

** 2013年6月改訂(第8版)

* 2011年5月改訂

日本標準商品分類番号

87449

アレルギー性疾患治療剤

** アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「TCK」

** アゼラスチン塩酸塩錠1mg「TCK」

《アゼラスチン塩酸塩錠》

AZELASTINE HYDROCHLORIDE

貯法：気密容器、室温保存

使用期限：外装に表示

	錠 0.5mg	錠 1mg
** 承認番号	22500AMX00951000	22500AMX00952000
** 薬価収載	2013年12月	2013年12月
販売開始	2011年6月	1994年10月







** 【 組成・性状 】

アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「TCK」 は1錠中にアゼラスチン塩酸塩を 0.5mg 含有する。

添加物として、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、セルロース、ポビドン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、二酸化ケイ素、ステアリン酸 Mg、白糖、タルク、アラビアゴム末、ゼラチン、マクロゴール、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「TCK」 は1錠中にアゼラスチン塩酸塩を 1mg 含有する。

添加物として、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、セルロース、デキストリン、ポビドン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、二酸化ケイ素、ステアリン酸 Mg、白糖、タルク、アラビアゴム末、ゼラチン、マクロゴール、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

販売名	外 形			色 調 剤 形	識別コード
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量 (mg)		
アゼラスチン 塩酸塩錠0.5mg 「TCK」	 6.7	 3.5	 120	白 色 糖衣錠	Tu 405
アゼラスチン 塩酸塩錠 1mg 「TCK」	 6.7	 3.5	 120	白 色 糖衣錠	Tu AD

【 効能又は効果 】

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

【 用法及び用量 】

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、皮膚癢痒症、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、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) の上昇、ALT (GPT) の上昇、Al-P の上昇等
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。]

(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。)

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。

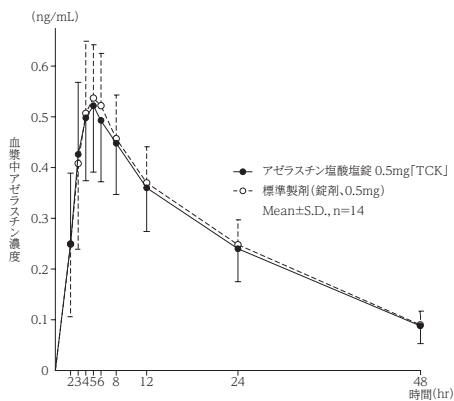
** 【 薬物動態 】

生物学的同等性試験

アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「TCK」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 1mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中アゼラスチン濃度を測定し、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)～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 _{0→48hr} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
アゼラスチン 塩酸塩錠0.5mg 「TCK」	12.17±3.04	0.55±0.13	4.5±1.0	17.30±2.63
標準製剤 (錠剤、0.5mg)	12.47±2.37	0.57±0.13	4.9±0.9	17.25±2.30

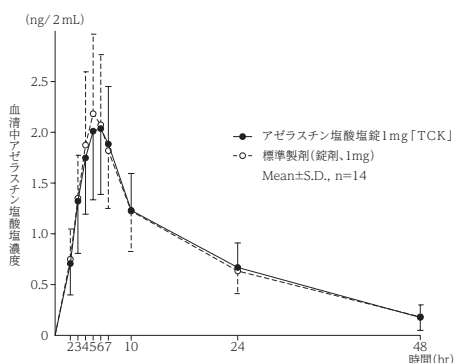
(Mean±S.D.,n=14)



アゼラスチン塩酸塩錠 1mg [TCK] 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錠 2mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中アゼラスチン塩酸塩濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 95% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、±20% 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 _{0→48hr} (ng·hr/2mL)	Cmax (ng/2mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg [TCK]	37.26 ± 11.57	2.12 ± 0.63	5.64 ± 0.63	14.51 ± 3.20
標準製剤 (錠剤, 1mg)	36.89 ± 12.30	2.24 ± 0.75	5.36 ± 0.84	14.87 ± 2.61

(Mean ± S.D., n=14)



血漿中及び血清中濃度並びに 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。

溶出挙動

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

【 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)

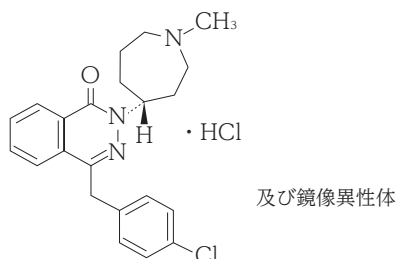
化学名：4- [(4-Chlorophenyl) methyl] -2- [(4RS) - (1-methylazepan-4-yl)] phthalazin-1 (2H) -onemono hydrochloride

分子式：C₂₂H₂₄ClN₃O · HCl

分子量：418.36

融点：約 225℃ (分解)

構造式：



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。

**【 取扱い上の注意 】

安定性試験

加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月) の結果、アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg [TCK] 及びアゼラスチン塩酸塩錠 1mg [TCK] 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。³⁾

**【 包装 】

アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg [TCK] : 100 錠 (PTP)

アゼラスチン塩酸塩錠 1mg [TCK] : 100 錠 (PTP)

1,200 錠 (PTP)

【 主要文献 】

1) 辰巳化学株式会社：生物学的同等性試験

2) 辰巳化学株式会社：溶出試験

3) 辰巳化学株式会社：安定性試験

【 文献請求先 】

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。

辰巳化学株式会社 薬事・学術課

〒921-8164 金沢市久安 3 丁目 406 番地

TEL 076-247-2132

FAX 076-247-5740



製造販売元

辰巳化学株式会社

金沢市久安 3 丁目 406 番地