

貯 法：気密容器で室温保存
使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること。

	0.5mg	1 mg
承認番号	22400AMX00142000	22400AMX00143000
薬価収載	2012年12月	2012年12月
販売開始	2012年12月	2012年12月

アレルギー性疾患治療剤

アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」

アゼラスチン塩酸塩錠 1 mg「日医工」

Azelastine Hydrochloride

アゼラスチン塩酸塩錠

【組成・性状】

品名	アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」	アゼラスチン塩酸塩錠 1 mg「日医工」
有効成分	アゼラスチン塩酸塩	
含量	1錠中 0.5mg	1錠中 1 mg
剤形・色調	白色のフィルムコーティング錠	
外形		
識別コード	HH2	HH1
添加物	乳糖、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、タルク、酸化チタン	乳糖、セルロース、カルメロースカルシウム、ヒプロメロース、タルク、ステアリン酸マグネシウム、アンモニオアルキルメタクリレートコポリマー、マクロゴール、酸化チタン、カルナウバロウ

【効能・効果】

気管支喘息
アレルギー性鼻炎
蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、アトピー性皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹

【用法・用量】

1. 気管支喘息
通常、アゼラスチン塩酸塩として1回2 mgを、朝食後及び就寝前の1日2回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
2. アレルギー性鼻炎及び蕁麻疹、湿疹・皮膚炎、アトピー性皮膚炎、皮膚癢痒症、痒疹
通常、アゼラスチン塩酸塩として1回1 mgを、朝食後及び就寝前の1日2回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意
 - (1)眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には、自動車の運転等の危険を伴う機械の操作には従事させないように十分注意すること。
 - (2)長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイド減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。
 - (3)気管支喘息に用いる場合、本剤はすでに起こっている発作を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことを患者に十分説明しておく必要がある。
 - (4)本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。
2. 副作用
本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

	頻度不明
精神神経系	眠気、倦怠感、めまい、頭痛、手足のしびれ
消化器	口渇、悪心・嘔吐、口内及び口周囲のあれ、食欲不振、胸やけ、胃部不快感、腹痛、便秘、下痢
循環器	顔面のほてり、動悸
呼吸器	鼻乾燥、息苦しさ
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇等

	頻度不明
過敏症 ^{*)}	発疹
血液	白血球増多
泌尿器	頻尿、排尿困難、血尿
その他	苦味感、味覚異常、浮腫、月経異常

注)このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

3. 高齢者への投与
一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。
4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与
 - (1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人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はのみ投与すること。〔動物実験(ラット)で大量投与(臨床用量の370倍以上)による催奇形作用が報告されている。〕
 - (2)授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。〕
5. 小児等への投与
低出生体重児、新生児、乳児又は幼児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。
6. 適用上の注意
薬剤交付時：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、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。)
7. その他の注意
薬剤自身の味である苦味のため苦味感、味覚異常があらわれることがある。

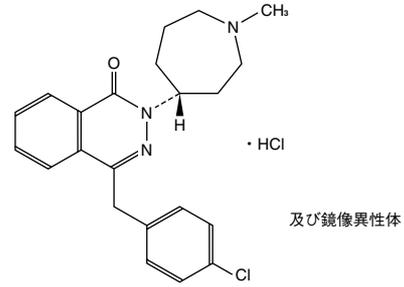
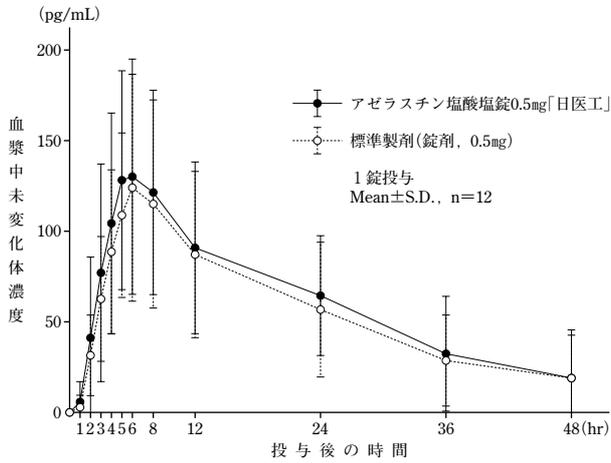
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験
アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(アゼラスチン塩酸塩として0.5mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC, C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾
また、アゼラスチン塩酸塩錠1 mg「日医工」及び標準製剤をそれぞれ2錠(アゼラスチン塩酸塩として2 mg)投与した場合においても、同様に両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

<アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (pg·hr/mL)	C _{max} (pg/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」	2918±1702	140.52±65.15	5.7±1.2	17.62±6.38
標準製剤(錠剤, 0.5mg)	2660±1586	129.10±60.70	5.8±0.8	16.75±3.75

(1錠投与, Mean±S.D., n=12)
(t_{1/2}のみ n=11)

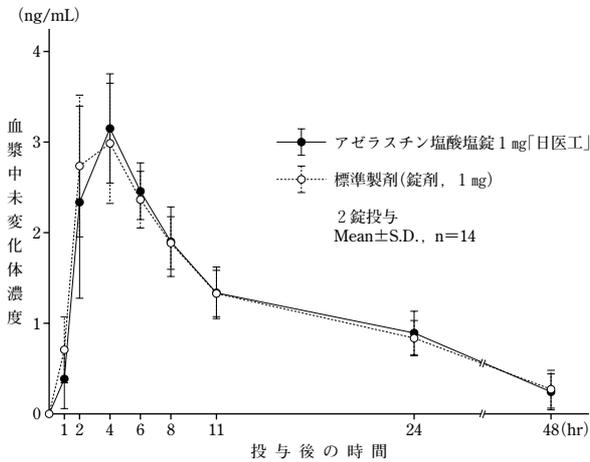


分子式：C₂₂H₂₁ClN₃O · HCl
 分子量：418.36
 性状：白色の結晶性の粉末である。
 ギ酸に溶けやすく、水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。
 本品の水溶液(1→200)は旋光性を示さない。
 融点：約225℃(分解)

<アゼラスチン塩酸塩錠1mg「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠1mg「日医工」	49.99±10.28	3.25±0.63	3.43±0.94	15.52±6.04
標準製剤(錠剤, 1mg)	49.60±7.47	3.26±0.50	2.86±1.03	16.96±9.24

(2錠投与, Mean±S.D., n=14)



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。

2. 溶出挙動

アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」及びアゼラスチン塩酸塩錠1mg「日医工」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアゼラスチン塩酸塩錠(0.5mg錠, 1mg錠)の溶出規格に適合していることが確認されている。²⁾

【薬効薬理】

抗ロイコトリエン作用

ロイコトリエン遊離抑制及び直接拮抗作用を示す(モルモット)。³⁾

抗ヒスタミン作用

ヒスタミン直接拮抗作用を示す(モルモット摘出腸管)。³⁾

抗アレルギー作用

同種受身皮膚アナフィラキシー(PCA)反応において抑制作用を示す(ラット)。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アゼラスチン塩酸塩 (Azelastine Hydrochloride)
 化学名：4-[(4-Chlorophenyl)methyl]-2-[(4R)-1-methylazepan-4-yl]phthalazin-1(2H)-one monohydrochloride

【取扱い上の注意】

安定性試験

本品につき加速試験(40℃, 相対湿度75%, 6ヵ月)を行った結果、アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」及びアゼラスチン塩酸塩錠1mg「日医工」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。⁴⁾

【包装】

アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「日医工」
 100錠(10錠×10; PTP)
 アゼラスチン塩酸塩錠1mg「日医工」
 100錠(10錠×10; PTP)
 1000錠(10錠×100; PTP)

【主要文献】

- 1) 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 日医工株式会社 社内資料：薬効薬理試験
- 4) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。
 日医工株式会社 お客様サポートセンター
 〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21
 ☎(0120)517-215
 Fax (076)442-8948