

## 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

筋緊張緩和剤

## チザニジン錠1mg「テバ」

Tizanidine Tab. 1mg “TEVA”  
チザニジン塩酸塩錠

|                               |   |
|-------------------------------|---|
| 剤形                            | 素錠  |
| 製剤の規制区分                       | 処方箋医薬品<br>(注意－医師等の処方箋により使用すること)   |
| 規格・含量                         | 1錠中：チザニジン塩酸塩…………… 1.144mg<br>(チザニジンとして1mg)  |
| 一般名                           | 和名：チザニジン塩酸塩 (JAN)<br>洋名：Tizanidine Hydrochloride (JAN)  |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・<br>発売年月日 | 製造販売承認年月日：2013年7月22日（販売名変更による）<br>薬価基準収載年月日：2013年12月13日（販売名変更による）<br>発売年月日：1996年7月5日  |
| 開発・製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名      | 販売：武田薬品工業株式会社<br>発売元：日医工株式会社<br>製造販売元：日医工岐阜工場株式会社   |
| 医薬情報担当者の連絡先                   |   |
| 問い合わせ窓口                       | 日医工株式会社 お客様サポートセンター<br>TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948<br>医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a> |

本IFは2023年12月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

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 <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

# 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 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の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）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 A4 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、添付文書で赤字・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。
- ②IF 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。

#### [IF の作成]

- ①IF 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。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF 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、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF 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（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IF の発行]

- ①「IF 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、「IF 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 IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF 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 IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページ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、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 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、IF 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、IF 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、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

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

IF 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。IF 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、IF 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)

# 目 次

|                             |    |  |    |
|-----------------------------|----|--|----|
| I. 概要に関する項目                 | 1  | VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目               | 13 |
| 1. 開発の経緯                    | 1  | 1. 警告内容とその理由                           | 13 |
| 2. 製品の治療学的・製剤学的特性           | 1  | 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）                  | 13 |
| II. 名称に関する項目                | 2  | 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由              | 13 |
| 1. 販売名                      | 2  | 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由              | 13 |
| 2. 一般名                      | 2  | 5. 慎重投与内容とその理由                         | 13 |
| 3. 構造式又は示性式                 | 2  | 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法                 | 13 |
| 4. 分子式及び分子量                 | 2  | 7. 相互作用                                | 13 |
| 5. 化学名（命名法）                 | 2  | 8. 副作用                                 | 14 |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号           | 2  | 9. 高齢者への投与                             | 15 |
| 7. CAS登録番号                  | 2  | 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与                     | 16 |
| III. 有効成分に関する項目             | 3  | 11. 小児等への投与                            | 16 |
| 1. 物理化学的性質                  | 3  | 12. 臨床検査結果に及ぼす影響                       | 16 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性        | 3  | 13. 過量投与                               | 16 |
| 3. 有効成分の確認試験法               | 3  | 14. 適用上の注意                             | 16 |
| 4. 有効成分の定量法                 | 3  | 15. その他の注意                             | 16 |
| IV. 製剤に関する項目                | 4  | 16. その他                                | 16 |
| 1. 剤形                       | 4  | IX. 非臨床試験に関する項目                        | 17 |
| 2. 製剤の組成                    | 4  | 1. 薬理試験                                | 17 |
| 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意         | 4  | 2. 毒性試験                                | 17 |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性          | 4  | X. 管理的事項に関する項目                         | 18 |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性             | 5  | 1. 規制区分                                | 18 |
| 6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）        | 5  | 2. 有効期間又は使用期限                          | 18 |
| 7. 溶出性                      | 5  | 3. 貯法・保存条件                             | 18 |
| 8. 生物学的試験法                  | 6  | 4. 薬剤取扱い上の注意点                          | 18 |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法           | 6  | 5. 承認条件等                               | 18 |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法            | 7  | 6. 包装                                  | 18 |
| 11. 力価                      | 7  | 7. 容器の材質                               | 18 |
| 12. 混入する可能性のある夾雑物           | 7  | 8. 同一成分・同効薬                            | 18 |
| 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 | 7  | 9. 国際誕生年月日                             | 18 |
| 14. その他                     | 7  | 10. 製造販売承認年月日及び承認番号                    | 18 |
| V. 治療に関する項目                 | 8  | 11. 薬価基準収載年月日                          | 19 |
| 1. 効能又は効果                   | 8  | 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の<br>年月日及びその内容 | 19 |
| 2. 用法及び用量                   | 8  | 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容             | 19 |
| 3. 臨床成績                     | 8  | 14. 再審査期間                              | 19 |
| VI. 薬効薬理に関する項目              | 9  | 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報                    | 19 |
| 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群        | 9  | 16. 各種コード                              | 19 |
| 2. 薬理作用                     | 9  | 17. 保険給付上の注意                           | 19 |
| VII. 薬物動態に関する項目             | 10 | XI. 文献                                 | 20 |
| 1. 血中濃度の推移・測定法              | 10 | 1. 引用文献                                | 20 |
| 2. 薬物速度論的パラメータ              | 11 | 2. その他の参考文献                            | 20 |
| 3. 吸収                       | 11 | XII. 参考資料                              | 21 |
| 4. 分布                       | 11 | 1. 主な外国での発売状況                          | 21 |
| 5. 代謝                       | 12 | 2. 海外における臨床支援情報                        | 21 |
| 6. 排泄                       | 12 | XIII. 備考                               | 22 |
| 7. トランスポーターに関する情報           | 12 | その他の関連資料                               | 22 |
| 8. 透析等による除去率                | 12 |  |    |

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

チザニジン塩酸塩は、中枢性筋弛緩薬に属する筋緊張緩和剤である。

弊社は、後発医薬品としてメキタック錠 1mg の開発を企画し、薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、1996 年 1 月に承認を取得、1996 年 7 月発売に至った。

その後、「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成 12 年 9 月 19 日医薬発第 935 号）に基づき、販売名をチザニジン錠 1mg 「テバ」と変更し、2013 年 7 月に承認を取得し、2013 年 12 月に薬価基準収載された。

2023 年 12 月 1 日、「チザニジン錠 1mg 「テバ」」は武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、日医工株式会社が販売を開始した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 筋緊張状態（頸肩腕症候群、腰痛症による）の改善、痙性麻痺（脳血管障害、痙性脊髄麻痺、頸部脊椎症、脳性（小児）麻痺、外傷後遺症（脊髄損傷、頭部外傷）、脊髄小脳変性症、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症による）に適応を有している。

（「V-1. 効能又は効果」の項参照）

2. 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のでいずれも頻度は不明であるが、重大な副作用として、ショック、急激な血圧低下、心不全、呼吸障害、肝炎、肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

（「VIII-8. 副作用」の項参照）

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

チザニジン錠 1mg 「テバ」

#### (2) 洋名

Tizanidine Tab. 1mg “TEVA”

#### (3) 名称の由来

主成分「チザニジン塩酸塩」より命名

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

チザニジン塩酸塩（JAN）

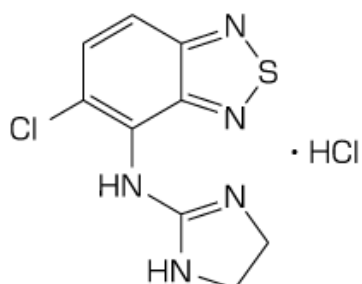
#### (2) 洋名（命名法）

Tizanidine Hydrochloride（JAN）

#### (3) ステム

-nidine：クロニジン系薬剤

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>9</sub>H<sub>8</sub>ClN<sub>5</sub>S · HCl

分子量：290.17

### 5. 化学名（命名法）

5-Chloro-*N*-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)-2,1,3-benzothiadiazole-4-amine monohydrochloride (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

塩酸チザニジン

### 7. CAS 登録番号

64461-82-1

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色～淡黄白色の結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

水にやや溶けやすく、エタノール（99.5）に溶けにくく、無水酢酸又は酢酸（100）にほとんど溶けない。

各種 pH における溶解度<sup>1)</sup>

| 溶液    | 溶解度（37℃） |
|-------|----------|
| pH1.2 | 54 mg/mL |
| pH4.0 | 72 mg/mL |
| pH6.8 | 69 mg/mL |
| 水     | 69 mg/mL |

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 290℃(分解)

##### (5) 酸塩基解離定数<sup>1)</sup>

$pK_a$  : 7.26

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「チザニジン塩酸塩」の確認試験法による

- 1) 紫外可視吸光度測定法（吸収スペクトル）
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）
- 3) 塩化物の定性反応

#### 4. 有効成分の定量法

日局「チザニジン塩酸塩」の定量法による

電位差滴定法

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

| 販売名                        | 性状                  | 外形  |   |   |
|----------------------------|---------------------|---|---|---|
|                            |                     | 表   | 裏   | 側面  |
| チザニジン錠 1mg<br>「テバ」         | 白色の片面 1/2<br>割線入り素錠 |  |  |  |
| 直径：7.0mm、厚さ：2.2mm、重量：110mg |                     |   |   |   |

#### (2) 製剤の物性<sup>2)</sup>

(参考：＜無包装状態での安定性試験＞の試験開始時の硬度)

| 販売名             | 硬度 (kgf) |
|-----------------|----------|
| チザニジン錠 1mg 「テバ」 | 4.9      |

#### (3) 識別コード

| 販売名             | PTP 識別コード | 薬物本体識別コード |
|-----------------|-----------|-----------|
| チザニジン錠 1mg 「テバ」 | t TZ      | T Z       |

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1 錠中：チザニジン塩酸塩を 1.144mg（チザニジンとして 1mg）含有

#### (2) 添加物

カルメロース、結晶セルロース、ステアリン酸カルシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物

#### (3) その他

特になし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

### 4. 製剤の各種条件下における安定性

＜加速試験＞<sup>3)</sup>

試験条件

| 保存条件             | 包装形態     |
|------------------|----------|
| 40±1℃・75±5%RH・遮光 | PTP+アルミ袋 |

試験結果

| 試験項目(規格)       | 試験開始時         | 2 ヶ月          | 4 ヶ月          | 6 ヶ月          |
|----------------|---------------|---------------|---------------|---------------|
| 性状<br>(白色の素錠)  | 白色の素錠で<br>あった | 白色の素錠で<br>あった | 白色の素錠で<br>あった | 白色の素錠で<br>あった |
| 崩壊試験           | 4～6 分         | 4～6 分         | 4～6 分         | 4～6 分         |
| 定量*1 (95～105%) | 100.5±0.3     | 100.0±0.4     | 100.7±0.4     | 100.7±0.4     |

\*1 平均値±S. D.



<無包装状態での安定性試験> <sup>2)</sup>

試験条件

| 保存条件 |           | 保存容器  |
|------|-----------|-------|
| 温度   | 40℃       | 遮光・気密 |
| 湿度   | 25℃・75%RH | 遮光・開放 |
| 光    | 60万 lx・hr | 透明・気密 |

試験結果

| 検体               | 性状        | 色差 (dE) | 硬度 (kgf) | 溶出試験 (%)  | 定量*1 (%) |
|------------------|-----------|---------|----------|-----------|----------|
| 試験開始時            | 白色の素錠であった | —       | 4.9      | 92.6~95.3 | 100      |
| 40℃<br>3ヵ月       | 白色の素錠であった | 1.96    | 4.7      | 93.2~96.9 | 98.9     |
| 25℃・75%RH<br>3ヵ月 | 白色の素錠であった | 1.86    | 3.5      | 90.3~94.5 | 100.2    |
| 60万 lx・hr        | 白色の素錠であった | 1.03    | 4.6      | 94.0~97.1 | 100.2    |

\*1 試験開始時を100とした

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)

該当しない

7. 溶出性

(1) 溶出挙動における類似性 <sup>4)</sup>

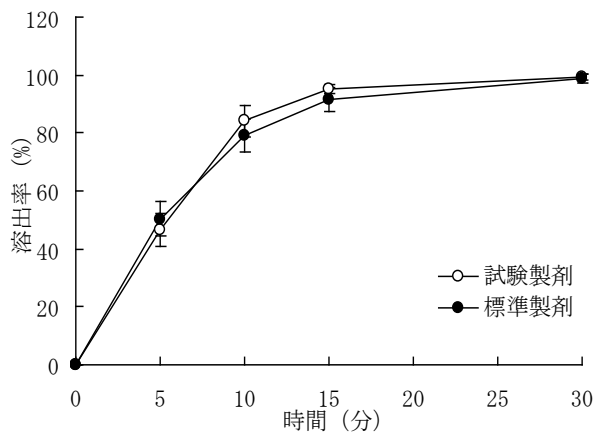
|      |  |      |       |      |       |
|------|--|------|-------|------|-------|
| 通知   | 「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について」<br>(平成10年7月15日医薬発第634号) (その44) |      |       |      |       |
| 試験方法 | 日本薬局方一般試験法 溶出試験法 パドル法                                    |      |       |      |       |
| 試験液  | pH1.2 : 日本薬局方崩壊試験の第1液                                    |      |       |      |       |
|      | pH4.0 : 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 (0.05mol/L)                        |      |       |      |       |
|      | pH6.8 : 日本薬局方試薬・試液のリン酸塩緩衝液 (1→2)                         |      |       |      |       |
|      | 水 : 日本薬局方精製水   |      |       |      |       |
| 試験液温 | 37±0.5℃  | 試験液量 | 900mL | 試験回数 | 6ベッセル |

<試験結果>

全ての試験条件において基準に適合したため、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

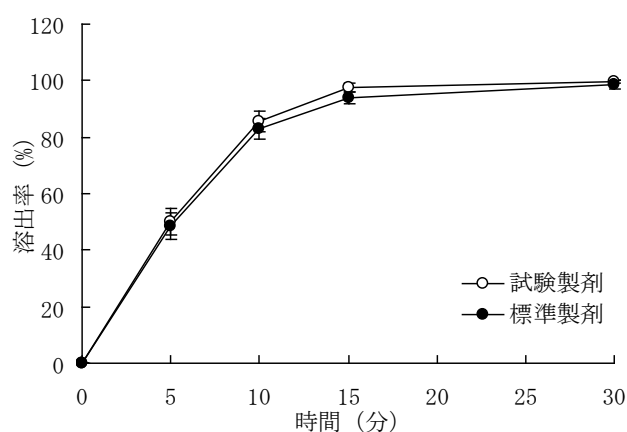
| 回転数    | 試験液   | 溶出挙動  | 判定 |
|--------|-------|---|----|
| 50回転/分 | pH1.2 | 標準製剤、試験製剤ともに15分以内に平均85%以上溶出した。  | 適合 |
|        | pH4.0 | 標準製剤、試験製剤ともに15分以内に平均85%以上溶出した。  | 適合 |
|        | pH6.8 | 標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる2時点(10分及び15分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 | 適合 |
|        | 水     | 標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる2時点(10分及び30分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 | 適合 |

<pH1.2、50rpm>



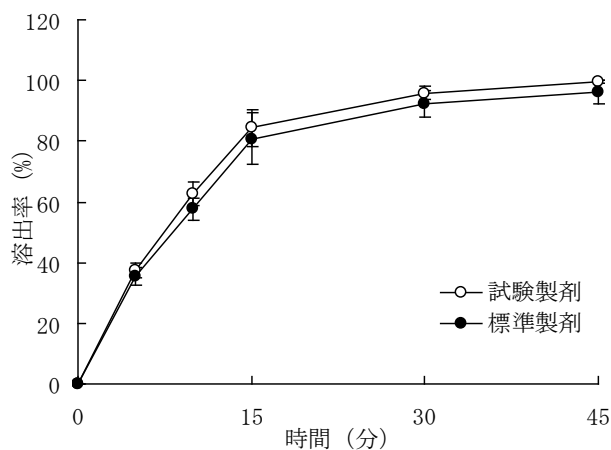
| 時間(分) | 5    | 10   | 15   | 30   |
|-------|------|------|------|------|
| 試験製剤  | 46.7 | 84.1 | 95.1 | 99.1 |
| 標準製剤  | 50.4 | 79.1 | 91.5 | 98.7 |

<pH4.0、50rpm>



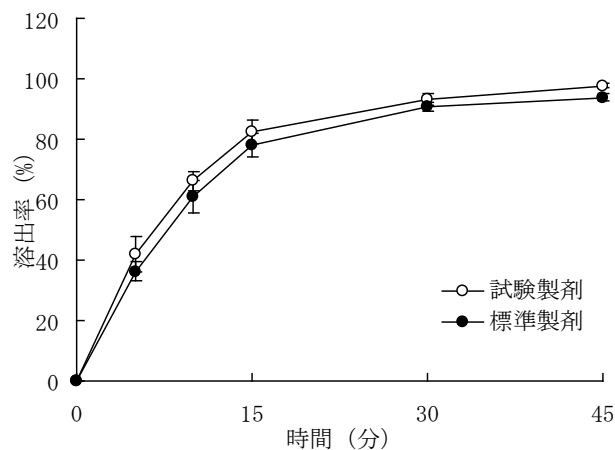
| 時間(分) | 5    | 10   | 15   | 30   |
|-------|------|------|------|------|
| 試験製剤  | 50.2 | 85.4 | 97.5 | 99.8 |
| 標準製剤  | 48.5 | 83.0 | 94.1 | 98.6 |

<pH6.8、50rpm>



| 時間(分) | 5    | 10   | 15   | 30   | 45   |
|-------|------|------|------|------|------|
| 試験製剤  | 37.3 | 62.7 | 84.4 | 95.9 | 99.6 |
| 標準製剤  | 35.4 | 57.6 | 80.8 | 92.5 | 96.2 |

<水、50rpm>



| 時間(分) | 5    | 10   | 15   | 30   | 45   |
|-------|------|------|------|------|------|
| 試験製剤  | 41.9 | 66.2 | 82.3 | 93.2 | 97.7 |
| 標準製剤  | 36.3 | 61.1 | 78.1 | 90.7 | 93.7 |

(2) 公的溶出規格への適合

本剤の溶出性は、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。

| 規定時間 | 溶出率   |
|------|-------|
| 30分  | 75%以上 |

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

- 1) ピクラーートの融点測定
- 2) 紫外可視吸光度測定法 (吸収スペクトル)
- 3) 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法  
液体クロマトグラフィー
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  
特になし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 1. 下記疾患による筋緊張状態の改善

頸肩腕症候群、腰痛症

#### 2. 下記疾患による痙性麻痺

脳血管障害、痙性脊髄麻痺、頸部脊椎症、脳性（小児）麻痺、外傷後遺症（脊髄損傷、頭部外傷）、脊髄小脳変性症、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症

### 2. 用法及び用量

#### 1. 筋緊張状態の改善の場合

通常成人には、チザニジンとして3mg（3錠）を1日3回に分けて食後に経口投与する。

なお、年齢・症状により適宜増減する。

#### 2. 痙性麻痺の場合

通常成人には、チザニジンとして1日3mg（3錠）より投与を始め、効果をみながら1日6～

9mg（6～9錠）まで漸増し、1日3回に分けて食後に経口投与する。

なお、年齢・症状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

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (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

該当資料なし

## 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

エペリゾン塩酸塩、バクロフェン、アフロクアロン等の中枢性筋弛緩薬

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>5)</sup>

チザニジン塩酸塩は、脊髄及び上位中枢に作用して、脊髄多シナプス反射を抑制することによって骨格筋の弛緩をもたらす。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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

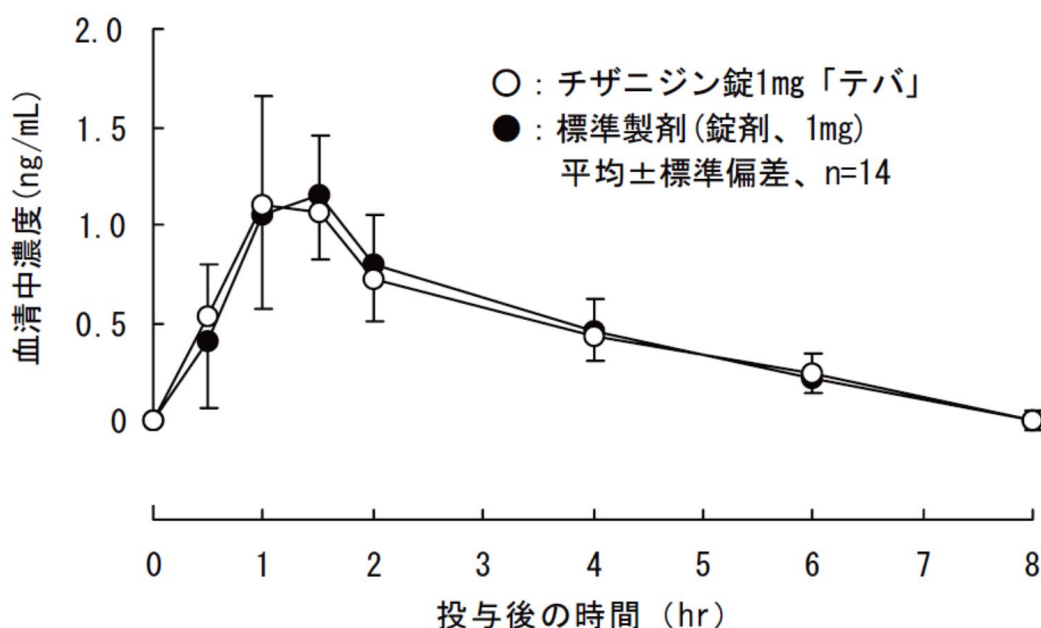
#### (2) 最高血中濃度到達時間

「VII-1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>6)</sup>

チザニジン錠 1mg 「テバ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ4錠（チザニジンとして4mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）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回投与量：承認外用量）

|      |  |
|------|--|
| 通知   | 「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱い等について」（昭和55年5月30日、薬審第718号） |
| 被験者数 | 14名  |
| 投与方法 | 2剤2期のクロスオーバー法<br>水100mLと共に絶食単回経口投与                       |
| 投与量  | 製剤4錠（チザニジンとして4mg）  |
| 採血時間 | 8時点（投与前、投与後0.5、1、1.5、2、4、6、8時間）                          |
| 休薬期間 | 1週間  |
| 分析法  | 液体クロマトグラフィー  |



#### <薬物動態パラメータ>

(平均±標準偏差、n=14)

|                 | 投与量 (mg) | AUC <sub>0-8</sub> (ng·hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | T <sub>1/2</sub> (hr) |
|-----------------|----------|-------------------------------|--------------|-----------|-----------------------|
| チザニジン錠 1mg 「テバ」 | 4        | 3.6±0.6                       | 1.4±0.3      | 1.2±0.3   | 2.6±0.9               |
| 標準製剤（錠剤、1mg）    | 4        | 3.7±0.8                       | 1.3±0.3      | 1.3±0.3   | 2.1±0.5               |

血清中濃度並びに AUC、Cmax 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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ－7. 相互作用」の項参照

(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

該当資料なし

(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<sup>5)</sup>

全身クリアランスは 320 L/hr である。

(6) 分布容積<sup>5)</sup>

分布容積は 960 L である。

(7) 血漿蛋白結合率<sup>5)</sup>

血漿タンパク結合率は約 30% である。

3. 吸収

該当資料なし

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

「Ⅷ－10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ－10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

(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

該当資料なし

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

本剤は主として肝で代謝される。

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

本剤は主として肝代謝酵素チトクローム P450（CYP）1A2 で代謝される。

### (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

主として腎から排泄される。

### (2) 排泄率<sup>5)</sup>

尿中排泄率は 53%

### (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）】

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) フルボキサミン又はシプロフロキサシンを投与中の患者（「相互作用」の項参照）
- (3) 重篤な肝障害のある患者 [本剤は主として肝で代謝される。また、肝機能の悪化が報告されている。]

### 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）

- (1) 肝障害のある患者 [本剤は主として肝で代謝される。また、肝機能の悪化が報告されている。]
- (2) 腎障害のある患者 [腎からの排泄が遅延し、高い血中濃度が持続するとの報告がある]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 投与初期に急激な血圧低下があらわれることがあるので注意すること。
- (2) 反射運動能力の低下、眠気、めまい及び低血圧等があらわれることがあるので、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は従事させないよう十分注意すること。

### 7. 相互作用

本剤は主として肝代謝酵素チトクローム P450 (CYP) 1A2 で代謝されるので、本酵素の活性に影響を与える薬剤を併用する場合には注意すること。特に CYP1A2 を阻害する薬剤との併用により、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。また、CYP1A2 を誘導する薬剤との併用により、本剤の血中濃度が低下する可能性がある。

## (1) 併用禁忌とその理由

| 併用しないこと   |   |  |
|---|---|--|
| 薬剤名等  | 臨床症状・措置方法   | 機序・危険因子                                |
| フルボキサミン<br>(ルボックス、デプロメール)<br>シプロフロキサシン<br>(シプロキサン等) | フルボキサミン又はシプロフロキサシンとの併用により、本剤の血中濃度が上昇し、AUCがそれぞれ33倍、10倍に上昇したとの報告がある。<br>臨床症状として、著しい血圧低下、傾眠、めまい及び精神運動能力の低下等があらわれることがあるので併用しないこと。 | これらの薬剤がCYP1A2を阻害し、本剤の血中濃度を上昇させると考えられる。 |

## (2) 併用注意とその理由

| 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   |
| 降圧剤<br>降圧利尿剤等  | 低血圧及び徐脈があらわれることがある。   | 本剤の中枢性 $\alpha_2$ 刺激作用により降圧作用が増強されるため。                  |
| 中枢神経抑制剤<br>アルコール   | 眠気等の副作用が増強されるおそれがある。  | いずれも中枢神経抑制作用を有するため。                                     |
| 抗不整脈剤<br>アミオダロン<br>メキシレチン<br>プロパフェノン<br>シメチジン<br>ニューキノロン系抗菌剤<br>エノキサシン水和物<br>ノルフロキサシン<br>黄体・卵胞ホルモン剤<br>経口避妊薬<br>チクロピジン | 本剤の血中濃度が上昇し、副作用が増強されるおそれがある。  | これらの薬剤がCYP1A2を阻害し、本剤の血中濃度を上昇させる可能性がある。                  |
| CYP1A2を誘導する薬剤<br>リファンピシン<br>喫煙<br>等  | 本剤の血中濃度が低下し、本剤の作用が減弱するおそれがある。<br>リファンピシンとの併用により本剤の血中濃度が50%低下することがあるため、併用投与の必要がある場合には、慎重に用量調節(増量)を行うこと。<br>また、男性喫煙者(>10本/日)に本剤を投与したことにより、本剤のAUCが約30%減少したとの報告がある。 | これらの薬剤がCYP1A2を誘導することにより、本剤の血中濃度が低下し、本剤の治療効果が減弱するおそれがある。 |

## 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（頻度不明）

- 1) **ショック** ショック（血圧低下、徐脈、顔面蒼白、冷汗、呼吸困難、意識消失等）があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) **急激な血圧低下** 投与開始初期に急激な血圧低下があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。特に高齢者及び降圧剤との併用例では注意すること。
- 3) **心不全** 心不全（心拡大、肺水腫等）があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) **呼吸障害** 呼吸障害（喘鳴、喘息発作、呼吸困難等）があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 5) **肝炎、肝機能障害、黄疸** AST (GOT)、ALT (GPT) 等の著しい上昇、悪心・嘔吐、食欲不振、全身倦怠感等を伴う肝炎、肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

## (3) その他の副作用

|                   | 頻度不明  |
|-------------------|---|
| 循環器               | 血圧低下、徐脈、動悸、失神   |
| 精神神経系             | 眠気、頭痛・頭重感、めまい（回転性めまい、浮動性めまい）・ふらつき、知覚異常（しびれ感等）、構音障害（ろれつがまわらない等）、不眠、幻覚、錯乱 |
| 消化器               | 口渇、悪心、食欲不振、胃部不快感、腹痛、下痢、胃もたれ、便秘、口内炎、舌のあれ、口中苦味感、流涎                        |
| 肝臓                | AST (GOT)、ALT (GPT)、Al-P の上昇  |
| 過敏症 <sup>注)</sup> | 発疹、皮膚そう痒感、蕁麻疹、紅斑、血管性浮腫  |
| その他               | 脱力・倦怠感、浮腫、尿閉、霧視、眼瞼下垂  |

注) このような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

下記の項目参照

VIII-2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）(1)

VIII-8. (2) 重大な副作用と初期症状 1)、(3) その他の副作用：過敏症

## 9. 高齢者への投与

- (1) 本剤は主として腎から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので減量するなど注意すること。
- (2) 本剤により血圧低下があらわれることがあるので、高齢者では特に注意すること。

#### 10. 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。[動物実験（ラット）で、大量投与（100mg/kg）により奇形（脳ヘルニア、小眼球）の増加及び10～30mg/kg投与により胎児重量の低下、化骨遅延、出生児の死亡等が報告されている]
- (2) 授乳中の婦人には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。[動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている]

#### 11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は幼児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) 徴候・症状：悪心、嘔吐、血圧低下、徐脈、QT延長、めまい、縮瞳、呼吸窮迫、不穏、傾眠、昏睡等
- (2) 処置：活性炭投与あるいは、強制利尿などにより薬物除去を行う。また必要により対症療法を行う。

#### 14. 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）

#### 15. その他の注意

動物実験（サル）により精神依存の形成が示唆されたとの報告がある。

#### 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）

該当資料なし

- (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

- (3) 安全性薬理試験

該当資料なし

- (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

該当資料なし

- (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

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：処方箋医薬品（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：3年（安定性試験結果（加速）に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

特になし

#### (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－14. 適用上の注意」の項参照

・くすりのしおり : 有り

#### (3) 調剤時の留意点について

特になし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

PTP包装：100錠（10錠×10）、1,000錠（10錠×100）

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネート  
フィルムピロー

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：テルネリン錠 1mg

同 効 薬：エペリゾン塩酸塩、バクロフェン、アフロクアロン等

### 9. 国際誕生年月日

該当しない

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

| 製品名             | 製造販売承認年月日  | 承認番号             |
|-----------------|------------|------------------|
| チザニジン錠 1mg 「テバ」 | 2013年7月22日 | 22500AMX01284000 |

<旧販売名>

| 製品名        | 製造販売承認年月日  | 承認番号       |
|------------|------------|------------|
| メキタック錠 1mg | 1996年1月22日 | (08AM)0031 |

11. 薬価基準収載年月日

| 製品名             | 薬価基準収載年月日   |
|-----------------|-------------|
| チザニジン錠 1mg 「テバ」 | 2013年12月13日 |

<旧販売名>

| 製品名        | 薬価基準収載年月日 |
|------------|-----------|
| メキタック錠 1mg | 1996年7月5日 |

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  
該当しない

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

| 製品名             | HOT(9桁)番号 | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード<br>(YJコード) | レセプト<br>電算コード |
|-----------------|-----------|----------------------------------|---------------|
| チザニジン錠 1mg 「テバ」 | 101942104 | 1249010F1018<br>(1249010F1298)   | 620194201     |

17. 保険給付上の注意  
本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 医療用医薬品 品質情報集 No. 16, 日本公定書協会 (2003)
- 2) 社内資料 (無包装状態での安定性試験)
- 3) 社内資料 (加速試験)
- 4) 社内資料 (溶出試験)
- 5) 第十七改正日本薬局方解説書 (2016)
- 6) 社内資料 (生物学的同等性試験)

### 2. その他の参考文献

特になし



## XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況  
該当しない

2. 海外における臨床支援情報  
該当資料なし

## XIII. 備考

その他の関連資料