

※※印：2012年4月改訂(第10版、社名変更等に伴う改訂)  
 ※印：2009年6月改訂

日本標準商品分類番号
872399

使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。  
 取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照  
 ※ 規制区分：劇薬(顆粒のみ)

	顆粒2%	錠5mg
承認番号	21800AMX10845000	21800AMX10621000
薬価収載	2007年 6月	2006年12月
販売開始	1975年 1月	1975年 1月
再評価結果	1984年 6月	1984年 6月
再評価結果(品質再評価)	2001年10月	2001年10月

消化器機能異常治療剤

**ペラプリン<sup>®</sup>顆粒2%**

メトクロプラミド顆粒

日本薬局方

**メトクロプラミド錠**

**ペラプリン<sup>®</sup>錠5mg**

PERAPRIN

**【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
- 褐色細胞腫の疑いのある患者 [急激な昇圧発作を起こすおそれがある]
- 消化管に出血、穿孔又は器質的閉塞のある患者 [本剤には消化管運動の亢進作用があるため、症状を悪化させるおそれがある]

**【組成・性状】**

●ペラプリン顆粒2%

組成	1g中：メトクロプラミド……………15.35mg (塩酸メトクロプラミドとして20mg) <添加物> アラビアゴム末、カルメロースカルシウム、乳糖水和物
性状	味は苦く、においのほとんどない白色の顆粒剤

●ペラプリン錠5mg

組成	1錠中：メトクロプラミド……………3.84mg (塩酸メトクロプラミドとして5mg) <添加物> 軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000						
性状	白色のフィルムコーティング錠						
識別コード(PTP)	229 5mg						
外形(サイズ)	<table border="1"> <tr> <th>表(直径mm)</th> <th>裏(重量mg)</th> <th>断面(厚さmm)</th> </tr> <tr> <td>229 6.1</td> <td>85</td> <td>3.0</td> </tr> </table>	表(直径mm)	裏(重量mg)	断面(厚さmm)	229 6.1	85	3.0
表(直径mm)	裏(重量mg)	断面(厚さmm)					
229 6.1	85	3.0					

**【効能・効果】**

- 次の場合における消化器機能異常(悪心・嘔吐・食欲不振・腹部膨満感)  
 胃炎、胃・十二指腸潰瘍、胆嚢・胆道疾患、腎炎、尿毒症、乳幼児嘔吐、薬剤(制癌剤・抗生物質・抗結核剤・麻酔剤)投与時、胃内・気管内挿管時、放射線照射時、開腹術後  
 ○X線検査時のバリウムの通過促進

**【用法・用量】**

メトクロプラミドとして、通常成人1日7.67~23.04mg(塩酸メトクロプラミドとして10~30mg)を2~3回に分割し、食前に経口投与する。  
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

**〈用法・用量に関連する使用上の注意〉**

小児では錐体外路症状が発現しやすいため、過量投与にならないよう注意すること。

**【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)**

- 小児(「小児等への投与」の項参照)
- 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
- 腎障害のある患者 [高い血中濃度が持続するおそれがある]
- 脱水・栄養不良状態等を伴う身体的疲弊のある患者 [悪性症候群(Syndrome malin)が起こりやすい]

**2 重要な基本的注意**

- 本剤の投与により、内分泌機能異常(プロラクチン値上昇)、錐体外路症状等の副作用があらわれることがあるので、本剤の投与に際しては、有効性と安全性を十分考慮のうえ投与すること。
- 眠気、めまい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従事させないように注意すること。
- 制吐作用を有するため、他の薬剤に基づく中毒、腸閉塞、脳腫瘍等による嘔吐症状を不顕性化することがあるので注意すること。

**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 プロクロルペラジン クロルプロマジン チエチルペラジン 等 ブチロフェノン系薬剤 ハロペリドール等 ラウオルフィアルカロイド薬剤 レセルピン等 ベンザミド系薬剤 スルピリド チアプリド 等	内分泌機能異常、錐体外路症状が発現しやすくなる。	本剤及びこれらの薬剤は抗ドパミン作用を有するため、併用により抗ドパミン作用が強くなる。
ジギタリス剤 ジゴキシン ジゴトキシン 等	ジギタリス剤飽和時の指標となる悪心・嘔吐、食欲不振症状を不顕性化するおそれがある。	本剤の制吐作用による。
カルバマゼピン	カルバマゼピンの中毒症状(眠気、悪心・嘔吐、眩暈等)があらわれることがある。	機序不明
抗コリン剤 アトロピン硫酸塩水和物 ブチルスコポラミン臭化物 等	相互に消化管における作用を減弱するおそれがある。	本剤は消化管運動を亢進するため、抗コリン剤の消化管運動抑制作用と拮抗する。

**4 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。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

- ショック、アナフィラキシー様症状 ショック、アナフィラキシー様症状(呼吸困難、喉頭浮腫、蕁麻疹等)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。
- 悪性症候群(Syndrome malin) 悪性症候群があらわれることがあるので、無動緘黙、強度の筋強剛、嚥下困難、頻脈、血圧の変動、発汗等が発現し、それに引き続き発熱がみられる場合は、投与を中止し、体冷却、水分補給等の全身管理とともに適切な処置を行うこと。本症発症時には、白血球の増加や血清CK(CPK)の上昇がみられることが多く、また、ミオグロビン尿を伴う腎機能の低下がみられることがある。なお、高熱が持続し、意識障害、呼吸困難、循環虚脱、脱水症状、急性腎不全へと移行し、死亡した例が報告されている。

<裏面につづく>

- 3) 意識障害 意識障害があらわれることがある。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。
- 4) 痙攣 痙攣があらわれることがある。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。
- 5) 遅発性ジスキネジア 長期投与により、口周囲等の不随意運動があらわれ、投与中止後も持続することがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

	頻度不明
錐体外路症状 <sup>注1)</sup>	手指振戦、筋硬直、頸・顔部の攣縮、眼球回転発作、焦燥感
内分泌 <sup>注2)</sup>	無月経、乳汁分泌、女性型乳房
消化器	胃の緊張増加、腹痛、下痢、便秘
循環器	血圧降下、頻脈、不整脈
精神神経系	眠気、頭痛、頭重、興奮、不安
過敏症 <sup>注3)</sup>	発疹、浮腫
その他	めまい、倦怠感

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。なお、これらの症状が強い場合には、抗パーキンソン剤の投与等適切な処置を行うこと。

注2) 観察を十分に行い、異常が認められた場合には直ちに投与を中止すること。

注3) 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。

5 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、副作用(錐体外路症状等)の発現に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。

6 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦等：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) 授乳婦：授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。[母乳中に移行することが報告されている]

7 小児等への投与

錐体外路症状が発現しやすいため、過量投与にならないよう注意すること。とくに脱水状態、発熱時等には注意すること。

8 過量投与

- (1) 徴候・症状：錐体外路症状、意識障害(昏睡)等があらわれることがある。また外国において、本剤の大量投与によりメトヘモグロビン血症があらわれたとの報告がある。
- (2) 処置：胃洗浄、対症療法及び維持療法を行う。錐体外路症状に対しては、抗パーキンソン剤等を投与する。

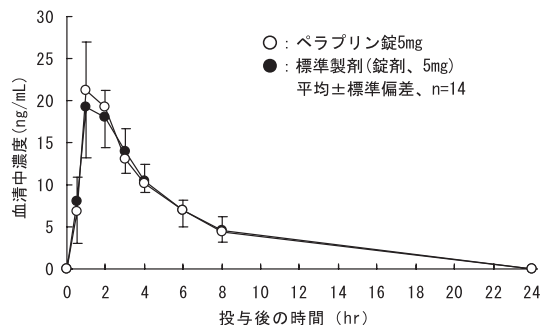
9 適用上の注意

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<sup>1)</sup>

ペラプリン錠5mgと標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠[メトクロプラミド3.84mg(塩酸メトクロプラミドとして5mg)]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。



薬物動態パラメータ

(平均±標準偏差、n=14)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-24</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ペラプリン錠5mg	5	120.7±13.4	22.2±4.4	1.3±0.5	3.5±1.2
標準製剤(錠剤、5mg)	5	120.8±21.7	21.5±4.5	1.4±0.5	3.5±1.1

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。

2 溶出性<sup>2)</sup>

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。

※※【薬効薬理】<sup>3)</sup>

メトクロプラミドは、化学受容体引き金帯(CTZ)のドパミンD<sub>2</sub>受容体を遮断することにより制吐作用を示す。更に、セロトニン5-HT<sub>3</sub>受容体遮断作用の関与や5-HT<sub>4</sub>受容体刺激作用による消化管運動促進作用も示唆されている。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：メトクロプラミド (Metoclopramide)  
 化学名：4-amino-5-chloro-N-[2-(diethylamino)ethyl]-2-methoxybenzamide

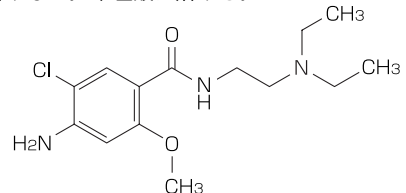
分子式：C<sub>14</sub>H<sub>22</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>

分子量：299.80

融点：146~149℃

性状：メトクロプラミドは白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。酢酸(100)に溶けやすく、メタノール又はクロロホルムにやや溶けやすく、エタノール(95)、無水酢酸又はアセトンにやや溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

構造式：



【取扱い上の注意】<sup>4)</sup>

安定性試験結果の概要

- ペラプリン顆粒2%  
長期保存試験(3年)の結果、ペラプリン顆粒2%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。
- ペラプリン錠5mg  
加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ペラプリン錠5mgは通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

【包装】

- ペラプリン顆粒2%  
バラ包装：1kg
- ペラプリン錠5mg  
PTP包装：100錠(10錠×10)、1,200錠(10錠×120)  
バラ包装：1,200錠

【主要文献】

- 1) テバ製薬(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) テバ製薬(株)社内資料(溶出試験)
- ※※3) 第十六改正日本薬局方解説書
- 4) テバ製薬(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文献・社内資料は下記にご請求下さい。  
 テバ製薬株式会社 DIセンター  
 〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号  
 TEL 0120-923-093 FAX 052-459-2853  
 受付時間 9:00~17:00(土・日・祝日を除く)

※※製造販売元

テバ製薬株式会社

名古屋市中村区太閤一丁目24番11号