

本態性・起立性・透析時低血圧治療剤

アmezニウムメチル硫酸塩錠

アmezニウムメチル硫酸塩錠 10mg「トワ」

AMEZINIUM METILSULFATE TABLETS 10mg “TOWA”

貯法：室温保存

有効期間：3年

承認番号	22900AMX00608
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

1錠中の有効成分	アmezニウムメチル硫酸塩 ……………10mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度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、軽質無水ケイ酸

3.2 製剤の性状

性状・剤形	白色の割線入り素錠		
識別コード	Tw121		
外形	表	裏	側面
			
直径(mm)	6.5		
厚さ(mm)	2.3		
質量(mg)	100		

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mez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mez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	血圧の異常上昇をきたすおそれがある。	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

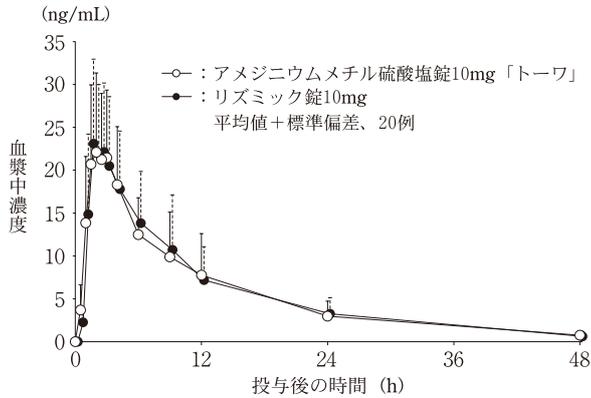
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

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「トーワ」とリズミック錠10mg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⁾



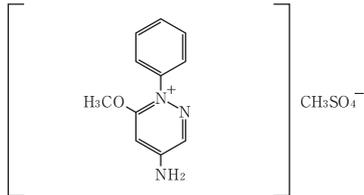
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (h)	t _{1/2} (h)
アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「トーワ」	266.3±112.2	24.76±8.47	2.28±0.75	10.39±2.65
リズミック錠10mg	270.9±114.4	25.03±9.15	1.88±0.51	9.79±2.37

(平均値±標準偏差、20例)

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。

19. 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



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

分子式：C₁₂H₁₅N₃O₅S

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10mLに溶かした液のpHは4.0～6.5である。

融点：約178℃（分解）

20. 取扱い上の注意

アルミビロー又は瓶開封後は吸湿に注意すること。

22. 包装

100錠 [10錠×10：PTP、乾燥剤入り]

500錠 [バラ、乾燥剤入り]

23. 主要文献

1) 社内資料：生物学的同等性試験

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター

〒570-0081 大阪府守口市市日吉町2丁目5番15号

TEL 0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号