

◎エバステル OD 錠, ○エバスチン OD 錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】エバスチン Ebastine 【分類】持続性選択 H1 受容体拮抗剤

【単位】◎5mg・▼10mg/OD 錠

【常用量】5～10mg/日

【用法】分1

【透析患者への投与方法】未変化体および活性代謝物の尿中排泄率が低いいため、減量の必要はないと思われる (5)

【その他の報告】HD, PD とも不明 (3)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【その他の報告】GFR<50mL/min : 50%に減量 (3)

【特徴】生体内で活性体カレバスチンとなり、強力で選択的なヒスタミン H1 受容体拮抗作用を有し、ヒスタミン遊離抑制作用も併せ持つ。作用が持続的であり、1日1回投与での有用性が認められている。中枢神経系におけるヒスタミン H1 受容体拮抗作用や抗コリン作用は弱く、眠気・倦怠感・口渇などの副作用が比較的少ない

【主な副作用・毒性】頻脈、倦怠感、頭痛、頭部しびれ感、めまい、胃部不快感、鼻・口腔内乾燥、舌炎、下痢、肝機能障害、好酸球増多、胸部圧迫感など

【吸収】食物の同時摂取は吸収に影響しない (Arzneimittelforschung 44: 59-64,1994)

【F】初回通過効果によりほとんどが代謝されて活性体となる (1) F のデータなし (1)

【tmax】カレバスチンとして 4～6hr (1,Arzneimittelforschung 44: 59-64,1994)

【代謝】初回通過効果により活性代謝物カレバスチンに代謝され血中にエバスチンはほとんど検出されない (Arzneimittelforschung 44: 59-64,1994) 未変化体から活性代謝物カレバスチンへの代謝は、小腸で主として CYP2J2 が、肝臓で CYP3A4 以外に CYP2J2 等が関与 (1) 未変化体の酸化的 N-脱アルキル化には、小腸・肝臓ともに CYP3A4 が関与 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 0.1% (1) カレバスチンとして 1.7% (1) 未変化体の尿中排泄率は無視できる程度、カレバスチンの尿中排泄率は 1.3～1.8% (Arzneimittelforschung 44: 59-64,1994)

【t1/2】活性代謝物カレバスチン 13.8～15.3hr (Arzneimittelforschung 44: 59-64,1994)

【蛋白結合率】99.9%以上、カレバスチン 97.4～97.7% (1)

【Vd/F】単回投与成績より約 100L/man (5)

【MW】469.66

【透析性】データなし (1) 蛋白結合率が高いため、透析で除去されにくいと思われる (5)

【TDM のポイント】投与 4 日目で定常状態に達し、その時の Cmax (360～396ng/mL) は初回投与時の Cmax (229ng/mL) の 1.6～1.7 倍になる (Arzneimittelforschung 44: 59-64,1994) TDM の対象にならない 【O/W 係数】8400「クロロホルム系, pH5.0」(1) カレバスチンの LogP=1.77 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】8.78 (1)

【相互作用】エリスロマイシンとの併用により代謝物カレバスチンの血漿中濃度が約 2 倍に上昇するという報告あり。イトラコナゾール併用により CL/F が 10%に低下し、活性代謝物の AUC が 3 倍に増加。リファンピシン併用により活性代謝物の AUC が 15%に低下し、bioavailability が著しく低下 (Shon JH, et al: J Clin Pharmacol 50:195-204, 2010)

【効果持続時間】経口投与で 24 時間ヒスタミンを低下させる (Br J Clin Pharmacol 26: 497-502,1988)

【更新日】20240530

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。