

アレルギー性疾患治療剤

アゼラスチン塩酸塩錠

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

貯 法：室温保存

有効期間：3年



	錠0.5mg	錠1mg
承認番号	22900AMX00609	22900AMX00610
販売開始	2010年5月	1994年7月

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	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
添加剤	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、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、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、ステアリン酸マグネシウム、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、沈降炭酸カルシウム、タルク、酸化チタン、マクロゴール6000、カルナウバロウ

3.2 製剤の性状

販売名	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」
性状・剤形	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
	包装	Tw RP
外形	表	
	裏	
	側面	
直径(mm)	6.2	6.5
厚さ(mm)	3.0	3.6
質量(mg)	90	120

4. 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、皮膚そう痒症、痒疹

6. 用法及び用量

〈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。

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 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。

8.2 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。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.3 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。

〈気管支喘息〉

8.4 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

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。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

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	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、ALTの上昇等	Al-Pの上昇
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

注）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。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

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。

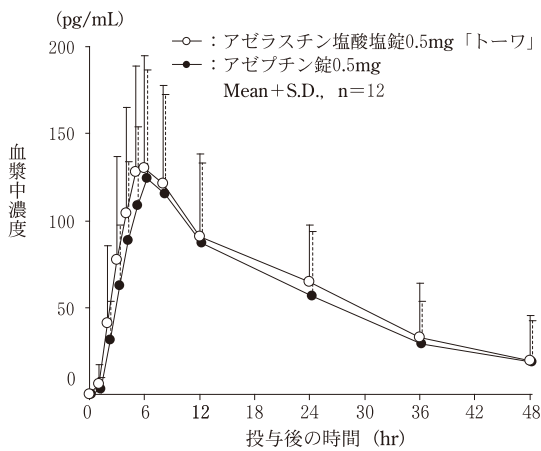
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

〈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」とアゼプチン錠0.5mg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 ₀₋₄₈ (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」	2918±1702	140.5±65.2	5.7±1.2	17.62±6.38
アゼプチン錠0.5mg	2660±1586	129.1±60.7	5.8±0.8	16.75±3.75

(Mean±S.D., n=12)

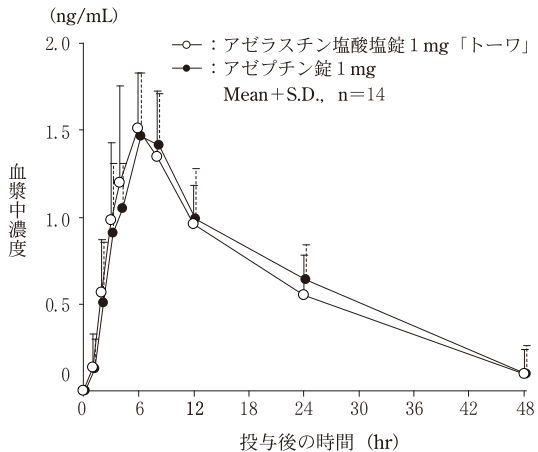
*: n=11

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。

〈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」とアゼプチン錠1mg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。²⁾

注) 3mg単回経口投与は承認外用量である。



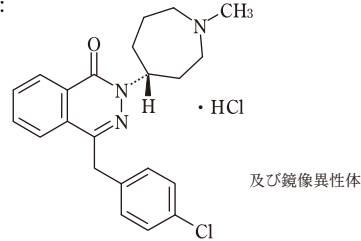
	製剤投与量 (アゼラスチン 塩酸塩として)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₄₈ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「トーワ」	3錠 (3mg)	29.25±9.09	1.55±0.38	5.57±1.16	15.04±4.18
アゼプチン錠1mg	3錠 (3mg)	30.83±8.51	1.52±0.35	6.36±1.34	18.01±12.49

(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。

19. 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



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：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)

22. 包装

〈アゼラスチン塩酸塩錠0.5mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

〈アゼラスチン塩酸塩錠1mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

1000錠 [バラ、乾燥剤入り]

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験（錠0.5mg）
- 社内資料：生物学的同等性試験（錠1mg）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号
☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 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