

アレルギー性疾患治療剤

※※**アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「トーフ」**
 ※※**アゼラスチン塩酸塩錠1mg「トーフ」**

《アゼラスチン塩酸塩錠》

AZELASTINE HYDROCHLORIDE TABLETS 0.5mg “TOWA” / TABLETS 1mg “TOWA”

貯 法：室温保存
 使用期限：外箱、ラベルに記載

日本標準商品分類番号 87449				
	承認番号	薬価収載	販売開始	再評価(品質)
錠0.5mg	22900AMX00609	2017年12月	2010年5月	—
錠1mg	22900AMX00610	2017年12月	1994年7月	2003年6月

※※【組成・性状】

		アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「トーフ」	アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「トーフ」
1錠中の有効成分		日局 アゼラスチン塩酸塩 ……0.5mg	日局 アゼラスチン塩酸塩 ……1mg
添加物		乳糖水和物、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Ca、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、タルク、酸化チタン	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸Mg、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、白糖、アラビアゴム末、ポリオキシエチレン(105)ポリオキシプロピレン(5)グリコール、沈降炭酸Ca、タルク、酸化チタン、マクロゴール6000、カルナウバロウ
性状		白色のフィルムコーティング錠	白色の糖衣錠
識別コード	本体	Tw300	Tw RP
	包装		Tw. RP
外形	表		
	裏		
	側面		
錠径(mm)		6.2	6.5
厚さ(mm)		3.0	3.6
質量(mg)		90	120

※※【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、皮膚そう痒症、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2mg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、皮膚そう痒症、痒疹
 通常、アゼラスチン塩酸塩として1回1mg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、けん怠感、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
過敏症 ^{注)}	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) 授乳中の女性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

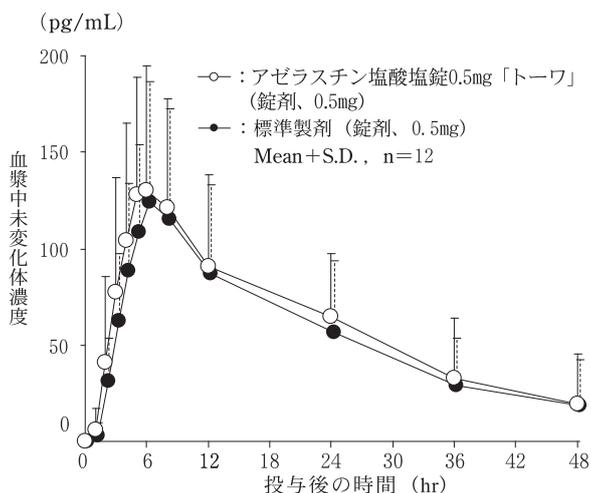
薬剤自身の味である苦味のため苦味感、味覚異常があらわれることがある。

※※【薬物動態】

※※ 1. 生物学的同等性試験

1) アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「トーワ」

アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「トーワ」と標準製剤を、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(n=12)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、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₄₈ (pg·hr/mL)	Cmax (pg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} * (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「トーワ」 (錠剤、0.5mg)	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

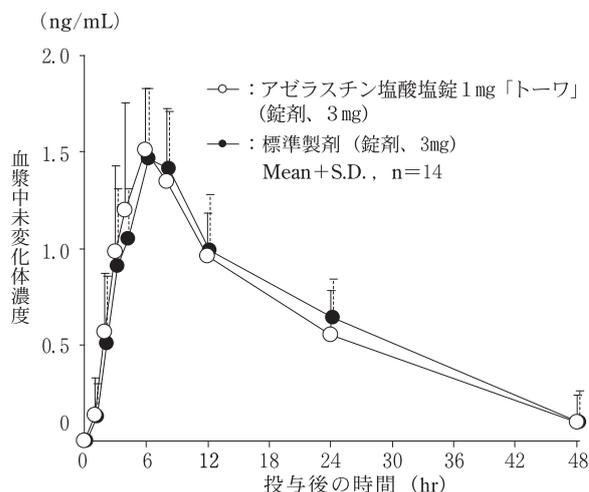
(Mean±S.D., n=12)
*: n=11

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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) アゼラスチン塩酸塩錠1mg「トーワ」

アゼラスチン塩酸塩錠1mg「トーワ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ3錠(アゼラスチン塩酸塩として3mg)健康成人男子(n=14)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、Cmax)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(昭和55年5月30日薬審第718号に基づく)²⁾。

(注) 3mg単回経口投与は承認外用量である。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₄₈ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「トーワ」 (錠剤、3mg)	29.25±9.09	1.55±0.38	5.57±1.16	15.04±4.18
標準製剤 (錠剤、3mg)	30.83±8.51	1.52±0.35	6.36±1.34	18.01±12.49

(Mean±S.D., n=14)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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

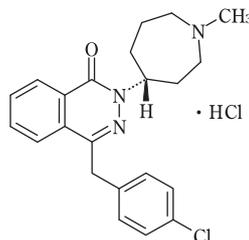
アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「トーワ」及びアゼラスチン塩酸塩錠1mg「トーワ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアゼラスチン塩酸塩錠の溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている³⁾⁴⁾。

【薬効薬理】

アレルギーに関与するケミカルメディエーター、即ちヒスタミンやロイコトリエン類の肥満細胞等からの遊離を抑制すると共に、抗ヒスタミン作用(H₁遮断作用)、抗ロイコトリエン作用をあらわす。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式:



及び鏡像異性体

一般名: アゼラスチン塩酸塩 (Azelastine Hydrochloride)

別名: 塩酸アゼラスチン

化学名: 4-[(4-Chlorophenyl)methyl]-2-[(4RS)-(1-methylazepan-4-yl)]phthalazin-1(2H)-one monohydrochloride

分子式: C₂₂H₂₄ClN₃O · 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。水溶液(1→200)は旋光性を示さない。

融点: 約225°C(分解)

※【取扱い上の注意】

※安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、通常の市場流通下においてそれぞれ3年間安定であることが推測された⁵⁾⁶⁾。

※※【包装】

- ※※アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「トーワ」：100錠（PTP）
※※アゼラスチン塩酸塩錠1mg「トーワ」：100錠、1000錠（PTP）
1000錠（バラ）

※【主要文献】

- ※1) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験（錠0.5mg）
2) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験（錠1mg）
※3) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験（錠0.5mg）
4) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験（錠1mg）
※5) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験（錠0.5mg）
6) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験（錠1mg）

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献（社内資料を含む）は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター（24時間受付対応）

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



製造販売元
東和薬品株式会社
大阪府門真市新橋町2番11号