

筋緊張性疼痛疾患治療剤

日本標準商品分類番号
871225

日本薬局方 クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠

*クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「サワイ」

*クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「サワイ」

CHLORPHENESIN CARBAMATE

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

	錠125mg	錠250mg
*承認番号	22500AMX01887000	22600AMX00120000
薬価収載	2014年6月	2014年6月
販売開始	1987年10月	1988年7月

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 本剤及び類似化合物(メトカルバモール等)に対し、過敏症の既往歴のある患者
- 2) 肝障害患者〔Modern Drug Encyclopedia, 13th Ed. 155 (1975)に投与禁忌として記載されたことがあり、これに準拠した。〕



【組成・性状】

組成

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「サワイ」：1錠中に日局クロルフェネシンカルバミン酸エステル125mgを含有する。添加物として、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「サワイ」：1錠中に日局クロルフェネシンカルバミン酸エステル250mgを含有する。添加物として、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

製剤の性状

	剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
125mg	素錠	 7.0 約180 4.4 〔識別コード：SW 174〕	白色
250mg	素錠	 9.0 約360 5.5 〔識別コード：SW 175〕	白色

【効能・効果】

運動器疾患に伴う痛性痙攣：

腰痛症、変形性脊椎症、椎間板ヘルニア、脊椎分離・沁り症、脊椎骨粗鬆症、頸肩腕症候群

【用法・用量】

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「サワイ」：

通常、成人1回2錠(クロルフェネシンカルバミン酸エステルとして250mg)を1日3回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「サワイ」：

通常、成人にはクロルフェネシンカルバミン酸エステルとして1回250mg(本剤1錠)を1日3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. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 肝障害の既往歴のある患者(「禁忌」の項参照)
- 2) 腎障害患者〔The United States DISPENSATORY, 27th Ed. 301 (1973)；MARTINDALE The Extra Pharmacopoeia, 26th Ed. 1891 (1972)に注意して投与せよと記載されたことがあり、これに準拠した。〕

2. 重要な基本的注意

ねむけ、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、本剤投与中の患者には、自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意すること。

3. 相互作用

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
フェノチアジン系薬剤 クロプロマジン塩酸塩等 中枢神経抑制剤 バルビツール酸誘導体等 モノアミン酸化酵素阻害剤 アルコール	相互に作用を増強することがあるので、用量を調節するなど注意すること。	機序不明

4. 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。

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **ショック**：ショック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し、適切な処置を行うこと。
- (2) **中毒性表皮壊死症(Lyell症候群)**：中毒性表皮壊死症(Lyell症候群)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し、適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

下記のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
精神神経系 ^{注1)}	めまい・ふらつき、ねむけ、頭痛・頭重感、倦怠感、脱力感
消化器	腹痛 ^{a)} 、消化不良 ^{b)} 、嘔気、胃腸障害、下痢、便秘、口内乾燥、舌炎、悪心
血液	白血球減少、血小板減少
過敏症	発疹 ^{注2)} 、 ^{c)} 、浮腫・腫脹感 ^{注2)} 、痒痒感、口内炎、熱感

注1) このような症状があらわれた場合には減量又は休業等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。

- a) 胃痛、胃部不快感を含む。
- b) 胃のもたれ(膨満感、胃重感)、胸やけ、食欲不振を含む。
- c) 皮疹、薬疹を含む。

5. 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。

6. 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た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) 授乳中の婦人には、投与しないことが望ましい。

7. 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。

8. 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)

9. その他の注意

本剤を長期間投与する場合は、臨床検査(血液検査、尿検査及び肝機能検査等)を行うことが望ましい。

【薬物動態】

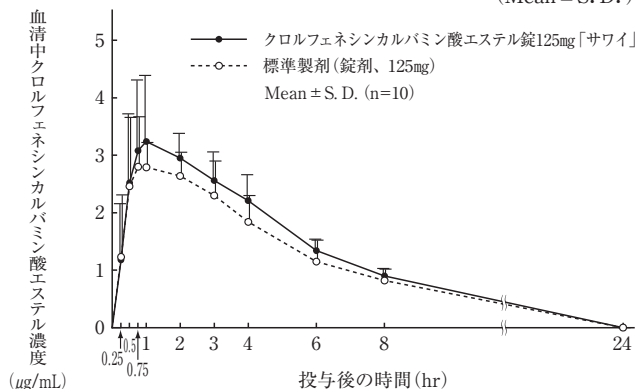
1. 生物学的同等性試験

○クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「サワイ」
クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ2錠(クロルフェネシンカルバミン酸エステルとして250mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血清中クロルフェネシンカルバミン酸エステル濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、 C_{max})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⁾

各製剤2錠投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC _{0-24hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)
クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「サワイ」	3.6 ± 0.7	1.4 ± 0.9	3.2 ± 0.6	23.3 ± 3.2
標準製剤 (錠剤、125mg)	3.3 ± 0.6	1.0 ± 0.8	3.5 ± 0.3	20.7 ± 4.1

(Mean \pm S. D.)

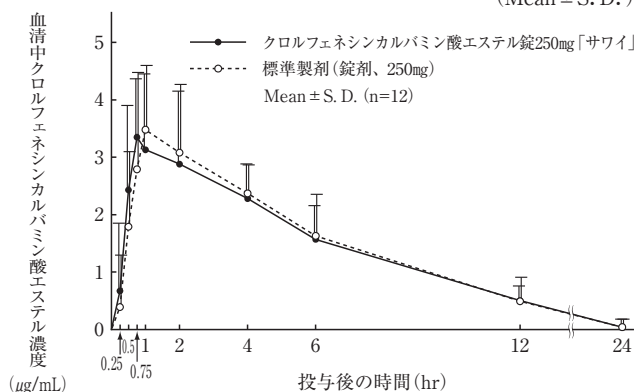


○クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「サワイ」
クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(クロルフェネシンカルバミン酸エステルとして250mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血清中クロルフェネシンカルバミン酸エステル濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、 C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC _{0-24hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)
クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「サワイ」	3.6 ± 1.2	1.2 ± 1.0	3.9 ± 1.2	23.5 ± 8.7
標準製剤 (錠剤、250mg)	3.8 ± 1.2	1.1 ± 0.4	3.7 ± 1.2	23.9 ± 9.8

(Mean \pm S. D.)



血清中濃度ならびに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

本製剤は、日本薬局方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】

脊髄の多シナプス反射経路中の介在ニューロンを選択的に抑制することにより骨格筋の痙縮を緩解する。除脳固縮(γ -固縮)及び貧血性除脳固縮(α -固縮)を共に緩解する。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: クロルフェネシンカルバミン酸エステル

(Chlorphenesin Carbamate)

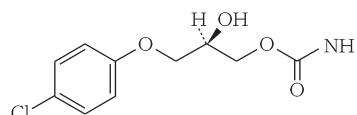
化学名: (2RS)-3-(4-Chlorophenoxy)-2-hydroxypropyl carbamate

分子式: $\text{C}_{10}\text{H}_{12}\text{ClNO}_4$

分子量: 245.66

融点: $88\sim 91^\circ\text{C}$

構造式:



及び鏡像異性体

性状: クロルフェネシンカルバミン酸エステルは白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。メタノール、エタノール(95)又はピリジンに溶けやすく、水に溶けにくい。エタノール(95)溶液(1→20)は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

PTP包装(PTPシートをアルミピロー包装)したもの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。^{3)、4)}

【包装】

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「サワイ」:

PTP: 100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「サワイ」:

PTP: 100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

1)、2) 沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]

3)、4) 沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

TEL: 0120-381-999 FAX: 06-6394-7355

製造販売元

沢井製薬株式会社

大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K11 A140601