

脂質代謝異常改善剤

* **エラスチム錠 1800** *Elaszym*

〈エラスターゼ製剤〉

承認番号	21800AMX10421000
薬価収載	2006年12月
販売開始	1984年6月
再評価結果	1992年6月

*【貯 法】 室温保存
PTP包装はアルミ袋開封後、バラ包装は開栓後湿気を避けて保存すること(湿気により含量が低下することがある)。
【使用期限】 外箱又はラベルに表示の使用期限内に使用すること。

【組成・性状】

1. 組成

本剤は、1錠中にエラスターゼ ES を1,800エラスターゼ単位(以下 EL.U.と略記)含有する白色の腸溶錠である。添加物としてカルナウバロウ、カルメロースカルシウム、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸カルシウム、タルク、デキストラン、トコフェロール、トリアセチン、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、ポリソルベート80、メタクリル酸コポリマー LD、ラウリル硫酸ナトリウムを含有する。

2. 製剤の性状

販売名	剤形 識別コード	外 形			性 状
		表	裏	側 面	
エラスチム錠 1800	腸溶錠				白色
	E 225	直径(mm) 6.8	質量(mg) 127	厚さ(mm) 3.9	

【効能・効果】

高脂血症

【用法・用量】

通常、成人には1日量3錠を3回に分けて食前に経口投与する。効果不十分の場合は、6錠まで増量できる。ただし、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 副作用

総症例10,132例中、94例(0.93%)の副作用が報告されている。(副作用発現頻度調査終了時)

	0.1~5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注)}	発疹、痒痒感	
消化器	悪心、食欲不振、胃障害、下痢	胃部不快感、腹部膨満感、便秘

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など適切な処置を行うこと。

2. 適用上の注意

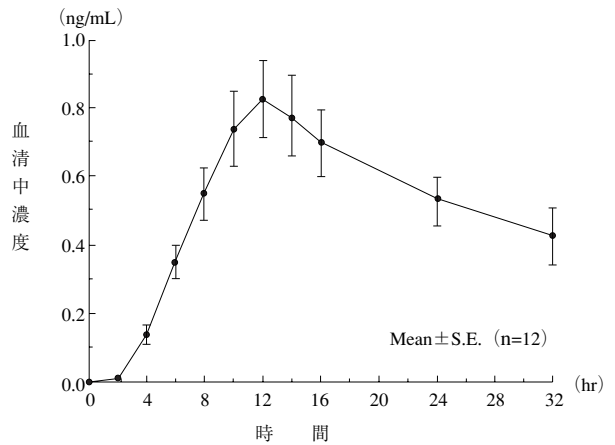
薬剤交付時

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報告されている)

【薬物動態】

血中濃度

健康成人男子12名に本剤6錠^{注)}を空腹時単回投与し、酵素免疫測定法により血中濃度を測定した。平均血中濃度は投与12時間後に最高値(0.88ng/mL)に達し、血中からの消失半減期は19.4時間であった。(①)



本剤6錠^{注)}単回経口投与時の血中濃度

本剤6錠^{注)}単回経口投与時の薬物動態パラメータ

C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
0.88±0.41	10~14	19±6

(Mean ± S. D., n=12)

注) 本剤6錠の単回経口投与は承認外用量である。

【臨床成績】

1. 血清脂質異常の改善

動脈硬化症、高血圧症、糖尿病及び高脂血症に伴う血清脂質異常に対する改善効果を3種の二重盲検試験及び一般臨床試験により検討した結果、本剤の有用性が認められた。(②③)

2. 血清リポ蛋白代謝異常の正常化

高脂血症患者並びに低HDL血症患者114名を対象として、本剤1日5,400EL.U.を12週間投与した結果、HDL-C、アポA蛋白、磷脂質は有意な増加あるいは増加傾向を示し、β-リポ蛋白、過酸化脂質、遊離脂肪酸、VLDL-LDL、及びVLDL-LDL/C-HDL比は有意な減少あるいは減少傾向を示した。(④)

3. 糖尿病を伴う血清脂質異常の改善

レントゲン上、下肢動脈石灰化が確認されている症例もしくは高血圧症、糖尿病など基礎疾患を有する高脂血症患者666例に本剤を約1年間投与した結果、血清脂質異常は投与3ヵ月後より有意に改善し、自覚症状にも高い改善を示した。(⑤)

【薬効薬理】

1. 脂質成分の移行を調節し、血清脂質異常を改善する

本薬は、広範な脂質代謝改善作用を有し、コレステロール負荷ウサギ及びラットにおいて、肝におけるコレステロールの異化と排泄を促進する。さらに、リポ蛋白リパーゼ及びLCAT活性を高め、リポ蛋白代謝、すなわち超低比重リポ蛋白(VLDL)、低比重リポ蛋白(LDL)、高比重リポ蛋白(HDL)の代謝を改善する。(⑥⑦⑧⑨⑩)

(裏面につづく)

2. 高脂肪食負荷ウサギの血清脂質異常を改善し、粥状動脈硬化の進展を抑制する

本薬はコレステロール負荷ウサギにおいて高脂血症状態を改善し、動脈壁へのコレステロールの沈着を抑制するとともに除去を促進し、動脈壁弾性線維エラスチンの変性を抑制してエラスチン生成を正常化する。また、動脈壁内膜における細胞増殖と泡沫細胞の出現を阻止することが認められており、さらに動脈壁物性に対する検討では、動脈の弾力性、伸展性に好影響を与える。(①⑫⑬⑭)

【有効成分に関する理化学的知見】

エラスターゼ ES は、ブタのすい臓から製したもので、エラスチンを分解し、カゼイン、フィブリン及び変性コラーゲンなども分解する。通例、デキストランを加えたものである。

一般名：エラスターゼ ES (Elastase ES)

物理化学的性状：

エラスターゼ ES は灰色～淡褐色の粉末で、特異なおいがある。

【包装】

エラスチーム錠1800……………100錠 (PTP)・210錠 (PTP21T×10)
500錠 (バラ)・1,000錠 (PTP)

【主要文献】

文献請求番号

- ① Kohno, T. et al. : Clin. Chem. Enzym. Comms.,
4, 123 (1991) ELA-0605
- ② 岸本道太ら：臨牀と研究, 50, 500 (1973) ELA-0037
- ③ 内藤周幸ら：医学のあゆみ,
82, 848 (1972) ELA-0038
- ④ 吉田良一ら：動脈硬化, 10, 905 (1982) ELA-0192
- ⑤ 後藤由夫ら：臨牀と研究, 62, 2954 (1985) ELA-0419
- ⑥ 亀谷富夫：動脈硬化, 6, 101 (1978) ELA-0062
- ⑦ 高橋 因ら：動脈硬化, 11, 351 (1983) ELA-0200
- ⑧ 小出 醇ら：動脈硬化, 12, 1529 (1985) ELA-0384
- ⑨ 中村治雄：医学と生物学, 92, 527 (1976) ELA-0005
- ⑩ 勝沼英宇ら：動脈硬化, 9, 861 (1981) ELA-0179
- ⑪ 村野俊一ら：動脈硬化, 14, 565 (1986) ELA-0474
- ⑫ 長谷川元治ら：動脈硬化, 12, 207 (1984) ELA-0283
- ⑬ 小山忠喜ら：動脈硬化, 12, 1021 (1984) ELA-0356
- ⑭ Hayashi, K. et al. : Atherosclerosis,
66, 259 (1987) ELA-0512

【文献請求先】

エーザイ株式会社 安全管理部 FAX 03(3811)2710

【商品情報お問い合わせ先】

エーザイ株式会社 お客様ホットライン ☎0120(419)497

製造販売元



エーザイ株式会社
東京都文京区小石川4-6-10

D35607-2

CODE DI-T-EL109