

貯 法：室温保存

有効期間：3年

承認番号 22100AMX01774000

販売開始 1959年10月

強心・喘息治療剤

処方箋医薬品^{注)}

プロキシフィリン注射液

モノフィリン[®]注200mgMONOPHYLLINE[®] Injection

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤、又は他のキサンチン系薬剤に対し、重篤な副作用の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	モノフィリン注200mg
有効成分	1管中 プロキシフィリン 200mg/2mL
添加剤	等張化剤、pH調節剤

3.2 製剤の性状

販売名	モノフィリン注200mg
剤形・性状	水性注射剤 無色澄明の液
pH	5.0～6.5
浸透圧比	約0.9 (生理食塩液に対する比)

4. 効能又は効果

気管支喘息、喘息性（様）気管支炎、うっ血性心不全

6. 用法及び用量

プロキシフィリンとして、通常、成人1回200mgを皮下、筋肉内または静脈内注射する。
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 急性心筋梗塞、重篤な心筋障害のある患者

心筋刺激作用を有するため、症状を悪化させるおそれがある。

9.1.2 てんかんの患者

中枢刺激作用によって発作を起こすおそれがある。

9.1.3 甲状腺機能亢進症の患者

甲状腺機能亢進に伴う代謝亢進、カテコールアミンの作用を増強するおそれがある。

9.1.4 急性腎炎の患者

腎臓に対する負荷を高め尿蛋白が増加するおそれがある。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。

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。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

本剤は主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがある。

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
他のキサンチン系薬剤 テオフィリン コリンテオフィリン ジプロフィリン カフェイン等 中枢神経興奮薬	過度の中枢神経刺激作用があらわれることがあるので、これらの薬剤とは併用しないことが望ましいが、やむをえず併用する場合には減量するなど慎重に投与すること。	キサンチン系薬剤の中枢神経興奮作用が、併用により増強されることがある。
ハロタン	頻脈、心室性細動等の不整脈を起こすおそれがある。	本剤の血中濃度が上昇することがある。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック（頻度不明）

[14.2参照]

11.1.2 痙攣、意識障害（頻度不明）

痙攣又はせん妄、昏睡等の意識障害があらわれることがあるので、抗痙攣剤の投与等適切な処置を行うこと。

11.1.3 急性脳症（頻度不明）

痙攣、意識障害等に引き続き急性脳症に至ることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、抗痙攣剤の投与等適切な処置を行うこと。

11.1.4 横紋筋融解症（頻度不明）

脱力感、筋肉痛、CK上昇等に注意し、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うとともに横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	頻度不明
精神神経系	頭痛、不眠	
循環器	心悸亢進	
消化器	悪心・嘔吐、食欲不振、腹痛、下痢	
過敏症		発疹

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 投与経路

- 筋肉内注射により、ときに局所の疼痛を起こすことがある。
- 皮下又は筋肉内に投与する場合には神経走行部位を避けるよう注意すること。
- 筋肉内への反復投与の必要がある場合には同一注射部位を避け左右交互に行うなどの配慮をすること。
- 乳児、幼児、小児には、特に組織・神経などへの影響を避けるため、連用しないことが望ましい。

14.2 投与速度

急速に静脈内注射すると、上記の副作用のほか、顔面紅潮、熱感、不整脈、まれにショック等があらわれることがあるので、ゆっくり注射すること。[11.1.1参照]

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人にプロキシフィリン7mg/kg (29 μ mol/kg) を静脈内投与 (10分間以上の定速注入) した場合、血清中未変化体濃度は2相性で消失し、 β 相の消失半減期は7.8~11.3時間であった。全身クリアランスは44~53mL/h \cdot kgであった¹⁾ (外国人のデータ)。

16.3 分布

健康成人にプロキシフィリン7mg/kg (29 μ mol/kg) を静脈内投与 (10分間以上の定速注入) した場合、見かけの分布容積は0.53~0.72L/kgであった¹⁾ (外国人のデータ)。

16.5 排泄

健康成人にプロキシフィリン7mg/kg (29 μ mol/kg) を静脈内投与したときの3日目までの尿中には未変化体が投与量の18~26%排泄され、腎クリアランスは8~13mL/h \cdot kgであった¹⁾ (外国人のデータ)。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

テオフィリンの7-hydroxypropyl誘導体で、ホスホジエステラーゼ阻害による細胞内サイクリックAMPの増加、アデニン受容体遮断、細胞内貯蔵Ca²⁺の遊離促進などの作用を示す。これらが総合して、骨格筋興奮、心筋興奮 (心拍数と収縮力の増加)、平滑筋弛緩、などの作用を示す。また、中枢興奮作用や、主として強心作用に由来する二次的利尿作用なども示す²⁾。

18.2 筋収縮力増加作用

ネコの摘出乳頭筋を用いた実験で、筋収縮力の増加作用はジプロフィリンとほぼ同等であり、テオフィリンの約0.5倍であった³⁾。

18.3 気管支痙攣緩解作用

モルモットの摘出肺を用いた実験で、ヒスタミンによる気管支痙攣に対する抑制作用はジプロフィリンの約1.5倍、テオフィリンの約0.25倍であった⁴⁾。

18.4 利尿作用

ウサギを用いた実験で、200mg/kg経口投与により130%の尿量増加 (20~60分) が認められた⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：プロキシフィリン (Proxiphylline)

化学名：7-(β -Hydroxypropyl)theophylline

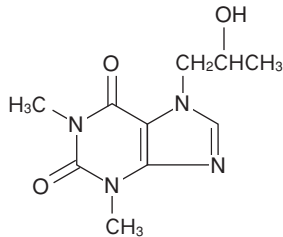
分子式：C₁₀H₁₄N₄O₃

分子量：238.25

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

水に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすく、無水酢酸又はアセトンにやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくい。

化学構造式：



融点：134~138°C

22. 包装

2mL \times 50管

23. 主要文献

- 1) Selvig K. : Eur. J. Clin. Pharmacol. 1981 ; 19 (2) : 149-155
- 2) 第十七改正日本薬局方解説書 廣川書店 2016 ; C3160-C3164
- 3) Kuschinsky G., et al. : Arzneimittel. Forsch. 1958 ; 8 (1) : 14-18
- 4) Jacobi H., et al. : Arzneimittel. Forsch. 1956 ; 6 (1) : 41-43
- 5) 北尾範子 他 : 日本薬理学雑誌. 1959 ; 55 (3) : 507-523

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

TEL (0120) 517-215

FAX (076) 442-8948

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **日医工株式会社**
NICHIKO 富山市総曲輪1丁目6番21