

貯法：室温保存、気密容器（開封後は吸湿に注意すること）
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。（使用期限内であつても開封後はなるべく速やかに使用すること。）

* 日本標準商品分類番号	
872190	
承認番号	22500AMX00469000
薬価収載	2013年6月
販売開始	1999年7月

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10mg「オーハラ」**

* **AMEZINIUM METILSULFATE TABLETS 10mg「OHARA」**
(アメジニウムメチル硫酸塩錠)

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- **
- (1) 高血圧症の患者〔高血圧症を悪化させる。〕
 - (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。〕
 - (3) 褐色細胞腫のある患者〔急激な昇圧発作を起こすおそれがある。〕
 - (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。〕
 - (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。〕

*【組成・性状】

販売名	アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「オーハラ」		
成分・含量	1錠中アメジニウムメチル硫酸塩10mgを含有		
添加物	乳糖水和物、カルメロースカルシウム、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸カルシウム		
色調・剤形	白色・片面割線入り素錠		
外形	表面	裏面	側面
			
	直径：6.5mm		厚さ：2.4mm
重量	100mg		
識別コード	OH-176		

【効能・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

【用法・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。

【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）
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。〕
2. 重要な基本的注意
透析施行時の血圧低下への適用にあたっては、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。

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
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。	本剤により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抑制される。

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。

	副作用の頻度	
	頻度不明	
過敏症 ^{注)}	発疹、湿疹、蕁麻疹	
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、焦躁感、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(GOT)・ALT(GPT)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) 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

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。〔高齢者では生理機能（腎機能、肝機能）が低下していることが多い。〕

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦また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) 本剤投与中は授乳を避けさせること。〔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。〕

7. 小児等への投与

乳児および幼児に対する安全性は確立していない。〔使用経験がない。〕

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】**

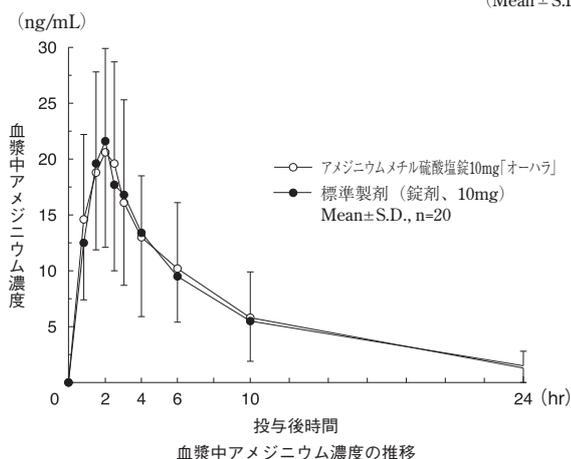
1. 生物学的同等性試験

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「オーハラ」と標準製剤を、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、 C_{max} ）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⁾。

薬物動態パラメータ

	n	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「オーハラ」	20	164.42±80.24	23.22±9.03	1.8±0.5	6.2±3.4
標準製剤 (錠剤、10mg)	20	159.57±71.00	24.51±9.57	1.9±0.5	6.5±2.5

(Mean±S.D.)



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、血液の採取回数・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

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「オーハラ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたメチル硫酸アメジニウム錠の溶出規格に適合していることが確認されている²⁾。

【薬効薬理】

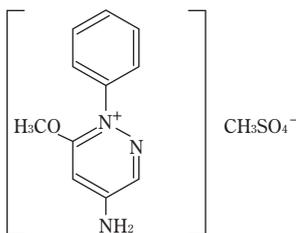
アメジニウムメチル硫酸塩は、ノルアドレナリンと競合して末梢の神経終末に取り込まれ、ノルアドレナリン再取り込みを抑制し、またノルアドレナリンの不活性化を抑制して間接的に交感神経機能を亢進させ、用量依存的に血圧上昇作用を示す。

【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 methylsulfate

構造式：



分子式：C₁₂H₁₅N₃O₅S

分子量：313.33

性状：本品は白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。

本品は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。

融点：約178℃（分解）

***【取扱い上の注意】**

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験（なりゆき温度及び湿度、3年間）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「オーハラ」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³⁾。

***【包装】**

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「オーハラ」：
(PTP) 100錠（10錠×10）
(バラ) 500錠

【主要文献】

- 1) 大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験（1997年）
- 2) 大原薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験（2002年）
- 3) 大原薬品工業株式会社 社内資料：長期安定性試験

***【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は下記にご請求下さい。

大原薬品工業株式会社 安全管理部 お客様相談室
〒104-6591 東京都中央区明石町8-1聖路加タワー36階
☎0120-419-363 FAX 03-6740-7703
URL <http://www.ohara-ch.co.jp>



製造販売元 **大原薬品工業株式会社**
滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野 121-15

AME(T)®