

**医薬品インタビューフォーム**  
日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2013 に準拠して作成

エドロホニウム塩化物製剤

**アンチレクス® 静注10mg**

**ANTIREX® Intravenous injection 10mg**

剤 形	注 射 剤
製 剤 の 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
規 格 ・ 含 量	規 格：1管1mL 含 量：1mL中に日局エドロホニウム塩化物10mg含有
一 般 名	和 名：エドロホニウム塩化物 洋 名：Edrophonium Chloride
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬 価 基 準 収 載 ・ 発 売 年 月 日	製 造 販 売 承 認 年 月 日：2008年 3月13日 薬 価 基 準 収 載 年 月 日：2008年 6月20日 発 売 年 月 日：1960年 10月5日
	旧名称「アンチレクス」 製 造 販 売 承 認 年 月 日 1960年 8月10日 薬 価 基 準 収 載 年 月 日 1961年 12月1日 発 売 年 月 日 1960年 10月5日
開 発 ・ 製 造 販 売 ( 輸 入 ) ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製 造 販 売 元：杏林製薬株式会社
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	
問 い 合 わ せ 窓 口	杏林製薬株式会社 くすり情報センター TEL 0120-409341 受付時間：9:00～17:30（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.kyorin-pharm.co.jp/medicalworker/">http://www.kyorin-pharm.co.jp/medicalworker/</a>

本 IF は 2013 年 5 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認下さい。

## IF 利用の手引きの概要－日本病院薬剤師会－

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」（<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

#### 【IF の様式】

- ①規格は A 4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

### 【 I F の作成】

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「 I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（ P D F ）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

### 【 I F の発行】

- ① 「 I F 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「 I F 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

## 3. I F の利用にあたって

「 I F 記載要領 2013」においては、 P D F ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」に掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、 I F の利用性を高める必要がある。

また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、 I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、 I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」で確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

## 4. 利用に際しての留意点

I F を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。 I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、 I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂・一部改変)

# 目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名(命名法)	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
7. CAS登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	4
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 注射剤の調製法	4
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4
5. 製剤の各種条件下における安定性	5
6. 溶解後の安定性	5
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5
8. 生物学的試験法	5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	5
10. 製剤中の有効成分の定量法	5
11. 力価	5
12. 混入する可能性のある夾雑物	6
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6
14. その他	6
V. 治療に関する項目	7
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
VI. 薬効薬理に関する項目	9
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	9
2. 薬理作用	9
VII. 薬物動態に関する項目	10
1. 血中濃度の推移・測定法	10
2. 薬物速度論的パラメータ	10
3. 吸収	11
4. 分布	11
5. 代謝	11
6. 排泄	11
7. トランスポーターに関する情報	12
8. 透析等による除去率	12

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	13
1. 警告内容とその理由	13
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	13
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	13
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	13
5. 慎重投与内容とその理由	13
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	13
7. 相互作用	13
8. 副作用	14
9. 高齢者への投与	14
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	14
11. 小児等への投与	14
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
13. 過量投与	15
14. 適用上の注意	15
15. その他の注意	15
16. その他	15
IX. 非臨床試験に関する項目	16
1. 薬理試験	16
2. 毒性試験	16
X. 管理的事項に関する項目	17
1. 規制区分	17
2. 有効期間又は使用期限	17
3. 貯法・保存条件	17
4. 薬剤取扱い上の注意点	17
5. 承認条件等	17
6. 包装	17
7. 容器の材質	17
8. 同一成分・同効薬	17
9. 国際誕生年月日	17
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	18
11. 薬価基準収載年月日	18
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	18
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	18
14. 再審査期間	18
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	18
16. 各種コード	18
17. 保険給付上の注意	18
XI. 文献	19
1. 引用文献	19
2. その他の参考文献	19
XII. 参考資料	20
1. 主な外国での発売状況	20
2. 海外における臨床支援情報	20
XIII. 備考	21
その他の関連資料	21

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

全身麻酔剤の発展に伴い筋弛緩剤の使用も頻繁となり、その拮抗剤の重要性が高まってきた。  
この様な背景から速効的な抗クラーレ作用を有するエドロホニウム塩化物 (Edrophonium Chloride) を国産化した。

同一製品としては外国ではロシュよりテンシロンの商品名で販売されている。

本剤は主に、重症筋無力症の診断 (テンシロンテスト) に応用される。

なお、第一次再評価 (1984年9月結果公示) で本剤の有用性が認められている。

「アンチレクス」は、「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について (平成16年6月2日付 薬食発第0602009号)」に基づき、2008年6月「アンチレクス静注10mg」と販売名を変更した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は、エドロホニウム塩化物の製剤で、ネオスチグミンに比し、速効・一過性のコリンエステラーゼ阻害作用を有し<sup>1),2)</sup>、重症筋無力症の診断や筋弛緩剤投与後の遷延性呼吸抑制の作用機序鑑別診断に用いられる。

## II. 名称に関する項目

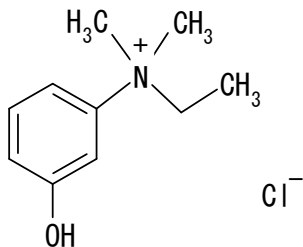
### 1. 販売名

- (1) 和名  
アンチレクス静注 10mg
- (2) 洋名  
ANTIREX Intravenous injection 10mg
- (3) 名称の由来  
Anti-relaxing agent (抗筋弛緩剤) に由来する。

### 2. 一般名

- (1) 和名 (命名法)  
エドロホニウム塩化物 (JAN)
- (2) 洋名 (命名法)  
Edrophonium Chloride (JAN, USAN, BAN, INN)
- (3) ステム  
四級アンモニウム化合物 : -ium

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 :  $C_{10}H_{16}ClNO$   
分子量 : 201.69

### 5. 化学名 (命名法)

*N*-Ethyl-3-hydroxy-*N,N*-dimethylanilinium chloride (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

### 7. CAS 登録番号

116-38-1 (エドロホニウム塩化物)  
312-48-1 (エドロホニウム)

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・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。  
本品は光によって徐々に着色する。

##### (2) 溶解性

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。

##### (3) 吸湿性

本品は吸湿性である。  
約60%RH(40℃)で、1日後には13%吸湿する。

##### (4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：166～171℃(分解)

##### (5) 酸塩基解離定数

pka：8.07 (27℃)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは3.5～5.0である。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

保存条件	保存期間	保存形態	結果
室温	3箇月	遮光した気密容器	変化なし
蛍光灯下 (5000～7000ルクス)	10日	開放シャーレ	約3時間で外観が白色から淡紫色に変化した。

#### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方のエドロホニウム塩化物の確認試験法による。

##### (1) フェノール性水酸基の確認

塩化鉄(Ⅲ)試液による呈色反応(淡赤紫色)

##### (2) 紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを比較するとき、同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

##### (3) 塩化物の確認

塩化物の定性反応

#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方のエドロホニウム塩化物の定量法による。

電位差滴定法による定量法

0.1mol/L過塩素酸 1mL=20.169 mgC<sub>10</sub>H<sub>16</sub>ClNO



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

成分・含量 (1管1mL中)	日局 エドロホニウム塩化物 10 mg
添加物 (1管1mL中)	乾燥亜硫酸ナトリウム 2 mg 等張化剤 4.7 mg
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	(-)

#### (2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等 上記参照

#### (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類 窒素

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1 管 1mL 中に日局 エドロホニウム塩化物を 10 mg 含有する。

#### (2) 添加物

乾燥亜硫酸ナトリウム、等張化剤

#### (3) 電解質の濃度

該当資料なし

#### (4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

#### (5) その他

該当しない

### 3. 注射剤の調製法

該当しない

### 4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 5. 製剤の各種条件下における安定性

保存条件	保存期間	保存形態	結果
室温	6年	褐色ガラスアンプル密封	変化なし
蛍光灯下	90日		

## 6. 溶解後の安定性

該当資料なし

## 7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

[参考] pH変動試験値

投与法	規格 pH域	試料 pH	0.1mol/L HCl (A) 0.1mol/L NaOH (B)	最終 pH または 変化点 pH	移動 指数	浸透 圧比
静注	6.5~8.0	7.2	(A)10.0	1.1	6.4	約1
			(B)10.0	13.0	5.8	

\*規格 pH 域：製造承認書に記載された値を示す。

\*試料 pH は実験に供した注射薬の pH を示す。

\*pH 変動：

0.1mol/L HCl を (A)、0.1mol/L NaOH を (B) とし、滴加 mL 数を記入してある。

10mL をもって限度とし、次に最終または変化点 pH を記入、移動指数は試料 pH とこれらの差で示される。

\*浸透圧比は氷点降下法により測定し、0.9%生理食塩液（286mOsm）を 1 として比で表した。

## 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方のエドロホニウム塩化物注射液の確認試験法による。

### (1) フェノール性水酸基の確認

塩化鉄(III)試液による呈色反応（淡赤紫色）

### (2) 紫外可視吸光度測定法による確認

（極大吸収波長：272~276nm）

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方のエドロホニウム塩化物注射液の定量法による。

試料溶液及び標準溶液につき、紫外可視吸光度測定法により試験を行い、波長 273nm における吸光度  $A_T$  及び  $A_S$  を測定する。

エドロホニウム塩化物 ( $C_{10}H_{16}ClNO$ ) の量 (mg)

$$= \text{エドロホニウム塩化物標準品の量 (mg)} \times A_T / A_S$$

## 11. 力価

該当しない

**12. 混入する可能性のある夾雑物**

該当資料なし

**13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報**

該当資料なし

**14. その他**

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

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

### 2. 用法及び用量

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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床効果

[参考]

重症筋無力症の診断に使用された例は以下のとおりである。

##### 1) アンチレクス静注10mgによる筋無力症の診断

[使用方法]

アンチレクス静注10mg 0.5mL(5mg)をツベルクリン注射器にとり通常肘静脈よりゆっくりと注射する。

時間は1～2分位かけて行なうのが安全であり、決して急いではない。

効果は早いもので注射完了30秒後で最高に達し2分間位持続する。

一般に眼科医を訪れる筋無力症の患者はほとんどが眼筋無力症であり、この疾患は重症筋無力症の患者に較べて、過敏性を呈することは稀である。

それ故本剤を投与中に症状の改善を見たら、注射を中止してしまえば良い。

欧米の文献には10mg静注と記してあるが、日本人は大体5mgで十分なことが多い<sup>3)</sup>。

[石川 哲、他、臨床眼科、18, 53(1964).]

##### 2) 抗コリンエステラーゼ剤不応性の重症筋無力症への対応<sup>4)</sup>

[有森 茂、日本医事新報、3630, 134(1993).]

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

抗コリンエステラーゼ剤  
(ネオスチグミン、ピリドスチグミン、アンベノニウム)

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

コリン作動性神経終末と効果細胞の接合部や後シナプス部位におけるアセチルコリンの作用を終わらせる酵素としてアセチルコリンエステラーゼがある。

エドロホニウム塩化物は、このアセチルコリンエステラーゼを阻害するため、抗コリンエステラーゼ薬と呼ばれ、フィズスチグミンに代表される可逆的な抗コリンエステラーゼ薬に分類される。

エドロホニウム塩化物は、コリン作動性受容体でのアセチルコリンの蓄積を起こし、中枢神経系、末梢神経系を問わずコリン作動性受容体を過剰に刺激したのと同質の効果を強力に発揮する<sup>5)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) コリンエステラーゼ阻害作用

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<sup>2)</sup>。

##### 2) 重症筋無力症の脱力状態回復

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<sup>6)、7)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

- (1) 治療上有効な血中濃度  
該当資料なし
- (2) 最高血中濃度到達時間  
該当資料なし
- (3) 臨床試験で確認された血中濃度  
該当資料なし
- (4) 中毒域  
該当資料なし
- (5) 食事・併用薬の影響  
該当資料なし
- (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因  
該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法  
該当しない
- (2) 吸収速度定数  
該当資料なし
- (3) バイオアベイラビリティ  
該当資料なし
- (4) 消失速度定数  
該当資料なし
- (5) クリアランス  
下記の分布容積の項参照
- (6) 分布容積

[参考]

ネオスチグミン、エドロホニウム及びピリドスチグミンの薬物動態（外国人患者）<sup>8)</sup>

	分布容積 (Vdss' L/kg)	分布半減期 ( $t_{1/2} \alpha'$ min)	排泄半減期 ( $t_{1/2} \beta'$ min)	クリアランス (CL' mL/kg/min)
ネオスチグミン (5.0mg)	0.7	3.5	80	9.0
エドロホニウム (0.5~1.0mg/kg)	1.1	7.2	110	9.6
ピリドスチグミン (0.35mg/kg)	1.1	6.8	112	8.6

- (7) 血漿蛋白結合率  
該当資料なし

### 3. 吸収

[参考]

ラットに  $^{14}\text{C}$ -エドロホニウム塩化物  $4.0 \mu\text{mol/kg}$  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<sup>9)</sup>。

### 4. 分布

(1) 血液—脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液—胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

[参考]

ラットに  $^{14}\text{C}$ -エドロホニウム塩化物  $2.0 \mu\text{mol/kg}$  を静注した結果、5 分後の肝と腎において高濃度を示し、肝と腎とで投与量の半分以上が認められ、他の組織及び器官における濃度のほぼ 20 倍であった<sup>9)</sup>。

### 5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

[参考]

約 70% が腎から排泄され、残りは腎以外で代謝・排泄される。  
エドロホニウムは代謝してエドロホニウムグルクロニドとなる（海外）<sup>8)</sup>。

[参考]

ラットに  $^{14}\text{C}$ -エドロホニウム塩化物  $2.0 \mu\text{mol/kg}$  を静注した結果、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<sup>10)</sup>。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

### 6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

VII. 薬物動態 5. 代謝 (1) 代謝部位及び代謝経路の項を参照のこと。

(2) 排泄率

VII. 薬物動態 5. 代謝 (1) 代謝部位及び代謝経路の項を参照のこと。



- (3) 排泄速度  
該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報  
該当資料なし

8. 透析等による除去率  
該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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。]

(設定理由)

同様なコリンエステラーゼ阻害作用を持つ臭化ジスチグミンでは、器質的なイレウス、尿路閉塞の患者においては抗コリンエステラーゼ作用により蠕動運動が亢進し、また排尿筋の収縮も起こるので症状を悪化させるおそれがある<sup>11)</sup>。

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

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。]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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こりうるので、これを防ぐためにアトロピン硫酸塩水和物 0.5～1 mg 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。

(設定理由)

- (2) 徐脈、血圧低下等のコリン作動性反応はムスカリン受容体に対する作用であり、アトロピンにより有効に拮抗される<sup>5)</sup>。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

## (2) 併用注意とその理由

エドロホニウム（コリン作動薬）のコリン作動クリーゼ（過量）は用量不足（筋弛緩性脱力）に酷似し、この薬物の投与はそれらの状態を増悪するので他の抗コリンエステラーゼ剤を与えられている患者には慎重に用いなければならない<sup>12)</sup>。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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。

### (2) 重大な副作用と初期症状

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。

副作用発生原因及び処置方法

副作用があらわれた場合は、減量又は投与を中止する。流涙、流涎、発汗、低血圧、気管・気管支分泌亢進、悪心・嘔吐、疝痛、下痢、徐脈等はコリン作動性反応であり、これらの反応が認められた場合には、アトロピン硫酸塩水和物を0.5mg投与する<sup>4)、13)</sup>。

### (3) 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、腹部疝痛、下痢
過 敏 症 <sup>注)</sup>	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) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

### (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

蕁麻疹等の過敏症があらわれた場合には投与を中止すること。

## 9. 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。

## 10. 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。]

## 11. 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）。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 13. 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。

## 14. 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。

## 15. その他の注意

該当しない

## 16. その他

該当しない

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）

#### (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### (3) 安全性薬理試験

##### 1) 中枢神経系に対する作用

Domer らは脊髄に対するエドロホニウムの作用について検討した。

エドロホニウム塩化物をネコ頸髄の脊表面に薬物を適用すると、後肢に自発性の搔爬反射が出現し、耳介あるいはその近傍摩擦によりこの反射は増強された。

しかしペントバルビタールナトリウム麻酔ネコにエドロホニウム塩化物を適用しても、この反応は出現しなかった<sup>14)</sup>。

##### 2) 心臓と血圧に対する作用

Randall はイヌにエドロホニウム 0.1～2.0mg/kg (静注) 投与し、血圧と心拍数に対する影響は少ないことを報告している<sup>15)</sup>。

##### 3) 呼吸に対する作用

Su らは麻酔したイヌを用い、syncurine による呼吸抑制に対するエドロホニウムの拮抗効果を検討した。syncurine は投与後 4 分で最大の呼吸抑制を生じたが約 10 分後に回復した。

エドロホニウムを syncurine 投与の 3 分後に与えると効果は瞬間的にあられ、呼吸容量は、6.89 分後に正常に回復した。

全換気量が呼吸容量よりも早く、正常に回復したと報告している<sup>16)</sup>。

#### (4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

#### (1) 単回投与毒性試験

表 単回投与毒性試験<sup>17)</sup>

	LD <sub>50</sub>
	静脈内
マウス	0.30mg (体重 20～22g)

(Behrens-Kaerber 法)

#### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

#### (3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (4) その他の特殊毒性

拮抗作用

エドロホニウムの拮抗作用をマウス(静注)で検討した。

エドロホニウム単独投与とアトロピン、ツボクラリン及びヘキサメトニウムをそれぞれ併用しても、拮抗作用に差は認められなかった<sup>18)</sup>。

エドロホニウム単独 18.6 (17.6～19.6) mg/kg、アトロピン併用 17.4 (16.35～18.5) mg/kg、ツボクラリン併用約 20 mg/kg、ヘキサメトニウム併用 17.6 (16.45～18.8)mg/kg

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：劇薬、処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意-医師等の処方箋により使用すること

有効成分：劇薬

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造の翌月より5年

### 3. 貯法・保存条件

貯法：遮光、室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目、14. 適用上の注意の項を参照のこと。

#### (3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

### 5. 承認条件等

なし

### 6. 包装

1 mL (10mg) 10 管

### 7. 容器の材質

褐色のガラスアンプル

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同 効 薬：(治療薬として) ネオスチグミン、ピリドスチグミン、アンペノニウム 等

### 9. 国際誕生年月日

不明

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造承認年月日：2008年3月13日 (旧名称「アンチレクス」：1960年8月10日)  
製造承認番号：22000AMX00661000 (旧名称「アンチレクス」：(長薬) 第7323号)

「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について(平成16年6月2日付 薬食発第0602009号)」に基づき、販売名を変更した。

## 11. 薬価基準収載年月日

2008年6月20日 (旧名称「アンチレクス」：1961年12月1日)  
本剤は1991年3月第12改正日本薬局方の制定に伴い日本薬局方収載品目となったため、1992年10月1日新たに日本薬局方医薬品として薬価基準へ収載された。

## 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

## 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価：1984年9月27日(その23)  
内 容： カテゴリー1(変化なし)

## 14. 再審査期間

該当しない

## 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

## 16. 各種コード

販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
アンチレクス静注10mg	111973201	7229401A1035	62000719

## 17. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) Wilson, I. B., Arch. Int. Pharmacodyn., 104, 204(1955).
- 2) Barrow, M. E. H., et al., Brit. J. Anaesth., 38, 420(1966).
- 3) 石川 哲, 他, 臨眼, 18(1), 53(1964).
- 4) 有森 茂, 日本医事新報, No.3630, P134(1993).
- 5) 藤原元始, 他, グッドマン・ギルマン薬理書, 第7版, 廣川書店, 東京, 1988, P143.
- 6) 宇尾野公義, 内科, 38(3), 402(1976).
- 7) Wray, S. H., Neurology, 21, 586(1971).
- 8) Cronnelly R. Morris RB: Br.J. Anaesth., 54, 183(1982).
- 9) Back D. J. et al., Brit. J. Pharmacol., 46, 355(1972).
- 10) Back D. J. et al., Brit. J. Pharmacol., 44, 534(1972).
- 11) 中野眞汎, 医薬品の使用禁忌とその理由, 医薬ジャーナル, 1987, P47.
- 12) 吉利 和, 他, マーチン 薬の副作用と臨床, 繁用医薬品の相互作用 一覧表-第2版-, 廣川書店, 東京, 1984, P.197.
- 13) 井形昭弘, 他, 総合臨牀, 24(5), 806(1975).
- 14) Domer. F. R., et al., Brit. J. Pharmacol., 25, 411(1965).
- 15) Randall, L. O., J. Pharmacol. Exptl. therap., 100, 83(1950).
- 16) Su, H. H., et al., Science, 113, 743(1951).
- 17) 田中, 他, 杏林製薬(株)社内資料
- 18) Parkes M. W. et al., Nature, 174, 969(1954).

### 2. その他の参考文献

なし



## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

Tensilon(カナダ)、他

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XII. 備考

その他の関連資料

なし

## 情報提供サービスのご案内

弊社製品の情報を電話、インターネットによりお届けしております。  
弊社製品についてお知りになりたい事などございましたら、お気軽にご利用ください。

### ●製品に関するお問い合わせ・ご意見

弊社製品に関するお問い合わせ、ご意見等はお電話でのお問い合わせのみとなります。  
下記の窓口までご連絡ください。

電話 0120-409341

受付時間 9:00～17:30（土・日・祝日・弊社休業日を除く）

担当部署 くすり情報センター

### ●キョーリン製薬ホームページ

弊社ホームページの「医療用医薬品情報」に添付文書、インタビューフォーム、剤形写真などの製品情報を掲載しております。下記アドレスにアクセスしてください。

URL <http://www.kyorin-pharm.co.jp/>

#### <掲載情報>

##### ●医療用医薬品情報

添付文書、くすりのしおり、インタビューフォーム、剤形写真、規制区分など

##### ●添付文書等改訂情報

##### ●新発売製品情報

##### ●新薬開発情報