

※※印：2012年 4月改訂(第10版、社名変更等に伴う改訂)

※印：2011年11月改訂

日本標準商品分類番号

87449

貯 法：室温・気密容器保存  
 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。  
 取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照







	※0.5mg	※1mg
承認番号	22300AMX00256000	22200AMX00880000
薬価収載	2011年11月	2011年11月
販売開始	2011年11月	1994年 7月
再評価結果 (品質再評価)	—	2003年 6月

アレルギー性疾患治療剤

※ **アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」**  
 ※ **アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」**

AZELASTINE HCl  
 アゼラスチン塩酸塩錠

【組成・性状】

	※アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」	アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」	
組 成	1錠中： アゼラスチン塩酸塩 ……………0.5mg 〈添加物〉 アラビアゴム末、カル ナウバロウ、含水 二酸化ケイ素、結晶 セルロース、ステア リン酸マグネシウム、 精製白糖、ゼラチン、 タルク、低置換度ヒ ドロキシプロピルセ ルロース、トウモロ コシデンブ、乳糖 水和物、ポビドン、 マクロゴール6000、 酸化チタン	1錠中： アゼラスチン塩酸塩 …………… 1mg 〈添加物〉 アミノアルキルメタ クリレートコポリマ ーE、グリセリン脂肪 酸エステル、酸化チ タン、ステアリン酸 マグネシウム、精製 セラック、トウモロ コシデンブ、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 ビドン、マクロゴール 6000	
性 状	白色の糖衣錠	白色のフィルムコー ティング錠	
識別コード (PTP)	ⓐAZE0.5 0.5mg	ⓐAZE 1mg	
外形 サイズ	表 (直径mm)	 6.7	 6.6
	裏 (重量mg)	 120	 110
	断面 (厚さmm)	 3.5	 3.2

【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、皮膚掻痒症、痒疹

【用法・用量】

- 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。
- 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、皮膚掻痒症、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】

- 重要な基本的注意
  - 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。
  - 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。
  - 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。
  - 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。
- 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)、ALT (GPT)、Al-Pの上昇等
過敏症 <sup>注)</sup>	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。

- 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。
- 妊婦、産婦、授乳婦等への投与
  - 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]
  - 授乳中の婦人に投与をすることを避け、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]
- 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)。
- 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、更には穿孔をお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)
- 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。

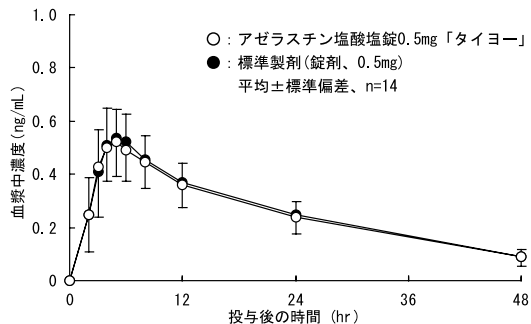


## 【薬物動態】

### 1 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

#### ※●アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「タイヨー」

アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「タイヨー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠(アゼラスチン塩酸塩として1mg)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、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。



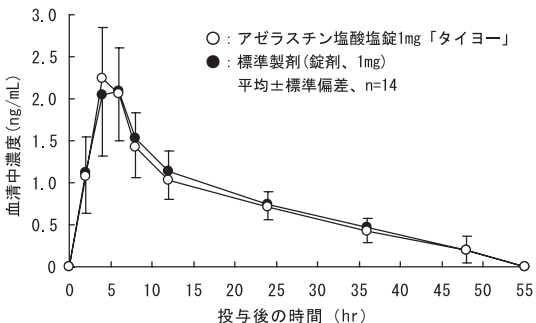
薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-48</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「タイヨー」	1	12.17±3.04	0.55±0.13	4.5±1.0	17.30±2.63
標準製剤(錠剤, 0.5mg)	1	12.47±2.37	0.57±0.13	4.9±0.9	17.25±2.30

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。

#### ●アゼラスチン塩酸塩錠1mg「タイヨー」

アゼラスチン塩酸塩錠1mg「タイヨー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ4錠(アゼラスチン塩酸塩として4mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清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。(1回投与量:承認外用量)



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-55</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠1mg「タイヨー」	4	38.6±6.4	2.6±0.5	4.6±0.9	18.1±4.1
標準製剤(錠剤, 1mg)	4	40.6±6.1	2.5±0.5	4.7±1.0	18.2±4.3

血清中濃度並びに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 溶出性<sup>2)</sup>

本剤の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

## 【薬効薬理】<sup>3)</sup>

アゼラスチン塩酸塩は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などからの遊離を抑制すると共に、抗ヒスタミン作用(H<sub>1</sub>遮断作用)、抗ロイコトリエン作用を現す。これらが総合して喘息やアレルギー性疾患に奏功すると考えられている。なお、ロイコトリエンの産生・遊離抑制の機序として、リボキシゲナーゼ阻害作用、細胞内へのカルシウム流入抑制作用、細胞内サイクリックAMP上昇作用、細胞膜安定化作用などが示唆されている。

## 【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-[(4RS)-(1-methylazepan-4-yl)]phthalazin-1(2H)-one monohydrochloride

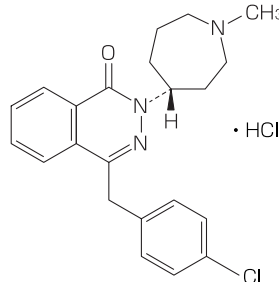
分子式: C<sub>22</sub>H<sub>24</sub>ClN<sub>3</sub>O·HCl

分子量: 418.36

融点: 約225℃(分解)

性状: アゼラスチン塩酸塩は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。

構造式:



及び鏡像異性体

## ※【取扱い上の注意】<sup>4)</sup>

安定性試験結果の概要

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「タイヨー」及びアゼラスチン塩酸塩錠1mg「タイヨー」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。

## 【包装】

※●アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「タイヨー」

PTP包装: 100錠(10錠×10)

●アゼラスチン塩酸塩錠1mg「タイヨー」

PTP包装: 100錠(10錠×10)、1,200錠(10錠×120)

## 【主要文献】

- 1) テバ製薬㈱社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) テバ製薬㈱社内資料(溶出試験)
- ※3) 第十六改正日本薬局方解説書
- 4) テバ製薬㈱社内資料(安定性試験)

## ※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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。

テバ製薬株式会社 DIセンター

〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

TEL 0120-923-093 FAX 052-459-2853

受付時間 9:00~17:00(土・日・祝日を除く)

※※製造販売元

テバ製薬株式会社

名古屋市中村区太閤一丁目24番11号