

貯法：気密容器で室温保存  
使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること

承認番号	22500AMX01237000
薬価収載	2013年12月
販売開始	2013年12月

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「日医工」

## Amezinium Metilsulfate

アメジニウムメチル硫酸塩錠

### 【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】

#### 1. 組成

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「日医工」は1錠中アメジニウムメチル硫酸塩10mgを含有する。  
添加物として乳糖，セルロース，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を含有する。

#### 2. 製剤の性状

本品は白色の素錠である。

販売名	形状 重量(mg) 直径(mm) 厚さ(mm)	本体 コード	包装 コード
アメジニウム メチル硫酸塩錠 10mg「日医工」	 90 6.0 2.5	n 092	n 092

### 【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 <sup>注1)</sup>	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

乳児及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。）

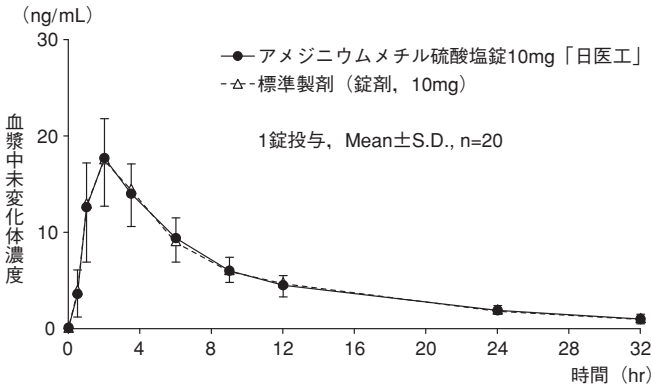
**【薬物動態】**

**1. 生物学的同等性試験**

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（アメジニウムメチル硫酸塩として10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC, Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→32</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「日医工」	158.8±30.3	17.7±4.0	2.0±0.4	9.7±1.6
標準製剤（錠剤, 10mg）	163.2±37.7	18.2±5.0	2.1±0.7	9.8±1.4

(1錠投与, Mean±S.D., n=20)



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。

**2. 溶出挙動**

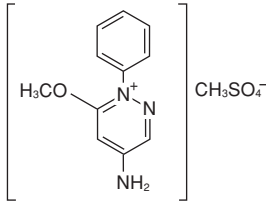
アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「日医工」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアメジニウムメチル硫酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>2)</sup>

**【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 methylsulfate

構造式：



分子式：C<sub>12</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>S

分子量：313.33

性状：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、酢酸(100)又はエタノール(95)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、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

0.1gを水10mLに溶かした液のpHは4.0～6.5である。

融点：約178℃（分解）

**【取扱い上の注意】**

**安定性試験**

本品につき加速試験（40℃, 相対湿度75%, 6ヵ月）を行った結果、アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「日医工」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。<sup>3)</sup>

**【包装】**

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「日医工」

100錠(10錠×10; PTP)

1000錠(10錠×100; PTP)

1000錠(バラ)

**【主要文献】**

- 1) 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

**【文献請求先】**

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948