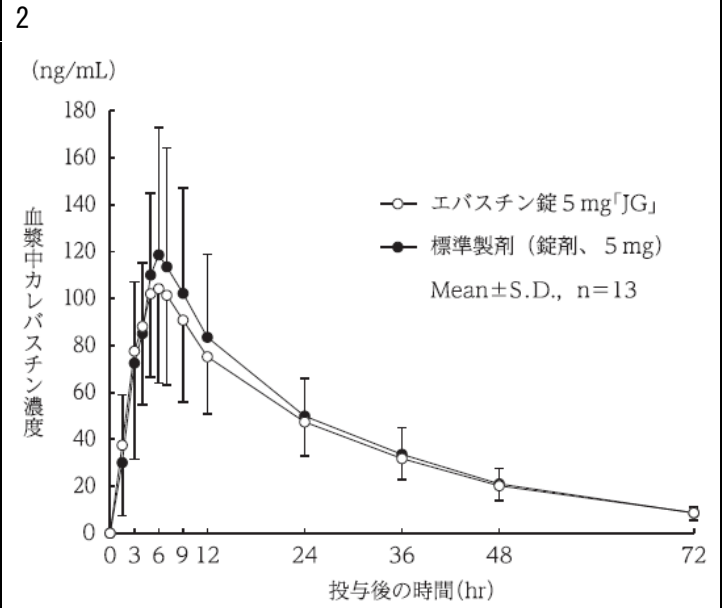
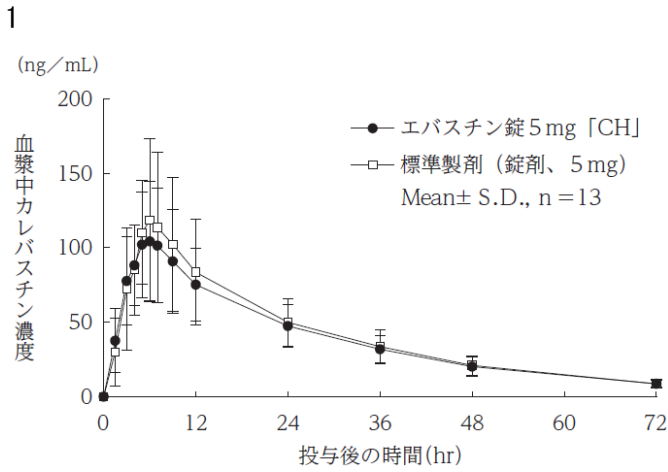
注)「品質再評価」の項目に○印がついているものは、品質再評価結果通知が発出されている品目である。空欄となっているものは、品質再評価指定以降に承認された品目等である。【20 ページ】

注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である(上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している)。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【21~23 ページ】

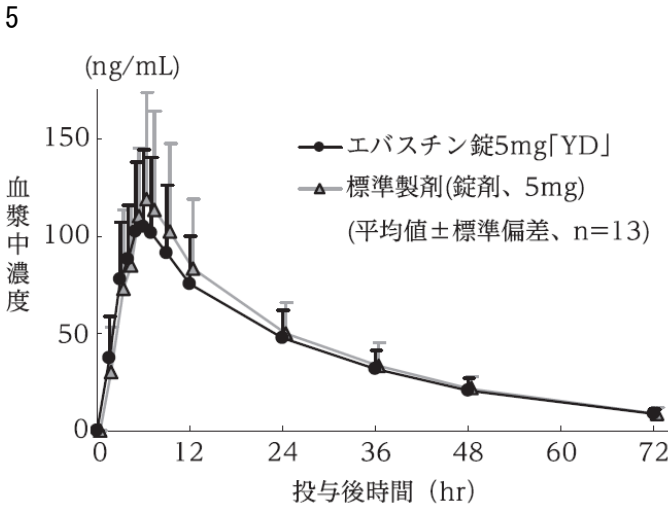
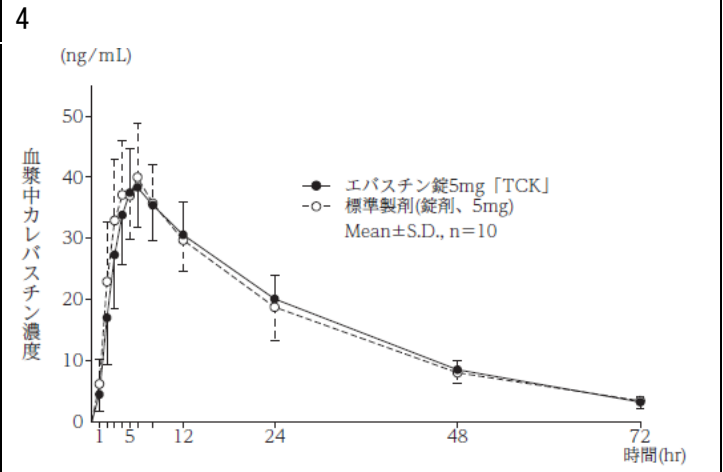
注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【24 ページ】

注)長生堂製薬、日本ジェネリック、日新製薬(山形)、陽進堂、ダイト、日本ケミファ、高田製薬、共和薬品工業及びファイザーの錠剤は、承認時において他社と共同開発されたものである。大興製薬、ニプロ、全星薬品工業、ダイト、日本ケミファ、沢井製薬、武田テバファーマ、高田製薬、日新製薬(山形)、陽進堂、共和薬品工業及びファイザーのOD錠は、承認時において他社と共同開発されたものである(医薬品審査管理課調査による)。

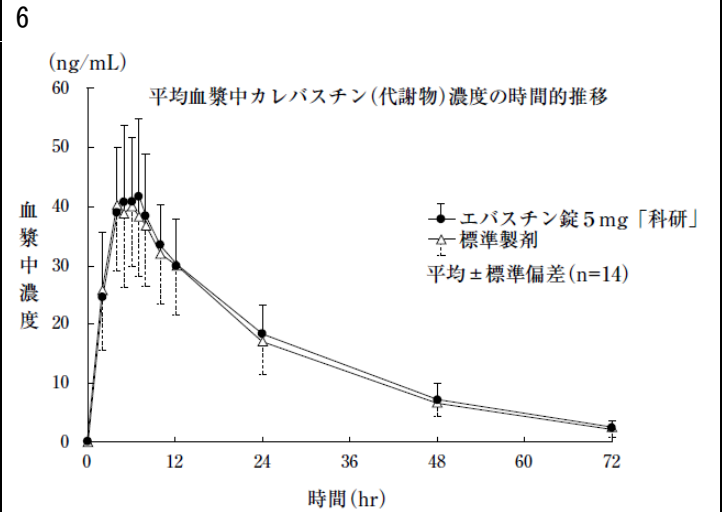
【生物学的同等性 (BE) 試験結果】



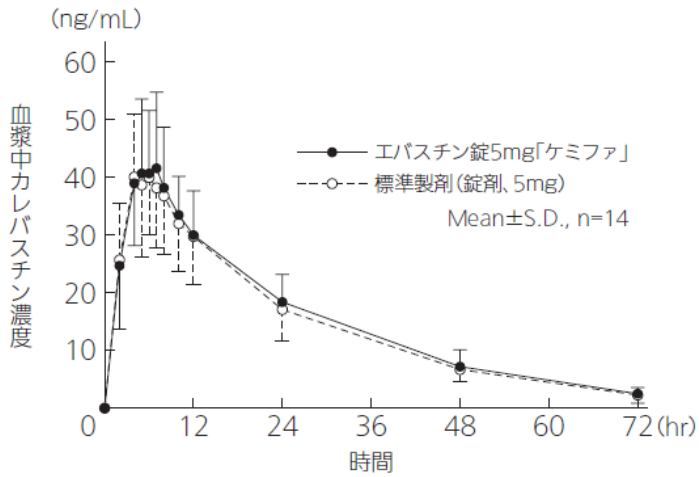
※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定



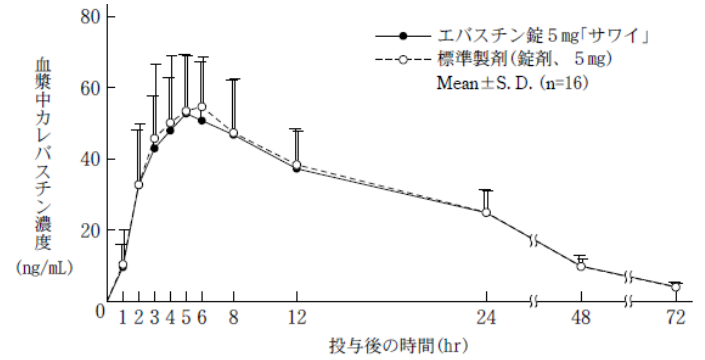
※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定



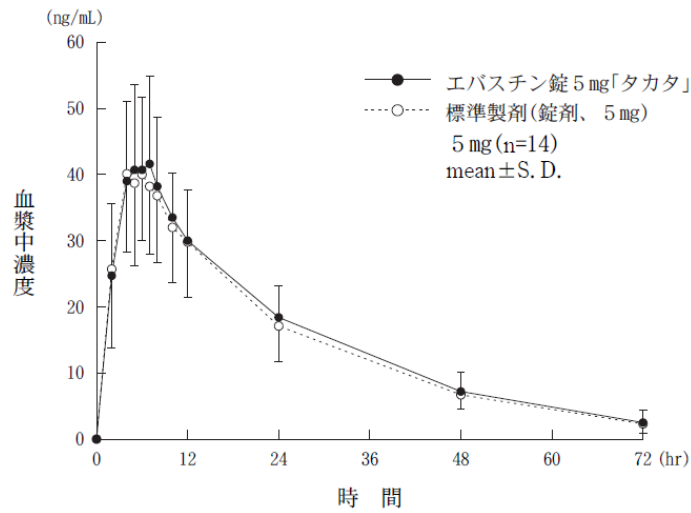
7



8

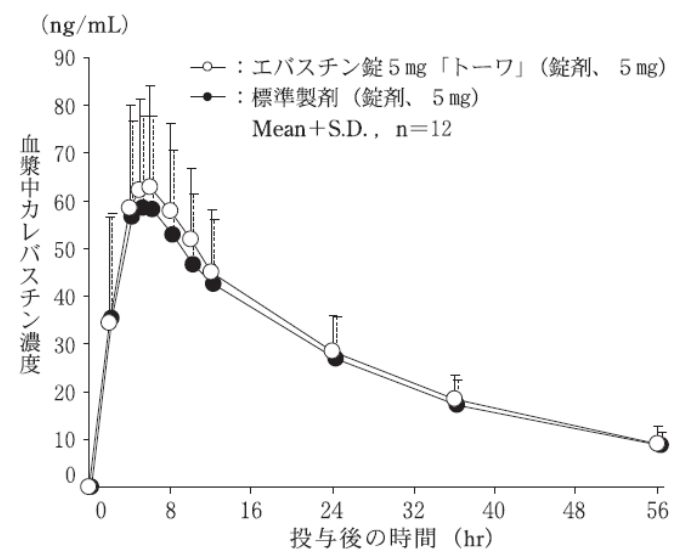


9

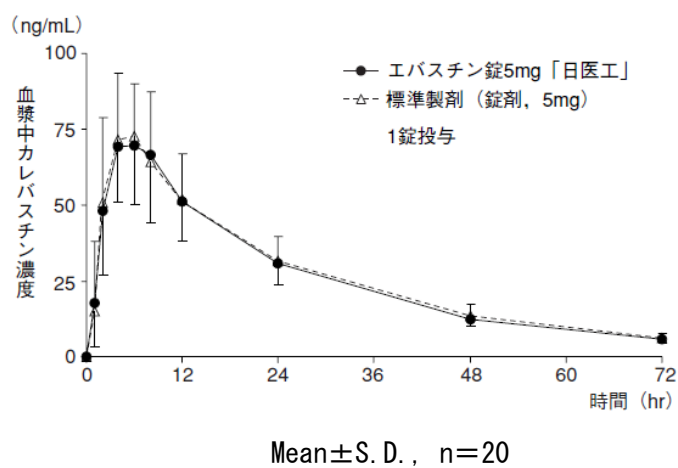


※血漿中の活性代謝物カレバステン濃度を測定

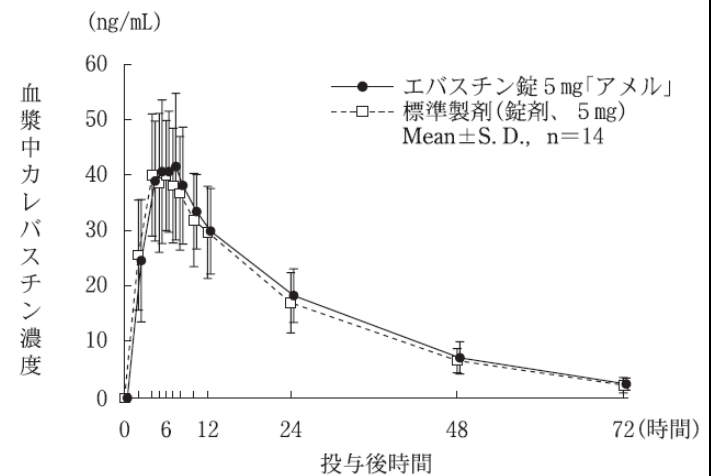
10



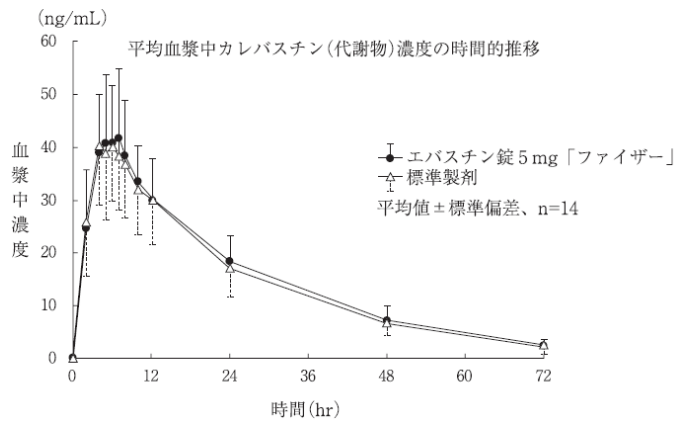
11



12

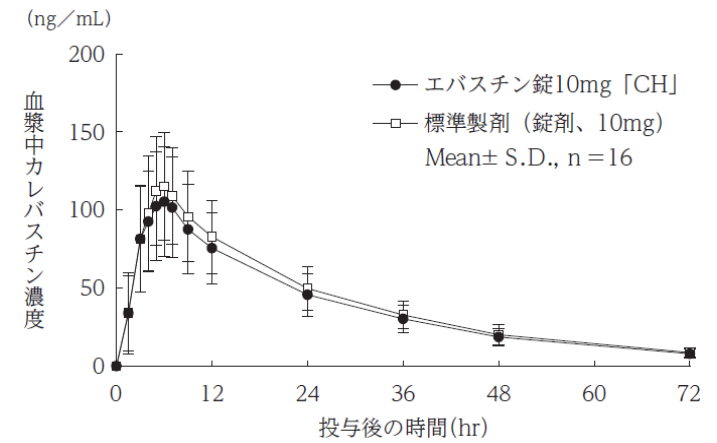


13

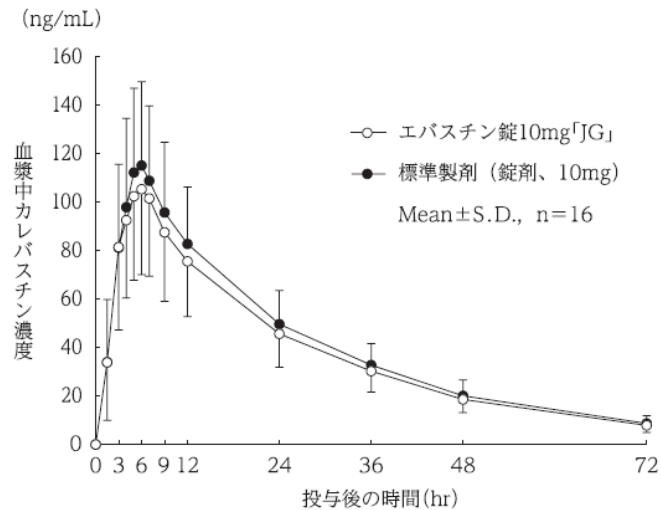


※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

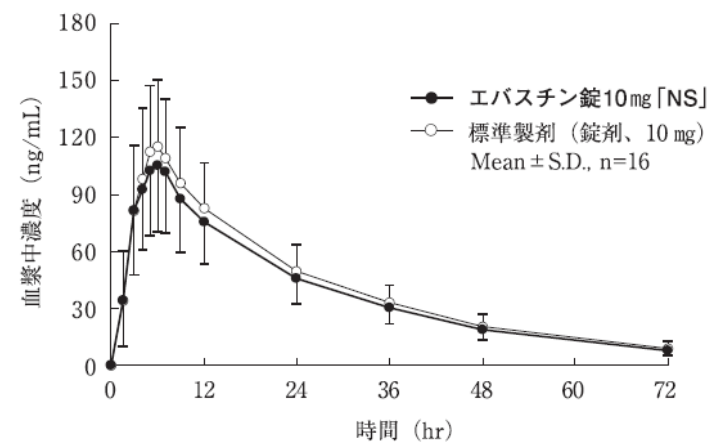
14



15

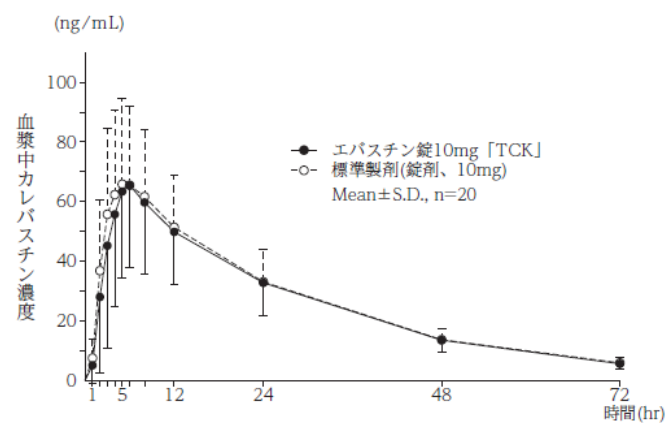


16

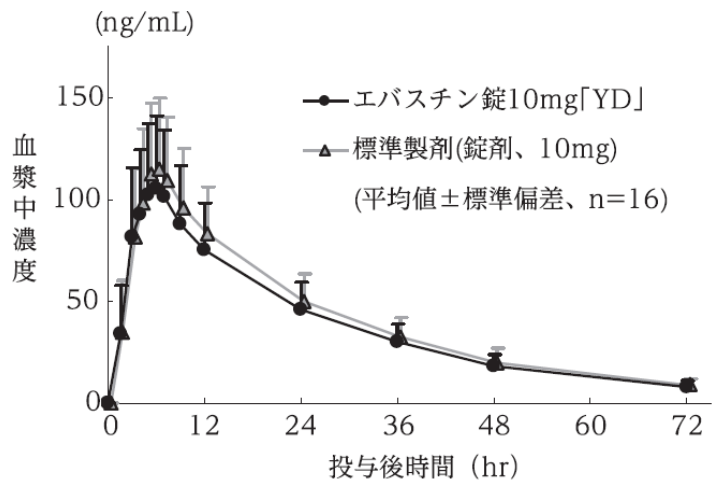


※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

17

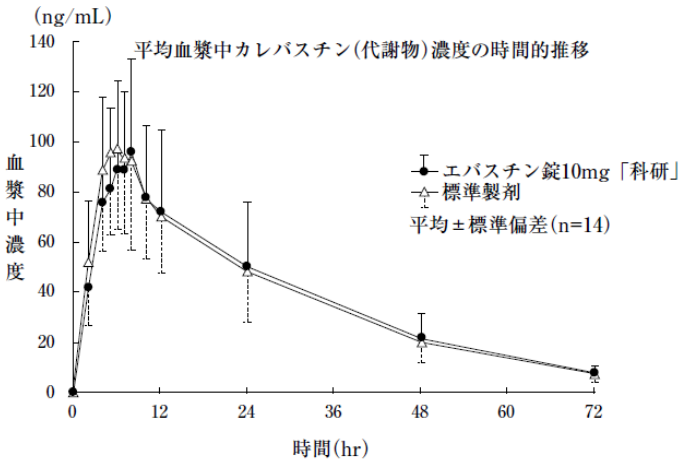


18

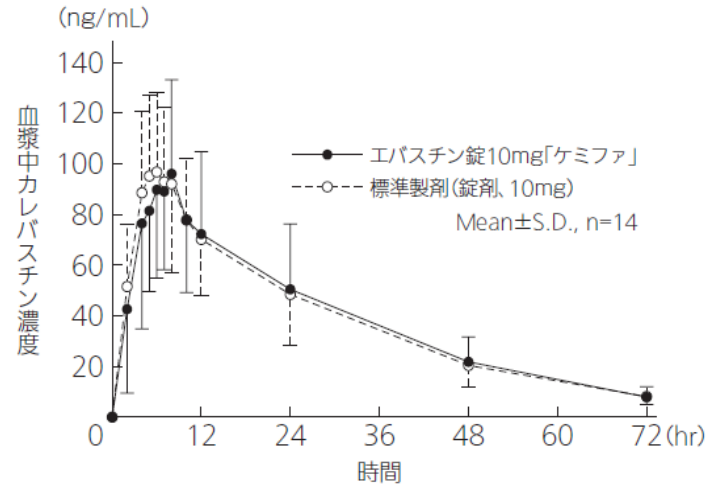


※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

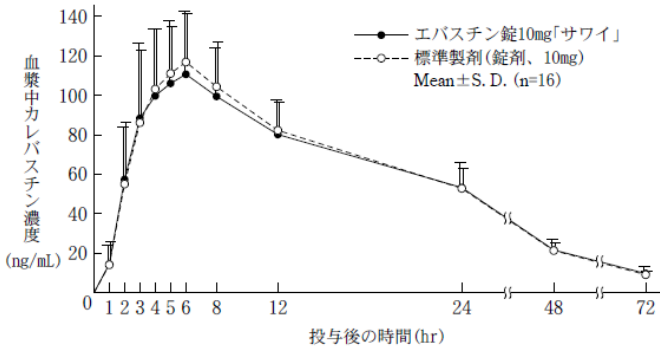
19



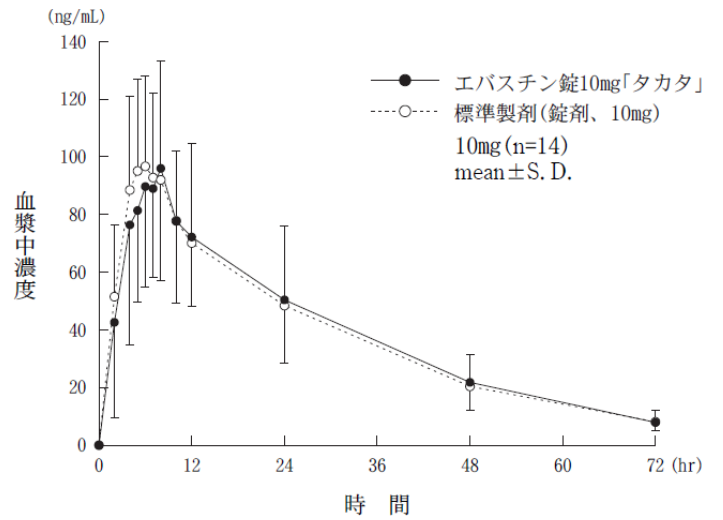
20



21

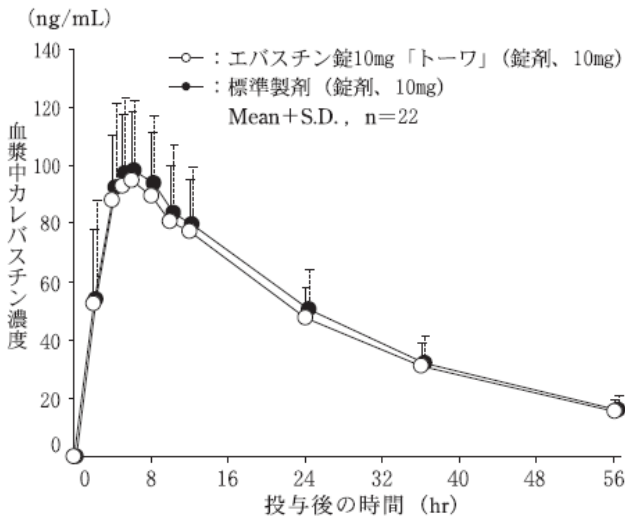


22

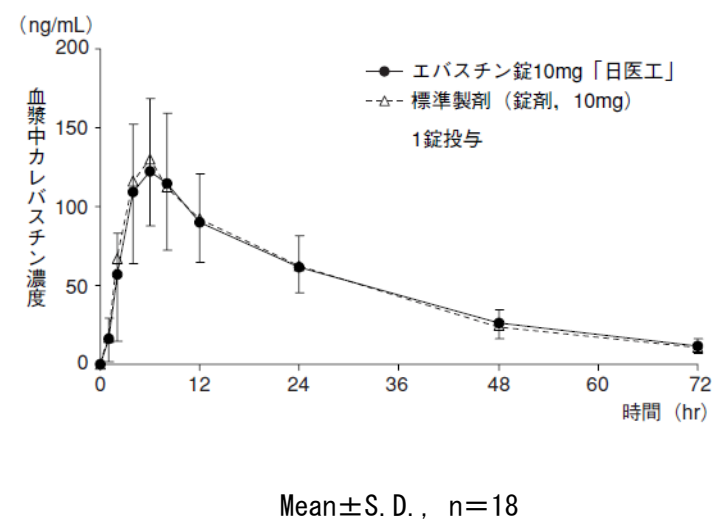


※血漿中の活性代謝物カレバステン濃度を測定

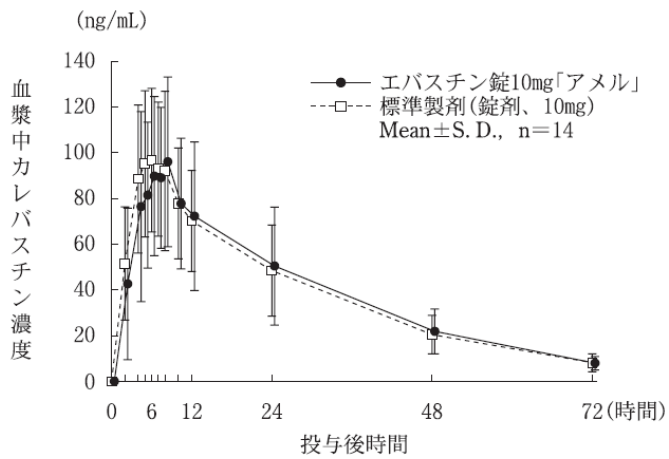
23



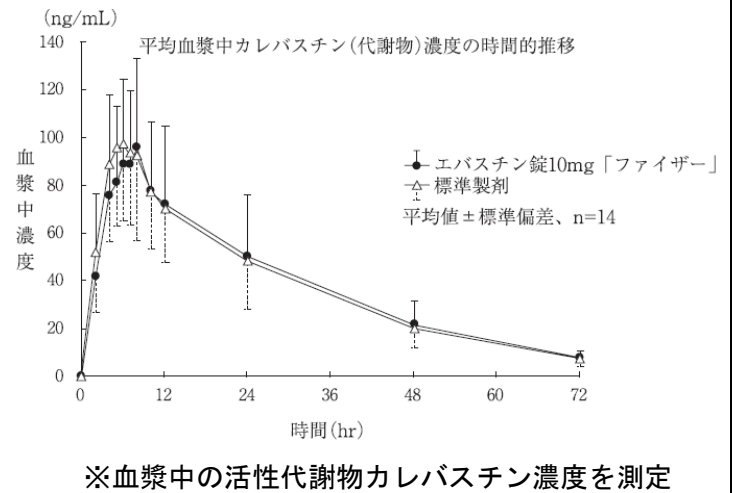
24



25

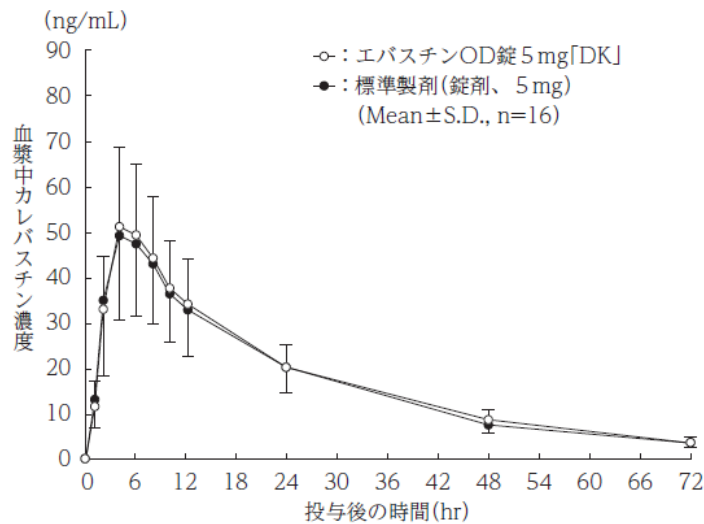


26

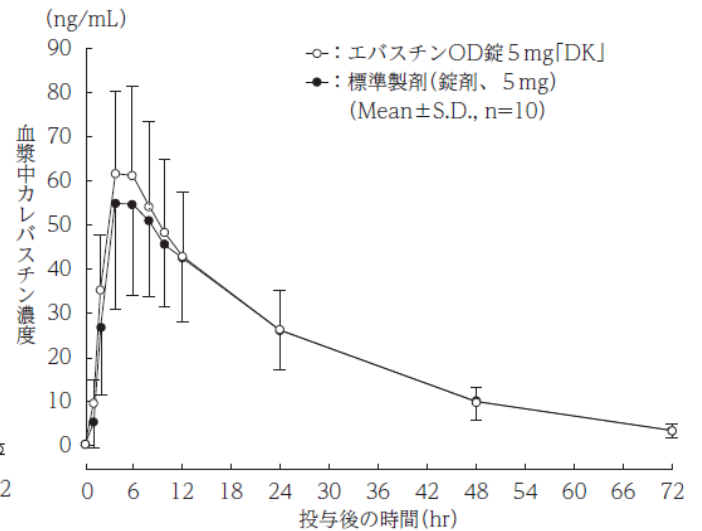


27

水あり投与

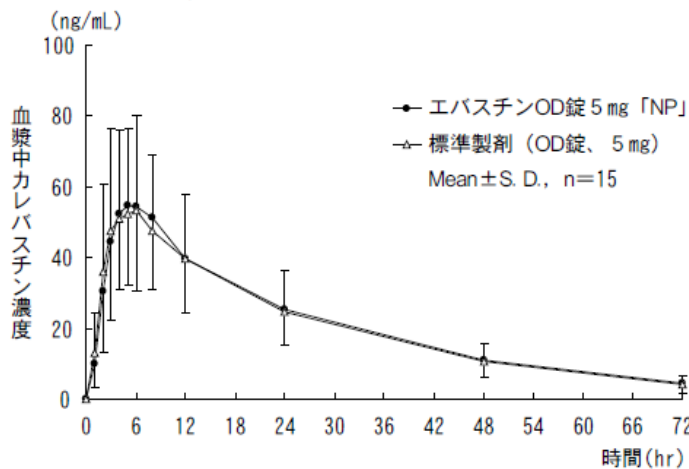


水なし投与

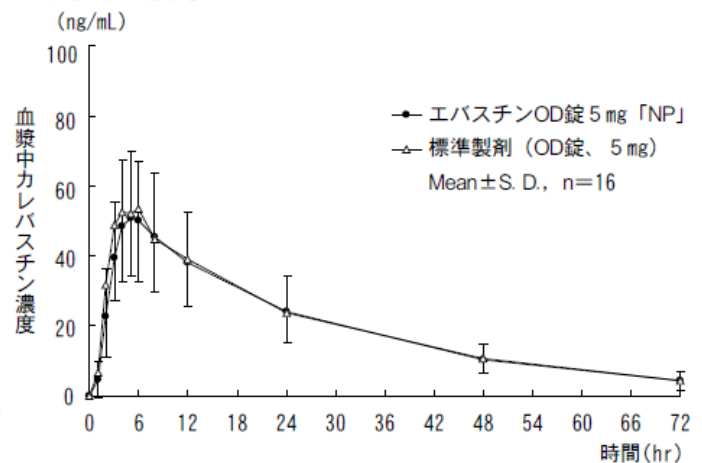


28

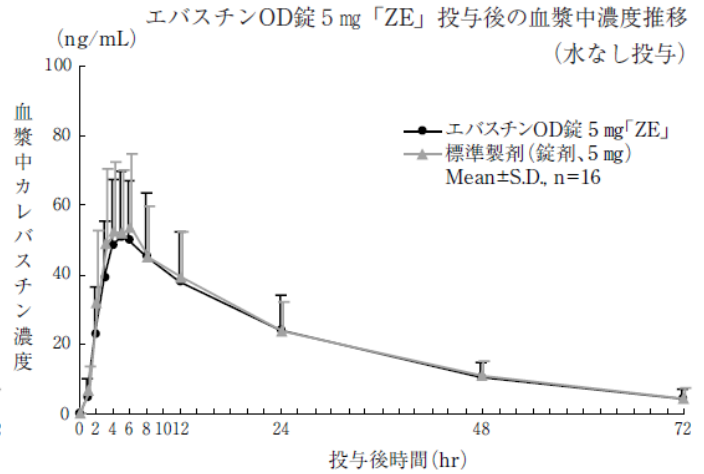
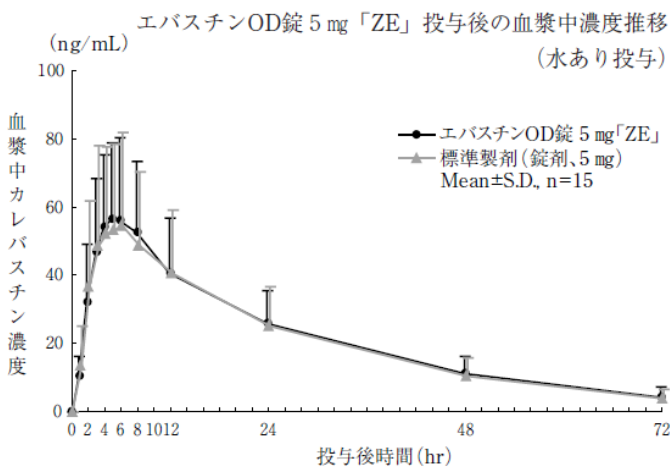
(1)水あり投与



(2)水なし投与

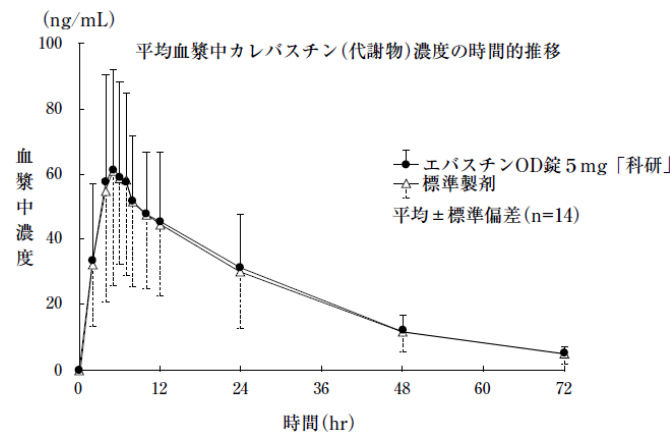


29

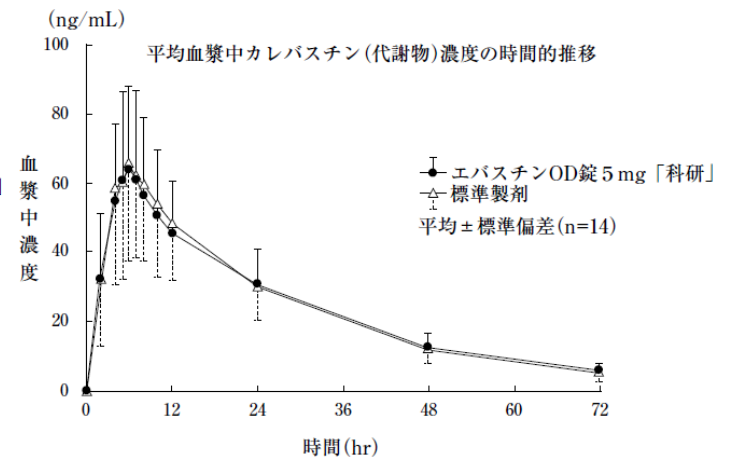


30

1) 水で服用の試験

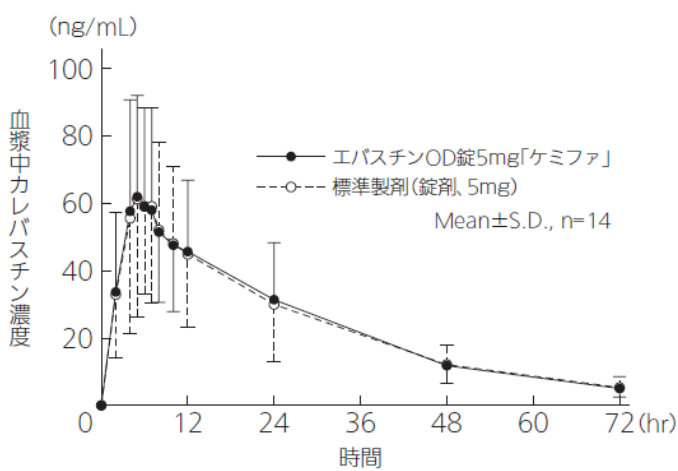


2) 水なしで服用の試験

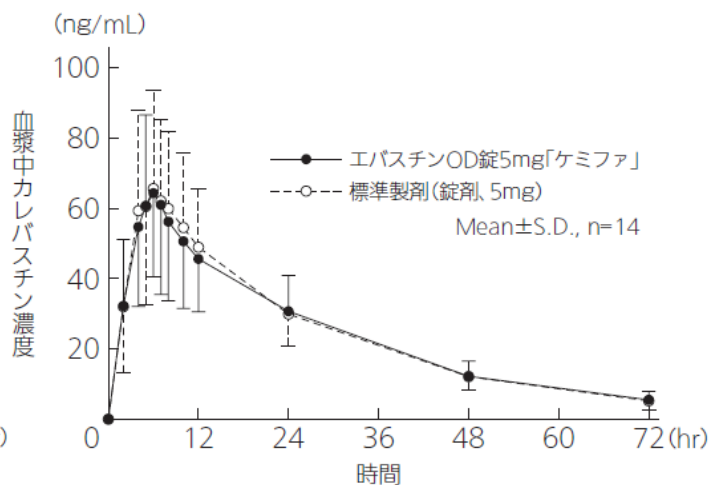


31

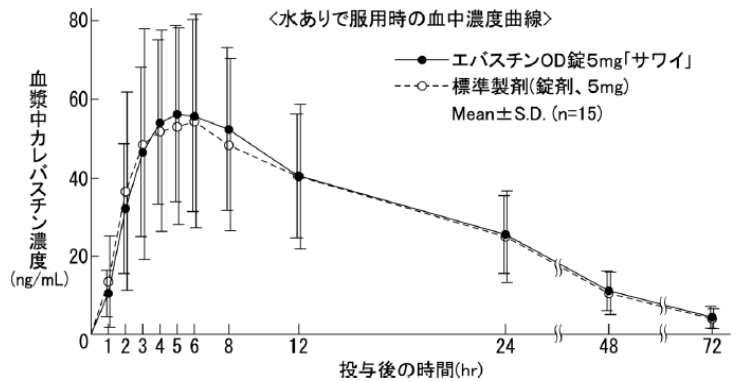
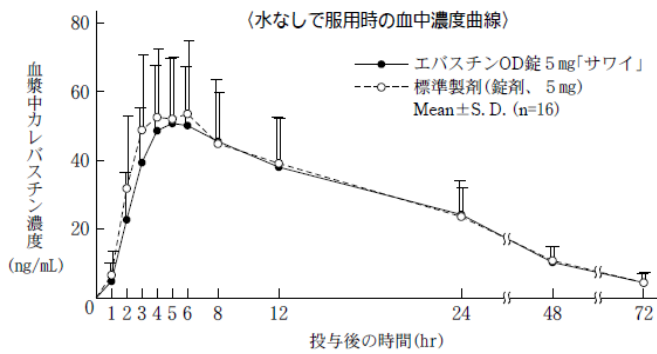
水あり投与



水なし投与



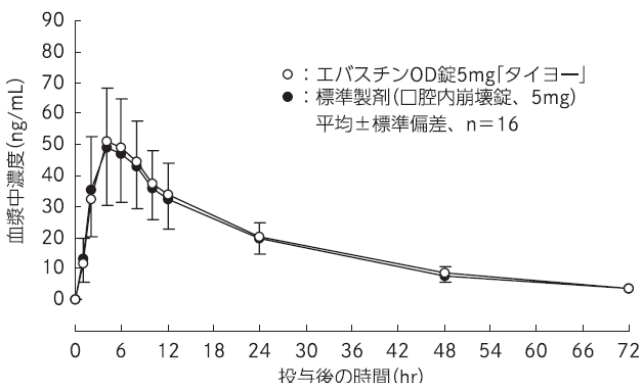
32



(インタビューフォームより)

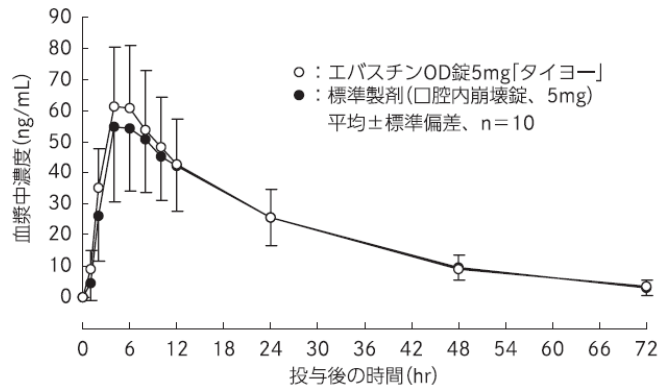
33

水で服用時



※血漿中の活性代謝物カレバステン濃度を測定

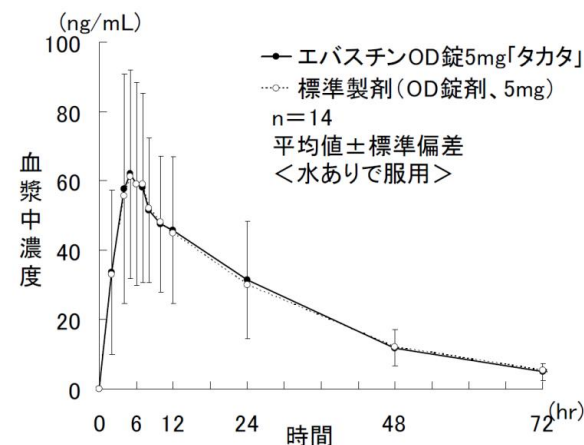
水なしで服用時



※血漿中の活性代謝物カレバステン濃度を測定

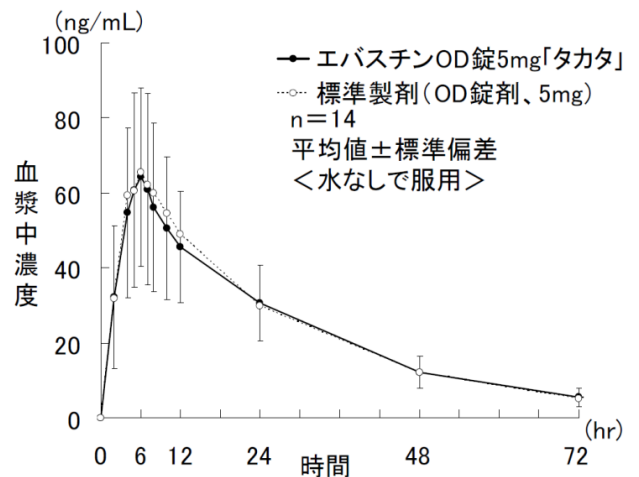
34

旧処方製剤



※血漿中の活性代謝物カレバステン濃度を測定

(インタビューフォームより)



※血漿中の活性代謝物カレバステン濃度を測定

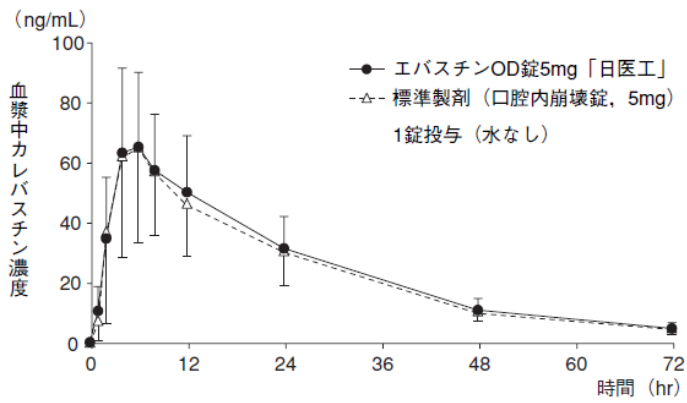
(インタビューフォームより)

新処方製剤

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、本剤と旧処方製剤〔ヒトを対象とした生物学的同等性試験により同等性が確認されている。〕の溶出挙動を比較したところ、両剤の溶出挙動は同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

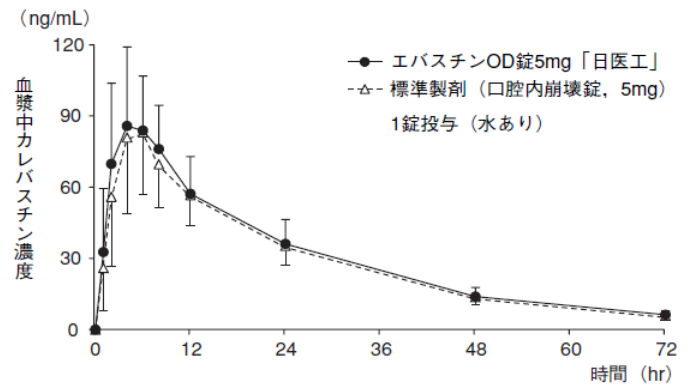
35

水なし服用



Mean ± S. D., n=10

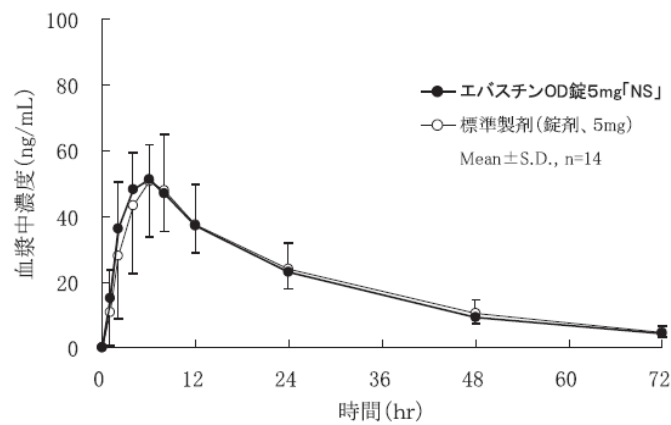
水あり服用



Mean ± S. D., n=10

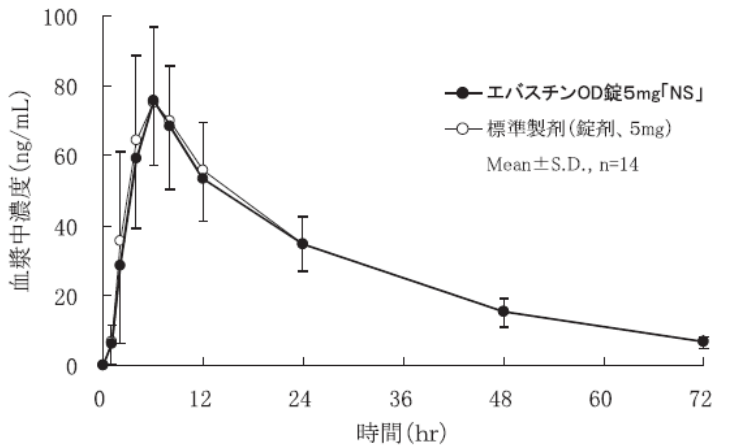
36

1) 水で服用



※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

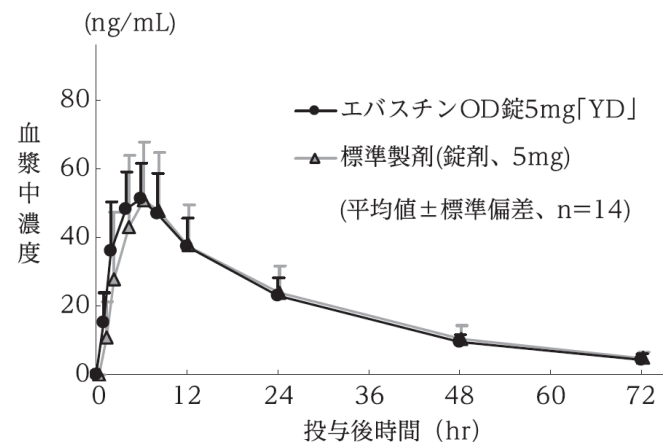
2) 水なしで服用



※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

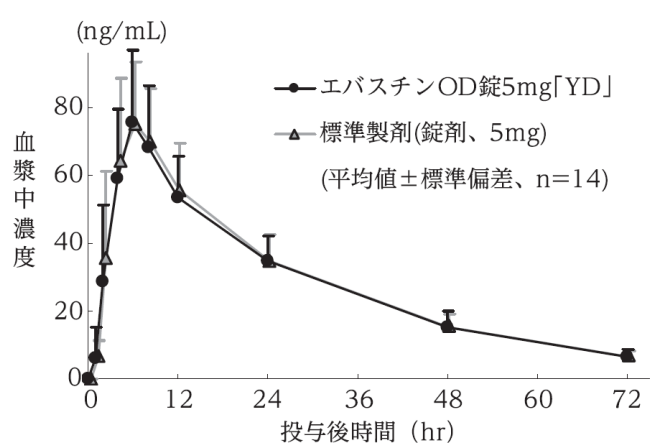
37

1) 水で服用した場合



※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

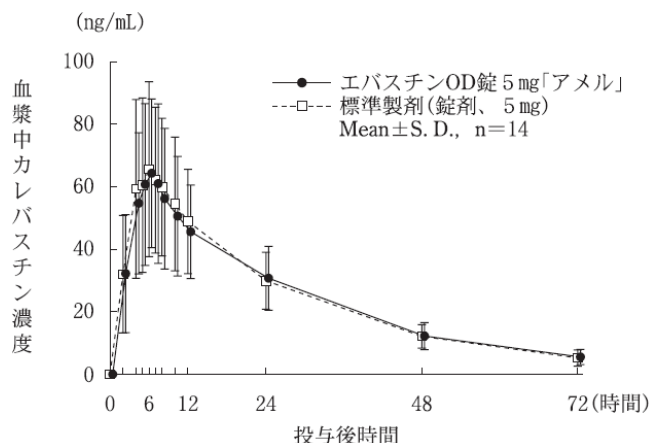
2) 水なしで服用した場合



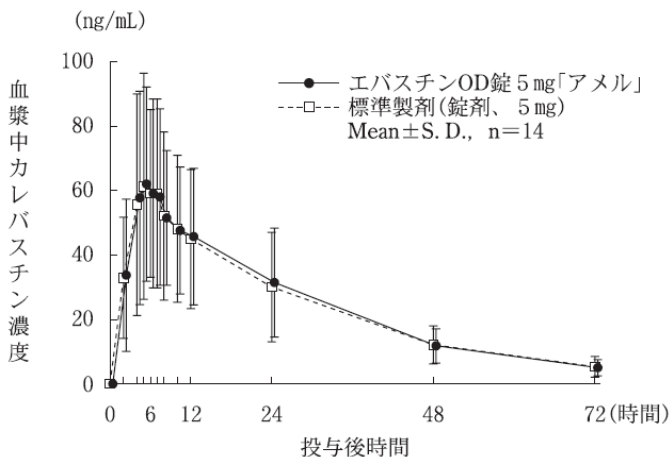
※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

38

水なし服用

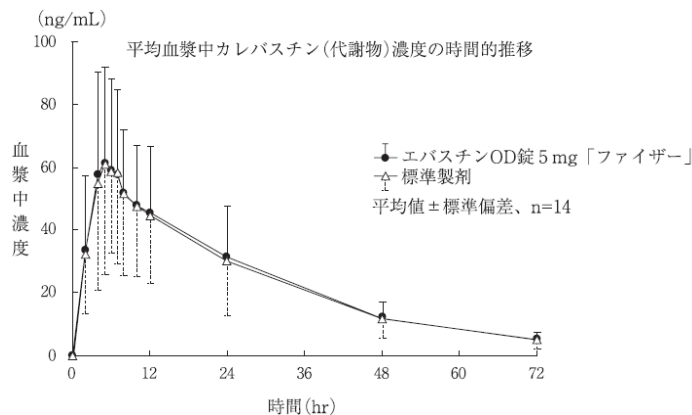


水あり服用

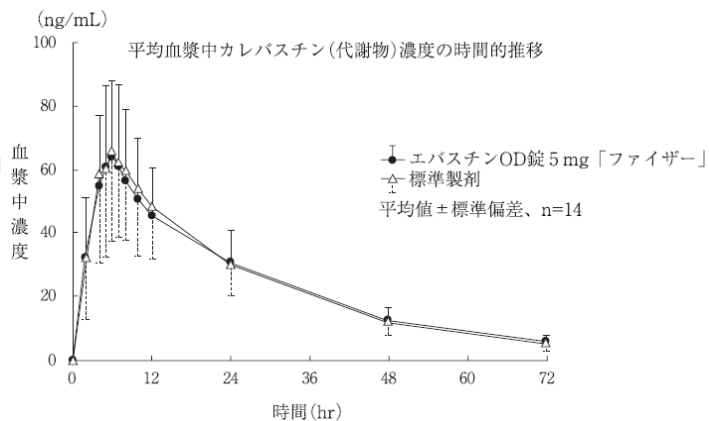


39

1) 水で服用の試験



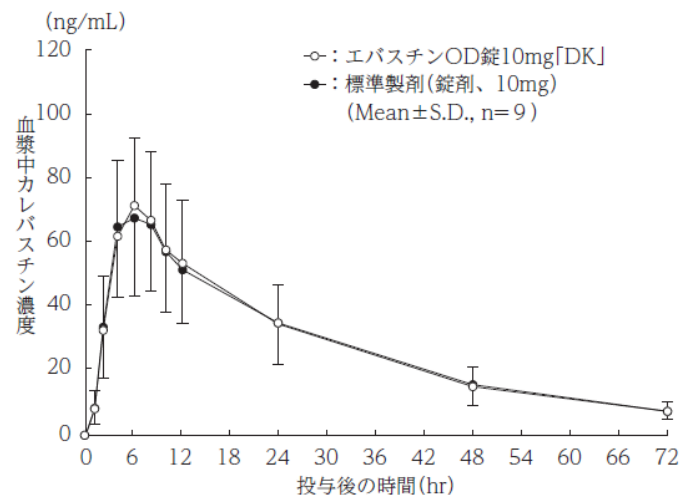
2) 水なしで服用の試験



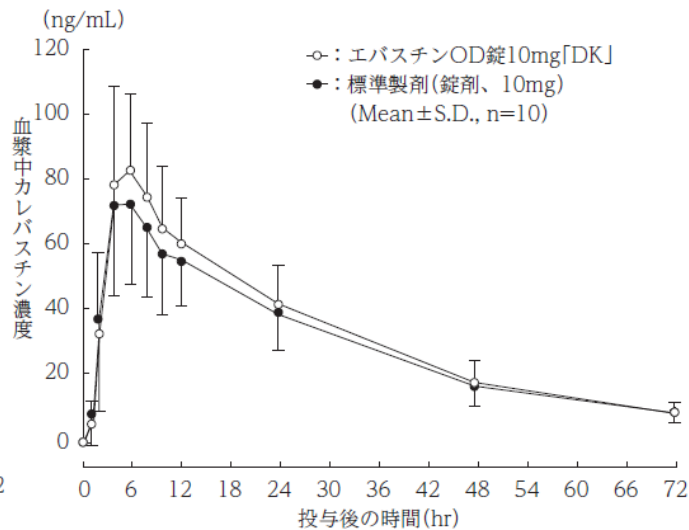
※血漿中の活性代謝物カレバスタチン濃度を測定

40

水あり投与

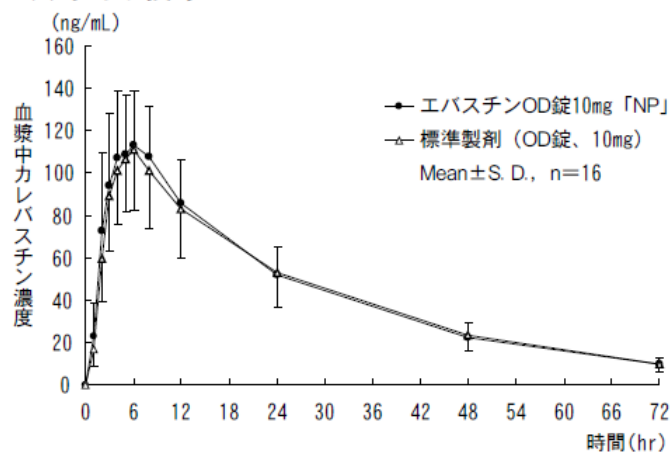


水なし投与

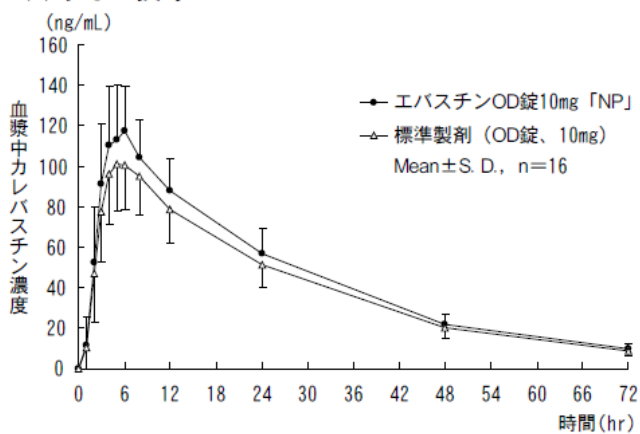


41

(1) 水あり投与

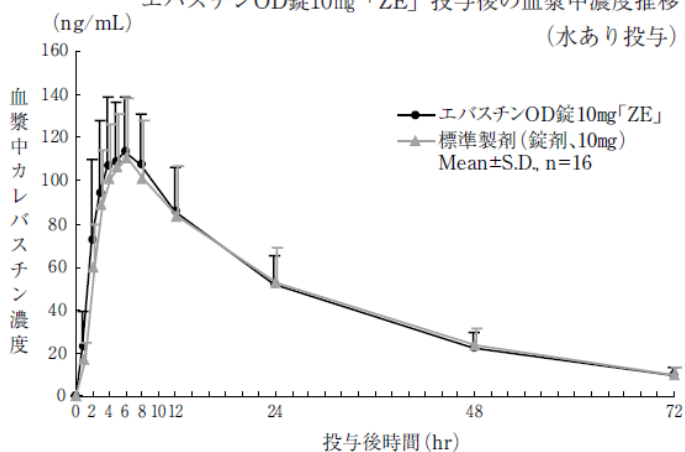


(2) 水なし投与

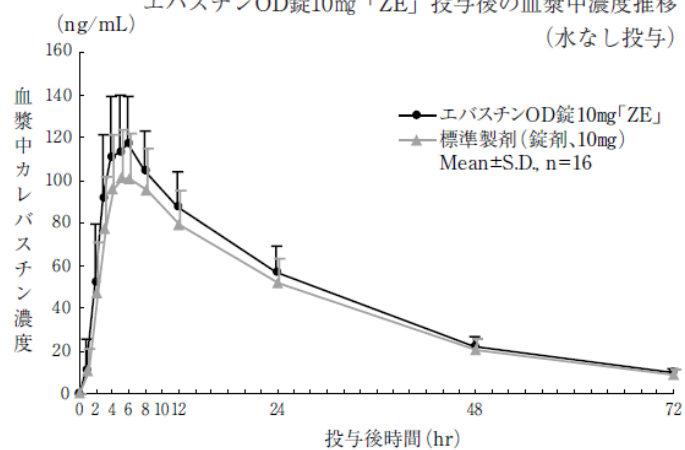


42

エバステチンOD錠10mg「ZE」投与後の血漿中濃度推移 (水あり投与)



エバステチンOD錠10mg「ZE」投与後の血漿中濃度推移 (水なし投与)

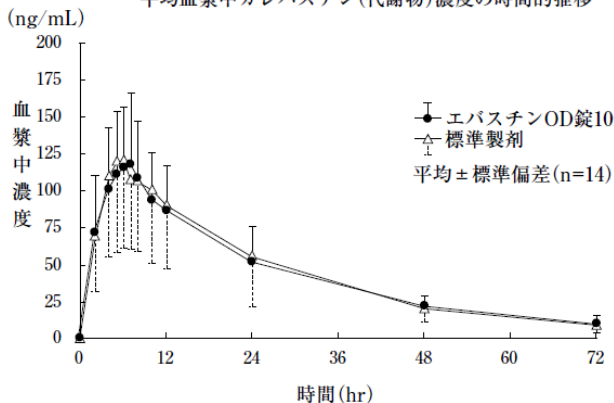


43

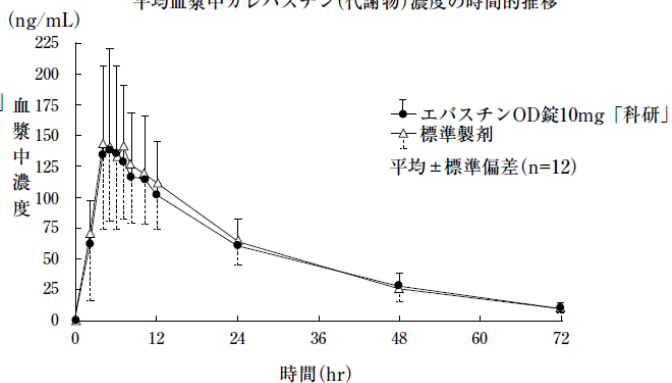
1) 水で服用の試験

2) 水なしで服用の試験

平均血漿中カレバステチン(代謝物)濃度の時間的推移

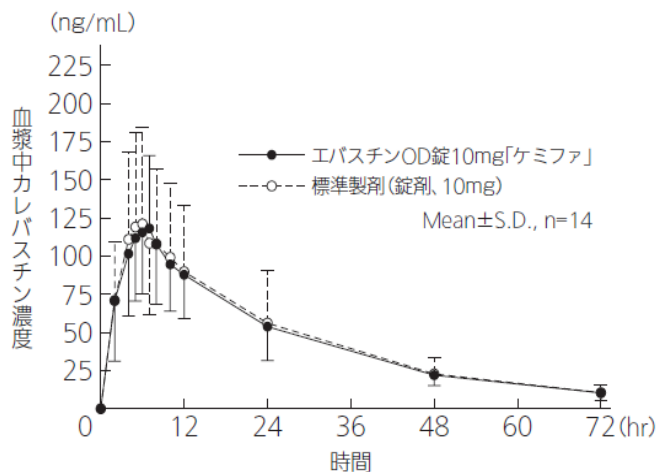


平均血漿中カレバステチン(代謝物)濃度の時間的推移

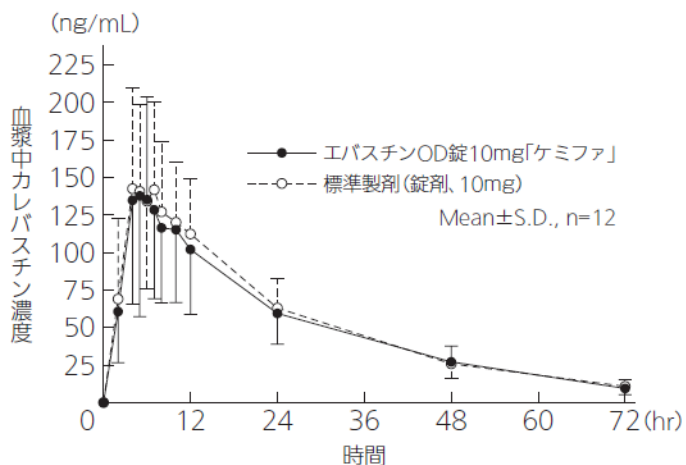


44

(水あり投与)

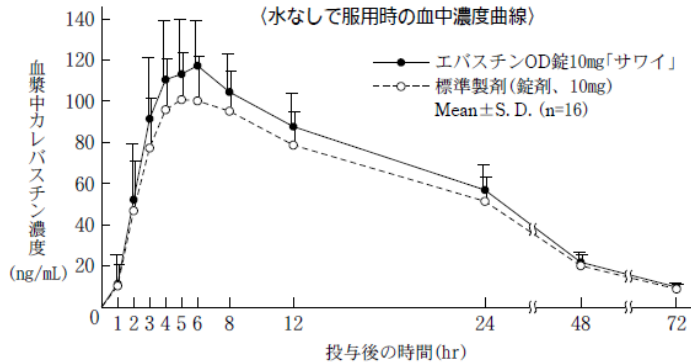


(水なし投与)

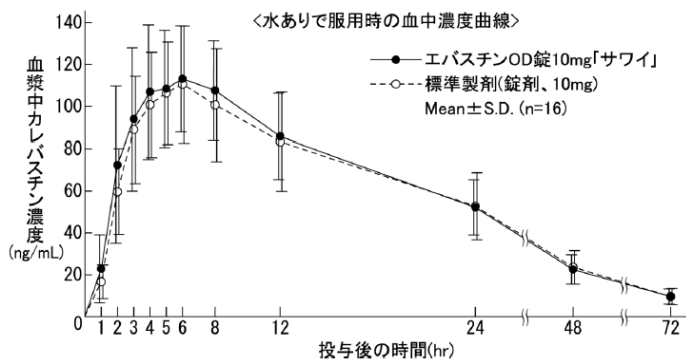


45

(水なしで服用時の血中濃度曲線)



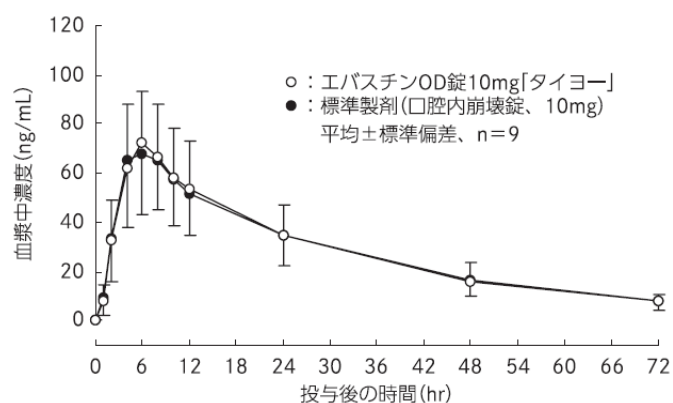
<水ありで服用時の血中濃度曲線>



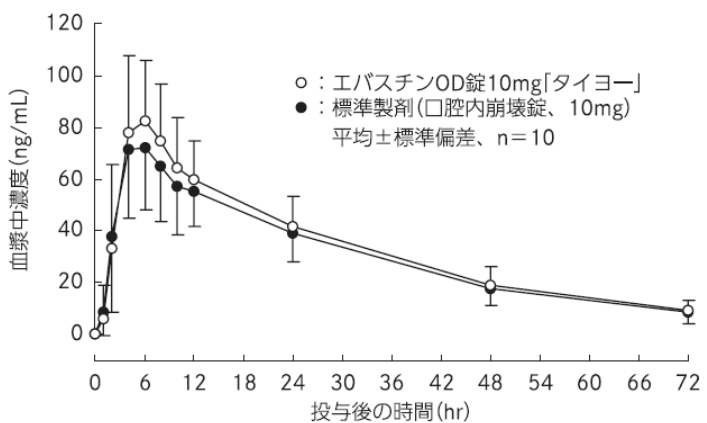
(インタビューフォームより)

46

水で服用時



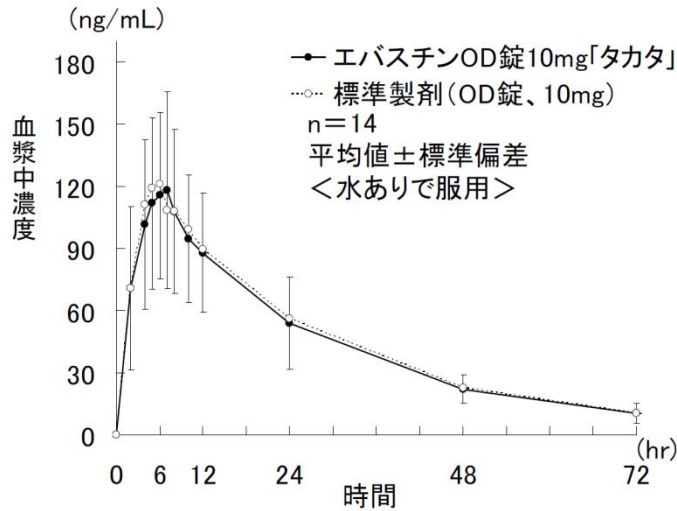
水なしで服用時



※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

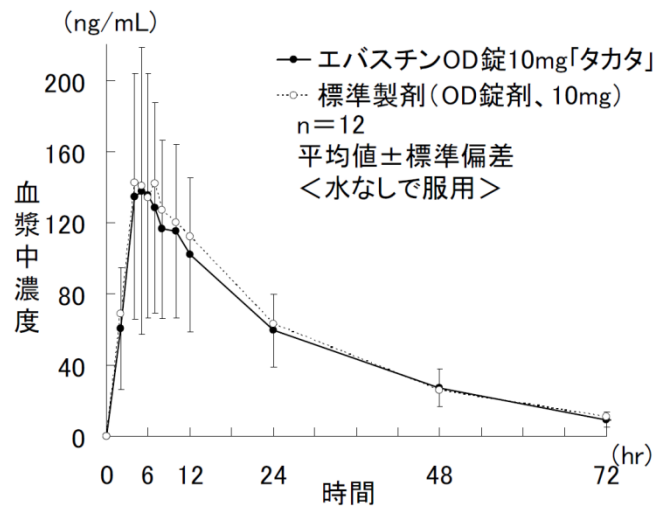
※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

旧処方製剤



※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

(インタビューフォームより)



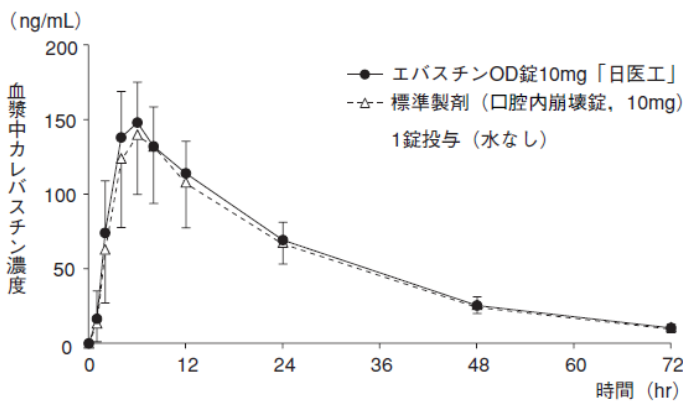
※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

(インタビューフォームより)

新処方製剤

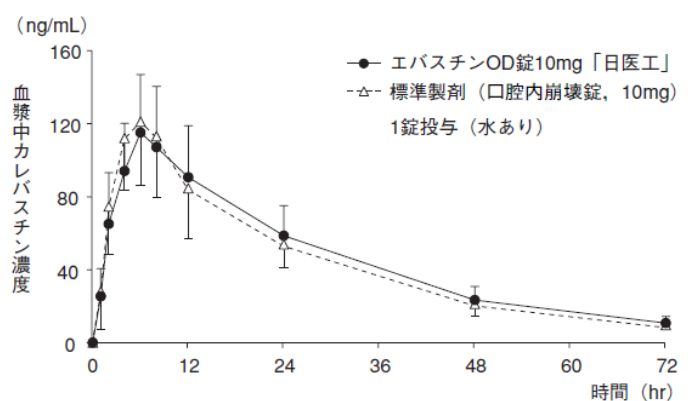
「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、本剤と旧処方製剤〔ヒトを対象とした生物学的同等性試験により同等性が確認されている。〕の溶出挙動を比較したところ、両剤の溶出挙動は同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

水なし服用



Mean±S. D. , n=20

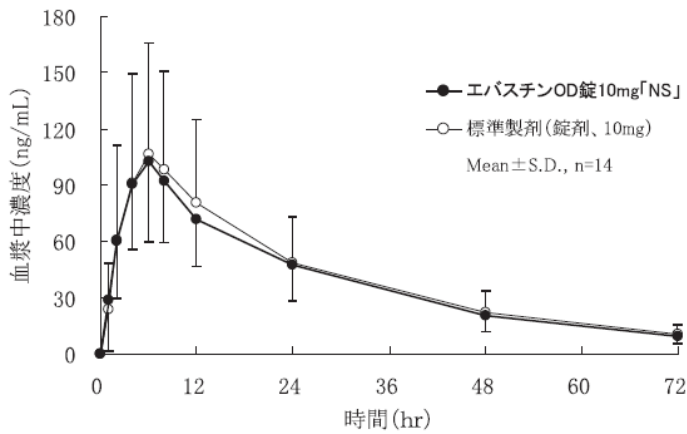
水あり服用



Mean±S. D. , n=10

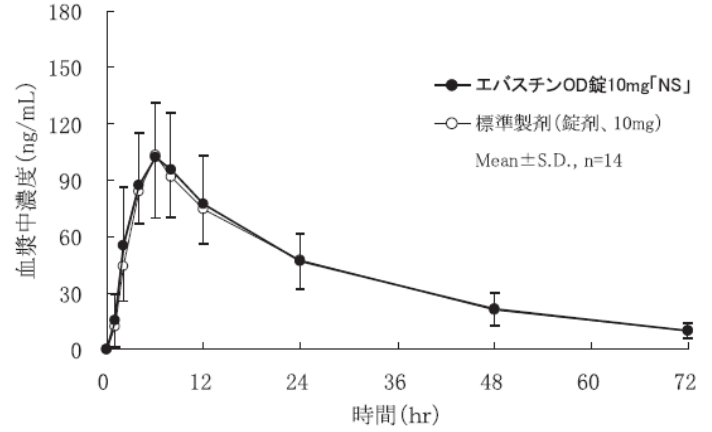
49

1) 水で服用



※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

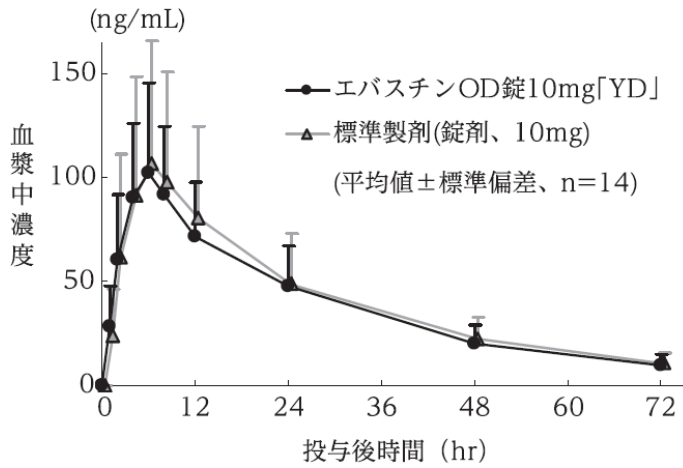
2) 水なしで服用



※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

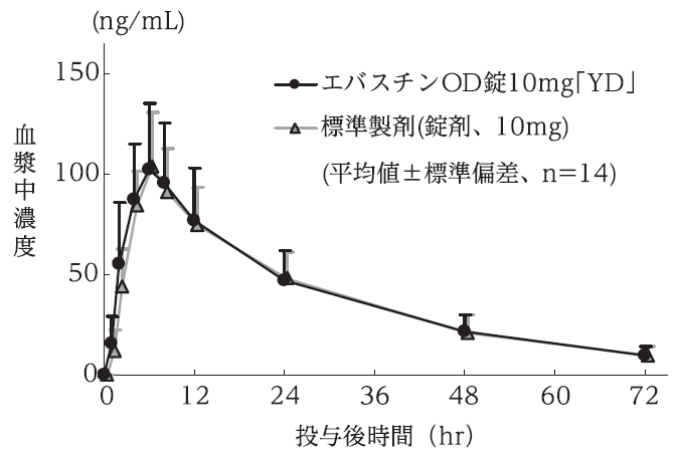
50

1) 水で服用した場合



※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

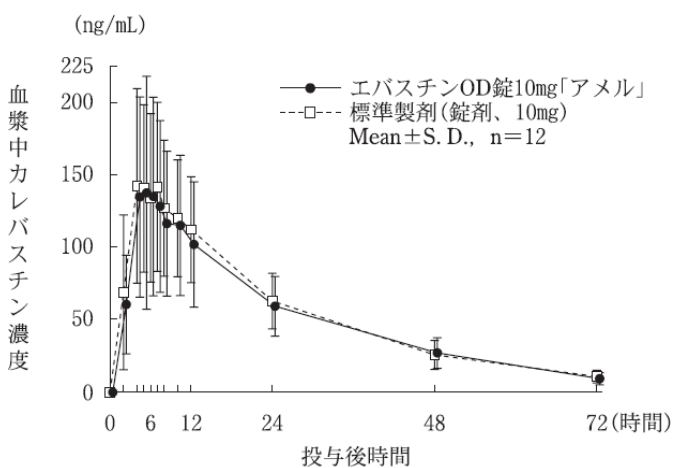
2) 水なしで服用した場合



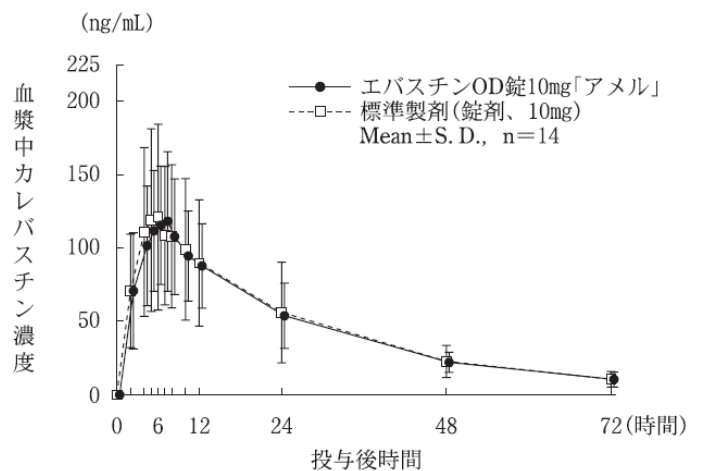
※血漿中の活性代謝物カレバスチン濃度を測定

51

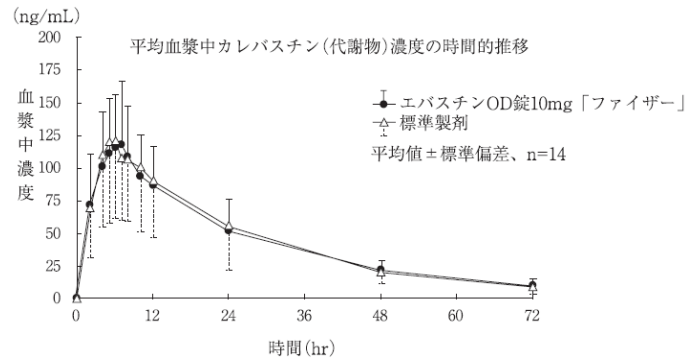
水なし服用



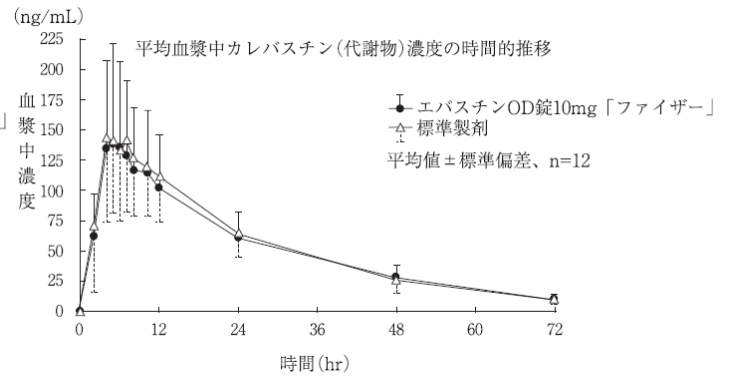
水あり服用



1) 水で服用の試験



2) 水なしで服用の試験



※血漿中の活性代謝物カレバステチン濃度を測定

【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】

なし

【溶出試験結果（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】²⁾

製剤 No	製品名	製造販売元	ロット番号	使用期限	備考
No. 1	エバステル錠 10mg	大日本住友製薬(株)	2033C	2016. 10	先発医薬品
No. 2	エバスチン錠 10mg 「科研」	ダイト(株)	1350141	2016. 12	
No. 3	エバスチン錠 10mg 「ケミファ」	日本ケミファ(株)	0303	2016. 09	
No. 4	エバスチン錠 10mg 「タカタ」	高田製薬(株)	NY11219	2016. 11	
No. 5	エバスチン錠 10mg 「アメル」	共和薬品工業(株)	1201	2015. 11	
No. 6	エバスチン錠 10mg 「ファイザー」	ファイザー(株)	14101	2016. 12	
No. 7	エバスチン錠 10mg 「日医工」	日医工(株)	LK1401	2016. 12	
No. 8	エバスチン錠 10mg 「TCK」	辰巳化学(株)	ZBDK	2017. 02	
No. 9	エバスチン錠 10mg 「YD」	(株)陽進堂	YIB-1	2017. 01	
No. 10	エバスチン錠 10mg 「CH」	長生堂製薬(株)	YI041	2016. 09	
No. 11	エバスチン錠 10mg 「JG」	日本ジェネリック (株)	305580	2016. 04	
No. 12	エバスチン錠 10mg 「NS」	日新製薬(株)	40011A	2016. 12	
No. 13	エバスチン錠 10mg 「サワイ」	沢井製薬(株)	13901	2016. 12	
No. 14	エバスチン錠 10mg 「MED」	メディサ新薬(株)	13651	2016. 07	
No. 15	エバスチン錠 10mg 「トーワ」	東和薬品(株)	B175	2017. 08	

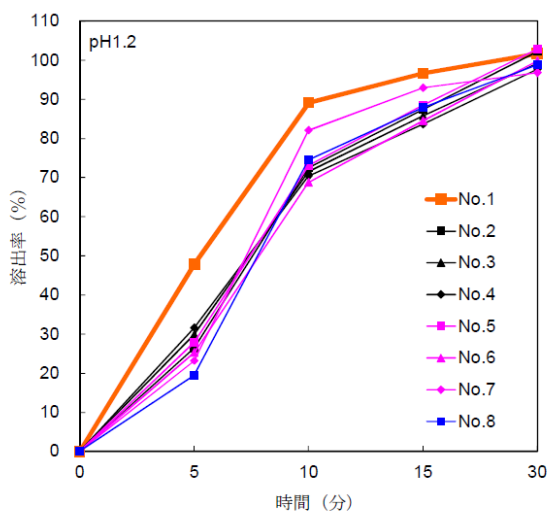


図 29 エバスチン錠 (No.1~No.8) の pH1.2 における溶出挙動

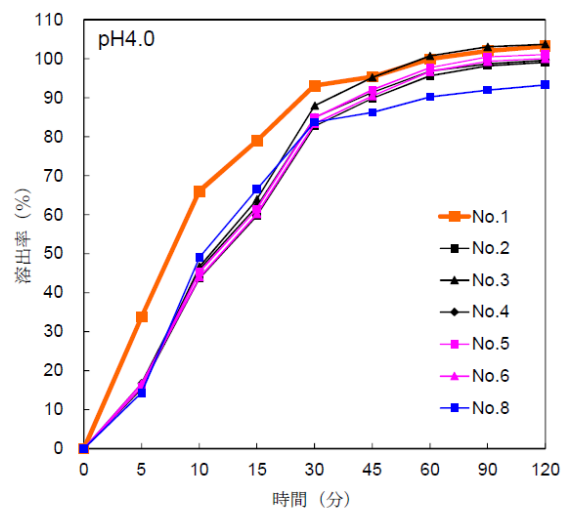


図 30 エバスチン錠 (No.1~No.6, No.8) の pH4.0 における溶出挙動

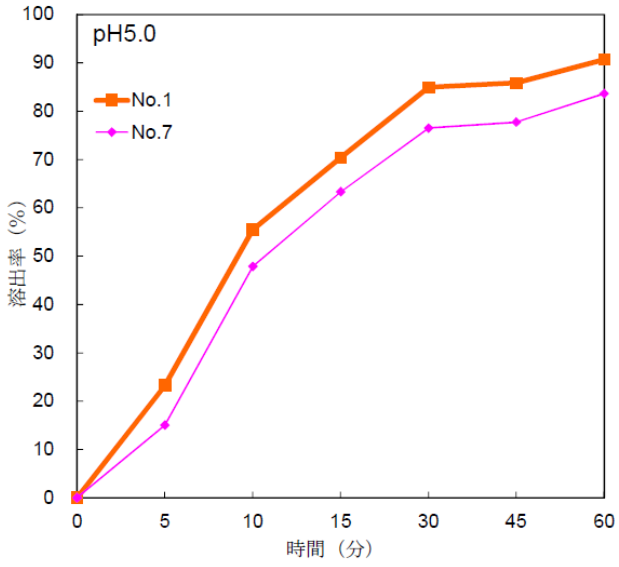


図 31 エバスチン錠 (No.1, No.7) の pH5.0 における溶出挙動

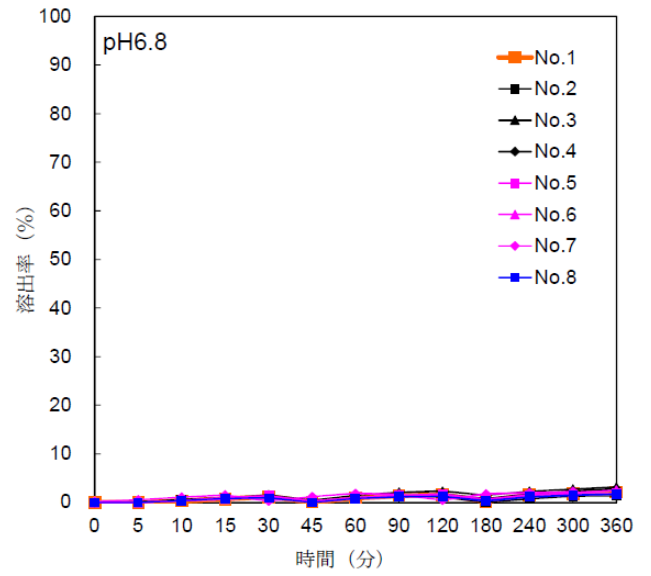


図 32 エバスチン錠 (No.1~No.8) の 6.8 における溶出挙動

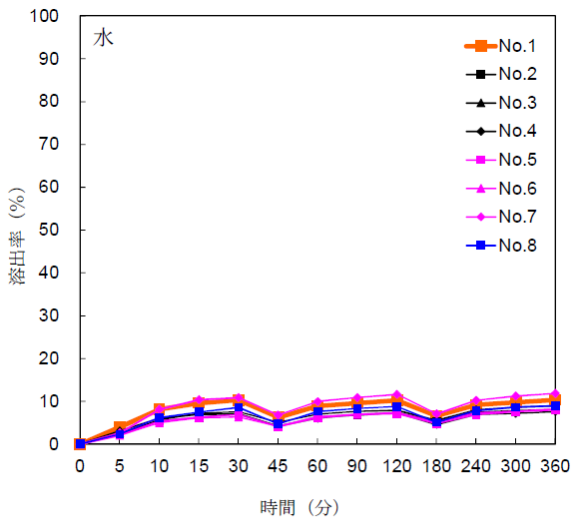


図 33 エバスチン錠 (No.1~No.8) の水における溶出挙動

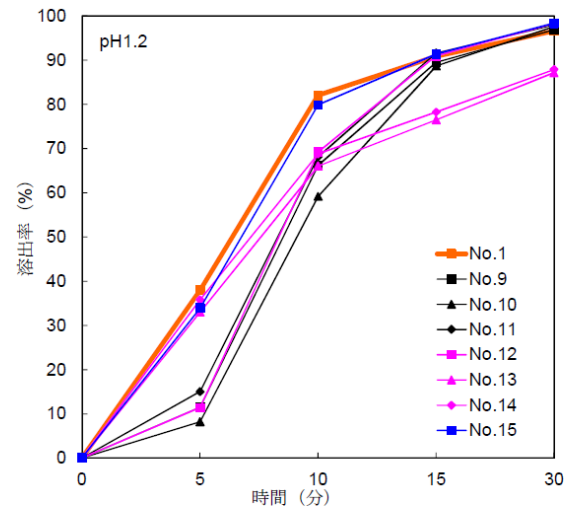


図 34 エバスチン錠 (No.1, No.9~No.15) の pH1.2 における溶出挙動

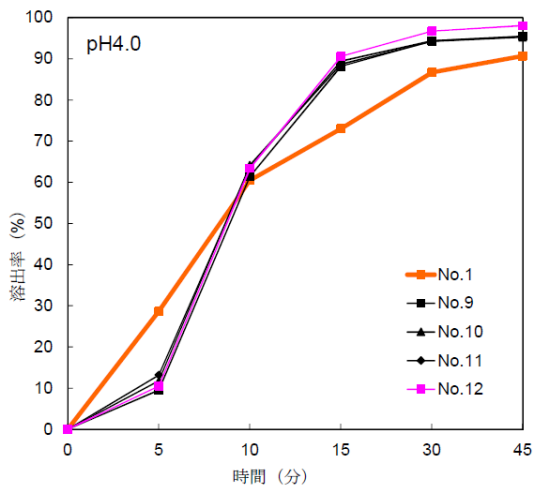


図 35 エバスタチン錠 (No.1, No.9~No.12) の pH4.0 における溶出挙動

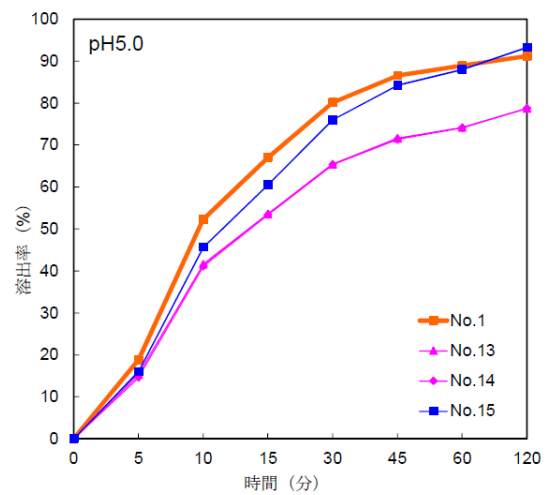


図 36 エバスタチン錠 (No.1, No.13~No.15) の pH5.0 における溶出挙動

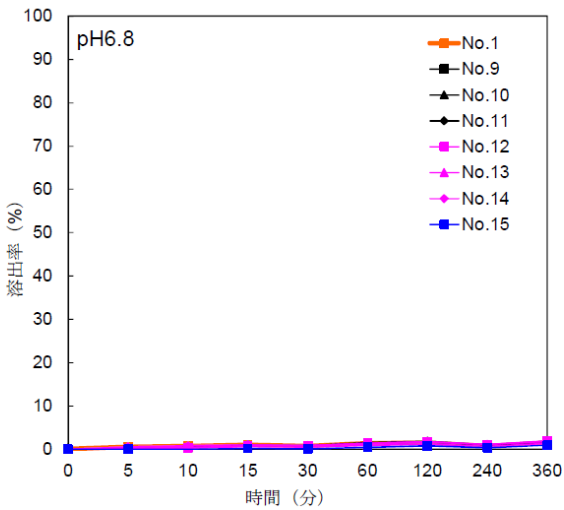


図 37 エバスタチン錠 (No.1, No.9~No.15) の pH6.8 における溶出挙動

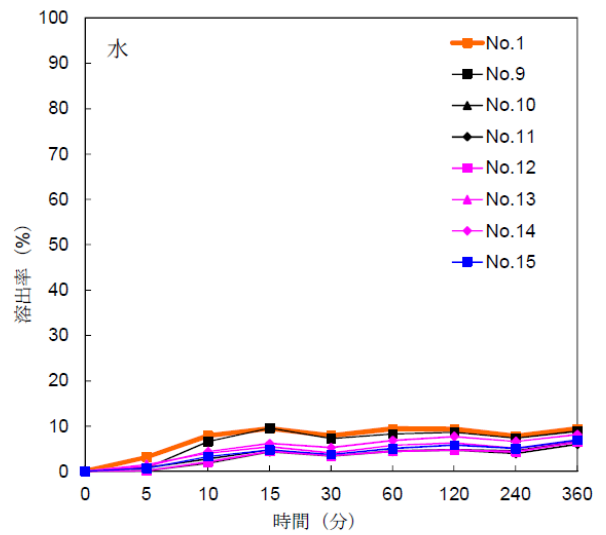


図 38 エバスタチン錠 (No.1, No.9~No.15) の水における溶出挙動

各試験液における溶出曲線を図 29~38 に示した。図 29~33 は製剤 No. 1~No. 8、図 34~38 は製剤 No. 1 および No. 9~No. 15 の溶出曲線である。

エバスタチン錠10mgの公的溶出規格は、溶出試験第1液を試験液として、毎分50回転で試験を行なうとき、30分で75%以上であり、全ての製剤が規格に適合した(図29, 図34)。

いずれの試験液においても、全ての製剤が先発品の溶出挙動と類似の範囲内にあった。

【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】³⁾

平成 25 年度（溶出試験） 適

【分析法（溶出試験）①】⁴⁾

※錠が適用対象。OD錠は適用対象外。

エバステン錠
Ebastine Tablets

溶出性 〈6.10〉 試験液に溶出試験第1液900mLを用い、パドル法により、毎分50回転で試験を行うとき、本品の30分間の溶出率は75%以上である。

本品1個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液20mL以上をとり、孔径0.45 μ m以下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液10mLを除き、次のろ液1mLを正確に量り、1mL中にエバステン ($C_{32}H_{39}NO_2$) 約5.6 μ gを含む液となるように試験液を加えて正確に V' mLとし、試料溶液とする。別に定量用エバステンを酸化リン (V) を乾燥剤として60°Cで2時間減圧乾燥し、その約28mgを精密に量り、メタノールに溶かし、正確に50mLとする。この液1mLを正確に量り、試験液を加えて正確に100mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、試験液を対照とし、紫外可視吸光度測定法 〈2.24〉 により試験を行い、波長258nmにおける吸光度 A_1 及び A_3 を測定する。

エバステン ($C_{32}H_{39}NO_2$) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= M_3 \times A_1 / A_3 \times V' / V \times 1 / C \times 18$$

M_3 : 定量用エバステンの秤取量 (mg)

C : 1錠中のエバステン ($C_{32}H_{39}NO_2$) の表示量 (mg)

【分析法（溶出試験）②】⁴⁾

※OD錠が適用対象。錠は適用対象外。

エバスチン口腔内崩壊錠
Ebastine Orally Disintegrating Tablets

溶出性〈6.10〉 試験液に溶出試験第1液 900 mL を用い、パドル法により、毎分 50 回転で試験を行うとき、本品の 15 分間の溶出率は 80%以上である。

本品 1 個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液 20 mL 以上をとり、孔径 0.45 μm 以下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液 10 mL を除き、次のろ液 V mL を正確に量り、1 mL 中にエバスチン ($\text{C}_{32}\text{H}_{39}\text{NO}_2$) 約 5.6 μg を含む液となるように試験液を加えて正確に V' mL とし、試料溶液とする。別に定量用エバスチンを酸化リン(V)を乾燥剤として 60°C で 2 時間減圧乾燥し、その約 28 mg を精密に量り、メタノールに溶かし、正確に 50 mL とする。この液 1 mL を正確に量り、試験液を加えて正確に 100 mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、試験液を対照とし、紫外可視吸光度測定法〈2.24〉により試験を行い、波長 258nm における吸光度 A_1 及び A_3 を測定する。

エバスチン ($\text{C}_{32}\text{H}_{39}\text{NO}_2$) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= M_3 \times A_1 / A_3 \times V' / V \times 1 / C \times 18$$

M_3 : 定量用エバスチンの秤取量 (mg)

C : 1 錠中のエバスチン ($\text{C}_{32}\text{H}_{39}\text{NO}_2$) の表示量 (mg)

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) エバステル錠 5mg／錠 10mg／OD 錠 5mg／OD 錠 10mg（製造販売元：大日本住友製薬株式会社）医薬品インタビューフォーム（2018年1月改訂、第21版）
- 2) 第15回ジェネリック医薬品品質情報検討会 資料 15-1
- 3) 平成25年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成27年3月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
- 4) 第十七改正日本薬局方（平成28年3月7日厚生労働省告示第64号）