

\*\* 2019年4月改訂（第9版、販売会社変更に伴う改訂）  
\* 2009年7月改訂（規制区分の変更）

日本標準商品分類番号  
871225

貯法：室温保存  
使用期限：外箱及び容器に表示

筋緊張性疼痛疾患治療剤

日本薬局方 クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠

\* **リンラキサー<sup>®</sup>錠125mg**  
\* **リンラキサー<sup>®</sup>錠250mg**  
**RINLAXER tab.125mg/tab.250mg**

クロルフェネシンカルバミン酸エステル製剤

	錠125mg	錠250mg
承認番号	21800AMX10185000	21800AMX10186000
薬価収載	2006年6月	2006年6月
販売開始	1979年4月	1984年6月
効能追加	1982年9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】**

販売名	リンラキサー錠 125 mg	リンラキサー錠 250 mg
成分・含量	1錠中 日局 クロルフェネシンカルバミン酸エステル 125 mg	1錠中 日局 クロルフェネシンカルバミン酸エステル 250 mg
添加物	結晶セルロース 軽質無水ケイ酸 ポリソルベート 80 カルメロースカルシウム ヒプロメロース ステアリン酸マグネシウム 硬化油	

販売名	識別コード	剤形	外形・サイズ等		
			上面	下面	側面
リンラキサー錠 125 mg	T 735	白色錠			
			直径 (mm)	厚み (mm)	重量 (mg)
			約 7	約 3.7	約 160
リンラキサー錠 250 mg	T 737	白色錠			
			直径 (mm)	厚み (mm)	重量 (mg)
			約 9	約 4.6	約 320

**【効能・効果】**

運動器疾患に伴う痛性痙縮：

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】**

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に注意すること。
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 [クロルプロマジン塩酸塩等]	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
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		

4. 副作用
 

総症例 16,400 例中、391 例 (2.38 %) 433 件の副作用が認められた。その主なものは、腹痛 109 件、消化不良 63 件、発疹 46 件、嘔気 45 件であった。[剤形追加時]

  - (1) 重大な副作用
    - 1) ショック（頻度不明）：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）（頻度不明）：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。

	0.1~1%未満	0.1%未満	頻度不明
精神神経系 <sup>注1)</sup>	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 <sup>a)</sup> 消化不良 <sup>b)</sup> 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 <sup>注2),c)</sup>	浮腫・腫脹感 <sup>注2)</sup> 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薬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ため、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. 血中濃度<sup>1)</sup>

健常成人に250 mgを空腹時単回経口投与した場合、血清中濃度は以下の通りであった。

	C <sub>max</sub> (μg/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
健常成人(n=6)	3.62	1	3.7

2. 組織中濃度<sup>2)</sup>

(参考) 動物による成績：

ラットに<sup>14</sup>C-クロルフェネシカルバミン酸エステルを経口投与した場合、3時間後の放射活性は胃、小腸、肝、脊髄、副腎、腎の順に高かった。長時間にわたる特定組織への残存は認められなかった。

3. 代謝・排泄<sup>1)</sup>

健常成人に250 mgを空腹時単回経口投与した場合、24時間で尿中には投与量の約92%が排泄され、約84%が未変化体のグルクロン酸抱合体であった。

【臨床成績】<sup>3)~11)</sup>

一般臨床試験及び市販後の調査を含めた運動器疾患に伴う痛性痙縮に対する本剤の効果は以下の通りである。

疾患名	有効率(%)【有効以上】
腰背痛症	68.3 (3267/4786)
変形性脊椎症	57.5 (2695/4689)
椎間板ヘルニア	60.3 (1425/2363)
脊椎分離・辻り症	58.9 ( 458/ 778)
脊椎骨粗鬆症	55.0 ( 516/ 939)
頸肩腕症候群	60.4 (1349/2232)

【薬効薬理】<sup>12)~20)</sup>

1. ネコの脊髄後根電気刺激実験において、本剤は脊髄の多シナプス反射経路における介在ニューロンを選択的に遮断し、神経インパルスの伝達を抑制することにより、骨格筋の痙縮を緩解させる。
2. ラットの脊髄に対して、運動ニューロンの軸索起始部の興奮性を、シナプスの膜安定化作用により低下させ、筋弛緩作用を示す。
3. 除脳ラットのγ-運動ニューロンの自発活動をメフェネシン、メトカルバモールに比し持続的に抑制し、筋弛緩作用を示す。
4. 回転円筒法（マウス、ラット）、傾斜板法（マウス）、握力試験（マウス、ラット）などによる本剤の筋弛緩効果は、メトカルバモールより強く、その作用は持続的である。

筋弛緩作用（マウス回転円筒法）

薬剤名	ED <sub>50</sub> (mg/kg) p. o.	持続時間 (min) i. p.
クロルフェネシカルバミン酸エステル	265.0	115 (100 mg/kg)
メトカルバモール	595.0	60 (200 mg/kg)

5. ラットのSherrington型除脳固縮、Pollock and Davis型貧血性固縮の緩解作用はメフェネシンより強くまた持続的である。
6. ウサギ慢性脳波実験において、本剤は著明な筋弛緩症状を呈する用量においても、脳各部位の覚醒水準に大きく影響を与えず、鎮静作用はごく軽度である。

脳波に対する作用 100 mg/kg i. d.

薬剤名	行動	覚醒反応		
		中脳網様体	視床内側中心核	後部視床下部
クロルフェネシカルバミン酸エステル	筋弛緩著明、軽度鎮静、3時間後回復	閾値上昇率10~20%	閾値上昇率20~40%	閾値上昇率10~25%
クロルメザノン	軽度筋弛緩、鎮静状態、5~6時間後回復	軽度抑制	閾値上昇率50~70%	閾値上昇率40~60%

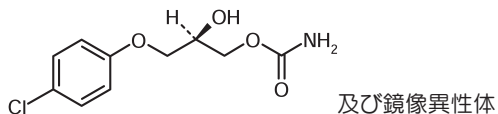
7. 腰部痛、肩凝りを主訴とする患者に本剤を投与し、客観的な評価が可能な筋緊張度測定器により筋緊張度を測定した結果、緊張度の明らかな低下が認められた。
8. 腰痛、背痛、頸部痛及び肩部痛を主訴とする患者に本剤を投与し、皮電点（病変部直上皮膚に生ずる疼痛の投影所見）の検索を行った結果、皮電点の減少が認められた。
9. 腰痛症と診断された患者に本剤を投与し、軀幹最大前屈時の指床間距離の測定、筋電図によるAPテスト（軀幹前屈運動時における活動電位の出現様式による判定）を行った結果、改善が他覚的に認められた。

## 【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) (JAN)

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

構造式：



分子式：C<sub>10</sub>H<sub>12</sub>ClNO<sub>4</sub>

分子量：245.66

性状：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、2-プロパノールにやや溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくく、水に溶けにくく、ヘキサンにほとんど溶けない。本品のエタノール (95) 溶液 (1→20) は旋光性を示さない。

融点：88～91℃

## 【包装】

リンラキサー錠 125 mg：PTP 100 錠、PTP 1000 錠

リンラキサー錠 250 mg：PTP 100 錠、PTP 1000 錠、  
PTP 1050 錠

## 【主要文献】

- 1) 社内資料 (吸収、代謝、排泄に関する資料)
- 2) 野津隆司ほか：応用薬理, **14** (1), 1 (1977)
- 3) 伊丹康人ほか：診療と新薬, **14** (1), 7 (1977)
- 4) 古屋光太郎ほか：診療と新薬, **14** (1), 31 (1977)
- 5) 広畑和志ほか：診療と新薬, **13** (12), 2669 (1976)
- 6) 青木虎吉ほか：医学のあゆみ, **100** (9), 716 (1977)
- 7) 佐野精司ほか：診療と新薬, **13** (12), 2709 (1976)
- 8) 広畑和志ほか：診療と新薬, **14** (1), 45 (1977)
- 9) 広畑和志ほか：現代の診療, **20** (12), 2229 (1978)
- 10) 三浦幸雄ほか：現代の診療, **20** (12), 2237 (1978)
- 11) 広畑和志ほか：診療と新薬, **18** (8), 1834 (1981)
- 12) Matthews, R. J. et al.: Arch. int. Pharmacodyn., **143**, 574 (1963)
- 13) Kurachi, M. et al.: Jpn. J. Pharmacol., **36** (1), 7 (1984)
- 14) 福田英臣ほか：応用薬理, **13** (5), 701 (1977)
- 15) 笹島道忠ほか：応用薬理, **13** (5), 689 (1977)
- 16) 福田英臣ほか：日薬理誌, **70**, 341 (1974)
- 17) 渡辺繁紀ほか：日薬理誌, **73**, 479 (1977)
- 18) 桜井実：診療と新薬, **13** (12), 2645 (1976)
- 19) 立野勝彦ほか：診療と新薬, **13** (12), 2653 (1976)
- 20) 宮崎淳弘ほか：診療と新薬, **13** (12), 2657 (1976)

## \*\*【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

大正製薬株式会社 メディカルインフォメーションセンター  
〒170-8633 東京都豊島区高田 3-24-1  
電話 0120-591-818