

日本薬局方
イフェンプロジル酒石酸塩錠
* **イフェンプロジル酒石酸塩錠10mg「あすか」** **
* **イフェンプロジル酒石酸塩錠20mg「あすか」**

	10mg	20mg
* 承認番号	23000AMX00148	23000AMX00149
* 薬価収載	2018年6月	2018年6月
販売開始	1984年8月	1987年10月
再評価結果	1999年9月	

IFENPRODIL TARTRATE TABLETS

貯 法：気密容器，室温保存
使用期限：外箱等に表示

【禁 忌】 (次の患者には投与しないこと)
頭蓋内出血発作後，止血が完成していないと考えられる患者

【組成・性状】

* 販 売 名	イフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg「あすか」	イフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg「あすか」				
成分・含量	1錠中 日局イフェンプロジル酒石酸塩 10mg	1錠中 日局イフェンプロジル酒石酸塩 20mg				
添 加 物	結晶セルロース，ステアリン酸マグネシウム，トモロコシデンプン，乳糖水和物，ヒドロキシプロピルセルロース	結晶セルロース，ステアリン酸マグネシウム，乳糖水和物，ヒドロキシプロピルセルロース，ポビドン				
剤 形	白色素錠					
外 形	表	側面	裏	表	側面	裏
識別コード	G223			G224		

【効能・効果】

脳梗塞後遺症，脳出血後遺症に伴うめまいの改善

【用法・用量】

イフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg「あすか」
通常成人には，1回2錠（イフェンプロジル酒石酸塩として20mg）を1日3回毎食後経口投与する。
イフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg「あすか」
通常成人には，1回1錠（イフェンプロジル酒石酸塩として20mg）を1日3回毎食後経口投与する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤の投与期間は，臨床効果及び副作用の程度を考慮しながら慎重に決定するが，投与12週で効果が認められない場合には投与を中止すること。

【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) 脳梗塞発作直後の患者
[脳内盗血現象を起こすおそれがある.]
 - (2) 低血圧のある患者
[血圧低下を増強するおそれがある.]
 - (3) 心悸亢進のある患者
[心機能を亢進させるおそれがある.]

2. 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
出血傾向をきたすと考えられる薬剤	出血傾向が増強されるおそれがある。	本剤の血小板粘着能・凝集能抑制作用による。
ドロキシドパ	ドロキシドパの作用を減弱するおそれがある。	本剤のα1受容体遮断作用による。

3. 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。

	頻 度 不 明
消 化 器	口渇，悪心・嘔吐，食欲不振，胸やけ，下痢，便秘，口内炎，腹痛
精神神経系	頭痛，めまい，不眠，眠気
過 敏 症	発疹，皮膚そう痒感
循 環 器	動悸，立ちくらみ，頻脈，顔面潮紅，のぼせ感
肝 臓	AST (GOT)・ALT (GPT) 上昇
血 液	貧血
そ の 他	顔面浮腫，上・下肢のしびれ感

4. 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。

5. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

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。
[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない.]

6. 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】

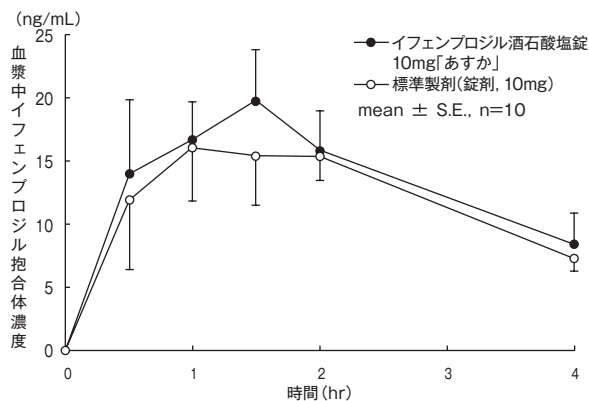
1. 生物学的同等性試験¹⁾

健康成人男性にイフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg「あすか」又はイフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg「あすか」と標準製剤それぞれイフェンプロジル酒石酸塩として20mgを，クロスオーバー法により絶食単回経口投与して血漿中イフェンプロジル抱合体濃度を測定し，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) イフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg「あすか」

	投与量	AUC ₀₋₄ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)
イフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg「あすか」	20mg (2錠)	53.4 ±8.3	27.9 ±4.3	1.4 ±0.3
標準製剤 (錠剤，10mg)	20mg (2錠)	48.3 ±5.9	26.7 ±4.2	1.6 ±0.3

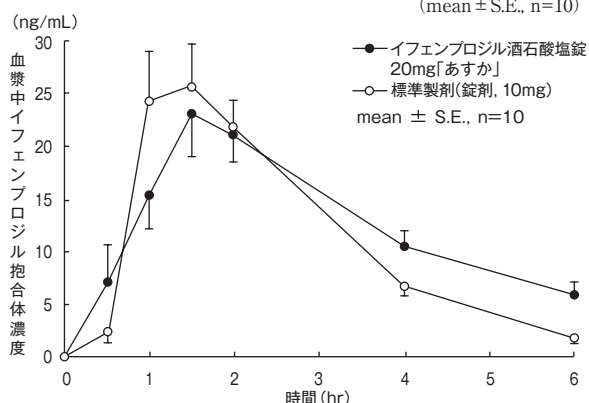
(mean ± S.E., n=10)



(2) イフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg 「あすか」

	投与量	AUC ₀₋₆ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)
イフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg「あすか」	20mg (1錠)	75.33 ± 10.32	26.6 ± 3.3	1.7 ± 0.1
標準製剤 (錠剤, 10mg)	20mg (2錠)	68.45 ± 7.28	32.1 ± 2.7	1.4 ± 0.1

(mean ± S.E., n=10)



血漿中濃度並びにAUC, C_{max}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. 溶出挙動²⁾

イフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg 「あすか」及びイフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg 「あすか」は, 日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたイフェンプロジル酒石酸塩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】

1. 脳血管拡張作用³⁾

摘出血管のK⁺による収縮に対し弛緩作用が認められ, 弛緩作用は脳底動脈において大腿動脈より強く認められている(イヌ)。なお, 脳血管拡張作用の機序はα遮断作用とともにCa拮抗作用も関与していると考えられる。

2. 脳血流増加作用^{4, 5)}

- (1) 脳血管障害患者の脳血流量を増加させることが認められている (¹³³Xe-クリアランス法)。
- (2) 椎骨動脈の血流量を特異的かつ持続的に増加させることが認められている (モルモット, ラット, 超音波トランジットタイム法)。
- (3) 大脳基底核部の血流量を持続的に増加させることが認められている (ラット, 水素クリアランス法)。
- (4) 椎骨動脈系流域 (視床下部など) の血流量の増加が有意であることが認められている (ラット, ¹⁴C-Antipyrine の脳組織取り込み法)。

3. 脳代謝に対する作用⁶⁾

グルコースの脳内への取り込み促進と乳酸生成の抑制が認められている (マウス)。

4. 血小板凝集能に対する作用^{7, 8)}

マウス (*in vivo*), ウサギ (*in vitro, ex vivo*), 健常男性 (*ex vivo*) 及び脳血管障害患者において血小板凝集抑

制作用が認められている。流血中での血小板凝集抑制作用はPGI₂との相互作用によると考えられる。

5. 赤血球変形能に対する作用⁵⁾

ラット (*ex vivo*), ウサギ (*in vitro*) において赤血球変形能の改善作用が認められている。

【有効成分に関する理化学的知見】

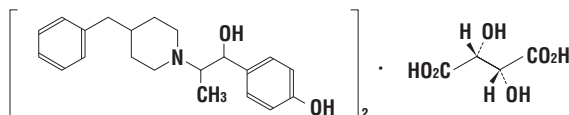
一般名: イフェンプロジル酒石酸塩

Ifenprodil Tartrate [JAN]

化学名: (1*R*, 2*S*)-4-[2-(4-Benzylpiperidin-1-yl)-1-hydroxypropyl]phenol hemi-(2*R*, 3*R*)-tartrate

分子式: (C₂₁H₂₇NO₂)₂·C₄H₆O₆

化学構造式:



分子量: 800.98

- * 性状: 白色の結晶性の粉末で, においはない。酢酸 (100) に溶けやすく, エタノール (95) にやや溶けやすく, 水又はメタノールに溶けにくく, ジエチルエーテルにほとんど溶けない。旋光度 [α]_D²⁰: +11~+15° (脱水物に換算したもの 1g, エタノール (95), 20mL, 100mm) 融点: 約 148°C (分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験⁹⁾

最終包装製品を用いた加速試験 (40°C, 相対湿度 75%, 6 カ月) の結果, イフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg 「あすか」及びイフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg 「あすか」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】

- イフェンプロジル酒石酸塩錠 10mg 「あすか」:
100錠 (10錠×10)
- イフェンプロジル酒石酸塩錠 20mg 「あすか」:
100錠 (10錠×10)
500錠 (10錠×50)

【主要文献】

- 1) 社内資料 (生物学的同位性試験)
- 2) 社内資料 (溶出試験)
- 3) H. Honda et al.: Arch. Int. Pharmacodyn. Ther., **285**:211, 1987
- 4) H. Honda et al.: Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. Toxicol., **26**:4, 1988
- 5) 入野 理 他: 日薬理誌, **89**:197, 1987
- 6) 斎藤 清 他: 日本薬学会第107年会発表 1987
- 7) 斎藤 清 他: 日薬理誌, **91**:105, 1988
- 8) 嶋崎 譲 他: 基礎と臨床, **19**:2745, 1985
- 9) 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】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。
あすか製薬株式会社 くすり相談室
〒108-8532 東京都港区芝浦二丁目5番1号
TEL 0120-848-339 FAX 03-5484-8358

製造販売元

あすか製薬株式会社
東京都港区芝浦二丁目5番1号

販売

武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号