

**2019年6月改訂(第3版)
*2019年1月改訂

日本標準商品分類番号

87216

規制区分:

劇薬
処方箋医薬品
注意—医師等の処方箋により
使用すること

5-HT_{1B/1D}受容体作動型片頭痛治療剤

エレトリプタンOD錠20mg「アメル」

ELETRIPTAN OD

貯 法:
気密容器、室温保存

* 使用期限:
包装箱に表示。
使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。

承認番号	23000AMX00783
葉価収載	2018年12月
販売開始	2018年12月

【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)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。]
- (3)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性発作があらわれることがある。]
- (4)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。]
- (5)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。]
- (6)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。]
- (7)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]

【効能・効果に関する使用上の注意】

- (1)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にのみ投与すること。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。
- 1)今までに片頭痛と診断が確定したことのない患者
- 2)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
- (2)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。

【組成・性状】

1. 組成

販売名	エレトリプタンOD錠20mg「アメル」
有効成分	1錠中、エレトリプタン臭化水素酸塩24.242mg(エレトリプタンとして20mg)を含有する。
添加物	クロスカルメロースナトリウム、スクラロース、黄色三二酸化鉄、D-マンニトール、D-マンニトール・カルメロース・結晶セルロース・クロスポビドン混合物、香料、ステアリン酸マグネシウム

2. 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード(表/裏)
エレトリプタンOD錠20mg「アメル」	素錠	  	アメルELT /OD 20
	淡黄色	直径:約 8.0mm 厚さ:約 2.9mm 質量:約180.0mg	

※本剤の錠剤表面に斑点が認められることがあります。これは使用色素によるものであり、品質に影響はありません。

【効能・効果】

片頭痛

【用法・用量】

通常、成人にはエレトリプタンとして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・用量に関する使用上の注意】

- (1)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。
- (2)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。
- (3)本剤は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜からの吸収により効果発現を期待する製剤ではないため、崩壊後は唾液又は水で飲み込むこと。[「適用上の注意」の項参照]

【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)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。]
- (2)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症候群の典型的な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。]
- (3)高齢者[「高齢者への投与」の項参照]
- (4)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。]
- (5)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。]

(6)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。]

(7)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

(1)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。

(2)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。

(3)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十分注意すること。

* * (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。

(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)	血圧上昇又は血管収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)	血圧上昇又は血管収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、グラリスロマイシン	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、軽度に血圧が上昇した。	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	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。
抗てんかん剤 カルバマゼビ ン		
抗結核薬 リファンピシン		
飲食物 セイヨウオトギリソウ(St. John's Wort、 セント・ジョンズ・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

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。

(1)重大な副作用(頻度不明)

1)アナフィラキシーショック、アナフィラキシー：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：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)：類薬(5-HT_{1B/1D}受容体作用薬)でWPW症候群の典型的な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：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。

(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。

頻度不明	
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1)} 、咽喉絞扼感 ^{注1)} 、無力症、胸痛 ^{注1)} 、多汗、倦怠感、咽喉頭疼痛、痙攣、悪寒、筋痛、胸部圧迫感 ^{注1)} 、背部痛、筋無力症

注1) 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]。

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：10.19mmHg、拡張期血圧の最大上昇の差：2.59mmHg)[[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]。

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40mgを超えて80mgまでを単回経口投与した際、本剤20mg、40mg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つたが、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80mg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・徵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

(1) 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)。

(2) 服用時：

- 1) 本剤は舌の上にのせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。
- 2) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用しないこと。

【薬物動態】

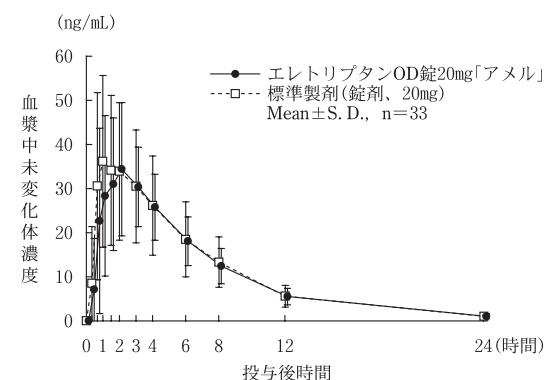
〈生物学的同等性試験²⁾

エレトリプタンOD錠20mg「アメル」と標準製剤(普通錠)を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(エレトリプタンとして20mg)健康成人男子に水なし又は水ありで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、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～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。

一水なし

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _(0→24) (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
エレトリプタンOD錠 20mg「アメル」	256.31± 81.59	40.02± 17.06	1.71±0.79	4.44±0.73
標準製剤 [*] (錠剤、20mg)	268.81± 117.12	39.65± 18.41	1.43±0.85	4.34±0.66

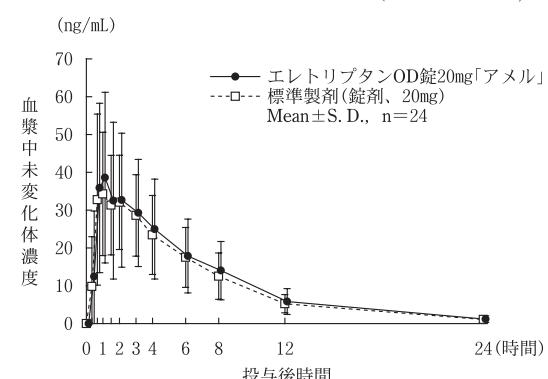
※水で服用 (Mean ± S. D., n=33)



一水あり

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _(0→24) (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
エレトリプタンOD錠 20mg「アメル」	270.60± 135.84	44.91± 23.75	1.17±0.91	4.45±0.56
標準製剤 (錠剤、20mg)	252.54± 98.10	42.56± 18.78	1.41±1.02	4.34±0.69

(Mean ± S. D., n=24)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax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。

【薬効薬理】

5-HT_{1D}と5-HT_{1B}受容体に麦角アルカロイドより選択的に相互作用し、動脈吻合を含む脳内の血管の収縮を引き起こす。また、血管周囲腔の神経終末の段階で炎症誘発性の神経ペプチドの遊離を遮断する。³⁾

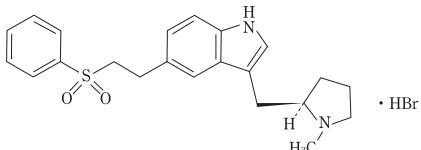
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エレトリプタン臭化水素酸塩
(Eletriptan Hydrobromide)

分子式：C₂₂H₂₆N₂O₂S · HBr

分子量：463.43

構造式：



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

性状：白色又はわずかに着色した粉末である。

ジメチルアセトアミド又はメタノールに溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

【取り扱い上の注意】

*〈安定性試験〉⁴⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、24ヵ月)及び加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、エレトリプタンOD錠20mg「アメル」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

【包 裝】

PTP10錠(10錠×1)

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- * * 1) International Headache Society 2018 : Cephalalgia, 38(1), 1(2018)
- 2) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 3) グッドマン・ギルマン：薬理書(上) 第12版, 廣川書店, 431(2013)
- 4) 共和薬品工業株式会社 社内資料：安定性試験

〈文献請求先〉

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。
日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172



参考

国際頭痛学会による片頭痛の分類^{注2)}

1.1 前兆のない片頭痛
1.2 前兆のある片頭痛
1.2.1 典型的前兆に片頭痛を伴うもの
1.2.2 典型的前兆に非片頭痛様の頭痛を伴うもの
1.2.3 典型的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)
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
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
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2)}

1.1 前兆のない片頭痛

- A. B～Dを満たす頭痛発作が5回以上ある
- 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)
- C. 頭痛は以下の特徴の少なくとも2項目を満たす
 - 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
- D. 頭痛発作中に少なくとも以下の1項目を満たす
 - 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
- E. 他の疾患によらない

1.2 前兆のある片頭痛

- A. Bを満たす頭痛が2回以上ある
- 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
- C. 他の疾患によらない

1.2.1 典型的前兆に片頭痛が伴うもの

- A. B～Dを満たす頭痛発作が2回以上ある
- 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
 - 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(感觉鈍麻)を含む完全可逆性の感觉症状
 - 3.完全可逆性の失語性言語障害
- C. 少なくとも以下の2項目を満たす
 - 1.同名性の視覚症状または片側性の感觉症状(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
- D. 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
- E. 他の疾患によらない

1.2.2 典型的前兆に非片頭痛様の頭痛を伴うもの

- 下記を除き1.2.1と同じ
- D. 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
- 1.2.3～1.2.6の診断基準については省略した

注2)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

販売元

JG 日本ジェネリック株式会社
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号

製造販売元

○ 共和薬品工業株式会社
大阪市北区中之島3-2-4

A20671DK2
410049000-003