

貯法：室温保存  
有効期間：3年

# メペンゾラート臭化物錠 7.5mg「ツルハラ」

Mepenzolate Bromide Tablets「TSURUHARA」

承認番号	22500AMX01147000
販売開始	1984年6月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）
- 閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕
  - 前立腺肥大による排尿障害のある患者〔排尿筋の弛緩と膀胱括約筋の収縮を起こし、排尿障害を悪化させるおそれがある。〕
  - 重篤な心疾患のある患者〔心臓の運動を促進させ、症状を悪化させるおそれがある。〕
  - 麻痺性イレウスのある患者〔消化管運動を低下させるため、症状を悪化させるおそれがある。〕
  - 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

有効成分	1錠中、メペンゾラート臭化物 7.5mg
添加剤	黄色5号、乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、タルク、沈降炭酸カルシウム、アラビアゴム末、白糖、硫酸カルシウム、ポリオキシエチレン(105)ポリオキシプロピレン(5)グリコール、カルボキシメチルスターチナトリウム、カルナウバロウ

#### 3.2 製剤の性状

剤形	糖衣錠	
色調	淡褐色	
大きさ	直径	約7.0mm
	厚さ	約4.3mm
	質量	約150mg

### 4. 効能又は効果

過敏大腸症（イリタブルコロン）

### 6. 用法及び用量

通常成人には1回2錠（メペンゾラート臭化物として15mg）を、1日3回経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

### 8. 重要な基本的注意

視調節障害を起こすことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に注意させること。

### 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 開放隅角緑内障の患者

抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。

##### 9.1.2 前立腺肥大のある患者

排尿障害を起こすおそれがある。

##### 9.1.3 甲状腺機能亢進症のある患者

心臓の運動を促進させ、心悸亢進や頻脈を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.4 うっ血性心不全又は不整脈のある患者

心臓の運動を促進させ、症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.5 潰瘍性大腸炎のある患者

中毒性巨大結腸があらわれるおそれがある。

##### 9.1.6 高温環境にある患者

汗腺等の分泌機能を抑制するので、体温調節が障害され高熱になるおそれがある。

#### 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。

#### 9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

#### 9.8 高齢者

一般に抗コリン作用による視調節障害、口渇、排尿障害等があらわれやすい。

### 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
三環系抗うつ剤 イミプラミン アミトリプチリン等 フェノチアジン系薬剤 クロプロロマジン等 抗ヒスタミン剤 ジフェンヒドラミン等	抗コリン作用に基づく副作用（視調節障害、口渇、排尿障害等）があらわれるおそれがある。	本剤及びこれらの薬剤はともに抗コリン作用を有するため相加的に抗コリン作用が増強されることがある。
モノアミン酸化酵素阻害剤	抗コリン作用に基づく副作用（視調節障害、口渇、排尿障害等）があらわれるおそれがある。	本剤の代謝が阻害され、抗コリン作用が増強されることがある。

### 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。

#### 11.2 その他の副作用

	頻度不明
眼	視調節障害
消化器	口渇、便秘、悪心・嘔吐、食欲不振
泌尿器	排尿障害
精神神経系	めまい、頭痛・頭重
過敏症	発疹

### 13. 過量投与

#### 13.2 処置

抗コリン作用に対してはネオスチグミン等を静脈内投与する。

### 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。

### 18. 薬効薬理

#### 18.1 作用機序

ムスカリン受容体遮断薬で、副交感神経興奮による反応を抑制することにより様々な作用を現す<sup>1)</sup>。

#### 18.2 鎮痙作用

##### 18.2.1 生体位消化管の自動運動抑制作用及び拮抗緩解作用

麻酔イヌ及びネコを用いた試験でメペンゾラート臭化物は、胃、小腸及び結腸の自動運動、フィズスチグミン-アセチルコリンによる消化管拮抗及び迷走神経刺激による消化管拮抗を明らかに抑制する<sup>2),3),4)</sup>。メペンゾラート臭化物による自動運動抑制作用は、小腸に対するよりも結腸に対しより著明である<sup>3)</sup>。

##### 18.2.2 腸管輸送能に対する作用

ラットでのCharcoal meal法で、メペンゾラート臭化物は、消化管運動に対する抑制作用を示し、その効果は、アトロピンの1/2である<sup>5)</sup>。

##### 18.2.3 胃・大腸反射に対する作用

イヌを用いた寒冷刺激による胃・大腸反射の試験で、メペンゾラート臭化物は、明らかな抑制作用を示す<sup>4)</sup>。

##### 18.2.4 抗コリン作用

イヌでの血圧を指標とした試験でメペンゾラート臭化物は、アセチルコリンによる血圧下降を著明に抑制し、その効果は、アトロピンとほぼ同等である<sup>5)</sup>。

#### 18.3 その他の作用

##### 18.3.1 唾液分泌抑制作用

麻酔したイヌ及びネコにおいて、アセチルコリンによって起こした唾液分泌に対し、メペンゾラート臭化物は0.5mg/kgの静脈内投与で抑制作用を示していない<sup>2)</sup>。しかし、麻酔ウサギのピロカルピンによる唾液分泌に対し、筋肉内注射によるメペンゾラート臭化物は、アトロピンの2倍の強さの抑制を示したとの報告がある<sup>5)</sup>。

##### 18.3.2 膀胱収縮に対する作用

麻酔イヌでの骨盤神経刺激による膀胱収縮に対し、メペンゾラート臭化物は4mg/kgを静脈内投与しても部分的にしか抑制せず、この作用は臭化メタンテリンの約1/10の強さである<sup>3)</sup>。

### 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：メペンゾラート臭化物 (Mepenzolate Bromide)

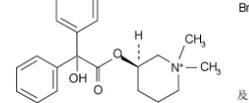
化学名：(3*RS*)-3-[(Hydroxy)(diphenyl)acetoxy]-1,1-dimethylpiperidinium bromide

分子式：C<sub>21</sub>H<sub>26</sub>BrNO<sub>3</sub>

分子量：420.34

性状：本品は白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。本品はギ酸に極めて溶けやすく、メタノールに溶けやすく、熱湯にやや溶けやすく、水又はエタノール(95)に溶けにくく、無水酢酸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。

構造式：



及び鏡像異性体

融点：約230℃（分解）

### 20. 取扱い上の注意

開封後は、遮光して保存すること。光により錠剤の表面が退色することがある。

### 22. 包装

PTP：100錠（10錠×10）、1000錠（10錠×100）

バラ〔缶〕：1200錠

### 23. 主要文献

- 第十七改正日本薬局方解説書 廣川書店 2016；C5527-C5530
- Buckley,J.P. et al. : J. Am. Pharm. Assoc. 1957；46（10）：592-594
- Chen,J.Y.P. : Arch. Int. Pharmacodyn. Ther. 1959；121（1-2）：78-84
- 日野貞雄：日本消化器病学会雑誌 1967；64（10）：943-947
- Long,J.P. et al. : J. Am. Pharm. Assoc.1954；43（10）：616-619

### 24. 文献請求先及び問い合わせ先

鶴原製薬株式会社 医薬情報部  
〒563-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号  
TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252

### 26. 製造販売業者等

#### 26.1 製造販売元

**鶴原製薬株式会社**

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号