

◎ミオナール錠, ○エペリゾン塩酸塩錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エペリゾン塩酸塩 Eperisone Hydrochloride 【分類】 筋緊張改善剤

【単位】 ◎50mg/錠

【常用量】 150mg/日

【用法】 分3

【透析患者への投与方法】 常用量 (1)

透析患者の投与方法に言及した文献はないが、減量の必要はないと思われる (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 常用量 (5)

【特徴】 中枢神経系と血管平滑筋の双方に作用して、骨格筋緊張緩和作用と血流改善作用を発揮し、筋緊張症候を改善する。

【主な副作用・毒性】 ショック, アナフィラキシー, SJS, TEN, めまい, ふらつき, 眠気, 肝・腎障害, 口内炎, 四肢のふるえ, 貧血, 嘔吐, 尿閉, 発疹, 消化器症状など。中毒症状として QT 延長に関連 (Yamagiwa T, et al: Am J Emerg Med 32: 75-77, 2014)

【F】 初回通過効果を受け 10%程度 [ラット] (1) ヒトでの F もおそらく低い (5) 経口より経皮吸収が高い (Yang SI, et al: Pharmacology 2004 PMID: 15161997)

【tmax】 1.6~1.9hr (1) 1.6hr (Melilli B, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 36: 71-78, 2011)

【代謝】 肝代謝 (1) P450 にて ω -1 水酸化を受けて ω -1 水酸化体に変換され, 次にジオール体を経てカルボン酸型代謝物 (CMO) に代謝されると推測 (1) 代謝物の活性は低い (1) ミクロソームの 11 β -hydroxysteroid dehydrogenase type 1 [11 β -HSD 1] により代謝を受け, R 体の親和性が高い (Yoo HH, et al: Xenobiotica 41: 758-763, 2011) 酸化とカルボニル基の還元により 7 種の代謝物に変換され, 腸管での代謝には CYP2J2, 3A4 が寄与し初回通過効果の要因 (Yoo HH, et al: Xenobiotica 2009 PMID: 19219743) ラットでは消化管において CYP1A で ω -1 水酸化代謝物 (HMO) に代謝 (Mihara K, et al: Pharm Res 2001 PMID: 11587484)

【排泄】 腎・腸 (1) 尿中にはカルボン酸型代謝物 (CMO) が多く, ジオール体, ω -1 水酸化体の順に多く, 未変化体はほとんど認めない (1)

【CL】 7L/hr (1) AST, 喫煙が CL の共変量 (Baek IH, et al: Biopharm Drug Dispos 2021 PMID: 33527395)

【t1/2】 1.6~1.8hr (1) 1.87hr (Melilli B, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 36: 71-8, 2011) 半減期が短く蓄積性はない (Melilli B, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2011 PMID: 21448778)

【蛋白結合率】 95.8% (1)

【Vd】 49.9±34.1L/kg [おそらく Vd/F] (1)

【MW】 295.85

【透析性】 データなし (1) 蛋白結合率が高いため, 透析では除去されにくいと思われる (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない 【O/W 係数】 0.411 [1-オクタノール水系] (1) 【pKa】 8.91 (1)

【主な臨床報告】 ترامadol と併用した腰痛の改善効果はチザニジンより優れる (Rossi M, et al: Minerva Med 103: 143-9, 2012) 腰痛の改善効果が認められる (Chandanwale AS, et al: J Postgrad Med 57: 278-85, 2011) 痙性麻痺における効果は 150mg/日よりも 300mg/日が高い (Bresolin N, et al: Eur Rev Med Pharmacol Sci 13: 365-70, 2009) 痙性麻痺に対してバクロフェン 60mg/日とエペリゾン 300mg/日は同等の効果でエペリゾンで臨床的メリットが高いと思われる (Bresolin N, et al: Adv Ther 26: 563-73, 2009)

頸椎症治療に有用 (Bose K: Methods Find Exp Clin Pharmacol 1999 PMID: 10389124)

【更新日】 20240530

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。