

貯 法：室温保存
有効期間：3年本態性・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アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「サワイ」
AMEZINIUM METILSULFATE Tablets [SAWAI]日本標準商品分類番号
87219承認番号 22700AMX00005000
販売開始 1999年7月**2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)**

- 2.1 高血圧症の患者[高血圧症を悪化させる。]
2.2 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。]
* 2.3 褐色細胞腫又はパラガングリオーマのある患者[急激な昇圧発作を起こすおそれがある。]
2.4 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。]
2.5 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。]

3. 組成・性状**3.1 組成**

有効成分 [1錠中]	アメジニウムメチル硫酸塩 10mg
添加剤	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

3.2 製剤の性状

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

4. 効能又は効果

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

5. 効能又は効果に関連する注意**〈透析施行時の血圧低下の改善〉**

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。

6. 用法及び用量**〈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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意**9.1 合併症・既往歴等のある患者****9.1.1 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。

9.5 妊婦

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。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

9.7 小児等

乳児及び幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

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。生理機能(腎機能、肝機能)が低下していることが多い。

10. 相互作用**10.2 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
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		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。

11. 副作用

次の副作用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。

11.2 その他の副作用

	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症		発疹、湿疹、じん麻疹	
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、焦燥感、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、ALT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)発現頻度は市販後の調査を含む。

14. 適用上の注意**14.1 薬剤交付時の注意**

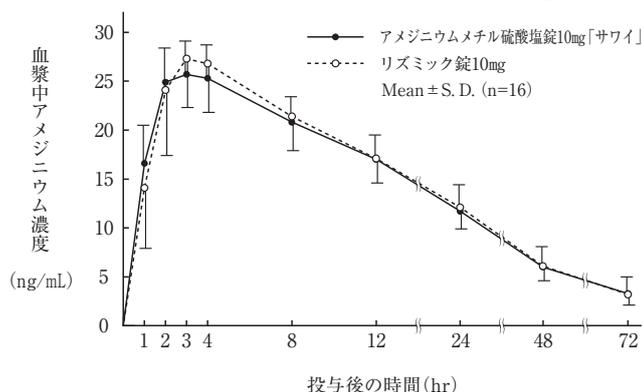
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

16. 薬物動態**16.1 血中濃度****16.1.1 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」とリズミック錠10mg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、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⁾。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (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
リズミック錠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、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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

アメジニウムは、ノルアドレナリンと競合して末梢の神経終末に取り込まれ、ノルアドレナリンの神経終末への再取り込みを抑制するとともに、神経終末においてノルアドレナリンの不活性化を抑制し、交感神経機能を亢進させる²⁾⁻⁵⁾。

19. 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)

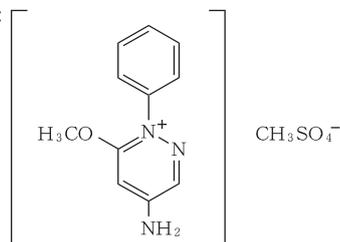
化学名：4-Amino-6-methoxy-1-phenylpyridazinium methyl sulfate

分子式：C₁₂H₁₅N₃O₅S

分子量：313.33

融点：約178℃ (分解)

構造式：



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、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。

20. 取扱い上の注意

アルミビロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

22. 包装

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験
- 島野尚仁他：薬理と治療, 1988；16：1433-1441
- 古川清他：薬理と治療, 1988；16：1443-1453
- Lenke, D. et al. : *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, 1981；31：1558-1565
- Traut, M. et al. : *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, 1981；31：1566-1574

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

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：06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 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

KA1 A231004