

中枢・末梢性筋緊張緩解剤
※ **ロキシーン[®]錠4mg**
LOXEEN[®] Tab. 4mg

※ 承認番号	21900AMX01432000
※ 薬価収載	2007.12
販売開始	2004.12
再評価結果	1976.7
再評価結果 (品質再評価)	2004.2


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。

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1) 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 緑内障の患者 [抗コリン作用により眼圧を上昇させるおそれがある。]
- (3) 前立腺肥大による排尿障害のある患者 [抗コリン作用により排尿障害を悪化させるおそれがある。]
- (4) 重篤な心疾患の患者 [心疾患の症状を悪化させるおそれがある。]
- (5) 麻痺性イレウスの患者 [麻痺性イレウスの症状を悪化させるおそれがある。]

【組成・性状】

品名	ロキシーン錠4mg	
有効成分	プリジノールメシル酸塩	
添加物	乳糖水和物、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム	
含量	1錠中 4mg	
剤形・色調	白色の割線入素錠	
外形		直径 9.0mm
		厚さ 2.5mm
		重量 約200mg
包装コード	TBP121	

【効能・効果】

運動器疾患に伴う有痛性痙縮

(腰背痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、変形性脊椎症など)

【用法・用量】

プリジノールメシル酸塩として、通常成人1回4mgを1日3回経口投与する。

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)
 - (1) 肝障害の患者[肝障害を悪化させるおそれがある。]
 - (2) 腎障害の患者[腎障害を悪化させるおそれがある。]
2. 重要な基本的注意
眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下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に注意すること。

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
中枢神経抑制剤 (フェノチアジン系薬剤、バルビツール酸誘導体等) モノアミン酸化酵素阻害剤 アルコール	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下を増強することがあるので、単独投与することが望ましいが、止むを得ず併用する場合には、減量するなど注意すること。	相互に中枢神経抑制作用を増強することがある。

4. 副作用^{1)~4)}

臨床試験974例中、副作用が報告されたのは135例(13.8%)で、症状別では眠気32例(3.3%)、めまい・ふらつき感21例(2.2%)、倦怠感・脱力感17例(1.7%)、また、悪心・嘔吐・食欲不振等の消化器症状53例(5.4%)が主たるもので、重篤な症状は認められなかった。臨床検査値の変動は、白血球減少が1例(10例中)認められた。(再評価終了時)

	5%以上または頻度不明	0.1~5%未満
過敏症 ^{注1)}	発疹等	
精神神経系 ^{注2)}		眠気、めまい、ふらつき、脱力感、倦怠感等
消化器系	食欲不振、胸やけ・胃のもたれ・胃部不快感、口渇	悪心・嘔吐、下痢、心窩部痛・胃痛等

注1)：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。
注2)：このような症状があらわれた場合には、減量または休薬等、適切な処置を行うこと。

5. 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。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦また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) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましい。

7. 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(使用経験がない)。

【臨床成績】^{1)~4)}

ロキシーン錠 4mgの臨床試験は、二重盲検比較試験を含め、国内30施設で計900例について実施した。その概要は次のとおりである。

〈臨床試験〉

1. 腰痛症：腰痛症に対しては、有効率86.2% (75/87)を示した。
2. 頸肩腕症候群：頸肩腕症候群に対しては、有効率54.3% (51/94)を示し、また、二重盲検比較試験によって本剤の治療効果が認められている。
3. 肩関節周囲炎：肩関節周囲炎に対しては、有効率31.5% (28/89)を示し、また、二重盲検比較試験によって本剤の治療効果が認められている。
4. 変形性脊椎症：変形性脊椎症に対しては、有効率53.1% (69/130)を示し、また、二重盲検比較試験によって本剤の治療効果が認められている。
5. 上記以外の運動器疾患に伴う痛性痙攣：脊椎分離及びびり症、椎間板ヘルニア、変形性関節症、坐骨神経痛、脊椎性疾患、関節性疾患等に対しては、有効率56.4% (282/500)を示した。

【薬効薬理】

プリジノールメシル酸塩の作用は、大脳皮質、脳幹網様体、延髄および脊髄等の中枢から、骨格筋に至る末梢神経系に及ぶ。

〈中枢神経系に対する作用〉

- (1) 電撃痙攣(マウス、ラット)、ペンテトラゾール痙攣(マウス)、ストリキニーネ痙攣(マウス、トノサマガエル)、およびニコチン痙攣(マウス)を抑制する。⁵⁾
- (2) 電気刺激による交叉伸展反射を抑制する(ラット)。⁵⁾

〈末梢神経系に対する作用〉

- (1) カエル腹筋のKCl痙攣を抑制する。⁶⁾
- (2) ゴム張力法で筋弛緩作用を示す(マウス)。⁵⁾
- (3) Magnus法により抗アセチルコリン作用、抗ヒスタミン作用、抗塩化バリウム作用、抗オキシトシン作用および抗ブラジキニン作用を示す(モルモット腸管)。^{5), 7)}
- (4) 生体内において、抗塩化バリウム作用(ウサギ腸管)および抗ヒスタミン作用(モルモット気管支)を示す。^{5), 6)}

【有効成分に関する理化学的知見】

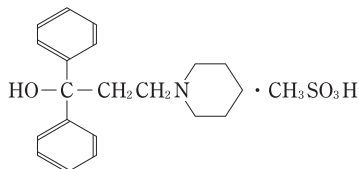
一般名：プリジノールメシル酸塩 (Pridinol Mesilate)

化学名：1, 1-Diphenyl-3-piperidino-1-propanol
methanesulfonate

分子式：C₂₀H₂₅NO · CH₃SO₃H

分子量：391.52

構造式：



融点：160～162℃

性状：白色の微粉末で、わずかに特異なおいがあり、味は苦い。クロロホルムに溶けやすく、水またはエタノール(95)にやや溶けにくく、アセトンに溶けにくく、ジエチルエーテルまたは石油エーテルにほとんど溶けない。

水溶液(1→50)のpHは5.0～6.0である。

【包装】

PTP 100錠、1000錠 バラ 1000錠

【主要文献】

- 1)磯部 饒他：基礎と臨床, 8, (2), 507(1974)
- 2)白野 明他：新薬と臨床, 16, (2), 221(1967)
- 3)有沢 修他：日本臨床外科医会誌, 27, (4), 341(1966)
- 4)ロキシーン文献集
- 5)古川敏議他：東邦医学会雑誌, 14, (1), 17(1967)
- 6)E. Traubucchi et al.: Switzerland
- 7)L. Sorrentino et al.: Farmaco., 26, (5), 293(1971)

※【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948



販売元

日医工株式会社

富山市総曲輪1丁目6番21

製造販売元



東菱薬品工業株式会社

東京都千代田区有楽町1-10-1