

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

筋緊張・循環改善剤

エペリゾン塩酸塩錠50mg「旭化成」

Eperisone Hydrochloride

(エペリゾン塩酸塩製剤)

剤形	錠剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品 注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1錠中日局エペリゾン塩酸塩50mg含有
一般名	和名：エペリゾン塩酸塩（JAN） 洋名：Eperisone Hydrochloride（JAN）、Eperisone（INN）
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：2018年7月23日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2018年12月14日（販売名変更による） 発売年月日：2007年6月15日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：旭化成ファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	旭化成ファーマ株式会社 【医薬情報部 くすり相談窓口】 ☎0120-114-936 FAX:03-6699-3697 受付時間：9:00～17:45（土日祝、休業日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.asahikasei-pharma.co.jp

本IFは2018年12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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>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。この変更に合わせて、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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」（<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>）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料であり、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	2. 用法及び用量	9
1. 開発の経緯	3. 臨床成績	9
2. 製品の治療学的・製剤学的特性		
II. 名称に関する項目	VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	11
2. 一般名	2. 薬理作用	11
3. 構造式又は示性式		
4. 分子式及び分子量	VII. 薬物動態に関する項目	
5. 化学名（命名法）	1. 血中濃度の推移・測定法	13
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2. 薬物速度論的パラメータ	14
7. CAS 登録番号	3. 吸収	14
	4. 分布	14
	5. 代謝	15
	6. 排泄	15
	7. トランスポーターに関する情報	15
	8. 透析等による除去率	15
III. 有効成分に関する項目	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
1. 物理化学的性質	1. 警告内容とその理由	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	16
3. 有効成分の確認試験法	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
4. 有効成分の定量法	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
	5. 慎重投与内容とその理由	16
	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
	7. 相互作用	16
	8. 副作用	17
	9. 高齢者への投与	18
	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18
	11. 小児等への投与	19
	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
	13. 過量投与	19
	14. 適用上の注意	19
	15. その他の注意	19
	16. その他	19
IV. 製剤に関する項目		
1. 剤形		
2. 製剤の組成		
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意		
4. 製剤の各種条件下における安定性		
5. 調製法及び溶解後の安定性		
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）		
7. 溶出性		
8. 生物学的試験法		
9. 製剤中の有効成分の確認試験法		
10. 製剤中の有効成分の定量法		
11. 力価		
12. 混入する可能性のある夾雑物		
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報		
14. その他		
V. 治療に関する項目		
1. 効能又は効果		9

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験……………20
2. 毒性試験……………20

Ⅹ. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分……………21
2. 有効期間又は使用期限……………21
3. 貯法・保存条件……………21
4. 薬剤取扱い上の注意点……………21
5. 承認条件等……………21
6. 包装……………21
7. 容器の材質……………21
8. 同一成分・同効薬……………22
9. 国際誕生年月日……………22
10. 製造販売承認年月日及び承認番号……………22
11. 薬価基準収載年月日……………22
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……………22
13. 再審査結果、再評価結果公表年月
日及びその内容……………22
14. 再審査期間……………22
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報……………22
16. 各種コード……………23
17. 保険給付上の注意……………23

ⅩⅠ. 文献

1. 引用文献……………24
2. その他の参考文献……………24

ⅩⅡ. 参考資料

1. 主な外国での発売状況……………25
2. 海外における臨床支援情報……………25

ⅩⅢ. 備考

- その他の関連資料……………26

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

β -アミノプロピオフェノン誘導体の研究から、中枢神経系と血管平滑筋の双方に作用して、骨格筋緊張緩和作用と血管拡張作用を有するエペリゾン塩酸塩製剤が、1983年に痙性麻痺の効能で発売され、1985年に頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、腰痛症の筋緊張状態の改善の効能が追加された。弊社では1990年から後発品「サンバゾン錠」を販売し、1999年品質再評価に適合した。また、医療事故防止対策に基づき、2007年に販売名を「サンバゾン錠」から「サンバゾン錠 50mg」に変更した。なお、一般的名称への変更のため、2018年12月に販売名を『エペリゾン塩酸塩錠 50mg「旭化成」』に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は鎮静・催眠作用を示さず、脊髄レベルに作用し、シナプス反射を前シナプス性に抑制して、脳性及び脊髄性の痙性麻痺症状（つっぱり・こわばり・歩きにくさ等）を改善し、痙性麻痺患者を容易にリハビリテーションに導くことが期待される。

重大な副作用としてショック、アナフィラキシー様症状、中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）が報告されている。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名：

エペリゾン塩酸塩錠 50mg 「旭化成」

(2) 洋名：

Eperisone Hydrochloride

(3) 名称の由来：

通知「薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）：

エペリゾン塩酸塩（JAN）

(2) 洋名（命名法）：

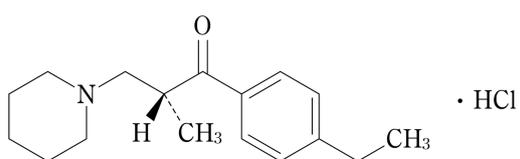
Eperisone Hydrochloride（JAN）

Eperisone（INN）

(3) ステム：

不明

3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

4. 分子式及び分子量

分子式： $C_{17}H_{25}NO \cdot HCl$

分子量：295.85

5. 化学名（命名法）

(2*RS*)-1-(4-Ethylphenyl)-2-methyl-3-piperidin-1-ylpropan-1-one monohydrochloride
(IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：EMPP

7. CAS 登録番号

56839-43-1

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。

(2) 溶解性：

水、メタノール又は酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けやすい。

(3) 吸湿性：

該当資料なし。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点：

融点：約 167℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数：

該当資料なし。

(6) 分配係数：

該当資料なし。

(7) その他の主な示性値：

メタノール溶液（1→100）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

該当資料なし。

3. 有効成分の確認試験法¹⁾

日局「エペリゾン塩酸塩」の確認試験による。

4. 有効成分の定量法¹⁾

日局「エペリゾン塩酸塩」の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状：

色・剤形	白色のフィルムコーティング錠
外形	
大きさ	直径 7.7mm 厚み 3.9mm
重量	150mg

(2) 製剤の物性：

硬 度：13.7kg (3 ロット平均)

崩壊性：日局一般試験法崩壊試験法(2)白糖又はそのほかの適当なコーティング剤で剤皮を施した錠剤の項により試験を行うとき、これに適合する。

(3) 識別コード：

D221 (錠剤の表面及び PTP シートの裏面に表示)

(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：

1 錠中に日局エペリゾン塩酸塩 50mg を含有する。

(2) 添加物：

結晶セルロース、カルメロース、トウモロコシデンプン、カルメロースカルシウム、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、タルク、ヒプロメロース、エチルセルロース、トリアセチン、酸化チタン、カルナウバロウ

(3) その他：

該当資料なし。

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²⁾

エペリゾン塩酸塩錠 50mg「旭化成」を室温に長期保存し、安定性を調べた。

保存温度	保存形態	保存期間	試験項目	結果
室温	最終包装製品	3年	性状 確認試験 含量 溶出試験	いずれの試験項目においても変化は認められなかった。

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、3年間）の結果、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。

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（物理化学的变化）

該当しない。

7. 溶出性³⁾

試験法（日本薬局方外医薬品規格第三部（製剤の溶出性））

本品1個をとり、試験液に水900 mLを用い、溶出試験法第2法により、毎分50回転で試験を行う。溶出試験を開始し、規定時間後、溶出液20 mL以上をとり、孔径0.45 μmのメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液10 mLを除き、次のろ液V mLを正確に量り、表示量に従い1 mL中にエペリゾン塩酸塩（C₁₇H₂₅NO・HCl）約6 μgを含む液となるように0.1 mol/L塩酸試液を加えて正確にV' mLとし、試料溶液とする。別にエペリゾン塩酸塩標準品を酸化リン(V)を乾燥剤として24時間減圧乾燥し、その約0.05 gを精密に量り、水に溶かし、正確に100 mLとする。この液5 mLを正確に量り、水を加えて正確に50 mLとする。更に、この液5 mLを正確に量り、0.1 mol/L塩酸試液を加えて正確に50 mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、紫外可視吸光度測定法により試験を行い、波長262 nmにおける吸光度A_T及びA_Sを測定する。

本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

エペリゾン塩酸塩（C₁₇H₂₅NO・HCl）の表示量に対する溶出率（%）

$$= W_S \times A_T / A_S \times V' / V \times 1 / C \times 9$$

W_S : エペリゾン塩酸塩標準品の量 (mg)

C : 1錠中のエペリゾン塩酸塩（C₁₇H₂₅NO・HCl）の表示量 (mg)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
50mg	90分	70%以上

試験結果

エペリゾン塩酸塩錠 50mg「旭化成」の90分での溶出率は92.3%～95.2%で、溶出規格を満たしたことから適合と判定した。

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

(1) 3級アミンの確認 (ライネツケ塩による反応)

本品を粉末とし、表示量に従いエペリゾン塩酸塩 0.1 g に対応する量を取り、希塩酸 10 mL を加えてよく振り混ぜ、ろ過する。ろ液 5 mL にライネツケ塩試液 1 mL を加えるとき、紅白色の沈殿を生じる。

(2) 紫外吸収スペクトル

本品を粉末とし、表示量に従いエペリゾン塩酸塩 0.05 g に対応する量を取り、0.1 mol/L 塩酸試液を加えて 50 mL とし、よく振り混ぜた後、ろ過する。ろ液 1 mL をとり、0.1 mol/L 塩酸試液を加えて 100 mL とし、試料溶液とする。試料溶液につき、日局一般試験法吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 260 ~ 264 nm に吸収の極大を示す。

10. 製剤中の有効成分の定量法

本品 20 個以上をとり、その重量を精密に量り、粉末とする。エペリゾン塩酸塩 ($C_{17}H_{25}NO \cdot HCl$) 約 0.05 g に対応する量を精密に量り、0.1 mol/L 塩酸試液 40 mL に溶かし、更に 0.1 mol/L 塩酸試液を加えて正確に 50 mL とする。この液をろ過し、初めのろ液 5 mL を除き、次のろ液 2 mL を正確に量り、内標準溶液 2 mL を正確に加え、更に移動相を加えて 20 mL とし、試料溶液とする。

別に、エペリゾン塩酸塩標準品を乾燥 (減圧、シリカゲル、3 時間) し、その約 0.05 g を精密に量り、0.1 mol/L 塩酸試液に溶かし、正確に 50 mL とする。この液 2 mL を正確に量り、内標準溶液 2 mL を正確に加え、更に移動相を加えて 20 mL とし、標準溶液とする。

試料溶液及び標準溶液 10 μ L につき、次の条件で日局一般試験法液体クロマトグラフ法・内標準法により試験を行い、内標準物質のピーク面積に対するエペリゾン塩酸塩のピーク面積の比 Q_T 及び Q_S を求める。

$$\begin{aligned} & \text{秤取試料中のエペリゾン塩酸塩 } (C_{17}H_{25}NO \cdot HCl) \text{ の量 (mg)} / \\ & = \text{エペリゾン塩酸塩標準品秤取量 (mg)} \times Q_T / Q_S \end{aligned}$$

内標準溶液：日局アミノ安息香酸エチルのエタノール溶液 (1→1000)

操作条件

検出器：紫外吸光光度計 (測定波長：260 nm)

カラム：内径約 6 mm、長さ 15 ~ 30 cm のステンレス管に 5 ~ 10 μ m のオクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度：室温

移動相：メタノール・0.5%酢酸アンモニウム水溶液 (酢酸で pH を約 3.5 に調整する) の混液 (5 : 5)

流量：エペリゾン塩酸塩の保持時間が約 6 分になるよう調整する。

11. カ価

該当しない。

12. 混入する可能性のある夾雑物¹⁾

重金属：20 ppm 以下

塩酸ピペリジン：0.2%以下

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない。

14. その他

該当資料なし。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- 下記疾患による筋緊張状態の改善
頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、腰痛症
- 下記疾患による痙性麻痺
脳血管障害、痙性脊髄麻痺、頸部脊椎症、術後後遺症（脳・脊髄腫瘍を含む）、外傷後遺症（脊髄損傷、頭部外傷）、筋萎縮性側索硬化症、脳性小児麻痺、脊髄小脳変性症、脊髄血管障害、スモン（SMON）、その他の脳脊髄疾患

2. 用法及び用量

通常、成人には1日量として3錠を3回に分けて食後に経口投与する。
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：
該当しない。
- (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：

該当しない。

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

トルペリゾン塩酸塩

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序^{4~7)}：

主として脊髄レベルに作用するが、脊髄より上位の中枢にも作用する。

本剤の特徴は、脊髄における単シナプス反射と多シナプス反射を抑制することである。そして、 α 運動ニューロンより γ 運動ニューロンを強く抑制し、単シナプス反射より多シナプス反射を強く抑制するが、筋紡錘には直接作用せず、筋紡錘から出る求心性神経(Ia線維)の活動を抑制することから、脊髄反射および γ 運動ニューロン自発発射を抑制して筋紡錘の感度を緩和することにより、骨格筋緊張緩和作用を発揮すると考えられている。

神経筋接合部に対する作用は弱く、また鎮静作用はほとんどないことが動物実験で確認されている。本剤には末梢血管拡張作用もある。

<参考>

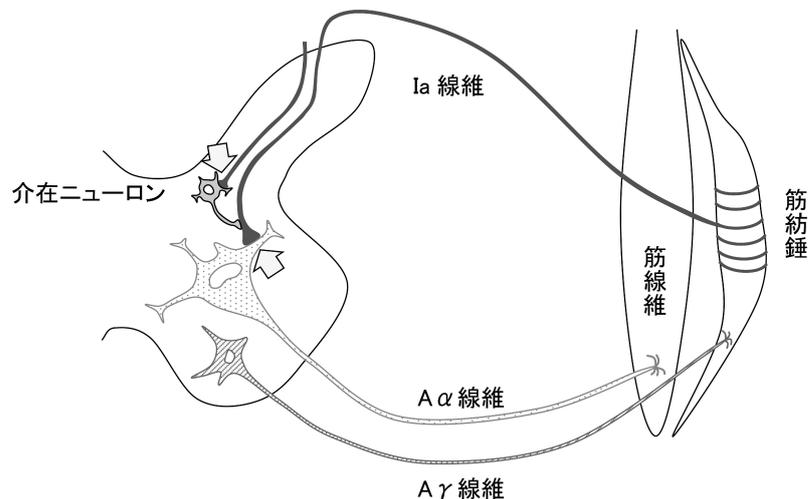
骨格筋の神経支配⁴⁾

骨格筋は運動ニューロンに支配されており、その興奮によって収縮する。すなわち、大脳皮質からの下行性指令（運動指令）によって $A\alpha$ および $A\gamma$ 運動ニューロンが興奮し、 $A\alpha$ ニューロンは骨格筋（錘外筋）を、また、 $A\gamma$ ニューロンは筋肉内に存在する筋紡錘の錘内筋を収縮させる。筋紡錘は骨格筋の伸展度を感知するが、 $A\gamma$ ニューロンによって錘内筋が収縮すると筋紡錘の感度が上昇する。次に、収縮していた筋肉が伸張すると筋紡錘が興奮し、筋紡錘からの求心性 Ia 線維を介して脊髄内の $A\alpha$ 運動ニューロンにその情報が伝えられ、 $A\alpha$ ニューロン支配下の筋肉が収縮する。この $A\gamma$ 運動ニューロン→筋紡錘→Ia 線維→ $A\alpha$ 運動ニューロン→骨格筋という経路を γ ループとよび、この経路の活性化により $A\alpha$ 運動ニューロンの興奮性（筋の緊張）が高まる。これは痛みによる反射ではなく、重力系の筋肉を引っぱる力に対抗して収縮させ、バランスを維持させるための反射である。

痙性麻痺とは⁷⁾

痙性麻痺とは、筋緊張の異常としての痙縮と運動麻痺という二つの現象の組み合わされた状態である。また、痙縮とは、上位運動ニューロンの障害により下部脳幹、脊髄レベルに中枢のある反射機構が上位からの抑制・制御を受けなくなった結果生じる筋緊張の亢進状態である。痙縮が生じる機序としては、おそらく、脊髄における介在ニューロンの興奮性の変化、求心性 Ia 線維の終末に対するシナプス前抑制の消失や、上位中枢からの線維が損傷された結果として、遠心性 $A\alpha$ 運動線維に結合するシナプスが変性し、そのあとを末梢からの Ia 線維シナプスがうめるといふ発芽現象（sprouting）などが $A\alpha$ 運動ニューロンの興奮性を高めるのではないかと考えられる。

下図に示すように、筋紡錘からの Ia 線維を介したインパルスは $A\alpha$ 運動ニューロンを興奮させる。エペリゾン塩酸塩は筋弛緩剤のバクロフェンなどと同様に、 $A\alpha$ 運動ニューロンへ入力している Ia 線維終末からの興奮性トランスミッターの放出を抑える（ \downarrow ）ことなどにより、効果を発揮すると考えられる。



(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。

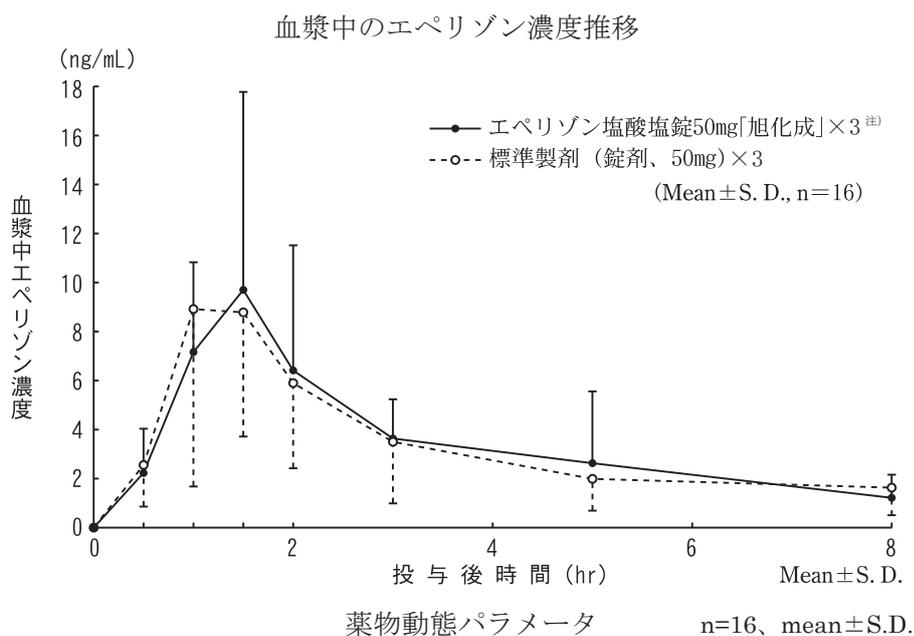
(2) 最高血中濃度到達時間：

1.5 時間

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁸⁾：

生物学的同等性試験

エペリゾン塩酸塩錠 50mg「旭化成」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 3 錠（エペリゾン塩酸塩として 150 mg^{注)}）健康成人男子 16 名に空腹時^{注)}、単回経口投与したときの血漿中未変化体濃度から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。



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。

注) 本剤の用法・用量は、「通常、成人には 1 日量として 3 錠を 3 回に分けて食後に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

(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：

該当資料なし。

(3) 乳汁への移行性 :

該当資料なし。

(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）

禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

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

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

(1) 薬物過敏症の既往歴のある患者

(2) 肝障害のある患者 [肝機能を悪化させることがある。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

本剤投与中に脱力感、ふらつき、眠気等が発現することがあるので、その場合には減量又は休薬すること。なお、本剤投与中の患者には自動車の運転など危険を伴う機械の操作には従事させないように注意すること。

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：

併用注意（併用に注意すること）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
メトカルバモール	類似薬のトルペリゾン塩酸塩で、眼の調節障害があらわれたとの報告がある。	機序不明

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：

重大な副作用（頻度不明）

- 1) **ショック、アナフィラキシー様症状** ショック、アナフィラキシー様症状を起こすことがあるので、観察を十分に行い、発赤、掻痒感、蕁麻疹、顔面等の浮腫、呼吸困難等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) **中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）** 中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群等の重篤な皮膚障害を起こすことがあるので、観察を十分に行い、発熱、紅斑、水疱、掻痒感、眼充血、口内炎等の症状が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用：

分類	頻度	頻度不明
肝 臓 ^{注1)}		AST (GOT)、ALT (GPT)、Al-P の上昇
腎 臓 ^{注1)}		蛋白尿、BUN の上昇
血 液 ^{注1)}		貧血
過 敏 症 ^{注2)}		発疹、掻痒、多形滲出性紅斑
精神神経系		眠気、不眠、頭痛、四肢のしびれ、体のこわばり、四肢のふるえ
消 化 器		悪心・嘔吐、食欲不振、胃部不快感、腹痛、下痢、便秘、口渇、口内炎、腹部膨満感
泌 尿 器		尿閉、尿失禁、残尿感
全身症状		脱力感、ふらつき、全身倦怠感、筋緊張低下、めまい
そ の 他		ほてり、発汗、浮腫、動悸、しゃっくり

注1) このような症状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。

注2) 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：

関連事項として、以下の記載あり。

VIII.2. 「禁忌内容とその理由」の項参照。

禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

VIII.5. 「慎重投与内容とその理由」の項参照。

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

(1) 薬物過敏症の既往歴のある患者

VIII.8. 「(2)重大な副作用と初期症状」の項参照。

重大な副作用（頻度不明）

1) **ショック、アナフィラキシー様症状** ショック、アナフィラキシー様症状を起こすことがあるので、観察を十分に行い、発赤、掻痒感、蕁麻疹、顔面等の浮腫、呼吸困難等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

VIII.8. 「(3)その他の副作用」の項参照。

分類	頻度	頻度不明
過敏症 ^{注2)}		発疹、掻痒、多形滲出性紅斑

注2) 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。

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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
(2) 授乳中の婦人に投与することは避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合には、授乳を避けさせること。

11. 小児等への投与

小児等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

該当しない。

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)

15. その他の注意

該当しない。

16. その他

該当資料なし。

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）：
- (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：エペリゾン塩酸塩錠 50mg「旭化成」 処方箋医薬品^注

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：エペリゾン塩酸塩 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：外箱等に表示（3年）

3. 貯法・保存条件

室温保存（湿気に注意）

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：

該当しない。

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）：

くすりのしおり：有り

VIII.14.「適用上の注意」の項参照。

(3) 調剤時の留意点について：

該当しない。

5. 承認条件等

該当しない。

6. 包装

1錠中エペリゾン塩酸塩 50mg 含有：PTP 100錠（10錠×10）

PTP 500錠（10錠×50）

PTP 1,000錠（10錠×100）

バラ 500錠

7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ミオナール錠 50mg、ミオナール顆粒 10%（エーザイ）

同 効 薬：チザニジン塩酸塩、バクロフェン、アフロクアロン等

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日：2018年7月23日^注（販売名変更による）

承認番号：23000AMX00577000^注（販売名変更による）

注) 旧販売名：サンバゾン錠 50mg 承認年月日：2007年2月28日 承認番号：21900AMX00150000

旧販売名：サンバゾン錠 承認年月日：1990年3月6日 承認番号：(02AM)0349

11. 薬価基準収載年月日

2018年12月14日^注（販売名変更による）

注) 旧販売名：サンバゾン錠 50mg 2007年6月15日 経過措置期間終了見込み：2019年9月30日

旧販売名：サンバゾン錠 1990年7月13日 経過措置期間終了：2008年3月31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

再評価結果 サンバゾン錠

公表年月日：1999年3月23日

内 容：溶出試験成績及び生物学的同等性試験成績から、薬事法（昭和35年法律第145号）第14条第2項各号のいずれにも該当しないことが確認された。

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	包装	HOT (13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 (統一収載品のレセプト電算コード)
エペリゾン塩酸塩錠 50mg「旭化成」	PTP 100錠	1019308150401	1249009F1481	620193015
	PTP 500錠	1019308150402		
	PTP 1,000錠	1019308150403		
	バラ 500錠	1019308150301		
サンバゾン錠 50mg	PTP 100錠	1019308150204	1249009F1317	620005008 (622311400)
	PTP 500錠	1019308150205		
	PTP 1,000錠	1019308150206		
	バラ 500錠	1019308150102		

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。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書、財団法人 日本公定書協会（廣川書店）
- 2) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 サンバズン錠 50mg の長期安定性に関する資料（2008）
- 3) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 サンバズン錠 50mg の溶出に関する資料（2008）
- 4) STANDARD 医師・歯科医師・薬剤師のための医薬品服薬指導情報集[薬効別]上、p1097、厚生省医薬安全局 安全対策課監修、日本薬剤師研修センター編集、じほう（2002）
- 5) 田中 千賀子 他：New 薬理学、p294（1989）
- 6) 水野 修：Current Therapy、6(9)、1178（1988）
- 7) 安田 雄 他：医学と薬学、17(5)、1163（1987）
- 8) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 サンバズン錠 50mg の生物学的同等性試験成績（概要）（2008）

2. その他の参考文献

なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし。

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
なし

旭化成ファーマ株式会社