

** 2013年5月改訂(第6版 会社住所の変更)
* 2009年10月改訂

日本標準商品分類番号

877229

貯 法：遮光、室温保存
使用期限：外箱、容器に表示

劇薬 処方箋医薬品^注

エドロホニウム塩化物製剤

日本薬局方 エドロホニウム塩化物注射液

アンチレクス® 静注10mg

ANTIREX® Intravenous injection 10mg

承認番号	22000AMX00661000
薬価収載	2008年6月
販売開始	1960年10月
再評価結果	1984年 9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)】

消化管又は尿路の器質的閉塞のある患者
[症状を悪化させるおそれがある。]

【組成・性状】

成分・含量 (1管1mL中)	日局 エドロホニウム塩化物10mg
添加物 (1管1mL中)	乾燥亜硫酸ナトリウム 2mg 等張化剤 4.7mg
剤形	注射剤
色調	無色澄明
pH	6.5~8.0
浸透圧比	約1 (生理食塩液に対する比)
溶血性	(-)

【効能・効果】

重症筋無力症の診断、筋弛緩剤投与後の遷延性呼吸抑制の作用機序の鑑別診断

【用法・用量】

重症筋無力症の診断には、エドロホニウム塩化物として、通常成人1回10mgを静脈内注射する。その際、まず初めに2mgを15~30秒かけて注射し、45秒後に反応をみた上で必要に応じて残りの8mgを注射する。

筋弛緩剤投与後の遷延性呼吸抑制の作用機序の鑑別診断には、エドロホニウム塩化物として、通常成人5~10mgを30~40秒かけて静脈内注射する。筋弛緩状態が改善されれば非脱分極性ブロック、筋弛緩状態が増強されれば脱分極性ブロックと判定する。必要があれば5~10分以内に同量を反復投与する。

なお、年齢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)

クリーゼにある重症筋無力症患者
[徐脈あるいは心拍の停止があらわれることがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1)本剤を重症筋無力症の鑑別診断に使用するとき、過敏症患者においては重症筋無力症であるなしにかかわらず**過度のコリン作動性反応**が起りうるので、これを防ぐためにアトロピン硫酸塩水和物0.5~1mgを入れた注射器をすぐ使えるようにしておくこと。
- (2)本剤の投与後、**徐脈、血圧低下等の過度のコリン作動性反応**が認められた場合には、アトロピン硫酸塩水和物を静注すること。
- (3)本剤の投与により、**短時間又は遷延性に抗コリンエステラーゼ剤非感受性期**を生じることがあるので、このような場合、抗コリンエステラーゼ剤の投与は再び感受性が戻るまで減量又は中止すること。

3. 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

痙攣、呼吸中枢麻痺：痙攣、呼吸中枢麻痺があらわれることがある。

(2)その他の副作用

	頻度不明
精神神経系	頭痛、めまい、流涙、流涎、発汗、低血圧
感覚器	眼調節異常、霧視、視野の歪曲
呼吸器	気管・気管支分泌亢進、声門痙攣
消化器	悪心・嘔吐、胃腸障害、腹部痙攣、下痢
過敏症 ^注	過敏症状
その他	顔面潮紅、不整脈(徐脈)、筋力低下

注)発現した場合には、投与を中止すること。

4. 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ので患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。]

6. 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(使用経験が少ない)。

7. 過量投与

- (1)ムスカリン作用(嘔気、嘔吐、下痢、発汗、気管支及び唾液分泌亢進、徐脈)があらわれるので、このような場合はアトロピン硫酸塩水和物を投与する。
- (2)気管支分泌亢進により気道閉塞が起こることがあるので、このような場合は、吸引(特に気管切開を行った場合)及びアトロピン硫酸塩水和物を投与する。
- (3)エドロホニウム塩化物を過量投与した場合、十分な呼吸を維持し、心機能をモニターし、痙攣又はショックが起きた場合は適切な処置を行う。

8. 適用上の注意

アンプルカット時：本品はワンポイントカットアンプルを使用しているが、アンプルの首部をエタノール綿等で清拭し、カットすること。

【薬物動態】

ラットに¹⁴C-エドロホニウム塩化物4.0μmol/kgを静注した結果、血中濃度は2相性の減少を示し、第1相の半減期は8.3分であった¹⁾。また、6時間後で投与量の約5%が胆汁中に排泄され、代謝物のほとんどが3-oxyglucuronideで、未変化体はほとんど検出されなかった²⁾。

【薬効薬理】

1. コリンエステラーゼ阻害作用³⁾

ヒト(歯科手術時)にエドロホニウム塩化物を20mg投与して、その血清コリンエステラーゼ阻害作用を検討した結果、投与後3分位で作用が最大となり、10分位でコリンエステラーゼ活性は投与前の50%位まで回復した。

2. 重症筋無力症の脱力状態回復⁴⁾⁵⁾

エドロホニウム塩化物は、持続効果の短い抗コリンエステラーゼ剤で、投与後の眼筋等の脱力状態の回復の有無により、重症筋無力症の診断に使用される。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エドロホニウム塩化物(Edrophonium Chloride)[JAN]

化学名：N-Ethyl-3-hydroxy-N,N-dimethylanilinium chloride

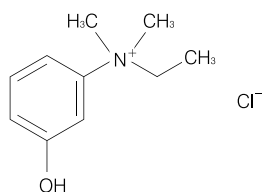
分子式：C₁₀H₁₆ClNO

分子量：201.69

融点：166～171℃(分解)

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。
本品は水に極めて溶けやすく、エタノール(95)又は酢酸(100)に溶けやすく、無水酢酸又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。
本品は吸湿性である。
本品は光によって徐々に着色する。

化学構造式：



【包装】

アンチレクス静注10mg

1mL(10mg)10管

【主要文献】

- 1)Back, D. J., *Brit. J. Pharmacol.*, **46**, 355(1972).
- 2)Back, D. J., *Brit. J. Pharmacol.*, **44**, 534(1972).
- 3)Barrow, M. E. H., et al., *Brit. J. Anaesth.*, **38**, 420(1966).
- 4)宇尾野公義, 内科, **38**(3), 402(1976).
- 5)Wray, S. H., *Neurology*, **21**, 586(1971).

【文献請求先】「*」「**」

杏林製薬株式会社 くすり情報センター

〒101-8311 東京都千代田区神田駿河台4-6

TEL 0120-409341

受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

*** 杏林製薬株式会社
東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地