

中枢・末梢性筋緊張緩剤

劇薬、処方箋医薬品[※]

ロキシーン[®]注2mg
LOXEEN[®] Inj. 2mg

承認番号	21900AMX01071000
薬価収載	2007.12
販売開始	2004.12
再評価結果	1976.7

貯法：室温保存

使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること。

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

※【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 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。〕
- (3) 前立腺肥大による排尿障害のある患者〔抗コリン作用により排尿障害を悪化させるおそれがある。〕
- (4) 重篤な心疾患の患者〔心疾患の症状を悪化させるおそれがある。〕
- (5) 麻痺性イレウスの患者〔麻痺性イレウスの症状を悪化させるおそれがある。〕

【組成・性状】

品名	ロキシーン注2mg
有効成分	プリジノールメシル酸塩
含量	1アンプル(1mL)中 2mg
添加物	塩化ナトリウム、氷酢酸、水酸化ナトリウム
性状	無色澄明な注射液
pH	5.0～6.0
浸透圧比	約1(生理食塩液に対する比)

【効能・効果】

運動器疾患に伴う有痛性痙縮

(腰背痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、変形性脊椎症など)。

【用法・用量】

プリジノールメシル酸塩として、通常成人1回2mgを1日1回筋肉内または静脈内注射する。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) 肝障害の患者〔肝障害を悪化させるおそれがある。〕
- (2) 腎障害の患者〔腎障害を悪化させるおそれがある。〕
- (3) 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。〕

2. 重要な基本的注意

眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、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
中枢神経抑制剤 (フェノチアジン系薬剤、バルビツール酸誘導体等) モノアミン酸化酵素阻害剤 アルコール	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下を増強することがあるので、単独投与することが望ましいが、止むを得ず併用する場合には、減量するなど注意すること。	相互に中枢神経抑制作用を増強することがある。

4. 副作用^{1)～4)}

臨床試験530例中、副作用が報告されたのは10例(1.89%)で、ねむけ4例(0.75%)、倦怠感・脱力感2例(0.38%)、ふらつき2例(0.38%)、発熱1例(0.19%)、盗汗1例(0.19%)であるが、いずれの場合も重篤な症状は認められなかった。(再評価終了時)

	5%以上または頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注1)}	発疹		ショック様症状等
精神神経系 ^{注2)}		眠気、めまい、ふらつき、脱力感、倦怠感等	
消化器	口渇		悪心・嘔吐等

注1)：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。

注2)：このような症状があらわれた場合には、減量または休業等、適切な処置を行うこと。

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ため、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) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましい。

7. 小児等への投与

小児等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

- (1) 本剤の注射は経口投与が不適当な場合にのみ使用すること。
- (2) 筋肉内注射時
筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響をさけるため、下記の点に配慮すること。
 - 1) 神経走行部位をさけるよう注意すること。
 - 2) 繰り返し注射する場合には、例えば左右交互に注射するなど、注射部位を変えて行うこと。
 - 3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。
- (3) 静脈内注射時
 - 1) 生理食塩液または5%ブドウ糖注射液に混じて行うことが望ましいが、止むを得ず単独で注射する場合には注射速度をできるだけ遅くすること。
 - 2) 静脈内注射は、患者を横臥させて行うこと。
- (4) アンプルカット時
アンプルカット時に異物混入を避けるため首部の周りをエタノール綿等で清拭しカットすること。

【臨床成績】^{1)~4)}

ロキシーン注2mgの臨床試験は、二重盲検比較試験を含め、国内18施設で計478例について実施した。その概要は次のとおりである。

〈臨床試験〉

1. 腰背痛症：腰背痛症に対しては、有効率71.4% (15/21)を示した。
2. 頸肩腕症候群：頸肩腕症候群に対しては、有効率59.7% (37/62)を示し、また、二重盲検比較試験によって本剤の治療効果が認められている。
3. 肩関節周囲炎：肩関節周囲炎に対しては、有効率53.1% (51/96)を示した。
4. 変形性脊椎症：変形性脊椎症に対しては、有効率52.9% (18/34)を示した。
5. 上記以外の運動器疾患に伴う有痛性痙攣：脊椎分離および迂り症、椎間板ヘルニア、変形性関節症、脊椎性疾患等に対しては、有効率52.1% (138/265)を示した。

【薬効薬理】

プリジノールメシル酸塩の作用は、大脳皮質、脳幹網様体、延髄および脊髄等の中枢から、骨格筋に至る末梢神経系におよぶ。

〈中枢神経系に対する作用〉

- (1) 電撃痙攣(マウス、ラット)、ペンテトラゾール痙攣(マウス)、ストリキニーネ痙攣(マウス、トノサマガエル)、およびニコチン痙攣(マウス)を抑制する。⁵⁾
- (2) 電気刺激による交叉伸展反射を抑制する(ラット)。⁵⁾

〈末梢神経系に対する作用〉

- (1) カエル腹筋のKCl痙攣を抑制する。⁶⁾
- (2) ゴム張力法で筋弛緩作用を示す(マウス)。⁵⁾
- (3) Magnus法により抗アセチルコリン作用、抗ヒスタミン作用、抗塩化バリウム作用、抗オキシトシン作用および抗ブラジキニン作用を示す(モルモット腸管)。^{5),7)}
- (4) 生体内において、抗塩化バリウム作用(ウサギ腸管)および抗ヒスタミン作用(モルモット気管支)を示す。^{5),6)}

【有効成分に関する理化学的知見】

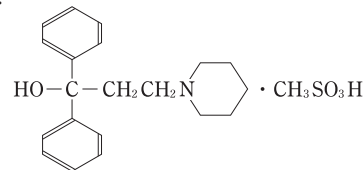
一般名：プリジノールメシル酸塩 (Pridinol Mesilate)

化学名：1, 1-Diphenyl-3-piperidino-1-propanol
methanesulfonate

分子式：C₂₀H₂₅NO · CH₃SO₃H

分子量：391.52

構造式：



融点：160~162°C

性状：白色の微粉末で、わずかに特異なおいがあり、味は苦い。クロロホルムに溶けやすく、水またはエタノール(95)にやや溶けにくく、アセトンに溶けにくく、ジエチルエーテルまたは石油エーテルにほとんど溶けない。

水溶液(1→50)のpHは5.0~6.0である。

【包装】

- 1 mL×50アンプル
- 1 mL×200アンプル

【主要文献】

- 1) 市川宣恭他：基礎と臨床, 8, (2), 518(1974)
- 2) 市川宣恭他：基礎と臨床, 8, (3), 833(1974)
- 3) 川村次郎他：新薬と臨床, 16, (4), 465(1967)
- 4) ロキシーン文献集
- 5) 古川敏議他：東邦医学会雑誌, 14, (1), 17(1967)
- 6) E. Traubucchi et al. : Switzerland
- 7) L. Sorrentino et al. : Farmaco., 26, (5), 293(1971)

【文献請求先】

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。

日医工株式会社 お客様サポートセンター
〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948



販売元

日医工株式会社

富山市総曲輪1丁目6番21

製造販売元



東菱薬品工業株式会社

東京都新宿区西新宿6丁目3番1号