

筋緊張改善剤

規制区分:
処方箋医薬品
注意-医師等の処方箋により
使用すること

エペリゾン 塩酸塩錠50mg「アメル」

EPERISONE HCl

〈エペリゾン塩酸塩製剤〉

承認番号	30100AMX00367
薬価収載	2020年6月
販売開始	2020年7月

貯法:

気密容器、室温保存
開封後は防湿して保存すること。

使用期限:

包装箱に表示。
使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。

【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】

1. 組成

販売名	エペリゾン塩酸塩錠50mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局エペリゾン塩酸塩50mgを含有する。
添加物	結晶セルロース、トウモロコシデンプン、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、精製白糖、沈降炭酸カルシウム、タルク、ポリオキシエチレン(105)ポリオキシプロピレン(5)グリコール、アラビアゴム末、ゼラチン、酸化チタン、カルナウバロウ

2. 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
エペリゾン塩酸塩錠50mg「アメル」	糖衣錠		KW630
	白色	直径:約7.4mm 厚さ:約4.3mm 質量:約175mg	

【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)

- 薬物過敏症の既往歴のある患者
- 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等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(頻度不明)

- ショック、アナフィラキシー様症状: 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、掻痒感、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。
- 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): 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、掻痒感、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

以下のような副作用が認められた場合には、投与を中止するなど症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
肝臓 ^(注1)	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇等
腎臓 ^(注1)	蛋白尿、BUNの上昇等
血液 ^(注1)	貧血
過敏症 ^(注2)	発疹、掻痒、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)授乳中の婦人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)

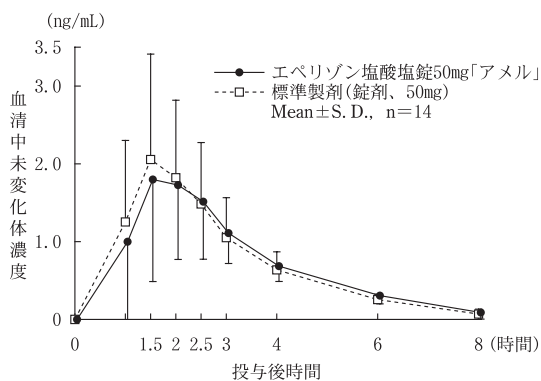
【薬物動態】

〈生物学的同等性試験〉¹⁾

エペリゾン塩酸塩錠50mg「アメル」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(エペリゾン塩酸塩として50mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清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。

	AUC ₍₀₋₈₎ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エペリゾン塩酸塩錠 50mg「アメル」	5.83±2.46	2.25±1.34	1.75±0.43	1.65±0.31
標準製剤 (錠剤、50mg)	5.95±2.55	2.37±1.22	1.61±0.35	1.62±0.41

(Mean ± S. D., n=14)



血清中濃度並びに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。

〈溶出挙動〉²⁾

エペリゾン塩酸塩錠50mg「アメル」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50mg錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

脊髄において単及び多シナプス反射を抑制するとともに、 γ -運動ニューロンの自発発射を減少させ、筋紡錘の感度を低下させることで、メフェネシンよりも強力な骨格筋弛緩作用を発揮する。また、中脳毛様体及び後部視床下部を介する脳波覚醒反応を抑制する作用や、血管平滑筋のCa²⁺チャネル遮断や交感神経活動の抑制を介して、皮膚・筋や脳への血流量を増大させる作用もある。脊髄レベルにおける鎮痛作用も有する。³⁾

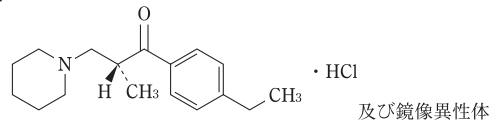
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エペリゾン塩酸塩(Eperisone Hydrochloride)

分子式：C₁₇H₂₅NO・HCl

分子量：295.85

構造式：



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

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)。

本品のメタノール溶液(1→100)は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

〈安定性試験〉⁴⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、エペリゾン塩酸塩錠50mg「アメル」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。

*【包装】

PTP100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 共和薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書、廣川書店、C-986(2016)
- 4) 共和薬品工業株式会社 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。
共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口
〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4
☎ 0120-041-189
FAX 06-6121-2858

製造販売元

共和薬品工業株式会社
大阪市北区中之島3-2-4