

エレクトリプタン錠20mg「ファイザー」

ELETRIPTAN Tablets 20mg [Pfizer]

エレクトリプタン臭化水素酸塩錠

貯法：室温保存
使用期限：最終年月を外箱等に記載

承認番号	3020AMX00885
薬価収載	2020年12月
販売開始	2021年3月

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）】

- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 心筋梗塞の既往歴のある患者、虚血性心疾患又はその症状・兆候のある患者、異型狭心症（冠動脈攣縮）のある患者〔不整脈、狭心症、心筋梗塞を含む重篤な虚血性心疾患様症状があらわれることがある。〕
- 脳血管障害や一過性脳虚血発作の既往のある患者〔脳血管障害や一過性脳虚血発作があらわれることがある。〕
- 末梢血管障害を有する患者〔症状を悪化させる可能性が考えられる。〕
- コントロールされていない高血圧症の患者〔一過性の血圧上昇を引き起こすことがある。〕
- 重度の肝機能障害を有する患者〔本剤は主に肝臓で代謝されるので、重度の肝機能障害患者では血中濃度が上昇するおそれがある（「薬物動態」の項参照）。〕
- エルゴタミン、エルゴタミン誘導体含有製剤、他の5-HT_{1B/1D}受容体作動薬、あるいはHIVプロテアーゼ阻害薬（リトナビル、インジナビル硫酸塩エタノール付加物、ネルフィナビルメシル酸塩）を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

- 家族性片麻痺性片頭痛、孤発性片麻痺性片頭痛、脳底型片頭痛あるいは眼筋麻痺性片頭痛の患者には投与しないこと。

【用法・用量】

通常、成人にはエレクトリプタンとして1回20mgを片頭痛の頭痛発現時に経口投与する。
なお、効果が不十分な場合には、追加投与をすることができるが、前回の投与から2時間以上あけること。
また、20mgの経口投与で効果が不十分であった場合には、次回片頭痛発現時から40mgを経口投与することができる。
ただし、1日の総投与量を40mg以内とする。

【用法・用量に関連する使用上の注意】

- 本剤は頭痛発現時にのみ使用し、予防的には使用しないこと。
- 本剤投与により全く効果が認められない場合は、その発作に対して追加投与をしないこと。このような場合は、再検査の上、頭痛の原因を確認すること。

【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）

- 虚血性心疾患の可能性のある患者（例えば、虚血性心疾患を疑わせる重篤な不整脈のある患者、閉経後の女性、40歳以上の男性、冠動脈疾患の危険因子を有する患者）〔不整脈、狭心症、心筋梗塞を含む重篤な虚血性心疾患様症状があらわれるおそれがある。〕
- ウォルフ・パーキンソン・ホワイト症候群（WPW症候群）又は他の心臓副伝導路と関連した不整脈のある患者〔類薬（5-HT_{1B/1D}受容体作動薬）でWPW症候群の典型的症状である重篤な発作性頻脈が発現したとの報告がある。〕
- 高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕
- 脳血管障害の可能性のある患者〔脳血管障害があらわれるおそれがある。〕
- てんかんあるいは痙攣を起こしやすい器質的脳疾患のある患者〔てんかん様発作がおこるおそれがある。〕
- 肝機能障害を有する患者〔本剤は主に肝臓で代謝されるので、血中濃度が上昇することがある（「薬物動態」の項参照）。〕
- コントロールされている高血圧症患者〔一過性の血圧上昇や末梢血管抵抗の上昇を引き起こすことがある。〕

2. 重要な基本的注意

- 本剤投与後、胸痛、胸部圧迫感等の一過性の症状（強度で咽喉頭部に及ぶ場合がある）があらわれることがある。このような症状が虚血性心疾患によると思われる場合には、以後の投与を中止し、虚血性心疾患の有無を調べるための適切な検査を行うこと。
- 心血管系の疾患が認められない患者においても、重篤な心疾患が極めてまれに発生することがある。このような場合は以後の投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 片頭痛あるいは本剤投与により眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械操作に従事させないように十分注意すること。

【組成・性状】

1. 組成

1錠中：

販売名	エレクトリプタン錠20mg「ファイザー」	
成分	エレクトリプタン臭化水素酸塩24.242mg (エレクトリプタンとして20mg)	
有効成分	エレクトリプタン臭化水素酸塩24.242mg (エレクトリプタンとして20mg)	
添加物	結晶セルロース、乳糖水和物、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、トリアセチン、黄色5号	

2. 性状

外形			識別コード	色調等
上面	下面	側面		
			ELT 20	だいたい色 フィルムコート錠
直径 6.3 mm	厚さ 3.0 mm	重量 103.500 mg		

【効能・効果】

片頭痛

【効能・効果に関連する使用上の注意】

- 本剤は国際頭痛学会による片頭痛診断基準（「参考」の項参照）により「前兆のない片頭痛」あるいは「前兆のある片頭痛」と確定診断が行われた場合のみ投与すること。特に次のような患者は、くも膜下出血等の脳血管障害や他の原因による頭痛の可能性があるので、本剤投与前に問診、診察、検査を十分に行い、頭痛の原因を確認してから投与すること。
 - 今までに片頭痛と診断が確定したことのない患者
 - 片頭痛と診断されたことはあるが、片頭痛に通常見られる症状や経過とは異なった頭痛及び随伴症状のある患者

(4)本剤を含むトリプタン系薬剤により、頭痛が悪化することがあるので、頭痛の改善を認めない場合には、「薬剤の使用過多による頭痛」¹⁾の可能性を考慮し、投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。

3. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素チトクロームP450 3A4により代謝される。〔薬物動態〕の項参照]

(1)併用禁忌 (併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エルゴタミン エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン (クリアミン) エルゴタミン誘導体含有製剤 ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩 (ジヒデルゴット) エルゴメトリンマレイン酸塩 (エルゴメトリンF) メチルエルゴメトリンマレイン酸塩 (メテルギン)	血圧上昇又は血管攣縮が増強されるおそれがある。 本剤投与後にエルゴタミンあるいはエルゴタミン誘導体含有製剤を投与する場合、もしくはその逆の場合は、それぞれ24時間以上の間隔をあけて投与すること。	5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬との薬理的相加作用により、相互に作用(血管収縮作用)を増強させる。
5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬 スマトリプタンコハク酸塩 (イミグラン) ゾルミトリプタン (ゾーミック) リザトリプタン安息香酸塩 (マクサルト) ナラトリプタン塩酸塩 (アマージ)	血圧上昇又は血管攣縮が増強されるおそれがある。 本剤投与後に他の5-HT _{1B/1D} 受容体作動型の片頭痛薬を投与する場合、もしくはその逆の場合は、それぞれ24時間以内に投与しないこと。	併用により相互に作用を増強させる。
HIVプロテアーゼ阻害剤 リトナビル、インジナビル 硫酸塩エタノール付加物、ネルフィナビルメシル酸塩	本剤の代謝が阻害され血中濃度が上昇するおそれがある。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクロームP450 3A4により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。

(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
マクロライド系抗生物質 エリスロマイシン、 ジョサマイシン、クラリスロマイシン	エリスロマイシンとの併用により、本剤の最高血漿中濃度 (Cmax) は2倍、血漿中濃度-時間曲線下面積 (AUC) は4倍に増大し、軽度血圧が上昇した。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクロームP450 3A4により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。
抗真菌剤 イトラコナゾール	イトラコナゾールとの併用により、本剤のCmax、AUCが増大し、血圧が上昇するおそれがある。	
カルシウム拮抗剤 ベラパミル	ベラパミルとの併用により、本剤のCmax、AUCが増大した。	
飲食物 グレープフルーツジュース	本剤の作用が増強するおそれがある。	
副腎皮質ホルモン剤 デキサメタゾン 抗てんかん剤 カルバマゼピン 抗結核薬 リファンピシン	本剤の代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがある。	酵素誘導剤により本剤の代謝が促進されるおそれがある。
飲食物 セイヨウオトギリソウ (St. John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート) 含有食品	本剤の代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがある。	セイヨウオトギリソウにより本剤の代謝が促進されるおそれがある。
選択的セロトニン再取り込み阻害薬 フルボキサミンマレイン酸塩 パロキセチン塩酸塩水和物 塩酸セルトラリン セロトニン・ノルアドレナリン再取り込み阻害薬 ミルナシプラン塩酸塩 デュロキセチン塩酸塩	セロトニン症候群 (不安、焦燥、興奮、頻脈、発熱、反射亢進、協調運動障害、下痢等) があらわれることがある。	セロトニンの再取り込みを阻害し、セロトニン濃度を上昇させる。よって本剤との併用により、セロトニン作用が増強する可能性が考えられる。

4. 副作用

プラセボを対照とした国内及び外国第Ⅱ/Ⅲ相試験において、本剤20 mg及び40 mg投与例2,365例中672例 (28.4%) に副作用が認められた。その主な副作用は、浮動性めまい (4.14%)、傾眠・眠

気 (4.06%)、嘔気 (3.25%)、口内乾燥 (2.58%)、疲労 (2.45%) 等であった。副作用のほとんどは軽度又は中等度であり、処置を必要とすることなく消失し、一過性のものであった。(レルパックス[®]錠承認時までの調査の集計)

市販後の使用成績調査症例数1,072例中、副作用発現症例は76例 (7.09%) であり、副作用発現件数は延べ99件であった。その主な副作用は、傾眠・眠気 (2.15%)、嘔気 (1.03%)、倦怠感 (1.03%) 等であった。副作用のほとんどは軽度又は中等度であり、処置を必要とすることなく消失し、一過性のものであった。(レルパックス[®]錠再審査終了時)

(1)重大な副作用

- 1) **アナフィラキシーショック、アナフィラキシー (頻度不明)^{注1)}** : アナフィラキシーショック、アナフィラキシー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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) **不整脈、狭心症あるいは心筋梗塞を含む虚血性心疾患様症状** : 不整脈、狭心症あるいは心筋梗塞を含む虚血性心疾患様症状をおこすことがまれにあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 3) **てんかん様発作 (頻度不明)^{注1)}** : てんかん様発作をおこすことがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) **頻脈 (WPW症候群における) (頻度不明)^{注2)}** : 類薬 (5-HT_{1B/1D}受容体作動薬) でWPW症候群の典型的症状である重篤な発作性頻脈の報告がある。
- 5) **薬剤の使用過多による頭痛 (頻度不明)^{注1)}** : 薬剤の使用過多による頭痛があらわれることがあるので、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。

注1 : 自発報告のため頻度不明。

注2 : 類薬の情報のため頻度不明。

(2)その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	1%以上	1%未満	頻度不明 ^{注1)}
神経系	傾眠・眠気、浮動性めまい、異常感覚	頭痛、感覚減退、回転性眩暈、筋緊張亢進	
心・血管系		熱感、動悸、潮紅、頻脈、血圧上昇	
消化器系	嘔気、口内乾燥	嘔吐、腹痛、消化不良	
皮膚		発疹、そう痒症	蕁麻疹、血管浮腫
その他	疲労	胸部絞扼感 ^{注2)} 、咽喉絞扼感 ^{注2)} 、無力症、胸痛 ^{注2)} 、多汗、倦怠感、咽喉頭疼痛、疼痛、寒寒、筋痛、胸部圧迫感 ^{注2)} 、背部痛、筋無力症	

注1 : 自発報告のため頻度不明。

注2 : これらの症状は通常一過性であるが、ときに激しい場合があり、胸部、咽喉頭部を含む身体各部でおこる可能性がある。〔重要な基本的注意〕の項参照。

発現頻度はレルパックス[®]錠承認時の国内臨床試験、外国で実施された第Ⅱ相/第Ⅲ相試験、及び使用成績調査の結果に基づいている。

5. 高齢者への投与

血圧の上昇は、若年者よりも高齢者で大きいので慎重に投与すること (高齢者と若年者における収縮期血圧の最大上昇の差 : 10.19 mmHg、拡張期血圧の最大上昇の差 : 2.59 mmHg²⁾) [「慎重投与」の項参照]。臨床使用における高齢者に対する安全性が確立していない (使用経験が少ない)。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又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) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること [本剤は投与後24時間までにヒト母乳中に約0.02%の移行が認められている³⁾]。

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない (使用経験が少ない)。

8. 過量投与

国内及び外国において、患者に本剤40 mgを超えて80 mgまでを単回経口投与した際、本剤20 mg、40 mg投与で報告されている以外の副作用はいずれも認められなかったが、副作用の発現頻度は用量とともに増加した。また、外国臨床試験において、重大な副作用として本剤80 mgが投与された患者1例において狭心症が認められた。過量投与時には以下の処置を考慮すること。

処置：本剤の消失半減期は約4時間であり、少なくとも20時間、あるいは症状・徴候が持続する限り患者をモニターすること。本剤に特異的な解毒薬はないので、重症中毒の場合、気道の確保・維持、適度の酸素負荷・換気、循環器系のモニタリング、対症療法を含む集中治療が望ましい。なお、血液透析・腹膜透析の効果は不明である。

9. 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、更には穿孔をお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】

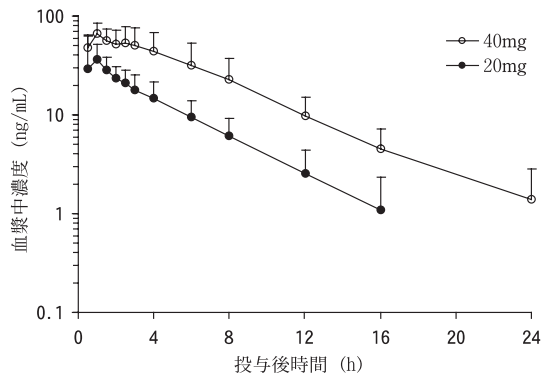
1. 血中濃度

(1) 単回投与

健康成人にエレトリブタン20、40、80及び120 mg（各6例）を単回経口投与した時の最高血漿中濃度（C_{max}）は、それぞれ38.9、69.7、134及び174 ng/mL、最高血漿中濃度到達時間（T_{max}）は、それぞれ1.0、1.2、2.4及び3.1時間、血漿中濃度-時間曲線下面積（AUC）は、それぞれ146、416、916及び1,398 ng・h/mL、消失半減期（T_{1/2}）は、それぞれ3.2、3.9、4.1及び5.5時間であった⁴⁾。

また、健康成人にエレトリブタン6 mg（24例）を単回静脈内投与した時の全身クリアランスは33.4 L/h、定常状態における分布容積は119 Lであった。静脈内投与時のAUCを基準にして求めたエレトリブタン80 mg（24例）単回経口投与時の絶対生物学的利用率は36.4%であった⁵⁾。

（注：本剤の日本での承認用量は1回20 mg又は40 mgである）



(2) 反復投与

健康成人6例にエレトリブタン1回40 mgを1日3回（投与間隔は1回目投与2時間後及び12時間後）7日間反復経口投与した時のAUC_{0-24h}は、1日目1,375 ng・h/mLから7日目1,894 ng・h/mLと38%増大し、各投与後のC_{max}は1日目にそれぞれ96、130及び92 ng/mLから、7日目にはそれぞれ178、157及び119 ng/mLとそれぞれ85、21及び29%上昇した。7日目のT_{1/2}は6.6時間であった。最小血漿中濃度（C_{min}）の推移から、投与2日目には定常状態に達していると考えられた⁶⁾。

2. 食事の影響

健康成人16例にエレトリブタン80 mgを食後又は空腹時に単回経口投与し、血漿中濃度に及ぼす食事の影響を検討した。エレトリブタンの最高血漿中濃度到達時間（T_{max}）は空腹時1.6時間から食後2.6時間に延長した。食後投与によりC_{max}及びAUCは空腹時に比べてそれぞれ27%及び30%増大した⁷⁾。

（注：本剤の日本での承認用量は1回20 mg又は40 mgである）

3. 分布・代謝・排泄

- 健康成人6例にエレトリブタン40 mgを1日3回7日間反復経口投与した時、血漿蛋白結合率は87%であった⁶⁾。
- 本剤は、主にチトクロームP450 3A4により代謝されると考えられる⁸⁾。
- 健康成人（外国人）3例に¹⁴C-エレトリブタン30 mgを単回経口投与した時、尿中及び糞中に排泄された放射能は、投与量のそれぞれ44.5%及び45.0%であった。尿中に未変化体は投与量の6%、N-脱メチル体（活性代謝物）は2%認められた⁹⁾。

(4)健康成人にエレトリブタン20、40、80及び120 mg（各6例）を単回経口投与した時の腎クリアランスは、それぞれ80.2、66.4、64.3及び85.0 mL/minであった⁴⁾。

(5)健康成人6例にエレトリブタン1回40 mgを1日3回、あるいは1回80 mgを1日2回7日間反復経口投与した時の腎クリアランスは、1日目（それぞれ90.8及び88.7 mL/min）と比較して7日目（それぞれ79.1及び63.4 mL/min）では減少傾向を示した⁶⁾。

（注：本剤の日本での承認用量は1回20 mg又は40 mgである）

4. 相互作用（外国人データ）

(1)健康成人18例にエリスロマイシン500 mg又はプラセボを反復経口投与し、投与7日目にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時、エリスロマイシン併用群ではプラセボ併用群と比較してエレトリブタンのC_{max}は約2倍、AUCが約4倍に増大し、T_{1/2}は4.6時間から7.1時間に延長した。同時に軽度の血圧上昇が認められた¹⁰⁾。

(2)健康成人18例にベラパミル240 mg又はプラセボを反復経口投与し、投与6日目にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時、ベラパミル併用群ではプラセボ併用群と比較してエレトリブタンのC_{max}は2.2倍、AUCが2.7倍に増大し、T_{1/2}は4.5時間から4.9時間となり、その差は小さかった。臨床的に問題となる血圧への影響は認められなかった¹¹⁾。

(3)健康成人18例にフルコナゾール（1日目は200 mg、2日目以降は100 mg）又はプラセボを反復経口投与し、投与6日目にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時、フルコナゾール併用群ではプラセボ併用群と比較してエレトリブタンのC_{max}は1.36倍、AUCが2.0倍に増大し、T_{1/2}は4.68時間から6.44時間に延長した。臨床的に問題となる血圧への影響は認められなかった¹²⁾。

健康成人18例にケトコナゾール（本邦未承認）400 mg又はプラセボを反復経口投与し、投与3日目にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時、ケトコナゾール併用群ではプラセボ併用群と比較してエレトリブタンのC_{max}は約2.7倍、AUCが約5.9倍に増大し、T_{1/2}は4.8時間から8.3時間に延長した。同時に軽度の血圧上昇が認められた¹³⁾。

(4)健康成人12例にプロプラノロール80 mg又はプラセボを反復経口投与し、投与7日目にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時、プロプラノロール併用群ではプラセボ併用群と比較してエレトリブタンのC_{max}は1.1倍、AUCが1.3倍に増大し、T_{1/2}は4.9時間から5.2時間となり、その差は小さかった。臨床的に問題となる血圧への影響は認められなかった¹⁴⁾。

（注：本剤の日本での承認用量は1回20 mg又は40 mgである）

5. 高齢者（外国人データ）

高齢者（65～93歳）16例及び若年者（18～36歳）16例にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時のT_{max}、C_{max}及びAUCに有意差は認められなかった。しかし、消失速度定数（kel）は、高齢者の方が若年者に比べ有意に小さく、また、高齢者のT_{1/2}（5.7時間）は若年者（4.4時間）と比較して延長した²⁾。

（注：本剤の日本での承認用量は1回20 mg又は40 mgである）

6. 腎機能障害患者（外国人データ）

健康成人6例及び腎機能障害患者16例にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時のC_{max}及びAUCに有意差は認められなかったが、重度腎機能障害患者のT_{max}（5.6時間）は健康成人（2.6時間）と比較して有意に延長した¹⁵⁾。

（注：本剤の日本での承認用量は1回20 mg又は40 mgである）

7. 肝機能障害患者（外国人データ）

健康成人10例及び軽度又は中等度の肝機能障害患者10例にエレトリブタン80 mgを単回経口投与した時の肝機能障害患者のAUC（2,234 ng・h/mL）は、健康成人（1,661 ng・h/mL）と比較して有意に増大（35%）した。C_{max}は、有意ではないもののわずかに上昇した¹⁶⁾。

（注：本剤の日本での承認用量は1回20 mg又は40 mgである）

【臨床成績】

臨床効果

有効性を評価するために、国内用量反応試験及び外国第Ⅱ/Ⅲ相試験（7試験）を実施した¹⁷⁻²⁴⁾。

これらの試験は、プラセボ対照、二重盲検比較試験にて実施され、本剤のいずれの用量も服用2時間後の頭痛の改善率（頭痛の程度が「重度」又は「中等度」から、「軽度」又は「なし」に軽減した症例の割合）はプラセボと比較して統計的に有意に高かった。

また、エルゴタミン酒石酸塩2 mg・無水カフェイン200 mgを対照とした試験では、本剤のいずれの用量も服用2時間後の頭痛の改善率はエルゴタミン酒石酸塩・無水カフェインと比較して統計的に有意に高かった。

服用2時間後における頭痛の改善率 (%) (ITT)

実施国	開発相 (治験No.)	頭痛の改善率 (%)			
		エレクトリプタン		プラセボ	エルゴタミン酒石酸塩・ 無水カフェイン
		20 mg	40 mg		
国内	第II相 ¹⁷⁾ (160-901)	64%* (51/80)	67%* (51/76)	51% (40/79)	
	第II相 ¹⁸⁾ (160-314)	54%* (70/129)	65%* (76/117)	24% (30/126)	
外国	第III相 ¹⁹⁾ (160-305)		62%* (265/430)	19% (44/232)	
	第III相 ²⁰⁾ (160-307)		54%** (111/206)	21% (21/102)	33% (65/197)
	第III相 ²¹⁾ (160-318)		64%* (108/169)	31% (25/80)	
	第III相 ²²⁾ (160-102)	47%* (129/273)	62%* (174/281)	22% (60/276)	
	第III相 ²³⁾ (160-103)		58%* (283/492)	30% (36/122)	
	第III相 ²⁴⁾ (160-104)		62%* (109/175)	40% (34/86)	
	計	50%* (199/402)	60%* (1126/1870)	24% (250/1024)	

*p<0.05：プラセボとの比較

+p<0.0001：エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェインとの比較

【薬効薬理】

1. 5-HT_{1B}及び5-HT_{1D}受容体に対する親和性

エレクトリプタンは、ヒト5-HT_{1B}及び5-HT_{1D}受容体に対して選択的な親和性を示し、いずれの受容体に対しても作動薬として作用した^{25,26)}。

2. 作用機序

(1) 頭蓋内血管に対する収縮作用

エレクトリプタンは、ヒトから摘出した中硬膜動脈を濃度依存的に収縮させた。この作用は、冠動脈に対する収縮作用と比較して約80倍選択的であった^{26,27)}。また、脳動脈収縮の指標として測定した麻酔イヌの頸動脈血流量を、冠動脈血流量、大腿動脈血流量及び全身血圧に影響を及ぼさない用量で減少させた (ED₅₀値12 µg/kg、静脈内投与)^{26,28)}。

(2) 硬膜での血管透過性の亢進に対する抑制作用

エレクトリプタンは、100 µg/kg (静脈内投与) 以上の用量で、麻酔ラットの三叉神経節を電気刺激したときに硬膜に惹起される血漿蛋白の漏出を抑制した^{26,28)}。

【有効成分に関する理化学的知見】

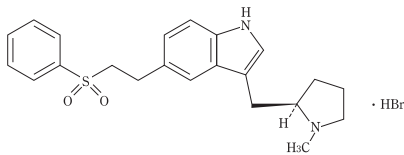
一般名：エレクトリプタン臭化水素酸塩 (eletriptan hydrobromide)

化学名：(+)-(R)-3-(1-methylpyrrolidin-2-ylmethyl)-5-(2-phenylsulfonyl ethyl)-1H-indole monohydrobromide

分子式：C₂₂H₂₆N₂O₂S · HBr

分子量：463.43

構造式：



性状：エレクトリプタン臭化水素酸塩は、白色又はわずかに着色した粉末であり、明らかに認められる異物を含まない。ジメチルアセトアミドに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、エタノール (99.5) 又は水に溶けにくい。

融点：173～176℃

分配係数 (LogD)：1.10 (pH7.4, 1-オクタノール/水系)

【包装】

エレクトリプタン錠20mg「ファイザー」：10錠 (患者さん用パッケージ入りPTP)

【主要文献】

- 1) International Headache Society 2018 : Cephalalgia 38(1) : 1, 2018
- 2) 社内資料：健康成人における薬物動態(性差、高齢者)
- 3) 社内資料：母乳中排泄
- 4) 社内資料：健康成人における単回投与時の安全性及び薬物動態
- 5) 社内資料：健康成人における単回投与及び単回静脈内投与時の薬物動態
- 6) 社内資料：健康成人における反復投与時の安全性及び薬物動態
- 7) 社内資料：健康成人における単回投与時の薬物動態に及ぼす食事の影響
- 8) 社内資料：代謝に関するチトクロムP450
- 9) 社内資料：健康成人における薬物動態
- 10) 社内資料：エリスロマイシン併用時の薬物動態
- 11) 社内資料：ペラバミル併用時の薬物動態
- 12) 社内資料：フルコナゾール併用時の薬物動態
- 13) 社内資料：ケトコナゾール併用時の薬物動態
- 14) 社内資料：プロプラノロール併用時の薬物動態
- 15) 社内資料：腎機能障害患者における薬物動態
- 16) 社内資料：肝機能障害患者における薬物動態
- 17) Eletriptan Steering Committee in Japan : Cephalalgia 22(6) : 416, 2002
- 18) Goadsby, P. J. et al. : Neurology 54(1) : 156, 2000
- 19) Stark, R. et al. : Cephalalgia 22(1) : 23, 2002
- 20) Diener, H-C. et al. : Eur Neurol 47(2) : 99, 2002
- 21) Sandrini, G. et al. : Neurology 59(8) : 1210, 2002
- 22) Sheftell, F. et al. : Headache 43(3) : 202, 2003
- 23) 社内資料：漸増投与による二重盲検比較試験
- 24) 社内資料：スマトリプタンを対照とした二重盲検比較試験
- 25) Napier, C. et al. : Eur J Pharmacol 368(2/3) : 259, 1999
- 26) 社内資料：非臨床薬理
- 27) Maassen VanDenBrink, A. et al. : Neurology 55(10) : 1524, 2000
- 28) Gupta, P. et al. : Eur J Pharmacol 398(1) : 73, 2000

※【文献請求先】

「主要文献」に記載の社内資料につきまして下記にご請求下さい。

ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部

〒105-0001 東京都港区虎ノ門5-11-2

フリーダイヤル 0120-419-043

参 考

国際頭痛学会による片頭痛の分類^(注)

1.1	前兆のない片頭痛
1.2	前兆のある片頭痛 <ul style="list-style-type: none"> 1.2.1 典型的な前兆に片頭痛を伴うもの 1.2.2 典型的な前兆に非片頭痛様の頭痛を伴うもの 1.2.3 典型的な前兆のみで頭痛を伴わないもの 1.2.4 家族性片麻痺性片頭痛 1.2.5 孤発性片麻痺性片頭痛 1.2.6 脳底型片頭痛
1.3	小児周期性症候群（片頭痛に移行することが多いもの） <ul style="list-style-type: none"> 1.3.1 周期性嘔吐症 1.3.2 腹部片頭痛 1.3.3 小児良性発作性めまい
1.4	網膜片頭痛
1.5	片頭痛の合併症 <ul style="list-style-type: none"> 1.5.1 慢性片頭痛 1.5.2 片頭痛発作重積 1.5.3 遷延性前兆で脳梗塞を伴わないもの 1.5.4 片頭痛性脳梗塞 1.5.5 片頭痛により誘発される痙攣
1.6	片頭痛の疑い <ul style="list-style-type: none"> 1.6.1 前兆のない片頭痛の疑い 1.6.2 前兆のある片頭痛の疑い 1.6.5 慢性片頭痛の疑い

国際頭痛学会による片頭痛診断基準^(注)

<p>1.1 前兆のない片頭痛</p> <p>A. B～Dを満たす頭痛発作が5回以上ある</p> <p>B. 頭痛の持続時間は4～72時間 (未治療もしくは治療が無効の場合)</p> <p>C. 頭痛は以下の特徴の少なくとも2項目を満たす</p> <ul style="list-style-type: none"> 1. 片側性 2. 拍動性 3. 中等度～重度の頭痛 4. 日常的な動作（歩行や階段昇降などの）により頭痛が増悪する、あるいは頭痛のために日常的な動作を避ける <p>D. 頭痛発作中に少なくとも以下の1項目を満たす</p> <ul style="list-style-type: none"> 1. 悪心または嘔吐（あるいはその両方） 2. 光過敏および音過敏 <p>E. その他の疾患によらない</p>
<p>1.2 前兆のある片頭痛</p> <p>A. Bを満たす頭痛が2回以上ある</p> <p>B. 片頭痛の前兆がサブフォーム1.2.1～1.2.6のいずれかの診断基準項目BおよびCを満たす</p> <p>C. その他の疾患によらない</p> <p>1.2.1 典型的な前兆に片頭痛を伴うもの</p> <p>A. B～Dを満たす頭痛発作が2回以上ある</p> <p>B. 少なくとも以下の1項目を満たす前兆があるが、運動麻痺（脱力）は伴わない</p> <ul style="list-style-type: none"> 1. 陽性徴候（例えばきらきらした光・点・線）および・または陰性徴候（視覚消失）を含む完全可逆性の視覚症状 2. 陽性徴候（チクチク感）および・または陰性徴候（感覚鈍麻）を含む完全可逆性の感覚症状 3. 完全可逆性の失語性言語障害 <p>C. 少なくとも以下の2項目を満たす</p> <ul style="list-style-type: none"> 1. 同名性の視覚症状または片側性の感覚症状（あるいはその両方） 2. 少なくとも1つの前兆は5分以上かけて徐々に進展するかおよび・または異なる複数の前兆が引き続き5分以上かけて進展する 3. それぞれの前兆の持続時間は5分以上60分以内 <p>D. 1.1「前兆のない片頭痛」の診断基準B～Dを満たす頭痛が、前兆の出現中もしくは前兆後60分以内に生じる</p> <p>E. その他の疾患によらない</p> <p>1.2.2 典型的な前兆に非片頭痛様の頭痛を伴うもの</p> <p>下記を除き1.2.1と同じ</p> <p>D. 1.1「前兆のない片頭痛」のB～Dを満たさない頭痛が、前兆の出現中もしくは前兆後60分以内に生じる</p> <p>1.2.3～1.2.6の診断基準については省略した</p>

注：国際頭痛分類 第2版（ICHD-II）：日本頭痛学会（新国際頭痛分類普及委員会）・厚生労働科学研究（慢性頭痛の診療ガイドラインに関する研究班）共訳より抜粋

※【製造販売】

ファイザーUPJ合同会社
東京都港区虎ノ門 5-11-2

※【販売】

ヴィアトリス製薬株式会社
東京都港区虎ノ門 5-11-2