

末梢性神経障害治療剤
 ※ 日本薬局方 メコバラミン錠
メコバラミン錠 500(ツルハラ)
Mecobalamin Tablets 500(TSURUHARA)

貯法	遮光保存(取扱以上の注意参照)
使用期限	外箱、容器に表示

承認番号	16200AMZ00517000
薬価収載	1987年10月
販売開始	1987年10月
再評価結果	1999年10月

【組成・性状】

組成

メコバラミン錠 500(ツルハラ)は1錠中メコバラミン 500 μ gおよび添加物として乳糖水和物、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、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール6000、精製白糖、ゼラチン、アラビアゴム末、タルク、沈降炭酸カルシウム、酸化チタン、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、カルナウバロウを含有する。

製剤の性状

メコバラミン錠 500(ツルハラ)は直径約 6.0mm、厚さ約 3.9mm、質量約 100mg の白色糖衣錠である。

【効能・効果】

末梢性神経障害

《効能・効果に関連する使用上の注意》

本剤投与で効果が認められない場合、月余にわたって漫然と使用すべきでない。

【用法・用量】

通常、成人は1日3錠(メコバラミンとして1,500 μ g)を3回にわけて経口投与する。
 ただし、年齢及び症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

(1) 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。

その他の副作用

	頻度	不明
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐、下痢	
過敏症 ^{注)}	発疹	

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。

(2) 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。)

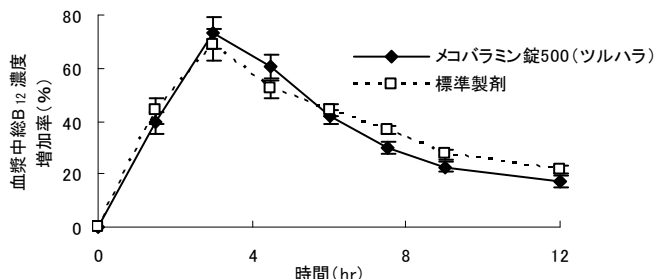
(3) その他の注意

水銀及びその化合物を取り扱う職業従事者に長期にわたって大量に投与することは避けることが望ましい。

【薬物動態】

(1) 生物学的同等性試験¹⁾

メコバラミン錠 500(ツルハラ)と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ6錠*(メコバラミン 3,000 μ g)を健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中総B₁₂濃度を測定し、投与前値からの増加率を算出した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。(*:6錠は承認外の用法・用量)



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (%)	C _{max} (%)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
メコバラミン錠 500(ツルハラ)	444±26	77±5	3.1±0.1	3.2±0.3
標準製剤(錠剤、500 μ g)	462±25	71±5	2.9±0.2	4.9±0.8

(Mean±S.E., n=12)

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⁾

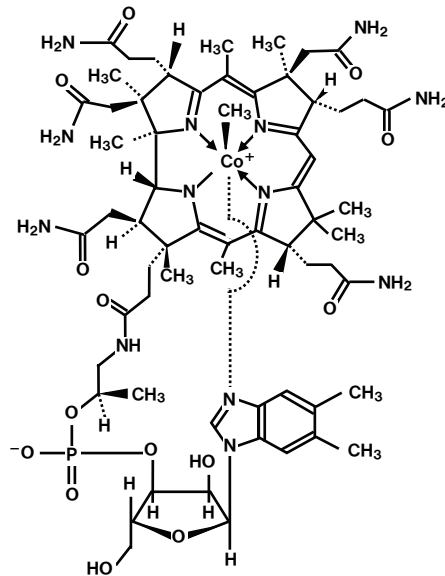
メコバラミン錠 500(ツルハラ)は、日本薬局方医薬品各条に定められたメコバラミン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

メコバラミンは生体内成分としてヒトの血漿中に存在する³⁾補酵素型のビタミンB₁₂で⁴⁾ホモシステインからメチオンを合成する反応でメチル基転移反応の補酵素として作用する⁵⁾とともに貯蔵型葉酸の利用を促進する⁶⁾。その他t-RNAやリン脂質代謝におけるメチル化反応に対しても補酵素として作用する⁷⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：メコバラミン (Mecobalamin)

化学名：Co α -[α -(5,6-Dimethylbenzyl-1H-imidazolyl)]-Co β -methylcobamide

分子式：C₆₃H₉₁CoN₁₃O₁₄P

分子量：1,344.38

性状：メコバラミンは暗赤色の結晶又は結晶性の粉末である。

本品は水にやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくく、アセトニトリルにほとんど溶けない。本品は光によって変化する。

【取扱上の注意】

開封後は光を遮り、湿気を避けて保存すること。(光により含量が低下し、湿気により錠剤が赤味をおびることがある。)

安定性試験⁸⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、3年)の結果、メコバラミン錠 500(ツルハラ)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。

※※

【包装】

(PTP) 100錠、1,000錠
 (バラ) 1,200錠

【主要文献】

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) Lindstrand, K.: Nature, 204, 188-189(1964)
- 4) Guest, J. R. et al.: Nature, 195, 340-342(1962)
- 5) Taylor, R. T. et al.: J. Biol. Chem., 242, 1517-1521(1967)
- 6) 高久史磨: 最新医学, 24, 727-734(1969)
- 7) 中沢恒幸 他: ビタミン, 46, 319-323(1972)
- 8) 鶴原製薬株式会社 社内資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料についても下記へご請求ください。
 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



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

(M20-75 18-2006)
 A006-S