

貯法：室温保存
有効期間：3年

5-HT_{1B/1D}受容体作動型片頭痛治療剤

エレクトリプタン臭化水素酸塩口腔内崩壊錠

エレクトリプタン OD錠 20mg「アメル」

Eletriptan OD Tablets 「AMEL」

劇薬

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋により使用すること

承認番号	23000AMX00783
販売開始	2018年12月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 心筋梗塞の既往歴のある患者、虚血性心疾患又はその症状・兆候のある患者、異型狭心症（冠動脈攣縮）のある患者〔不整脈、狭心症、心筋梗塞を含む重篤な虚血性心疾患様症状があらわれることがある。〕
- 2.3 脳血管障害や一過性脳虚血発作の既往のある患者〔脳血管障害や一過性脳虚血発作があらわれることがある。〕
- 2.4 末梢血管障害を有する患者〔症状を悪化させる可能性が考えられる。〕
- 2.5 コントロールされていない高血圧症の患者〔一過性の血圧上昇を引き起こすことがある。〕
- 2.6 重度の肝機能障害を有する患者〔9.3.1、16.6.1 参照〕
- 2.7 エルゴタミン、エルゴタミン誘導体含有製剤、他の5-HT_{1B/1D}受容体作動薬、HIVプロテアーゼ阻害薬（リトナビル）、あるいはニルマトレルビル・リトナビルを投与中の患者〔10.1 参照〕

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	エレクトリプタン OD錠 20mg「アメル」
有効成分	1錠中、エレクトリプタン臭化水素酸塩 24.242mg（エレクトリプタンとして20mg）を含有する。
添加剤	クロスカルメロースナトリウム、スクラロース、黄色三二酸化鉄、D-マンニトール、D-マンニトール・カルメロース・結晶セルロース・クロスポビドン混合物、香料、ステアリン酸マグネシウム

3.2 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
エレクトリプタン OD錠 20mg「アメル」	素錠		アメル ELT /OD 20
	淡黄色	直径：約 8.0mm 厚さ：約 2.9mm 質量：約 180.0mg	

※本剤の錠剤表面に斑点が認められることがありますが、これは使用色素によるものであり、品質に影響はありません。

4. 効能又は効果 片頭痛

5. 効能又は効果に関連する注意

- 5.1 本剤は国際頭痛学会による片頭痛診断基準¹⁾により「前兆のない片頭痛」あるいは「前兆のある片頭痛」と確定診断が行われた場合にのみ投与すること。特に次のような患者は、くも膜下出血等の脳血管障害や他の原因による頭痛の可能性があるので、本剤投与前に問診、診察、検査を十分に行い、頭痛の原因を確認してから投与すること。
 - ・今までに片頭痛と診断が確定したことがない患者
 - ・片頭痛と診断されたことはあるが、片頭痛に通常見られる症状や経過とは異なった頭痛及び随伴症状のある患者

- 5.2 家族性片麻痺性片頭痛、孤発性片麻痺性片頭痛、脳底型片頭痛あるいは眼筋麻痺性片頭痛の患者には投与しないこと。

6. 用法及び用量

通常、成人にはエレクトリプタンとして1回 20mgを片頭痛の頭痛発現時に経口投与する。
なお、効果が不十分な場合には、追加投与をすることができるとは、前回の投与から2時間以上あけること。
また、20mgの経口投与で効果が不十分であった場合には、次回片頭痛発現時から40mgを経口投与することができる。ただし、1日の総投与量を40mg以内とする。

7. 用法及び用量に関連する注意

- 7.1 本剤は頭痛発現時にのみ使用し、予防的には使用しないこと。
- 7.2 本剤投与により全く効果が認められない場合は、その発作に対して追加投与をしないこと。このような場合は、再検査の上、頭痛の原因を確認すること。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 心血管系の疾患が認められない患者においても、重篤な心疾患が極めてまれに発生することがある。このような場合は以後の投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 8.2 片頭痛あるいは本剤投与により眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械操作に従事させないように十分注意すること。
- 8.3 本剤を含むトリプタン系薬剤により、頭痛が悪化することがあるので、頭痛の改善を認めない場合には、「薬剤の使用過多による頭痛」¹⁾の可能性を考慮し、投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。〔11.1.5 参照〕

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 虚血性心疾患の可能性のある患者

例えば、以下のような患者では不整脈、狭心症、心筋梗塞を含む重篤な虚血性心疾患様症状があらわれるおそれがある。〔11.1.2 参照〕

- ・虚血性心疾患を疑わせる重篤な不整脈のある患者
- ・閉経後の女性
- ・40歳以上の男性
- ・冠動脈疾患の危険因子を有する患者

9.1.2 ウォルフ・パーキンソン・ホワイト症候群（WPW 症候群）又は他の心臓副伝導路と関連した不整脈のある患者

WPW 症候群の典型的症状である重篤な発作性頻脈が発現したとの報告がある。〔11.1.4 参照〕

9.1.3 脳血管障害の可能性のある患者

脳血管障害があらわれるおそれがある。

9.1.4 てんかんあるいは痙攣を起しやすしい器質的脳疾患のある患者

てんかん様発作がおこるおそれがある。〔11.1.3 参照〕

9.1.5 コントロールされている高血圧症患者

一過性の血圧上昇や末梢血管抵抗の上昇を引き起こすことがある。

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝機能障害を有する患者

投与しないこと。本剤は主に肝臓で代謝されるので、重度の肝機能障害患者では血中濃度が上昇するおそれがある。〔2.6、16.6.1 参照〕

9.3.2 肝機能障害を有する患者

本剤は主に肝臓で代謝されるので、血中濃度が上昇することがある。[16.6.1 参照]

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。本剤は投与後 24 時間までにヒト母乳中に約 0.02% の移行が認められている²⁾ (外国人データ)。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

血圧の上昇は、若年者よりも高齢者で大きいので慎重に投与すること。高齢者と若年者における収縮期血圧の最大上昇の差は 10.19mmHg、拡張期血圧の最大上昇の差は 2.59mmHg であった³⁾ (外国人データ)。

10. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素チトクローム P450 3A4 により代謝される。[16.4.1 参照]

10.1 併用禁忌 (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
エルゴタミン エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン(クリアミン) エルゴタミン誘導体含有製剤 ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩(ジヒデルゴット) エルゴメトリンマレイン酸塩(エルゴメトリンF) メチルエルゴメトリンマレイン酸塩(メテルギン) [2.7 参照]	血圧上昇又は血管攣縮が増強されるおそれがある。本剤投与後にエルゴタミンあるいはエルゴタミン誘導体含有製剤を投与する場合、もしくはその逆の場合は、それぞれ 24 時間以上の間隔をあけて投与すること。	5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬との薬理的相加作用により、相互に作用(血管収縮作用)を増強させる。
5-HT _{1B/1D} 受容体作動薬 スマトリプタンコハク酸塩(イミグラン) ゾルミトリプタン(ゾーミック) リザトリプタン安息香酸塩(マクサルト) ナラトリプタン塩酸塩(アマージ) [2.7 参照]	血圧上昇又は血管攣縮が増強されるおそれがある。本剤投与後に他の 5-HT _{1B/1D} 受容体作動型の片頭痛薬を投与する場合、もしくはその逆の場合は、それぞれ 24 時間以内に投与しないこと。	併用により相互に作用を増強させる。
HIV プロテアーゼ阻害剤 リトナビル(ノービア) [2.7 参照]	本剤の代謝が阻害され血中濃度が上昇するおそれがある。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクローム P450 3A4 により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。
ニルマトレルビル・リトナビル(パキロビッド) [2.7 参照]	本剤の代謝が阻害され血中濃度が上昇するおそれがある。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクローム P450 3A4 により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。

* 10.2 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
マクロライド系抗生物質 エリスロマイシン、ジョサマイシン、クラリスロマイシン [16.7.1 参照]	エリスロマイシンとの併用により、本剤の最高血漿中濃度 (C _{max}) は 2 倍、血漿中濃度-時間曲線下面積 (AUC) は 4 倍に増大し、軽度に血圧が上昇した。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクローム P450 3A4 により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。
抗真菌剤 イトラコナゾール	イトラコナゾールとの併用により、本剤の C _{max} 、AUC が増大し、血圧が上昇するおそれがある。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクローム P450 3A4 により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。
カルシウム拮抗剤 ベラパミル [16.7.2 参照]	ベラパミルとの併用により、本剤の C _{max} 、AUC が増大した。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクローム P450 3A4 により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。
飲食物 グレープフルーツジュース	本剤の作用が増強するおそれがある。	本剤は、主として肝代謝酵素チトクローム P450 3A4 により代謝され、代謝酵素阻害薬によりクリアランスが減少する。
* エンシトレルビル フマル酸	本剤の血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。	エンシトレルビル フマル酸のチトクローム P450 3A に対する阻害作用により、本剤の代謝が阻害されることが考えられる。
副腎皮質ホルモン剤 デキサメタゾン 抗てんかん剤 カルバマゼピン 抗結核薬 リファンピシン	本剤の代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがある。	酵素誘導剤により本剤の代謝が促進されるおそれがある。
飲食物 セイヨウオトギリソウ (St. John's Wort、セント・ジョンズ・ワート) 含有食品	本剤の代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがある。	セイヨウオトギリソウにより本剤の代謝が促進されるおそれがある。
選択的セロトニン再取り込み阻害薬 フルボキサミンマレイン酸塩 パロキセチン塩酸塩水和物 セルトラリン塩酸塩 セロトニン・ノルアドレナリン再取り込み阻害薬 ミルナシプラン塩酸塩 デュロキセチン塩酸塩	セロトニン症候群(不安、焦燥、興奮、頻脈、発熱、反射亢進、協調運動障害、下痢等)があらわれることがある。	セロトニンの再取り込みを阻害し、セロトニン濃度を上昇させる。よって本剤との併用により、セロトニン作用が増強する可能性が考えられる。

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 アナフィラキシーショック（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）

11.1.2 虚血性心疾患様症状（頻度不明）

不整脈、狭心症あるいは心筋梗塞を含む虚血性心疾患様症状があらわれることがある。本剤投与後、胸痛、胸部圧迫感等の一過性の症状（強度で咽喉頭部に及ぶ場合がある）があらわれることがある。このような症状が虚血性心疾患によると思われる場合には、以後の投与を中止し、虚血性心疾患の有無を調べるための適切な検査を行うこと。[9.1.1、11.2 参照]

11.1.3 てんかん様発作（頻度不明）

[9.1.4 参照]

11.1.4 頻脈（WPW 症候群における）（頻度不明）

WPW 症候群の典型的症状である重篤な発作性頻脈の報告がある。[9.1.2 参照]

11.1.5 薬剤の使用過多による頭痛（頻度不明）

[8.3 参照]

11.2 その他の副作用

	1%以上 ^{a)}	1%未満 ^{a)}	頻度不明
神経系	浮動性めまい、傾眠・眠気、異常感覚、頭痛	感覚減退、回転性めまい、筋緊張亢進	
心・血管系	熱感	潮紅	動悸、頻脈、血圧上昇
消化器系	嘔気、口内乾燥	消化不良、腹痛	嘔吐
皮膚			発疹、そう痒症、蕁麻疹、血管浮腫
その他	疲労、咽喉絞扼感 ^{b)}	多汗、胸部絞扼感 ^{b)} 、無力症、悪寒、咽喉頭疼痛、疼痛、背部痛	胸痛 ^{b)} 、倦怠感、筋痛、胸部圧迫感 ^{b)} 、筋無力症

a) 発現頻度は承認時の国内臨床試験及び外国で実施された第Ⅱ相/第Ⅲ相試験の結果に基づいている。

b) これらの症状は通常一過性であるが、ときに激しい場合があり、胸部、咽喉頭部を含む身体各部でおこる可能性がある。[11.1.2 参照]

13. 過量投与

13.1 処置

本剤の消失半減期は約 4 時間であり、少なくとも 20 時間、あるいは症状・徴候が持続する限り患者をモニターすること。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するように指導すること。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ある。

14.1.2 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

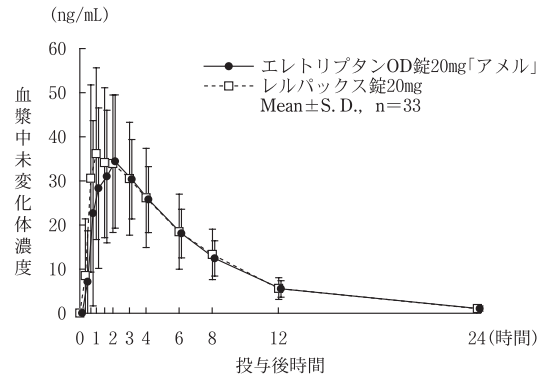
16.1.1 生物学的同等性試験

エレトリプタン OD 錠 20mg 「アメル」とレルパックス錠 20mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（エレトリプタンとして 20mg）健康成人男子に水なし又は水ありで絶食単回経口投与して血漿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 90% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された⁴⁾。

薬物動態パラメータ（生物学的同等性、水なし）

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _(0→24) (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エレトリプタン OD 錠 20mg 「アメル」	256.31 ± 81.59	40.02 ± 17.06	1.71 ± 0.79	4.44 ± 0.73
レルパックス錠 20mg [*]	268.81 ± 117.12	39.65 ± 18.41	1.43 ± 0.85	4.34 ± 0.66

※水で服用
(Mean ± S.D., n=33)

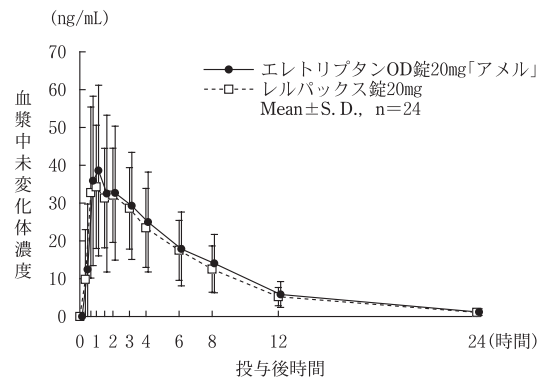


血漿中未変化体濃度（生物学的同等性、水なし）

薬物動態パラメータ（生物学的同等性、水あり）

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _(0→24) (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
エレトリプタン OD 錠 20mg 「アメル」	270.60 ± 135.84	44.91 ± 23.75	1.17 ± 0.91	4.45 ± 0.56
レルパックス錠 20mg	252.54 ± 98.10	42.56 ± 18.78	1.41 ± 1.02	4.34 ± 0.69

(Mean ± S.D., n=24)



血漿中未変化体濃度（生物学的同等性、水あり）

血漿中濃度並びに 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。

16.4 代謝

16.4.1 本剤は、主にチトクローム P450 3A4 により代謝されると考えられる⁵⁾。[10. 参照]

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 肝機能障害患者

健康成人 10 例及び軽度又は中等度の肝機能障害患者 10 例にエレトリプタン 80mg³⁾を単回経口投与した時の肝機能障害患者の AUC (2,234ng・h/mL) は、健康成人 (1,661ng・h/mL) と比較して有意に増大 (35%) した。Cmax は、有意ではないもののわずかに上昇した⁶⁾ (外国人データ)。[2.6、9.3.1、9.3.2 参照]

16.7 薬物相互作用

16.7.1 健康成人 18 例にエリスロマイシン 500mg 又はプラセボを反復経口投与し、投与 7 日目にエレトリプタン 80mg³⁾を単回経口投与した時、エリスロマイシン併用群ではプラセボ併用群と比較してエレトリプタンの Cmax は約 2 倍、AUC が約 4 倍に増大し、T_{1/2} は 4.6 時間から 7.1 時間に延

長した。同時に軽度の血圧上昇が認められた⁷⁾(外国人データ)。^[10.2 参照]

16.7.2 健康成人 18 例にベラパミル 240mg 又はプラセボを反復経口投与し、投与 6 日目にエレトリプタン 80mg^{注)}を単回経口投与した時、ベラパミル併用群ではプラセボ併用群と比較してエレトリプタンの Cmax は 2.2 倍、AUC が 2.7 倍に増大し、T_{1/2} は 4.5 時間から 4.9 時間となり、その差は小さかった。臨床的に問題となる血圧への影響は認められなかった⁸⁾(外国人データ)。^[10.2 参照]

注：本剤の日本での承認用量は 1 回 20mg 又は 40mg であり、1 日の総投与量は 40mg 以内である。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

5-HT_{1D} と 5-HT_{1B} 受容体に麦角アルカロイドより選択的に相互作用し、動静脈吻合を含む脳内の血管の収縮を引き起こす。また、血管周囲腔の神経終末の段階で炎症誘発性の神経ペプチドの遊離を遮断する⁹⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名

エレトリプタン臭化水素酸塩 (Eletriptan Hydrobromide)

化学名

(+)- (R)- 3- (1-methylpyrrolidin-2-ylmethyl) -5-(2-phenylsulfonyl ethyl) -1H-indole monohydrobromide

分子式

C₂₂H₂₆N₂O₂S · HBr

分子量

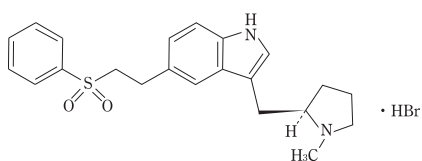
463.43

性状

白色又はわずかに着色した粉末である。

ジメチルアセトアミド又はメタノールに溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、エタノール (99.5) に溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

構造式



22. 包装

10 錠[10 錠(PTP)×1]

23. 主要文献

- 1) International Headache Society 2018 : Cephalalgia. 2018 ; 38 (1) : 1-211
- 2) 母乳中排泄 (レルパックス錠 : 2002 年 4 月 11 日承認、申請資料概要 へ.3.1.3)
- 3) 高齢者 (レルパックス錠 : 2002 年 4 月 11 日承認、申請資料概要 へ.3.1.6、ト.1.3.1)
- 4) 社内資料 : 生物学的同等性試験 [OD 錠 20mg]
- 5) 代謝に関与するチトクロム P450 (レルパックス錠 : 2002 年 4 月 11 日承認、申請資料概要 へ.3.4.1)
- 6) 肝機能障害患者における薬物動態 (レルパックス錠 : 2002 年 4 月 11 日承認、申請資料概要 へ.3.3.1)
- 7) エリスロマイシン併用時の薬物動態 (レルパックス錠 : 2002 年 4 月 11 日承認、申請資料概要 へ.3.4.7.1、ト.1.3.2.1)
- 8) ベラパミル併用時の薬物動態 (レルパックス錠 : 2002 年 4 月 11 日承認、申請資料概要 へ.3.4.7.3、ト.1.3.2.3)
- 9) グッドマン・ギルマン薬理書 第 12 版. 廣川書店. 2013 : 431

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目 9 番 1 号
TEL 0120-893-170
FAX 0120-893-172

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

共和薬品工業株式会社

大阪市北区中之島 3-2-4

26.2 販売元



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目 9 番 1 号