

承認番号	23000AMX00147
薬価収載	2018年 6月
販売開始	1997年 11月

筋緊張・痙性麻痺改善剤

処方箋医薬品<sup>注)</sup>

# エペリゾン塩酸塩錠50mg「あすか」

EPERISONE HYDROCHLORIDE TABLETS

\* 貯 法：気密容器、室温保存  
アルミビロー開封後は光を避けて  
保存すること（変色することがある）。  
エペリゾン塩酸塩錠

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

使用期限：外箱等に表示

**【禁 忌】** (次の患者には投与しないこと)  
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

**【組成・性状】**

販 売 名	エペリゾン塩酸塩錠50mg「あすか」		
成分・含量	1錠中 日局エペリゾン塩酸塩 50mg		
添 加 物	結晶セルロース、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、カルメロース、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、フマル酸・ステアリン酸・ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート・ヒドロキシプロピルメチルセルロース2910混合物、酸化チタン、マクロゴール6000		
剤 形	白色フィルムコーティング錠		
外 形	表	側 面	裏
	直径約 7.2mm 厚さ約 4.0mm 重量約 130mg		
識別コード	G155		

**【効能・効果】**

下記疾患による筋緊張状態の改善  
頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、腰痛症

下記疾患による痙性麻痺

脳血管障害、痙性脊髄麻痺、頸部脊椎症、術後後遺症（脳・脊髄腫瘍を含む）、外傷後遺症（脊髄損傷、頭部外傷）、筋萎縮性側索硬化症、脳性小児麻痺、脊髄小脳変性症、脊髄血管障害、スモン（SMON）、その他の脳脊髄疾患

**【用法・用量】**

通常成人には1日量として3錠（エペリゾン塩酸塩として150mg）を3回に分けて食後に経口投与する。  
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) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- (2) 肝障害のある患者  
[肝機能を悪化させることがある。]

2. 重要な基本的注意

本剤投与中に脱力感、ふらつき、眠気等が発現することがあるので、その場合には減量又は休薬すること。なお、本剤投与中の患者には自動車の運転など危険を伴う機械の操作には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
メトカルバモール	類似薬のトルペリゾン塩酸塩で、眼の調節障害があらわれたとの報告がある。	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

- 1) ショック、アナフィラキシー様症状（頻度不明）：  
ショック、アナフィラキシー様症状を起こすことがあるので、観察を十分に行い、発赤、そう痒感、蕁麻疹、顔面等の浮腫、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) 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis: TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群等の重篤な皮膚障害を起こすことがあるので、観察を十分に行い、発熱、紅斑、水疱、そう痒感、眼充血、口内炎等の症状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
肝 臓 <sup>注1)</sup>	AST (GOT)、ALT (GPT)、ALP の上昇等
腎 臓 <sup>注1)</sup>	蛋白尿、BUN の上昇等
血 液 <sup>注1)</sup>	貧血
過 敏 症 <sup>注2)</sup>	発疹、そう痒、多形滲出性紅斑
精神神経系	眠気、不眠、頭痛、四肢のしびれ、体のこわばり、四肢のふるえ
消 化 器	悪心・嘔吐、食欲不振、胃部不快感、腹痛、下痢、便秘、口渇、口内炎、腹部膨満感
泌 尿 器	尿閉、尿失禁、残尿感
全身症状	脱力感、ふらつき、全身倦怠感、筋緊張低下、めまい
そ の 他	ほてり、発汗、浮腫、動悸、しゃっくり

注1) このような症状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、投与を中止するなど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。

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。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳中の女性に投与することは避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合には、授乳を避けさせること。

[動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。]

## 7. 小児等への投与

小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

## 8. 適用上の注意

### 薬剤交付時

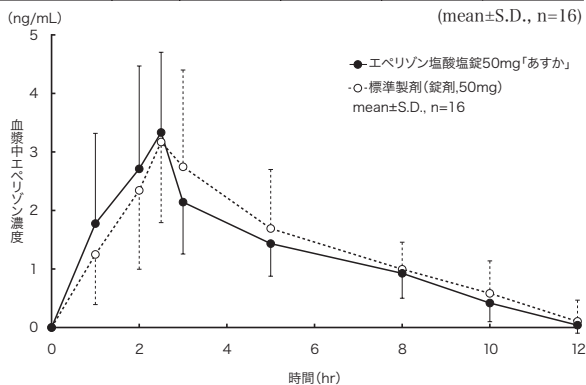
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)。

## 【薬物動態】

### 1. 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

健康成人男性にエペリゾン塩酸塩錠 50mg「あすか」と標準製剤それぞれ3錠(エペリゾン塩酸塩として150mg)をクロスオーバー法により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。

	投与量	AUC <sub>0-12</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エペリゾン塩酸塩錠 50mg「あすか」	150mg	15.25 ±4.98	3.96 ±1.59	2.19 ±0.54	3.819 ±1.259
標準製剤 (錠剤, 50mg)	150mg	16.25 ±5.99	4.23 ±1.57	2.66 ±0.72	4.567 ±1.478



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<sup>2)</sup>

エペリゾン塩酸塩錠 50mg「あすか」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたエペリゾン塩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。

## 【臨床成績】<sup>3~6)</sup>

頸肩腕症候群、肩関節周囲炎及び腰痛症患者を対象に、本剤を1回1錠、1日3回、1~12週間投与した結果、総症例78例中、改善以上は52.6%(41/78)、やや改善以上は76.9%(60/78)であった。

## 【薬効薬理】<sup>7)</sup>

### 1. 筋弛緩作用

エペリゾン塩酸塩は懸垂法により、100mg/kg以上で筋弛緩作用を示した(マウス、経口)。

### 2. 実験的固縮の抑制作用

#### (1) Sherrington 型除脳固縮

エペリゾン塩酸塩は Sherrington 型除脳固縮(γ-固縮)による筋放電頻度を用量依存的に抑制した(ラット、十二指腸内)。

#### (2) 虚血性除脳固縮

エペリゾン塩酸塩は虚血性除脳固縮(α-固縮)による筋放電頻度を用量依存的に抑制した(ラット、十二指腸内)。

### 3. 脊髄反射電位の抑制

エペリゾン塩酸塩はラット脊髄後根刺激後の単シナプス及び多シナプス反射電位のいずれにも、用量依存的にほぼ同程度抑制した(ラット、十二指腸内)。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

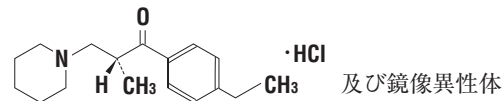
一般名：エペリゾン塩酸塩

Eperisone Hydrochloride [JAN]

化学名：(2RS)-1-(4-Ethylphenyl)-2-methyl-3-piperidin-1-ylpropan-1-one monohydrochloride

分子式：C<sub>17</sub>H<sub>25</sub>NO·HCl

化学構造式：



分子量：295.85

性状：白色の結晶性の粉末である。

水、メタノール又は酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けやすい。

融点：約167℃(分解)

メタノール溶液(1→100)は旋光性を示さない。

## 【取扱い上の注意】

### 安定性試験<sup>8)</sup>

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温, 3年)の結果、エペリゾン塩酸塩錠 50mg「あすか」は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。

## 【包装】

エペリゾン塩酸塩錠 50mg「あすか」： 100錠(10錠×10)  
500錠(10錠×50)

## 【主要文献】

- 1) 社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 社内資料(溶出試験)
- 3) 木村 哲彦 他：基礎と臨床, **24**：8175, 1990
- 4) 菅谷 修一 他：基礎と臨床, **24**：8185, 1990
- 5) 小林 正之 他：基礎と臨床, **25**：337, 1991
- 6) 味八木 二郎 他：新薬と臨床, **41**：1171, 1992
- 7) 河野 修 他：薬理と治療, **19**：1743, 1991
- 8) 社内資料(安定性試験)

## 【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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ください。

あすか製薬株式会社 くすり相談室

〒108-8532 東京都港区芝浦二丁目5番1号

TEL 0120-848-339

FAX 03-5484-8358

製造販売元

**あすか製薬株式会社**

東京都港区芝浦二丁目5番1号

販売

**武田薬品工業株式会社**

大阪市中央区道修町四丁目1番1号