

本態性・起立性・透析時低血圧治療剤

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「サワイ」

AMEZINIUM METILSULFATE

アメジニウムメチル硫酸塩錠

貯法：室温保存
開封後は湿気を避けて保存すること
使用期限：外箱に表示

日本標準商品分類番号

87219

承認番号	22700AMX00005000
薬価収載	2015年6月
販売開始	1999年7月

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 高血圧症の患者〔高血圧症を悪化させる。〕
- 2) 甲状腺機能亢進症の患者〔甲状腺機能亢進症を悪化させる。〕
- 3) 褐色細胞腫のある患者〔急激な昇圧発作を起こすおそれがある。〕
- 4) 閉塞隅角緑内障の患者〔急激な眼圧上昇をきたすおそれがある。〕
- 5) 残尿を伴う前立腺肥大のある患者〔尿閉をきたすおそれがある。〕


【組成・性状】

・組成

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「サワイ」は、1錠中にアメジニウムメチル硫酸塩10mgを含有する。

添加物として、ケイ酸Al、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、乳糖、ヒドロキシプロピルスターチを含有する。

・製剤の性状

剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
割線入り素錠	 6.0 約90 2.5 〔識別コード：SW 207〕	白色

【効能・効果】

本態性低血圧、起立性低血圧、透析施行時の血圧低下の改善

【用法・用量】

本態性低血圧、起立性低血圧

通常、成人にはアメジニウムメチル硫酸塩として、1日20mgを1日2回に分割経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

透析施行時の血圧低下の改善

通常、成人にはアメジニウムメチル硫酸塩として、透析開始時に1回10mgを経口投与する。

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)

重篤な心臓障害のある患者〔本剤の交感神経機能亢進作用を介する心臓刺激作用により、心臓障害が悪化するおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

透析施行時の血圧低下への適用にあたっては、透析中に血圧が低下したために透析の継続が困難となることが確認されている慢性腎不全患者のみを対象とすること。

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
ドロキシドパ	血圧の異常上昇をきたすことがある。	ドロキシドパから変換したノルアドレナリンの末梢神経終末における再取り込みと不活性化が、本剤により抑制される。
ノルアドレナリン	血圧の異常上昇をきたすおそれがある。	本剤によりノルアドレナリンの末梢神経終末における再取り込みと不活性化が抑制される。

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。

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹、湿疹、蕁麻疹
循環器	動悸、頻脈、血圧変動、不整脈(期外収縮、心房細動等)、ほてり感、のぼせた感じ、胸部不快感、息苦しさ、浮腫、胸内苦悶感、四肢冷感
精神神経系	めまい、立ちくらみ、頭痛、頭重、気分不良、ふらつき、全身倦怠感、焦躁感、情緒不安定、不眠、眠気、全身のしびれ、耳鳴
消化器	嘔気・嘔吐、腹痛、胸やけ、食欲不振、腹部膨満、下痢、便秘、口渇感
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇等の肝機能異常
その他	排尿障害、白血球減少、発熱、全身熱感、頸部痛、下肢痛、視力障害、歩行障害の悪化、構語障害の悪化

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。

5. 高齢者への投与

投与に際しては少量から開始するなど用量に留意すること。〔高齢者では生理機能(腎機能、肝機能)が低下していることが多い。〕

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 妊婦また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) 本剤投与中は授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット)において乳汁中への移行が報告されている。〕

7. 小児等への投与

乳児および幼児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

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)

【薬物動態】

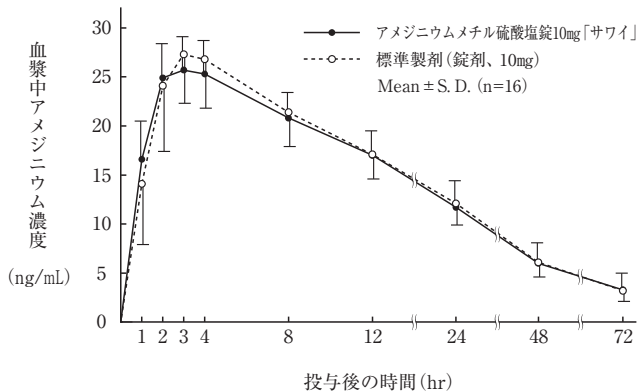
1. 生物学的同等性試験

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(アメジニウムメチル硫酸塩として10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中アメジニウム濃度を測定した。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1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC _{0-72hr} (ng·hr/mL)
アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「サワイ」	26.5 ± 3.2	3.3 ± 0.7	25.5 ± 6.7	741.6 ± 134.1
標準製剤 (錠剤、10mg)	28.0 ± 4.9	3.6 ± 0.6	25.2 ± 4.7	756.7 ± 122.3

(Mean ± S.D.)



血漿中濃度ならびに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。

【薬効薬理】

交感神経終末から放出されたノルアドレナリンの再取り込みを抑制してシナプス間隙のノルアドレナリンの量を増加させる。また、神経終末においてモノアミン酸化酵素を阻害することによってノルアドレナリンの不活化を抑制する。

これらの作用により、間接的に交感神経能を亢進させ心拍出量および末梢血管抵抗を増加させて血圧を上昇させる。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アメジニウムメチル硫酸塩(Amezinium Metilsulfate)

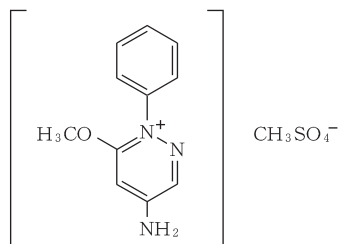
化学名：4-Amino-6-methoxy-1-phenylpyridazinium methyl sulfate

分子式： $C_{12}H_{15}N_3O_5S$

分子量：313.33

融点：約178℃(分解)

構造式：



性状：アメジニウムメチル硫酸塩は白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。水又はメタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)又は酢酸(100)に溶けにくく、アセトン又はクロロホルムに極めて溶けにくく、酢酸エチル、ジエチルエーテル又はヘキサンにほとんど溶けない。

【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(乾燥剤入り))及びバラ包装(アルミ袋(乾燥剤入り))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⁾

*【包装】

PTP：100錠(10錠×10)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

- 1) 沢井製薬(株)社内資料 [生物学的同等性試験]
- 2) 厚生省医薬安全局安全対策課監修：医師・歯科医師・薬剤師のための医薬品服薬指導情報集 16, p.59(1998).
- 3) 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

K12 A190503