

筋緊張性疾患治療剤

処方箋医薬品*

**アフロクアロン錠20mg「サワイ」

AFLOQUALONE

アフロクアロン錠

貯法：遮光室温保存
使用期限：外箱に表示

日本標準商品分類番号

871249

**	承認番号	22700AMX00095000
	薬価収載	2015年6月
	販売開始	1997年8月

※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)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

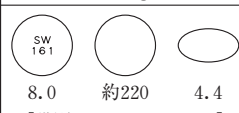
【組成・性状】

・組成

アフロクアロン錠20mg「サワイ」は、1錠中に日局アフロクアロン20mgを含有する。

添加物として、アラビアゴム、カルナウバロウ、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、炭酸Ca、トウモロコシデンプン、白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトールを含有する。

・製剤の性状

剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
糖衣錠	 8.0 約220 4.4 [識別コード：SW 161]	白色

【効能・効果】

下記疾患における筋緊張状態の改善

頸肩腕症候群、腰痛症

下記疾患による痙性麻痺

脳血管障害、脳性麻痺、痙性脊髄麻痺、脊髄血管障害、頸部脊椎症、後縦靭帯骨化症、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、脊髄小脳変性症、外傷後遺症(脊髄損傷、頭部外傷)、術後後遺症(脳・脊髄腫瘍を含む)、その他の脳脊髄疾患

【用法・用量】

アフロクアロンとして、通常成人1日量60mg(3錠)を3回に分けて経口投与する。

年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

反射運動能力の低下、眠気等が起こることがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意すること。

2. 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。

副作用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。

	頻度不明
精神神経系	ふらつき、めまい、眠気、頭痛
消化器	悪心、食欲不振、腹痛、胃部不快感、嘔吐、下痢、口渇、便秘、腹部膨満感、胃炎

	頻度不明
皮膚	光線過敏症
過敏症	発疹、痒痒
その他	脱力感、倦怠感、浮腫、耳鳴、頻尿、口内炎

3. 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減量するなど注意すること。

4. 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) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。〔授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

5. 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)。

6. 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、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)

【薬物動態】

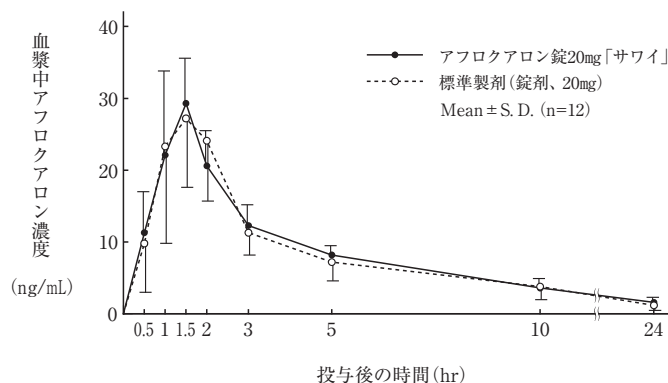
1. 生物学的同等性試験

アフロクアロン錠20mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(アフロクアロンとして20mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中アフロクアロン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL)
アフロクアロン錠 20mg「サワイ」	31.3±7.4	1.3±0.2	7.3±1.4	138.8±29.8
標準製剤 (錠剤、20mg)	32.9±7.9	1.5±0.4	8.1±5.0	134.8±39.4

(Mean ± S. D.)



血漿中濃度ならびに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。

2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

中枢神経系に作用して筋緊張亢進状態を緩解させる。除脳固縮(γ-固縮)の方が貧血性除脳固縮(α-固縮)よりも強力に緩解されるので、γ-系に対してより強い抑制作用を有する。脊髓レベルへの直接作用によって多シナプス及び単シナプス反射電位を抑制するが、介在ニューロン抑制作用による多シナプス反射電位抑制のほうが顕著に認められる。一方、抗痙攣作用、正常体温降下作用、条件回避反応抑制作用などは比較的弱く、筋緊張緩解作用が選択的に認められる。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アフロクアロン (Afloqualone)

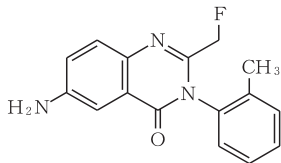
化学名：6-Amino-2-fluoromethyl-3-(2-tolyl)-3H-quinazolin-4-one

分子式：C₁₆H₁₄FN₃O

分子量：283.30

融点：約197℃(分解)

構造式：



性状：アフロクアロンは白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。アセトニトリルにやや溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。光によって徐々に着色する。

*【取扱い上の注意】

・安定性試験

PTP包装したものをを用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

*【包装】

PTP：100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

- 1) 沢井製薬(株)社内資料 [生物学的同等性試験]
- 2) “第16改正日本薬局方 解説書,” 廣川書店, 東京, 2011, C-189～C-193.
- 3) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元
沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K10 A150601