

貯法
遮光・室温保存

使用期限
外箱に表示(2年)

子宮収縮止血剤
劇薬・処方箋医薬品[※]

メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注0.2mg[F]

メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注射液
METHYLERGOMETRINE MALEATE injection

日本標準商品分類番号
872531

承認番号	22000AMX00354
薬価収載	2008年6月
販売開始	1996年7月

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

1. 妊婦又は妊娠している可能性のある女性(「4.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
2. 児頭娩出前[子宮破裂、胎児死亡のおそれがある。]
3. 本剤又は麦角アルカロイドに対し過敏症の既往歴のある患者
4. 重篤な虚血性心疾患又はその既往歴のある患者[冠動脈のれん縮により、狭心症、心筋梗塞が誘発されることがある。]
5. 敗血症の患者[血管収縮に対する感受性が増大し、症状が悪化するおそれがある。]
6. HIVプロテアーゼ阻害剤(リトナビル、インジナビル、ネルフィナビル、アタザナビル、ホスアンブレナビル、ダルナビル)、エファビレンツ、アゾール系抗真菌薬(イトラコナゾール、ボリコナゾール)、コピシスタット、レテルモビル、5-HT_{1B/1D}受容体作動薬(スマトリプタン、ゾルミトリプタン、エレトリプタン、リザトリプタン、ナラトリプタン)、エルゴタミンを投与中の患者(「2. 相互作用」の項参照)

※※

【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) 高血圧症、妊娠高血圧症候群又は子癇の患者、心疾患又は閉塞性血管障害のある患者[血管収縮作用により、これらの症状が悪化するおそれがある。]
- (2) 肝疾患、腎疾患のある患者[本剤の代謝・排泄が遅延するおそれがある。]

2. 相互作用

本剤は主に代謝酵素CYP3A4で代謝されるので、本酵素の活性に影響を及ぼす薬剤との併用に注意すること。

※※(1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
HIVプロテアーゼ阻害剤 リトナビル(ノービア等) インジナビル(クリキシバン) ネルフィナビル(ピラセプト) アタザナビル(レイアタツ) ホスアンブレナビル(レクシヴァ) ダルナビル(プリジスタ・プリジスタナイーブ) エファビレンツ (ストックリン) アゾール系抗真菌薬 イトラコナゾール(イトリゾール等) ボリコナゾール(ブイフェンド) コピシスタット含有製剤 (スタリビルド)	本剤の血中濃度が上昇し、血管れん縮等の重篤な副作用を起こすおそれがある。	本剤での報告はないが、CYP3A4の競合阻害により、本剤の代謝が阻害されるおそれがある。
レテルモビル (プレバイミス)		CYP3Aの阻害作用により、本剤の代謝が阻害されるおそれがある。
5-HT_{1B/1D}受容体作動薬 スマトリプタン(イミグラン) ゾルミトリプタン(ゾーミック) エレトリプタン(レルパックス) リザトリプタン(マクサルト) ナラトリプタン(アマージ) エルゴタミン (クリアミン)	血圧上昇又は血管れん縮が増強されるおそれがある。なお、5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬と本剤を前後して投与する場合は24時間以上の間隔をあけて投与すること。	これらの薬剤との薬理的相加作用により、相互に作用(血管収縮作用)を増強させる。

【組成・性状】

販売名	メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注0.2mg[F]	
有効成分	日局 メチルエルゴメトリンマレイン酸塩	
含量	0.2mg	
添加物	酒石酸	0.25mg
	塩化ナトリウム(等張化剤)	8.2mg
容量	1 mL	
pH	2.5~3.5	
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	約1	
色調・性状	無色澄明な水溶液	
剤形	注射剤(アンプル)	

【効能・効果】

子宮収縮の促進並びに子宮出血の予防及び治療の目的で次の場合に使用する。

胎盤娩出前後、弛緩出血、子宮復古不全、帝王切開術、流産、人工妊娠中絶

【用法・用量】

メチルエルゴメトリンマレイン酸塩として、通常成人1回0.1~0.2mgを静脈内注射するか、又は0.2mgを皮下、筋肉内注射する。なお、症状により適宜増減する。

《用法・用量に関連する使用上の注意》

静脈内注射は血圧等に注意しながら徐々に行うこと(特に麻酔剤、昇圧剤等を併用する場合)。

※(2) 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
プロモクリプチン	血圧上昇、頭痛、けいれん等があらわれるおそれがある。	機序は明確ではないが、相互に血管収縮作用、血圧上昇作用を増強すると考えられる。
マクロライド系抗生物質 エリスロマイシン クラリスロマイシン シメチジン キヌプリスチン・ダルホプリスチン スチリペントール グレープフルーツジュース	本剤の血中濃度が上昇し、血管れん縮等の重篤な副作用を起こすおそれがある。	本剤での報告はないが、CYP3A4の競合阻害により、本剤の代謝が阻害されるおそれがある。
ネビラピン リファンピシン	本剤の血中濃度が低下し、効果が減弱するおそれがある。	これらの薬剤はCYP3A4を誘導することから本剤の代謝が促進されると考えられる。

3. 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、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、悪心、嘔吐、チアノーゼ、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) 心筋梗塞、狭心症、冠動脈れん縮、房室ブロック：心筋梗塞、狭心症、冠動脈れん縮、房室ブロ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) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹等
循環器	胸痛、胸部圧迫感、血圧上昇、血圧低下、頻脈、徐脈、動悸等
血管系	静脈血栓、末梢循環障害、血管けいれん
精神神経系	頭痛、眠気、めまい、口渇、耳鳴、興奮、幻覚、けいれん、錯感覚等
消化器	悪心、嘔吐、腹痛、下痢等
筋・骨格系	筋けいれん
投与部位	疼痛、硬結
その他	胎盤嵌頓、多汗

注) 発現した場合には投与を中止すること。

4. 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女性には投与しないこと。[子宮収縮作用により、子宮内胎児死亡、流産のおそれがある。]

(2) 授乳中の女性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。[母乳中へ移行することが報告されている。]

5. 過量投与

徴候、症状：悪心、嘔吐、腹痛、しびれ感、手足の刺痛感、血圧上昇、血圧低下、呼吸抑制、低体温、けいれん、昏睡等を生じることがある。

処置：必要に応じて対症療法を行う。

6. 適用上の注意

(1) 筋肉内注射時：筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響を避けるため下記の点に注意すること。

1) 筋肉内注射はやむを得ない場合にのみ必要最小限に行うこと。
同一部位への反復注射は行わないこと。

2) 神経走行部位を避けること。

3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり血液の逆流をみた場合は直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。

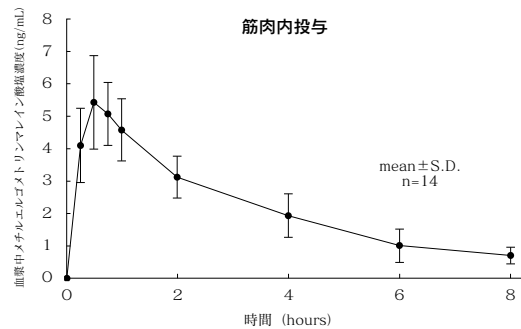
(2) アンブルカット時：本品はワンポイントカットアンブルであるが、アンブルのカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

【薬物動態】

生物学的同等性試験

1. 筋肉内投与

メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注0.2mg「F」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1mL(メチルエルゴメトリンマレイン酸塩として0.2mg)健康成人男子に筋肉内投与して血漿中メチルエルゴメトリンマレイン酸塩濃度を測定し、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⁾



メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注0.2mg「F」の薬物動態パラメータ(筋肉内投与)

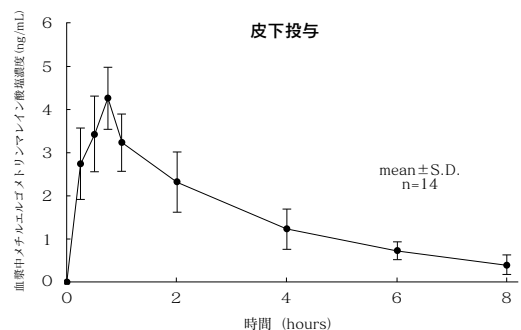
判定パラメータ		参考パラメータ	
AUC _{0→inf} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
20.54±3.36	5.92±1.21	0.66±0.23	2.88±1.44

(mean±S.D., n=14)

* 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. 皮下投与

メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注0.2mg「F」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1mL(メチルエルゴメトリンマレイン酸塩として0.2mg)健康成人男子に皮下投与して血漿中メチルエルゴメトリンマレイン酸塩濃度を測定し、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⁾



メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注0.2mg「F」の薬物動態パラメータ (皮下投与)

判定パラメータ		参考パラメータ	
AUC _{0→inf} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
13.89±2.15	4.26±0.72	0.75±0.00	3.22±3.02

(mean±S.D., n=14)

* 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。

※【薬効薬理】

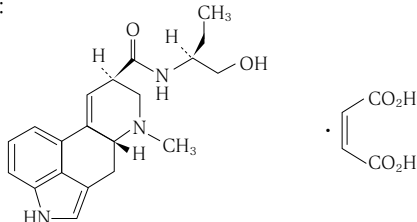
メチルエルゴメトリンマレイン酸塩は、パッカアルカロイドをメチル化した合成化合物であるが、エルゴメトリンと比べて、子宮収縮作用の強さと持続性が上昇している。臨床的には子宮収縮薬として使用される。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：メチルエルゴメトリンマレイン酸塩
(Methylethergometrine Maleate)

化学名：(8S)-N-[(1S)-1-(Hydroxymethyl)propyl]-6-methyl-9,10-didehydroergoline-8-carboxamide monomaleate

構造式：



分子式：C₂₀H₂₅N₃O₂ · C₄H₄O₄

分子量：455.50

性状：白色～微黄色の結晶性の粉末で、においはない。
水、メタノール又はエタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
光によって徐々に黄色となる。
融点：約190℃ (分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(1～30℃、遮光、2年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、メチルエルゴメトリンマレイン酸塩注0.2mg「F」は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。³⁾

【包装】

0.2mg/1 mL 10アンプル、50アンプル

【主要文献】

- 1) 富士製薬工業株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)
- ※2) 第十六改正日本薬局方解説書 (廣川書店) C-4819 (2011)
- 3) 富士製薬工業株式会社 社内資料 (安定性試験)

【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。
富士製薬工業株式会社 富山工場 学術情報課
〒939-3515 富山県富山市水橋辻ヶ堂1515番地
(TEL) 076-478-0032
(FAX) 076-478-0336

