

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

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

剤形	0.5mg：糖衣錠 1mg：フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	○アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」 1錠中：アゼラスチン塩酸塩 …………… 0.5mg ○アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」 1錠中：アゼラスチン塩酸塩 …………… 1mg
一般名	和名：アゼラスチン塩酸塩（JAN） 洋名：Azelastine Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日 0.5mg：2011年 1月 14日 1mg：2010年 8月 3日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日 0.5mg：2011年 11月 28日 1mg：2011年 11月 28日（販売名変更による） 発売年月日 0.5mg：2011年 11月 28日 1mg：1994年 7月 8日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販 売：武田薬品工業株式会社 製造販売元：武田テバファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	武田テバファーマ株式会社 武田テバDIセンター TEL 0120-923-093 受付時間 9:00～17:30（土日祝日・弊社休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.med.takeda-teva.com

本IFは2020年6月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要

— 日本病院薬剤師会 —

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。

また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	18
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	18
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	18
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	18
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	18
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	18
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	18
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	18
5. 化学名（命名法）	2	8. 副作用	18
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	19
7. CAS登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	19
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	19
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	20
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	20
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	20
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	21
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	21
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	2. 毒性試験	21
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	22
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	1. 規制区分	22
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7	2. 有効期間又は使用期限	22
7. 溶出性	7	3. 貯法・保存条件	22
8. 生物学的試験法	10	4. 薬剤取扱い上の注意点	22
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	11	5. 承認条件等	22
10. 製剤中の有効成分の定量法	11	6. 包装	22
11. 力価	11	7. 容器の材質	22
12. 混入する可能性のある夾雑物	11	8. 同一成分・同効薬	22
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	11	9. 国際誕生年月日	22
14. その他	11	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
V. 治療に関する項目	12	11. 薬価基準収載年月日	23
1. 効能又は効果	12	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の 年月日及びその内容	23
2. 用法及び用量	12	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	23
3. 臨床成績	12	14. 再審査期間	23
VI. 薬効薬理に関する項目	13	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	13	16. 各種コード	23
2. 薬理作用	13	17. 保険給付上の注意	23
VII. 薬物動態に関する項目	14	XI. 文献	24
1. 血中濃度の推移・測定法	14	1. 引用文献	24
2. 薬物速度論的パラメータ	16	2. その他の参考文献	24
3. 吸収	16	XII. 参考資料	25
4. 分布	16	1. 主な外国での発売状況	25
5. 代謝	16	2. 海外における臨床支援情報	25
6. 排泄	17	XIII. 備考	26
7. トランスポーターに関する情報	17	その他の関連資料	26
8. 透析等による除去率	17		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

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(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 (H₁遮断作用)、抗ロイコトリエン作用を現すアレルギー性疾患治療剤である。

弊社は、後発医薬品としてアゼピット錠 1mg の開発を企画し、薬発第 698 号 (昭和 55 年 5 月 30 日) に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、1994 年 3 月に承認を取得、1994 年 7 月発売に至った。

その後、「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」(平成 12 年 9 月 19 日医薬発第 935 号) に基づき、販売名をアゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」と変更し、2010 年 8 月に承認を取得し、2011 年 11 月に薬価基準収載された。

また、規格追加製剤としてアゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」の開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2011 年 1 月に承認を取得し、2011 年 11 月発売に至った。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 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、痒疹に適応を有している。

(「V-1. 効能又は効果」の項参照)

2. 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のでいずれも頻度は不明であるが、副作用として、眠気、倦怠感、口渇、悪心・嘔吐、苦味感、味覚異常などがあらわれることがある。

(「VIII-8. 副作用」の項参照)

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

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」

(2) 洋名

AZELASTINE HCl

(3) 名称の由来

主成分「アゼラスチン塩酸塩」より命名

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

アゼラスチン塩酸塩（JAN）

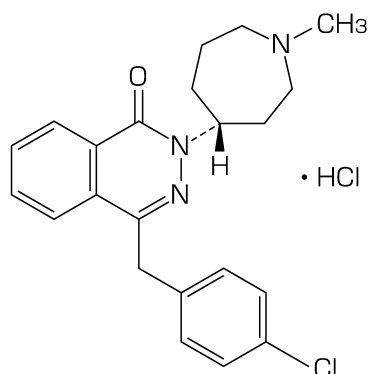
(2) 洋名（命名法）

Azelastine Hydrochloride（JAN）

(3) ステム

-astine：抗ヒスタミン薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₂H₂₄ClN₃O・HCl

分子量：418.36

5. 化学名（命名法）

4-[(4-Chlorophenyl)methyl]-2-[(4*RS*)-(1-methylazepan-4-yl)]phthalazin-1(2*H*)-one monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

79307-93-0

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。本品は無臭である¹⁾。

(2) 溶解性

ギ酸に溶けやすく、水又はエタノール（99.5）に溶けにくい。

各種 pH における溶解度²⁾

溶液	溶解度（37℃）
pH1.2	4.0 mg/mL
pH4.0	22.6 mg/mL
pH6.8	9.7 mg/mL
水	22.1 mg/mL

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 225℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数²⁾

pKa（25℃）：約 9.5（第三アミノ基、溶解度法）

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

水溶液（1→200）は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性²⁾

水	60℃、14 日は安定である。
液性(pH)	pH1.2～pH8.0 において、37℃、14 日は安定である。

3. 有効成分の確認試験法

日局「アゼラスチン塩酸塩」の確認試験法による

- 1) 紫外可視吸光度測定法（吸収スペクトル）
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）
- 3) 塩化物の定性反応(2)

4. 有効成分の定量法

日局「アゼラスチン塩酸塩」の定量法による

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	性状	外形		
		表	裏	側面
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」	白色の糖衣錠			
		直径：6.7mm、厚さ：3.5mm、重量：120mg		
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」	白色のフィルム コーティング錠			
		直径：6.6mm、厚さ：3.2mm、重量：110mg		

(2) 製剤の物性^{3) 4)}

(参考：＜無包装状態での安定性試験＞の試験開始時の硬度)

販売名	硬度 (kgf)
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」	3.1
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」	6.1

(3) 識別コード

販売名	PTP 識別コード	薬物本体識別コード
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」	t AZE0.5 0.5mg	AZE 0.5
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」	t AZE 1mg	AZE

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等 該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

- アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」
1錠中：アゼラスチン塩酸塩を 0.5mg 含有
- アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」
1錠中：アゼラスチン塩酸塩を 1mg 含有

(2) 添加物

- アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg「タイヨー」
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、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ポビドン、マクロゴール 6000、酸化チタン
- アゼラスチン塩酸塩錠 1mg「タイヨー」
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、トウモロコシデンプン、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

(3) その他

特になし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

○アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」

<加速試験> ⁵⁾

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。

試験条件

保存条件	包装形態
40±1℃・75±5%RH・遮光	PTP

試験結果

試験項目		規格	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状		白色の糖衣錠	白色の糖衣錠	同左	同左	同左
確認試験	沈殿反応	だいたい色の沈殿を生じる	適合	適合	適合	適合
	紫外可視吸収スペクトル	283～287nm に吸収の極大を示す	適合	適合	適合	適合
	薄層クロマトグラフィー	適合する*3	適合	—	—	適合
純度試験	総類縁物質*1,2 (%)	1.0 以下	0.04±0.01	0.10±0.03	0.15±0.03	0.14±0.01
	個々の類縁物質*2 (%)	0.2 以下	≤0.03	≤0.11	≤0.12	≤0.07
	アゼラスチン酸化体 (%)	0.5 以下	≤0.14	≤0.15	≤0.19	≤0.22
含量均一性		判定値は 15.0% を超えない	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%)		(45 分) 80 以上	87～105	82～104	90～103	91～103
定量*1 (%)		95.0～105.0	100.8±0.9	99.3±0.9	99.9±0.3	99.9±0.5

*1 平均値±S.D.

[3 ロット、n=3/ロット]

*2 アゼラスチン酸化体以外の類縁物質

*3 試料溶液から得た主スポット及び標準溶液から得たスポットの R_f 値は等しい

<無包装状態での安定性試験> ³⁾

全ての条件において、顕著な変化は認められなかった。

試験条件

保存条件		保存容器
温度	40±2℃	遮光・気密
湿度	25±1℃・75±5%RH	遮光・開放
光	60万 lx・hr	透明・気密

試験結果

保存条件	外観	硬度(kgf)	溶出率(%)	含量残存率*1(%)
開始時	白色の糖衣錠であった	3.1	96~107	100
40℃、3ヵ月	白色の糖衣錠であった	3.6	98~104	102.0
25℃・75%RH、3ヵ月	白色の糖衣錠であった	2.9	96~100	97.8
60万 lx・hr	白色の糖衣錠であった	3.3	99~104	100.0

*1 試験開始時を100とした

○アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」

<加速試験> ⁶⁾

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。

試験条件

保存条件	包装形態
40±1℃・75±5%RH・遮光	PTP (アルミパックした PTP)
	バラ (ガラス製容器)

試験結果 (上段: PTP、下段: バラ)

試験項目	規格	開始時	2ヵ月	4ヵ月	6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠であった	同左	同左	同左
			同左	同左	同左
崩壊性	60分以内	5~7	5~7	5~7	5~7
			5~7	5~7	5~7
定量*1(%)	95~105	100.1±0.8	100.1±0.8	100.4±0.7	100.6±0.7
			100.1±1.1	100.1±0.7	100.3±0.7

*1 平均値±S. D.

[3ロット]

<無包装状態での安定性試験> 4)

全ての条件において、顕著な変化は認められなかった。

試験条件

保存条件		保存容器
温度	40℃	遮光・気密
湿度	25℃・75%RH	遮光・開放
光	60万 lx・hr	透明・気密

試験結果

保存条件	外観	硬度(kgf)	溶出率(%)	含量 残存率*1(%)
開始時	白色のフィルム コーティング錠であった	6.1	102~109	100
40℃、3ヵ月	白色のフィルム コーティング錠であった	6.8	101~109	99.9
25℃・75%RH、3ヵ月	白色のフィルム コーティング錠であった	5.8	100~110	101.1
60万 lx・hr	白色のフィルム コーティング錠であった	4.8	102~110	98.7

*1 試験開始時を100とした

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

7. 溶出性

(1) 溶出挙動における類似性

○アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」 7)

通知	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」 (平成18年11月24日、薬食審査発第1124004号)				
試験方法	日本薬局方一般試験法 溶出試験法 パドル法				
試験液	pH1.2 : 日本薬局方溶出試験の第1液				
	pH4.0 : 薄めた McIlvaine の緩衝液				
	pH6.8 : 日本薬局方溶出試験の第2液				
	水 : 日本薬局方精製水				
試験液温	37±0.5℃	試験液量	900mL	試験回数	12 ベッセル

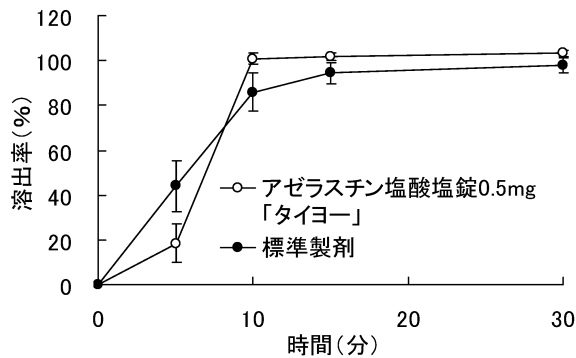
<試験結果>

全ての試験条件において基準に適合したため、両製剤の溶出挙動は類似であると判断した。

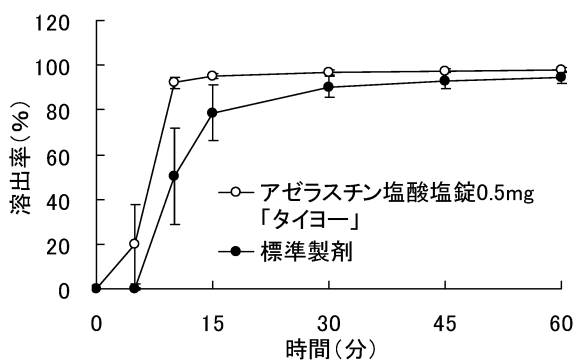
回転数	試験液	溶出挙動	判定
50 回転/分	pH1.2	標準製剤、試験製剤ともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。	適合
	pH4.0	試験製剤と標準製剤の平均溶出ラグ時間*1 の差は 10 分以内であった。 また、溶出曲線を溶出ラグ時間で補正すると、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる 2 時点(6.1 分及び 17.7 分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。	適合
	pH6.8	試験製剤と標準製剤の平均溶出ラグ時間*1 の差は 10 分以内であった。 また、溶出曲線を溶出ラグ時間で補正すると、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる 2 時点(6.0 分及び 22.4 分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。	適合
	水	試験製剤と標準製剤の平均溶出ラグ時間*1 の差は 10 分以内であった。 また、溶出曲線を溶出ラグ時間で補正すると、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる 2 時点(4.4 分及び 353 分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。	適合
100 回転/分	pH6.8	試験製剤と標準製剤の平均溶出ラグ時間*1 の差は 10 分以内であった。また、溶出曲線を溶出ラグ時間で補正すると、標準製剤、試験製剤ともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。	適合

*1 ラグ時間：5%溶出するまでに要する時間

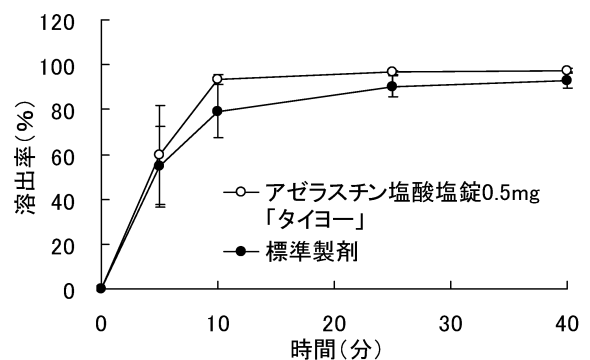
<pH1.2、50rpm>



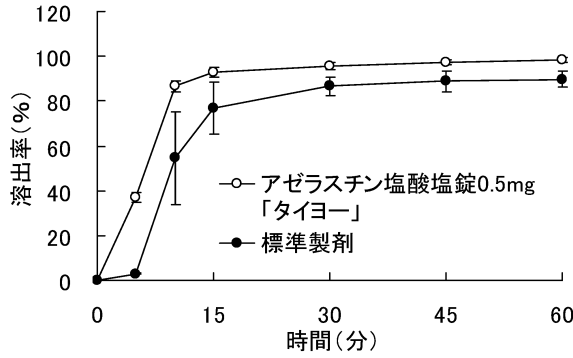
<pH4.0、50rpm>



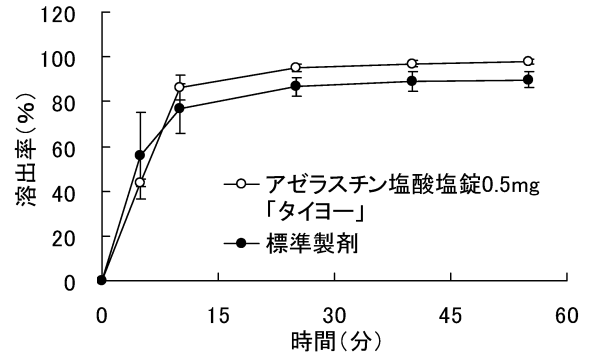
<pH4.0、50rpm (ラグ時間補正後)>



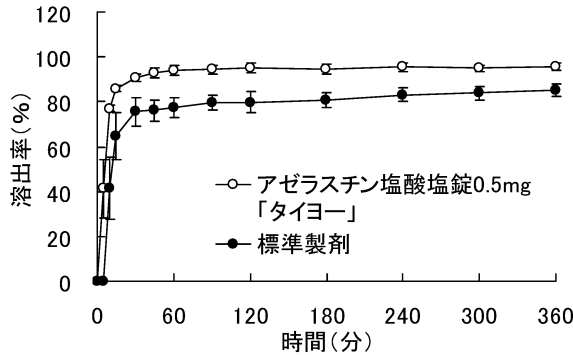
<pH6.8、50rpm>



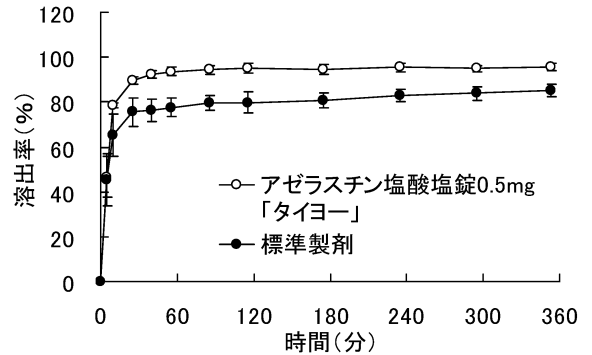
<pH6.8、50rpm (ラグ時間補正後)>



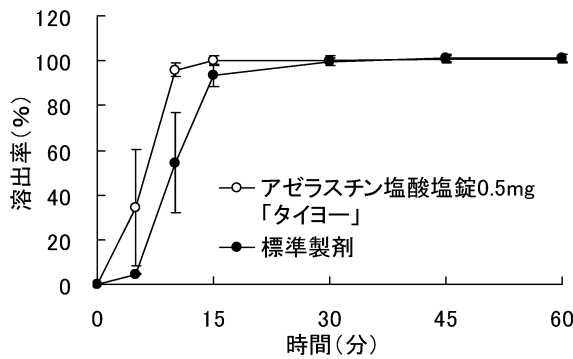
<水、50rpm>



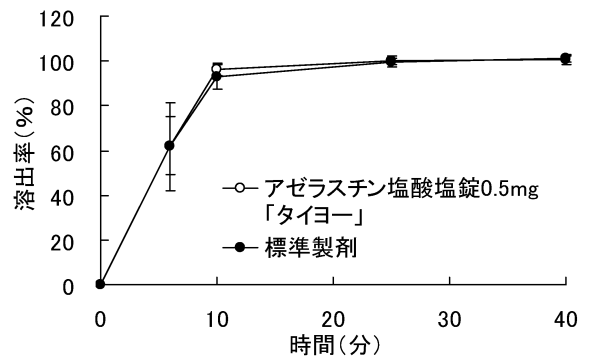
<水、50rpm (ラグ時間補正後)>



<pH6.8、100rpm>



<pH6.8、100rpm (ラグ時間補正後)>



○アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」⁸⁾

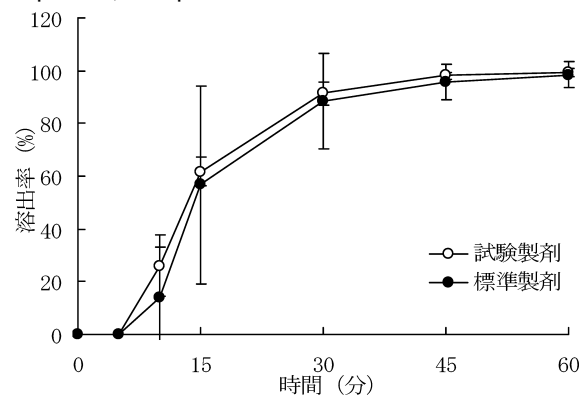
通知	「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について」 (平成10年7月15日、医薬発第634号) (その29)				
試験方法	日本薬局方一般試験法 溶出試験法 パドル法				
試験液	pH1.2 : 日本薬局方溶出試験の第1液				
	pH4.0 : 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液				
	pH6.8 : 日本薬局方溶出試験の第2液				
	水 : 日本薬局方精製水				
試験液温	37±0.5℃	試験液量	900mL	試験回数	6 ベッセル

<試験結果>

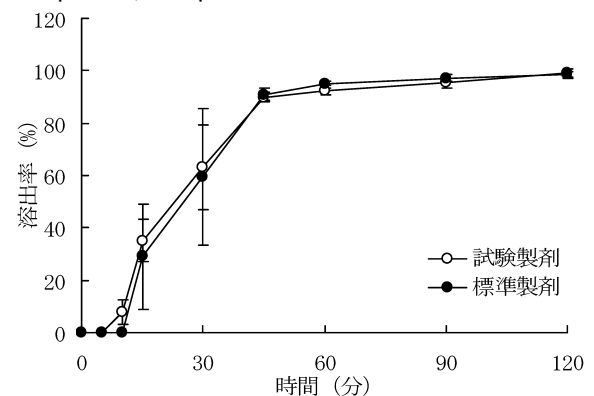
全ての試験条件において基準に適合したため、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

回転数	試験液	溶出挙動	判定
50 回転/分	pH1.2	試験製剤と標準製剤の平均溶出ラグ時間の差は10分以内であった。また、標準製剤の平均溶出率が60%付近(15分)及び85%付近(30分)の2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。	適合
	pH4.0	標準製剤の平均溶出率が40%付近(15分)及び85%付近(45分)の2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。	適合
	pH6.8	標準製剤の平均溶出率が40%付近(15分)及び85%付近(45分)の2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。	適合
	水	標準製剤の平均溶出率が40%付近(30分)及び85%付近(300分)の2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。	適合

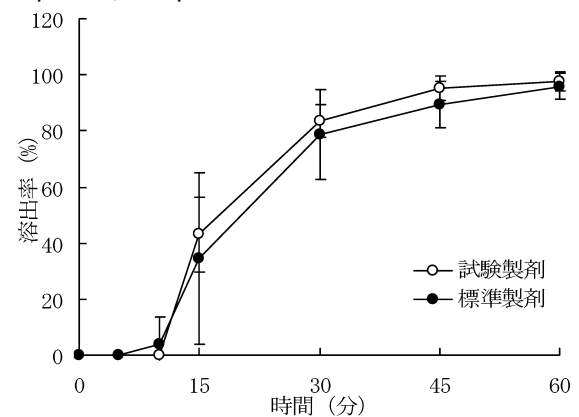
<pH1.2、50rpm>



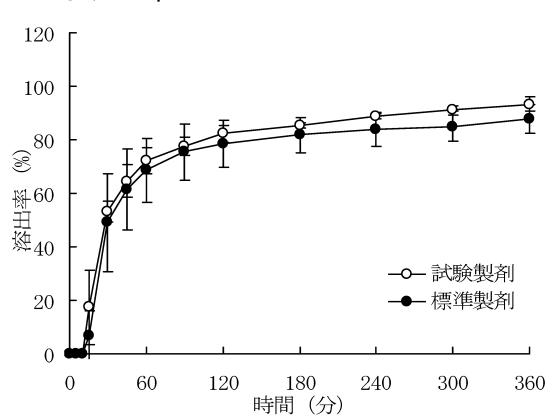
<pH4.0、50rpm>



<pH6.8、50rpm>



<水、50rpm>



(2) 公的溶出規格への適合

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。

	規定時間	溶出率
0.5mg	45分	80%以上
1mg	90分	80%以上

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」
 - 1) ドラーゲンドルフ試液による沈殿反応
 - 2) 紫外可視吸光度測定法 (吸収スペクトル)
 - 3) 薄層クロマトグラフィー
- アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」
 - 1) ドラーゲンドルフ試液による沈殿反応
 - 2) 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 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

2. 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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ケトチフェンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン、フェキソフェナジン塩酸塩、エバスチン、セチリジン塩酸塩、ベポタスチンベシル酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オロパタジン塩酸塩、ロラタジン 等の抗ヒスタミン薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

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、すなわ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(H₁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、リポ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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

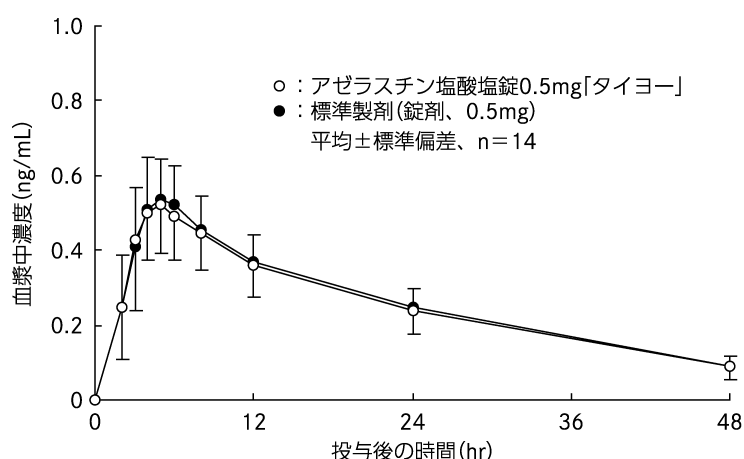
「VII-1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

○アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」⁹⁾

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。

通知	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」 (平成18年11月24日、薬食審査発第1124004号)		
被験者数	14名		
投与方法	2剤2期のクロスオーバー法	水150mLと共に絶食単回経口投与	
投与量	製剤2錠（アゼラスチン塩酸塩として1mg）		
採血時間	10時点（投与前、投与後2、3、4、5、6、8、12、24、48時間）		
休薬期間	7日間以上	分析法	LC/MS/MS法



<薬物動態パラメータ>

(平均±標準偏差、n=14)

	投与量 (mg)	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 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

<判定結果>

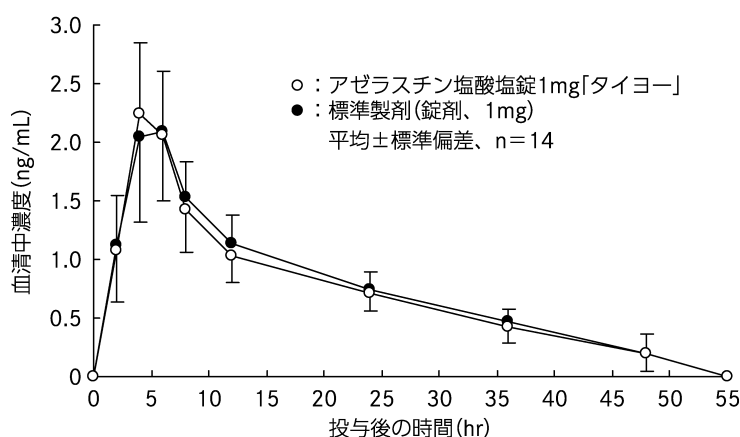
	AUC ₀₋₄₈	Cmax
平均値の差	$\log(0.96)$	$\log(0.95)$
90%信頼区間	$\log(0.89) \sim \log(1.04)$	$\log(0.87) \sim \log(1.03)$

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」¹⁰⁾

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）

通知	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱い等について」 （昭和55年5月30日、薬審第718号）		
被験者数	14名		
投与方法	2剤2期のクロスオーバー法	水100mLと共に絶食単回経口投与	
投与量	製剤4錠（アゼラスチン塩酸塩として4mg）		
採血時間	10時点（投与前、投与後2、4、6、8、12、24、36、48、55時間）		
休薬期間	2週間	分析法	HPLC法



<薬物動態パラメータ>

(平均±標準偏差、n=14)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₅₅ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (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

<判定結果>

	AUC ₀₋₅₅	Cmax
母平均の比	0.95	1.05
90%信頼区間	log(0.85)～log(1.06)	log(0.95)～log(1.16)

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

「Ⅷ－10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ－10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

該当しない

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (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。

7. 相互作用

(1)併用禁忌とその理由

該当しない

(2)併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1)副作用の概要

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。

(2)重大な副作用と初期症状

該当しない

(3) 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)、ALT (GPT)、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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

下記の項目参照

VIII-8. (3) その他の副作用：過敏症

9. 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。

10. 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]

11. 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）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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)

15. 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。

16. その他

該当しない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）

該当資料なし

- (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

- (3) 安全性薬理試験

該当資料なし

- (4) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

- (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

- (3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

- (4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない
有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果（加速）に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温・気密容器保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

特になし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ-14. 適用上の注意」の項参照

・くすりのしおり : 有り

(3) 調剤時の留意点について

特になし

5. 承認条件等

該当しない

6. 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）、1,000錠（10錠×100）

7. 容器の材質

○アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

○アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」

PTP包装：ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アゼプチン錠 0.5mg・1mg

同 効 薬：ケトチフェンフマル酸塩、エピナスチン塩酸塩、オキサトミド、メキタジン 等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」	2011年1月14日	22300AMX00256000
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」	2010年8月3日	22200AMX00880000

<旧販売名>

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
アゼピット錠 1mg	1994年3月15日	20600AMZ00575000

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」	2011年11月28日
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」	

<旧販売名>

製品名	薬価基準収載年月日
アゼピット錠 1mg	1994年7月8日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容
該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容
該当しない

14. 再審査期間
該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報
本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

製品名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード (YJコード)	レセプト 電算コード
アゼラスチン塩酸塩錠 0.5mg 「タイヨー」	121033002	4490004F1013 (4490004F1080)	622103301
アゼラスチン塩酸塩錠 1mg 「タイヨー」	109469530	4490004F2010 (4490004F2303)	620946906

17. 保険給付上の注意
本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書 (2016)
- 2) 医療用医薬品 品質情報集 No. 8, 日本公定書協会 (2001)
- 3) 武田テバファーマ(株)社内資料 (無包装状態での安定性試験 : 0.5mg)
- 4) 武田テバファーマ(株)社内資料 (無包装状態での安定性試験 : 1mg)
- 5) 武田テバファーマ(株)社内資料 (加速試験 : 0.5mg)
- 6) 武田テバファーマ(株)社内資料 (加速試験 : 1mg)
- 7) 武田テバファーマ(株)社内資料 (溶出試験 : 0.5mg)
- 8) 武田テバファーマ(株)社内資料 (溶出試験 : 1mg)
- 9) 武田テバファーマ(株)社内資料 (生物学的同等性試験 : 0.5mg)
- 10) 武田テバファーマ(株)社内資料 (生物学的同等性試験 : 1mg)

2. その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
該当しない

2. 海外における臨床支援情報
該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料