

筋緊張性疼痛疾患治療剤

日本薬局方 クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」

CHLORPHENESIN CARBAMATE TABLETS

貯 法：室温保存  
 使用期限：容器等に記載  
 注 意：「取扱い上の注意」参照

|      | 錠125mg        | 錠250mg        |
|------|---------------|---------------|
| 承認番号 | 22500AMX00775 | 22500AMX00776 |
| 薬価収載 | 2013年6月       | 2013年6月       |
| 販売開始 | 2011年6月       | 1987年10月      |

**禁忌（次の患者には投与しないこと）**

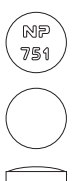

1. 本剤の成分及び類似化合物（メトカルバモール等）に対し、過敏症の既往歴のある患者
2. 肝障害のある患者 [Modern Drug Encyclopedia, 13th Ed. 155 (1975) に投与禁忌として記載され、これに準拠した。]

**【組成・性状】**

## 1. 組成、製剤の性状

|           |  |                              |
|-----------|--|------------------------------|
| 販売名       | クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」   | クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」 |
| 有効成分（1錠中） | 日本薬局方<br>クロルフェネシンカルバミン酸エステル<br>125mg                                 | 250mg                        |
| 添加物       | 結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、D-マンニトール、軽質無水ケイ酸、硬化油 | トウモロコシデンプン                   |

## 2. 製剤の性状

|       |   |   |
|-------|---|---|
|       | クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」  | クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」  |
| 外形    |  |  |
| 形状    | 白色の素錠   |   |
| 大きさ   | 直径 (mm)   | 8.0   |
|       | 厚さ (mm)   | 3.3   |
|       | 重量 (mg)   | 180   |
| 識別コード | NP-751  | HD-090  |

**【効能・効果】**

運動器疾患に伴う有痛性痙攣

腰痛症、変形性脊椎症、椎間板ヘルニア、脊椎分離・圧り症、脊椎骨粗鬆症、頸肩腕症候群

**【用法・用量】**

通常成人1回クロルフェネシンカルバミン酸エステルとして250mg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) 肝障害の既往歴のある患者（「禁忌」の項参照）
- 2) 腎障害のある患者 [The United States DISPENSATORY, 27th Ed. 301 (1973) ; MARTINDALE The Extra Pharmacopoeia, 26th Ed. 1891 (1972) に注意して投与せよと記載され、これに準拠した。]

## 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                     |
|---|--|-----------------------------|
| フェノチアジン系薬剤<br>・クロルプロマジン塩酸塩等<br>中枢神経抑制剤<br>・バルビツール酸誘導体等<br>モノアミン酸化酵素阻害剤 (MAO阻害剤)<br>アルコール (飲酒) | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が増強することがあるので、用量を調節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考えられている。 |

## 4. 副作用

本剤は、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（頻度不明）

## (1) ショック

ショックがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

## (2) 中毒性表皮壊死症（Lyell症候群）

中毒性表皮壊死症（Lyell症候群）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

## 2) その他の副作用

| 種類\頻度                 | 頻度不明                       |
|-----------------------|----------------------------|
| 精神神経系 <sup>(注1)</sup> | めまい・ふらつき、眠気、頭痛・頭重感、倦怠感、脱力感 |

| 種類\頻度 | 頻度不明   |
|-------|--|
| 消化器   | 腹痛 <sup>a)</sup> 、消化不良 <sup>b)</sup> 、嘔気、胃腸障害、下痢、便秘、口内乾燥、舌炎、悪心 |
| 血液    | 白血球減少、血小板減少  |
| 過敏症   | 発疹 <sup>注2)、c)</sup> 、浮腫・腫脹感 <sup>注2)</sup> 、そう痒感、口内炎、熱感       |

注1) このような症状があらわれた場合には減量又は休薬等適切な処置を行うこと。

注2) 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。

- a) 胃痛、胃部不快感を含む。  
 b) 胃のもたれ（膨満感、胃重感）、胸やけ、食欲不振を含む。  
 c) 皮疹、薬疹を含む。

#### 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ため、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) 授乳中の婦人には、投与しないことが望ましい。

#### 7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

#### 8. 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、更には穿孔を起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。〕

#### 9. その他の注意

本剤を長期投与する場合には、臨床検査（血液検査、尿検査及び肝機能検査等）を行うことが望ましい。

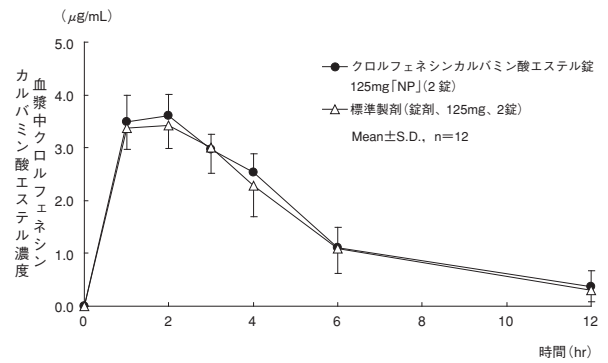
### 【薬物動態】

#### 1. 生物学的同等性試験

1) クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」  
 クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」と標準製剤のそれぞれ2錠（クロルフェネシンカルバミン酸エステルとして250mg）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に経口投与して血漿中クロルフェネシンカルバミン酸エステル濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC<sub>0-12hr</sub>、C<sub>max</sub>）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

|                                  | 判定パラメータ  |   | 参考パラメータ                  |                          |
|----------------------------------|--|---|--------------------------|--------------------------|
|                                  | AUC <sub>0-12hr</sub><br>( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ ) | C <sub>max</sub><br>( $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) | T <sub>max</sub><br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」(2錠) | 19.44±2.74   | 3.78±0.39                                       | 1.5±0.5                  | 3.1±1.4                  |
| 標準製剤<br>(錠剤、125mg、2錠)            | 18.48±3.35   | 3.64±0.27                                       | 1.4±0.5                  | 2.7±0.9                  |

(Mean±S.D., n=12)

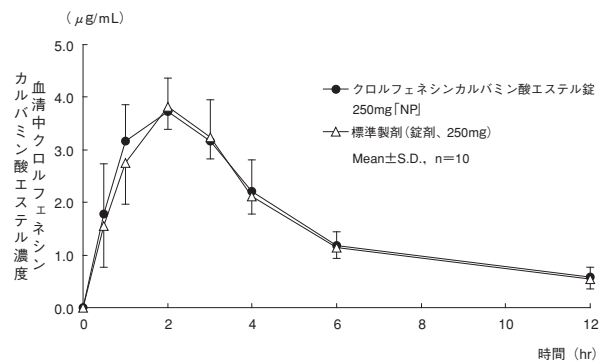


血漿中濃度並びにAUC、C<sub>max</sub>等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2) クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」  
 クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1錠（クロルフェネシンカルバミン酸エステルとして250mg）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に経口投与して血清中クロルフェネシンカルバミン酸エステル濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC<sub>0-12hr</sub>、C<sub>max</sub>）の平均値の差の95%信頼区間は±20%の範囲内にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>2)</sup>

|                              | 判定パラメータ  |   | 参考パラメータ                  |                          |
|------------------------------|--|---|--------------------------|--------------------------|
|                              | AUC <sub>0-12hr</sub><br>( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ ) | C <sub>max</sub><br>( $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) | T <sub>max</sub><br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」 | 19.91±3.62   | 3.94±0.42                                       | 1.9±0.6                  | 2.4±0.6                  |
| 標準製剤<br>(錠剤、250mg)           | 19.23±2.42   | 3.92±0.37                                       | 1.9±0.6                  | 2.2±0.3                  |

(Mean±S.D., n=10)



血清中濃度並びにAUC、C<sub>max</sub>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

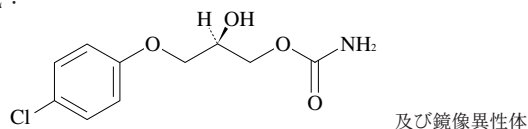
クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」及びクロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」は日本薬局方医薬品各条に定められたクロルフェネシンカルバミン酸エステル錠の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>3)</sup>

### 【薬効薬理】

脊髄の多シナプス反射経路中の介在ニューロンを選択的に抑制することによって骨格筋の弛緩をもたらすので、中枢性筋弛緩薬と呼ばれる。臨床的には、腰痛等の治療補助薬として用いられる。<sup>4)</sup>

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：クロルフェネシンカルバミン酸エステル  
(Chlorphenesin Carbamate)  
化学名：(2*RS*)-3-(4-Chlorophenoxy)-2-hydroxypropyl  
carbamate  
分子式：C<sub>10</sub>H<sub>12</sub>ClNO<sub>4</sub>  
分子量：245.66  
融点：88～91℃  
構造式：



性状：・白色の結晶又は結晶性の粉末である。  
・メタノール、エタノール(95)又はピリジンに溶けやすく、水に溶けにくい。  
・エタノール(95)溶液(1→20)は旋光性を示さない。

## 【取扱い上の注意】

### 安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」及びクロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」は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。<sup>9)</sup>

## 【包装】

クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠125mg「NP」  
：100錠 (PTP)  
クロルフェネシンカルバミン酸エステル錠250mg「NP」  
：100錠 (PTP)  
1,000錠 (PTP)

## 【主要文献】

- 1)ニプロ(株)：社内資料(生物学的同等性試験)
- 2)ニプロ(株)：社内資料(生物学的同等性試験)
- 3)ニプロ(株)：社内資料(溶出試験)
- 4)第十六改正日本薬局方解説書
- 5)ニプロ(株)：社内資料(安定性試験)

## 【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ニプロ株式会社 医薬品情報室  
〒531-8510 大阪市北区本庄西3丁目9番3号  
☎ 0120-226-898  
FAX 06-6375-0177

 **NIPRO**  
製造販売 ニプロ株式会社  
大阪市北区本庄西3丁目9番3号