

※※印：2015年2月改訂(第13版)
 ※印：2014年6月改訂

日本標準商品分類番号
 871249

貯法：室温・気密容器保存
 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。
 取扱い上の注意：「**取扱い上の注意**」の項参照
 ※ 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)

※※	承認番号	22600AMX00125000
※※	薬価収載	2015年6月
	販売開始	1990年9月
	再評価結果 (品質再評価)	1999年3月

筋緊張改善剤

※※ **エペリゾン** 塩酸塩錠 50mg「TEVA」

Eperisone Hydrochloride Tab. 50mg “TEVA”

エペリゾン塩酸塩錠

【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】

組 成	1錠中：エペリゾン塩酸塩 ……………50mg (添加物) エチルセルロース、クエン酸カルシウム、クロスカルメロースナトリウム、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ヒプロメロース、プルラン、マクロゴール6000		
	性 状 わずかに特異なおいを有する白色のフィルムコーティング錠		
識別コード (PTP)	t EPN 50mg		
外 形 (サイズ)	表(直径mm)	裏(重量mg)	側面(厚さmm)
	 6.1	 74	 3.0

【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)
 - (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**(頻度不明)

- 1) **ショック、アナフィラキシー** ショック、アナフィラキシー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)**
 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 ^{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、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)。

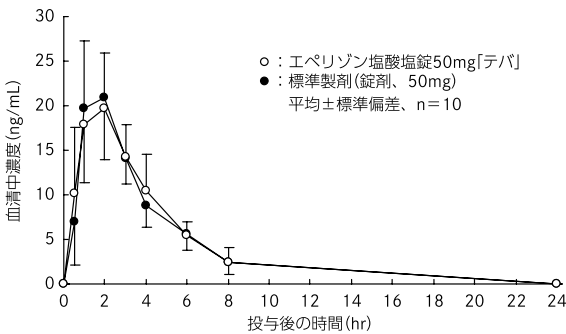
8. 適用上の注意

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、更には穿孔をお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¹⁾

エペリゾン塩酸塩錠50mg「テバ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ3錠(エペリゾン塩酸塩として150mg)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。(1回投与量：承認外用量)



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=10)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エペリゾン塩酸塩錠50mg「テバ」	150	101.3 ± 18.0	23.5 ± 3.8	1.5 ± 0.5	2.6 ± 1.6
標準製剤 (錠剤、50mg)	150	99.4 ± 10.8	24.2 ± 4.9	1.5 ± 0.5	2.7 ± 1.2

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。

2. 溶出性²⁾

エペリゾン塩酸塩錠50mg「テバ」の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】³⁾

エペリゾン塩酸塩は中枢性筋弛緩剤に分類され、主に脊髄レベルに作用し脊髄反射を抑制することにより骨格筋緊張緩和作用を示す。また、本剤は、血管拡張に基づく筋組織等の血流改善作用も有し、これらの作用により筋緊張性症候の改善にはたらくものと考えられている。

1. 骨格筋緊張緩和作用

(1) 除脳固縮抑制作用

エペリゾン塩酸塩(1.25~5.0mg/kg, i.v.)は、ラットの上丘-下丘間除脳固縮(γ-固縮)及び貧血性除脳固縮(α-固縮)に対して用量依存的な抑制作用を示した。また、その作用はトルペリゾン塩酸塩とほぼ同等、クロロフェネシカルバミン酸エステルより強力であった。

(2) 筋弛緩作用

エペリゾン塩酸塩(150~200mg/kg, p.o.)は、マウスの懸垂法及び回転円筒法において有意な筋弛緩作用を示した。また、その作用はトルペリゾン塩酸塩及びクロロフェネシカルバミン酸エステルより強力であった。

2. 血流増加作用

エペリゾン塩酸塩(3.0~9.0mg/kg, i.v.)は、イヌの椎骨動脈、総頸動脈、大腿動脈及び大腿部内側の皮膚血流に対して血流増加作用を示した。

3. 鎮痛作用

エペリゾン塩酸塩(200mg/kg, p.o.)は、マウスの疼痛反応(Tail pinch法)を有意に抑制した。

【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)

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

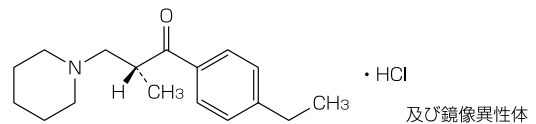
分子式：C₁₇H₂₅NO·HCl

分子量：295.85

融点：約167℃(分解)

性状：エペリゾン塩酸塩は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。メタノール溶液(1→100)は旋光性を示さない。

構造式：



※【取扱い上の注意】⁴⁾

安定性試験結果の概要

長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年)の結果、エペリゾン塩酸塩錠50mg「テバ」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「テバ」

PTP包装：100錠(10錠×10)、1,200錠(10錠×120)

【主要文献】

- 1) テバ製薬(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) テバ製薬(株)社内資料(溶出試験)
- 3) テバ製薬(株)社内資料(薬効薬理試験)
- 4) テバ製薬(株)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】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

テバ製薬株式会社 DIセンター

〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

TEL 0120-923-093 FAX 052-459-2853

受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

製造販売元

テバ製薬株式会社

名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

BT5B70