

貯 法：室温保存
有効期間：2.5年

承認番号 21800AMX10421000

販売開始 1984年6月

脂質代謝異常改善剤
エラスターゼ製剤




エラスチム[®]錠1800
Elaszym[®] tablets

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	エラスチム錠1800
有効成分	1錠中 エラスターゼESを1,800エラスターゼ単位 (EL.U.)
添加剤	カルナウバロウ、カルメロースカルシウム、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸カルシウム、タルク、デキストラン、トコフェロール、トリアセチン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ポリソルベート80、メタクリル酸コポリマーLD、ラウリル硫酸ナトリウム

3.2 製剤の性状

販売名	エラスチム錠1800	
剤形	腸溶錠	
識別コード	E エラスチム	
外形	表	
	裏	
	側面	
直径 (mm)	6.8	
質量 (mg)	127	
厚さ (mm)	3.9	
色	白色	

4. 効能又は効果

高脂血症

6. 用法及び用量

通常、成人には1日量3錠を3回に分けて食前に経口投与する。

効果不十分の場合は、6錠まで増量できる。

ただし、年齢、症状により適宜増減する。

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。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症	発疹、痒痒感	
消化器	悪心、食欲不振、胃障害、下痢	胃部不快感、腹部膨満感、便秘

発現頻度は製造販売後調査を含む。

14. 適用上の注意

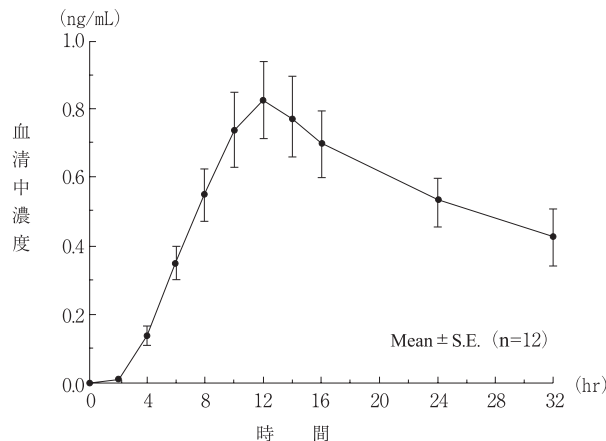
14.1 薬剤交付時の注意

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に刺入し、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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人男子12名に本剤6錠^(注)を空腹時単回投与し、酵素免疫測定法により血清中濃度を測定した。平均血清中濃度は投与12時間後に最高値 (0.88ng/mL) に達し、血清中からの消失半減期は19.4時間であった¹⁾。



本剤6錠^(注)単回経口投与時の血清中濃度

本剤6錠^(注)単回経口投与時の薬物動態パラメータ

C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
0.88±0.41	10～14	19±6

(Mean±S.D., n=12)

注) 本剤の承認された用法及び用量は「通常、成人には1日量3錠を3回に分けて食前に経口投与する。効果不十分の場合は、6錠まで増量できる。ただし、年齢、症状により適宜増減する。」である。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床成績 (血清脂質異常の改善)

動脈硬化症、高血圧症、糖尿病及び高脂血症に伴う血清脂質異常に対する改善効果を3種の二重盲検試験及び一般臨床試験により検討した結果、本剤の有用性が認められた^{2), 3)}。

17.1.2 国内臨床成績 (血清リポ蛋白質代謝異常の正常化)

高脂血症患者並びに低HDL血症患者114名を対象として、本剤1日5,400EL.U.を12週間投与した結果、HDL-C、アポA蛋白、磷脂質は有意な増加あるいは増加傾向を示し、β-リポ蛋白、過酸化脂質、遊離脂肪酸、VLDL-LDL-C、及びVLDL-LDL-C/HDL-C比は有意な減少あるいは減少傾向を示した⁴⁾。

17.1.3 国内臨床成績 (糖尿病を伴う血清脂質異常の改善)

レントゲン上、下肢動脈石灰化が確認されている症例もしくは高血圧症、糖尿病など基礎疾患を有する高脂血症患者666例に本剤を約1年間投与した結果、血清脂質異常は投与3ヵ月後より有意に改善し、自覚症状にも高い改善を示した⁵⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

本薬はコレステロールの肝における異化排泄の促進、リポ蛋白リパーゼ (LPL) の亢進など、脂質成分の移行を生理的に調節することにより、血清脂質異常を改善する。また、本剤は、粥状動脈硬化病変において、動脈壁への脂肪の沈着抑制、並びにコラーゲンの異常増生を抑制する。

18.2 脂質代謝改善作用

本薬は、広範な脂質代謝改善作用を有し、コレステロール負荷ウサギ及びラットにおいて、肝におけるコレステロールの

異化と排泄を促進する。さらに、リポ蛋白リパーゼ (LPL) 及びレシチン-コレステロール アシルトランスフェラーゼ (LCAT) 活性を高め、リポ蛋白代謝、すなわち超低比重リポ蛋白 (VLDL)、低比重リポ蛋白 (LDL)、高比重リポ蛋白 (HDL) の代謝を改善する^{6)~10)}。

18.3 動脈硬化抑制作用

本薬はコレステロール負荷ウサギにおいて高脂血症状態を改善し、動脈壁へのコレステロールの沈着を抑制するとともに除去を促進し、動脈壁弾性線維エラスチンの変性を抑制してエラスチン生成を正常化する。また、動脈壁内膜における細胞増殖と泡沫細胞の出現を阻止することが認められており、さらに動脈壁物性に対する検討では、動脈の弾力性、伸展性に好影響を与える^{11)~14)}。

19. 有効成分に関する理化学的知見

エラスターゼESは、ブタのすい臓から製したもので、エラスチンを分解し、カゼイン、フィブリン及び変性コラーゲンなども分解する。通例、デキストランを加えたものである。

一般名：エラスターゼES (Elastase ES)

性状：エラスターゼESは灰色～淡褐色の粉末で、特異なにおいがある。

20. 取扱い上の注意

20.1 PTP包装はアルミ袋開封後、湿気を避けて保存すること。湿気により含量が低下することがある。

22. 包装

〈エラスチーム錠1800〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10] (乾燥剤入り)

1,000錠 [10錠 (PTP) × 100] (乾燥剤入り)

23. 主要文献

- 1) Kohno T. et al. : Clin. Chem. Enzym. Commun., 1991 ; 4 : 123-133 ELA-0605
- 2) 岸本道太ら：臨牀と研究, 1973 ; 50 (2) : 500-510 ELA-0037
- 3) 内藤周幸ら：医学のあゆみ, 1972 ; 82 (13) : 848-859 ELA-0038
- 4) 吉田良一ら：動脈硬化, 1982 ; 10 (5) : 905-911 ELA-0192
- 5) 後藤由夫ら：臨牀と研究, 1985 ; 62 (9) : 2954-2966 ELA-0419
- 6) 亀谷富夫：動脈硬化, 1978 ; 6 (1) : 101-113 ELA-0062
- 7) 高橋 因ら：動脈硬化, 1983 ; 11 (2) : 351-356 ELA-0200
- 8) 小出 醇ら：動脈硬化, 1985 ; 12 (6) : 1529-1533 ELA-0384
- 9) 中村治雄：医学と生物学, 1976 ; 92 (6) : 527-529 ELA-0005
- 10) 勝沼英宇ら：動脈硬化, 1981 ; 9 (5) : 861-873 ELA-0179
- 11) 村野俊一ら：動脈硬化, 1986 ; 14 (3) : 565-571 ELA-0474
- 12) 長谷川元治ら：動脈硬化, 1984 ; 12 (1) : 207-218 ELA-0283
- 13) 小山忠喜ら：動脈硬化, 1984 ; 12 (4) : 1021-1031 ELA-0356
- 14) Hayashi K. et al. : Atherosclerosis, 1987 ; 66 : 259-267 ELA-0512

24. 文献請求先及び問い合わせ先

エーザイ株式会社 hhcホットライン
〒112-8088 東京都文京区小石川4-6-10
フリーダイヤル 0120-419-497

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

エーザイ株式会社

東京都文京区小石川4-6-10