

貯 法：室温保存  
使用期限：外箱に表示の使用期限内  
に使用すること  
注 意：開封後は吸湿に注意する  
こと

## 本態性・起立性・透析時低血圧治療剤

承認番号	22500AMX00428
薬価収載	1999年7月
販売開始	1999年7月

# ※ アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「フソー」

## Amezinium Metilsulfate Tablets 10mg "Fuso"

### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 高血圧症の患者 [高血圧症を悪化させる。]
- (2) 甲状腺機能亢進症の患者 [甲状腺機能亢進症を悪化させる。]
- (3) 褐色細胞腫のある患者 [急激な昇圧発作を起こすおそれがある。]
- (4) 狭隅角緑内障の患者 [急激な眼圧上昇をきたすおそれがある。]
- (5) 残尿を伴う前立腺肥大のある患者 [尿閉をきたすおそれがある。]

### ※【組成・性状】


#### 1. 組成

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「フソー」は1錠中アメジニウムメチル硫酸塩10mgを含む錠剤である。

添加物として乳糖水和物、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウムを含有する。

#### 2. 製剤の性状

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「フソー」は片面割線入りの白色の裸錠である。

外 形	大 き さ	識 別 コード
	直 径：6.5mm 厚 み：2.4mm	FS/D10

### 【効能・効果】

本態性低血圧，起立性低血圧，透析施行時の血圧低下の改善

### 【用法・用量】

#### 本態性低血圧，起立性低血圧

通常，成人にはアメジニウムメチル硫酸塩として，1日20mg（本剤2錠）を1日2回に分割経口投与する。

なお，年齢，症状により適宜増減する。

#### 透析施行時の血圧低下の改善

通常，成人にはアメジニウムメチル硫酸塩として，透析開始時に1回10mg（本剤1錠）を経口投与する。

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）

重篤な心臓障害のある患者 [本剤の交感神経機能亢進作用を介する心臓刺激作用により，心臓障害が悪化するおそれがある。]

#### 2. 重要な基本的注意

透析施行時の血圧低下への適用にあたっては，透析中に血圧が低下したために透析の継続が困難となることが確認されている慢性腎不全患者のみを対象とすること。

#### 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
ドロキシドパ	血圧の異常上昇をきたすことがある。	ドロキシドパから変換したノルアドレナリンの，末梢神経終末における再取り込みと不活性化が，本剤により抑制される。
ノルアドレナリン	血圧の異常上昇をきたすおそれがある。	本剤によりノルアドレナリンの末梢神経終末における再取り込みと不活性化が抑制される。

#### 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。

	頻 度 不 明
過 敏 症 <sup>注</sup>	発疹，湿疹，蕁麻疹
循 環 器	動悸，頻脈，血圧変動，不整脈（期外収縮，心房細動等），ほてり感，のぼせた感じ，胸部不快感，息苦しさ，浮腫，胸内苦悶感，四肢冷感
精 神 神 経 系	めまい，立ちくらみ，頭痛，頭重，気分不良，ふらつき，全身倦怠感，焦躁感，情緒不安定，不眠，眠気，全身のしびれ，耳鳴
消 化 器	嘔気・嘔吐，腹痛，胸やけ，食欲不振，腹部膨満，下痢，便秘，口渇感
肝 臓	AST(GOT)，ALT(GPT)の上昇等の肝機能異常
そ の 他	排尿障害，白血球減少，発熱，全身熱感，頸部痛，下肢痛，視力障害，歩行障害の悪化，構語障害の悪化

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。

#### 5. 高齢者への投与

投与に際しては少量から開始するなど用量に留意すること。  
[高齢者では生理機能（腎機能，肝機能）が低下していることが多い。]

#### 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まわ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) 本剤投与中は授乳を避けさせること。[動物実験（ラット）において乳汁中への移行が報告されている。]

## 7. 小児等への投与

乳児及び幼児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

**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、さら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。）

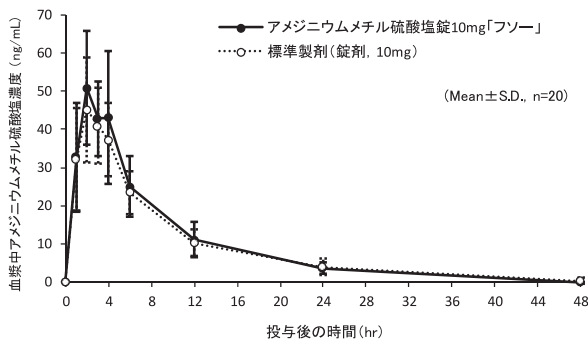
### ※※【薬物動態】

#### ◇生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「フソー」と標準製剤（錠剤、10mg）を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（アメジニウムメチル硫酸塩として20mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中アメジニウムメチル硫酸塩濃度を測定し、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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48hr</sub> (ng・hr/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$t_{max}$ (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「フソー」	455.9 (123.7)	54.8 (17.2)	2.3 (0.9)	5.7 (0.8)
標準製剤 (錠剤、10mg)	435.8 (106.0)	48.1 (12.0)	2.4 (0.8)	6.4 (1.8)

Mean (S. D.), n=20



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。

#### ◇溶出挙動

アメジニウムメチル硫酸塩錠10mg「フソー」は日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアメジニウムメチル硫酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている<sup>2)</sup>。

### 【薬効薬理】<sup>3)</sup>

#### ◇血圧上昇作用

本剤1回投与で用量依存的に収縮期血圧と拡張期血圧を同程度上昇させ、反復投与では安定した血圧上昇がみられ、耐性は認められない（ラット、イヌ）。

本剤は全末梢血管抵抗の増加及び心拍出量の増加により血圧を上昇させる（イヌ）。

その際、全末梢血管抵抗の増加は、主に皮膚及び骨格筋の血管系の抵抗増大によるものと考えられる。

#### ◇実験的起立性低血圧に対する作用

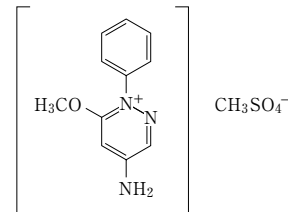
神経節遮断薬投与下の体位変換による実験的起立性低血圧において、本剤は起立後の血圧値を高く保持する（イヌ）。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アメジニウムメチル硫酸塩

化学名：4-amino-6-methoxy-1-phenylpyridazinium methylsulfate

構造式：



分子式： $\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{N}_3\text{O}_5\text{S}$

分子量：313.33

融点：約178°C（分解）

性状：白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。水又はメタノールにやや溶けにくく、酢酸(100)又はエタノール(95)に溶けにくく、アセトン又はクロロホルム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。0.1gを水10mLに溶かした液のpHは4.0～6.5である。

### 【取扱い上の注意】

#### ◇安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験（25°C、相対湿度60%、3年間）の結果、試験項目はいずれも規格範囲内であった<sup>4)</sup>。

### 【包装】

(PTP) 100錠（10錠×10）  
500錠（10錠×50）

### 【主要文献及び文献請求先】

- 1) 扶桑薬品工業株式会社（生物学的同等性試験）社内資料
- 2) 扶桑薬品工業株式会社（溶出挙動）社内資料
- 3) 筒井末春 ほか、現代医療, 24, 2109 (1992)
- 4) 扶桑薬品工業株式会社（安定性試験）社内資料

【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下さい。

扶桑薬品工業株式会社 研究開発センター 学術部門  
〒536-8523 大阪市城東区森之宮二丁目3番30号  
TEL 06-6964-2763 FAX 06-6964-2706  
(9:00～17:30/土日祝日を除く)

製造販売元



扶桑薬品工業株式会社

大阪市城東区森之宮二丁目3番11号

SG-007-007A