

※※ **アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「ツルハラ」**

※※ **アゼラスチン塩酸塩錠1mg「ツルハラ」**

貯法	室温保存(気密容器)
使用期限	外箱、容器に表示

Azelastine Hydrochloride Tablets 0.5mg/1mg
「TSURUHARA」

	※※錠0.5mg	※※錠1mg
承認番号	22500AMX 01150000	22500AMX 01151000
薬価収載	2013年12月	2013年12月
販売開始	2012年2月	1997年7月

【組成・性状】

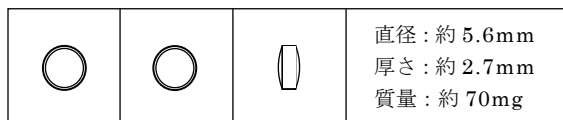
組 成

アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「ツルハラ」は1錠中アゼラスチン塩酸塩 0.5mg および添加物として乳糖水和物、トウモロコシデンプン、メチルセルロース、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

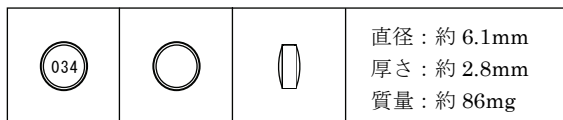
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「ツルハラ」は1錠中アゼラスチン塩酸塩 1mg および添加物として乳糖水和物、トウモロコシデンプン、メチルセルロース、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

製剤の性状

アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「ツルハラ」は白色フィルムコート錠である。



アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「ツルハラ」は白色フィルムコート錠で識別記号は 034 である。



【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、好発季節を考えて、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。

その他の副作用

	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*	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

*: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。)

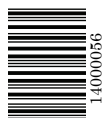
(7) その他の注意

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。

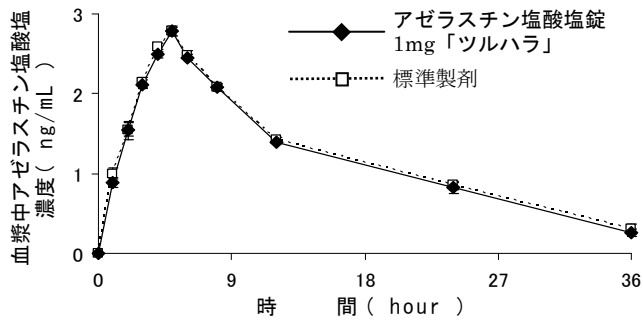
【薬物動態】

(1) 生物学的同等性試験

アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「ツルハラ」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 4mg*)を健康成人男子に絶食時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(0.8)~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⁾。(※: 1回4mgは承認外の用量)
 また、**アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「ツルハラ」**は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)」に基づき、**アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「ツルハラ」**を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた²⁾。



14000036



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₃₆ (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 「ツルハラ」	42.3±1.0	2.82±0.04	4.9±0.2	12.1±0.8
標準製剤 (錠剤、1mg)	43.4±0.9	2.85±0.05	5.0±0.1	12.4±0.8

(Mean ± S.E., n=12)

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

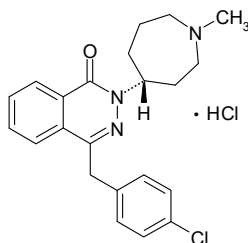
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「ツルハラ」³⁾ 及びアゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「ツルハラ」⁴⁾ は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

アゼラスチンは 5-リポキシゲナーゼを阻害してロイコトリエンの産生を減少させる。肥満細胞からのロイコトリエンやヒスタミン等のアレルギー反応に関与するケミカルメディエーターの遊離も抑制することが示されている。また、これらのケミカルメディエーターに対する直接的な拮抗作用も有することが認められている。

【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)
 化学名：4-[(4-Chlorophenyl)methyl]-2-[(4*RS*)-(1-methylazepan-4-yl)]phthalazin-1(2*H*)-one monohydrochloride
 分子式：C₂₂H₂₄ClN₃O・HCl
 分子量：418.36
 性状：アゼラスチン塩酸塩は白色の結晶性の粉末である。
 本品はギ酸に溶けやすく、水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。
 融点：約 225°C(分解)
 本品の水溶液 (1→200) は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験 (40°C、相対湿度 75%、6 ヶ月) の結果、アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「ツルハラ」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⁵⁾。最終包装製品を用いた長期保存試験 (室温、3 年) の結果、アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「ツルハラ」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが確認された⁶⁾。

【包装】

アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「ツルハラ」：(PTP) 100 錠
 アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「ツルハラ」：(PTP) 100 錠、1000 錠

【主要文献】

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 4) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 5) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 6) 鶴原製薬株式会社 社内資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。
 鶴原製薬株式会社 医薬情報部
 〒563-0036 大阪府池田市豊島北 1 丁目 1 6 番 1 号
 TEL : 072-761-1456 (代表) FAX : 072-760-5252



製造販売元
鶴原製薬株式会社
 大阪府池田市豊島北 1 丁目 16 番 1 号

(A40)
 (A51)-26 14-2102
 A102-S