

向精神薬
習慣性医薬品^{注1)}
処方箋医薬品^{注2)}

不眠症治療剤



Erimin[®]
ニメタゼパム錠

	錠3mg	錠5mg
承認番号	22000AMX00479	22000AMX00478
薬価収載	2008年6月	
販売開始	1977年5月	

貯法：遮光・室温保存(光により変色することがある)
使用期限：外箱等に記載

注1) 注意-習慣性あり

注2) 注意-医師等の処方箋により使用すること

禁忌(次の患者には投与しないこと)

- (1)急性閉塞隅角緑内障のある患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状が悪化するおそれがある。〕
- (2)重症筋無力症のある患者〔筋弛緩作用により症状が悪化するおそれがある。〕

原則禁忌(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)

肺性心、肺気腫、気管支喘息及び脳血管障害の急性期などで呼吸機能が高度に低下している場合〔炭酸ガスナルコーシスを起こしやすい。〕

組成・性状

販売名	エリミン錠3mg	エリミン錠5mg
有効成分(1錠中)	ニメタゼパム 3mg	ニメタゼパム 5mg
添加物	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、カルメロースカルシウム、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、ステアリン酸マグネシウム、黄色五号アルミニウムレーキ	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、カルメロースカルシウム、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、ステアリン酸マグネシウム、黄色五号アルミニウムレーキ
色・剤形	うすいだいだい色の素錠	うすいだいだい色の素錠
外形		
大きさ	直径約8mm	直径約8mm
識別コード	☛028/3	☛028/5

効能・効果**不眠症****用法・用量**

通常、成人には1回ニメタゼパムとして3～5mgを就寝前に経口投与する。

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】

不眠症には、就寝の直前に服用させること。また、服用して就寝した後、睡眠途中において一時的に起床して仕事等をする可能性があるときは服用させないこと。

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)**

- (1)心障害のある患者〔症状が悪化することがある。〕
- (2)肝障害、腎障害のある患者〔排泄が遅延するおそれがある。〕
- (3)脳に器質的障害のある患者〔作用が強くなる可能性がある。〕

(4)高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕

(5)衰弱患者〔副作用があらわれやすい。〕

(6)幼児、小児〔作用が強くなる可能性がある。〕

2. 重要な基本的注意

本剤の影響が翌朝以後に及び、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、**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
中枢神経抑制剤 フェノチアジン誘導体 バルビツール酸誘導体 等	作用が増強されることがある。併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与すること。	ともに中枢神経抑制作用を有するため、相互に作用を増強することが考えられている。
アルコール(飲酒)		
モノアミン酸化酵素阻害剤		機序不明

4. 副作用

承認までの臨床試験における調査症例498例中137例(27.5%)、承認後の使用成績調査5076例中196例(3.9%)、計5574例中333例(5.97%)に臨床検査値異常を含む副作用が認められている。その主な副作用は、ふらつき139件(2.5%)、倦怠感90件(1.6%)、眠気67件(1.2%)、脱力感54件(1.0%)、頭重37件(0.7%)等であった。

以下の副作用には頻度が算出できない副作用報告を含む。

(1)重大な副作用**1) 依存性(頻度不明)**

大量連用により薬物依存を生じることがあるので、観察を十分に行い、用量を超えないよう慎重に投与すること。また、大量投与又は連用中における投与量の急激な減少ないし投与の中止により、痙攣発作、せん妄、振戦、不眠、不安、幻覚、妄想等の離脱症状があらわれることがあるので、投与を中止する場合には、徐々に減量するなど慎重に行うこと。

2) 刺激興奮、錯乱等(頻度不明)

統合失調症等の精神障害者に投与すると逆に**刺激興奮、錯乱**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。

(2)重大な副作用(類薬)**一過性前向性健忘、もうろう状態**

類薬(他の不眠症治療薬)において、一過性前向性健忘、また、もうろう状態があらわれることがあるので、本剤を投与する場合には少量から開始するなど、慎重に行うこと。なお、類薬において、十分に覚醒しないまま、車の運転、食事等を行い、その出来事を記憶していないとの報告がある。異常が認められた場合には投与を中止すること。

③その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満
精神神経系	ふらつき、眠気、頭痛、頭重感、めまい、不快感、いらいら感	振戦、耳鳴、構音障害
肝臓		AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、ALP上昇
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐	胃部不快感、下痢、腹痛
循環器	動悸	胸部圧迫感
過敏症※		発疹、発赤
骨格筋	倦怠感、脱力感	腰痛、肩こり
その他	口渇	発汗、寝汗

※このような場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者へ投与する場合は、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。〔運動失調等の副作用があらわれやすい。〕

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊娠中の投与に関し、次のような報告があるなど、安全性は確立していないので、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まわると判断される場合にのみ投与すること。

- 1)妊娠動物に投与した実験で胎仔の体重増加抑制、新生仔の生存率低下が報告されている。
- 2)妊娠中に他のベンゾジアゼピン系薬剤を服用していた患者が出産した新生児において、口唇裂、口蓋裂等が対照群と比較して有意に多いとの疫学的調査が報告されている。
- 3)ベンゾジアゼピン系薬剤で新生児に哺乳困難、嘔吐、活動低下、筋緊張低下、過緊張、嗜眠、傾眠、呼吸抑制・無呼吸、チアノーゼ、易刺激性、神経過敏、振戦、低体温、頻脈等を起こすことが報告されている。なお、これらの症状は、離脱症状あるいは新生児仮死として報告される場合もある。また、ベンゾジアゼピン系薬剤で新生児に黄疸の増強を起こすことが報告されている。
- 4)分娩前に連用した場合、出産後新生児に離脱症状があらわれることが、ベンゾジアゼピン系薬剤で報告されている。

(2)授乳中の投与に関し、次のような報告があり、また黄疸を増強する可能性があるので授乳婦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。

- 1)動物の授乳期に投与した実験で新生仔の生存率低下が報告されている。
- 2)ヒト母乳中へ移行し、新生児に嗜眠、体重減少等を起こすことが、他のベンゾジアゼピン系薬剤(ジアゼパム)で報告されている。

7. 過量投与

本剤の過量投与が明白又は疑われた場合の処置としてフルマゼニル(ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤)を投与する場合には、使用前にフルマゼニルの使用上の注意(禁忌、慎重投与、相互作用等)を必ず読むこと。

8. その他の注意

- (1)動物実験で精巣の萎縮が報告されている。
- (2)投与した薬剤が特定されないままにフルマゼニル(ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤)を投与された患者で、新たに本剤を投与する場合、本剤の鎮静・抗痙攣作用が変化、遅延するおそれがある。

■薬物動態

1. 血中濃度

健康成人に1回5mgを経口投与した場合、速やかに血中であらわれ、投薬後1時間の血中濃度は10.4ng/mLで、ピークとなる2～4時間後の濃度(13.4ng/mL)と同程度であり、ニトラゼパムに比べて高い初期血中濃度を示す。

2. 代謝

血中代謝物は1-デスマethyl体と3-ヒドロキシ体が確認されているが、その血中濃度は未変化体に比べて極めて低い。

3. 分布・排泄

(参考)

¹⁴C-ニメタゼパムを経口投与した場合、血中から脳へのとりこみは早く、ニトラゼパムより短時間に移行する。肝臓、腎臓、脂肪、副腎に¹⁴Cの分布が高い(マウス・ラット)。投与後24～48時間で、尿及び糞に80%以上排泄された(マウス、ラット、イヌ)。

■臨床成績

二重盲検比較試験を含む435例を対象とした臨床試験で、不眠症に対し有効率45.7%(199/435)を示した。また、ニトラゼパムを対照とした二重盲検比較試験によって本剤の有用性が認められている。^{1)～3)}

■薬効薬理

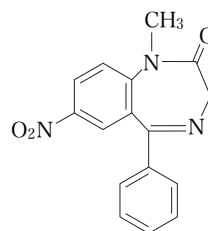
ニトラゼパムと同様の作用スペクトラム(馴化、鎮静、筋弛緩、睡眠誘起及び増強、抗痙攣作用等)を示すが、ニトラゼパムより効力が強く、かつ効果発現が速い(マウス、ラット)。⁴⁾本剤による睡眠発現機序は、大脳辺縁系及び視床下部の情動機構の抑制並びに大脳辺縁系賦活機構の抑制によるものと考えられている。

■有効成分に関する理化学的知見

一般名：ニメタゼパム(Nimetazepam)

化学名：1-methyl-7-nitro-5-phenyl-1H-1,4-benzodiazepin-2(3H)-one

構造式：



分子式：C₁₆H₁₃N₃O₃ (295.29)

性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。酢酸(100)又はクロロホルムに溶けやすく、アセトン又は1,4-ジオキサンにやや溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)、イソプロパノール又はジエチルエーテルに溶けにくく、水又はヘキサンにほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

融点：158～161℃

■包装

**エリミン錠3mg：[ヒートシール]100錠(10錠×10)
エリミン錠5mg：
[ヒートシール]100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)
[バラ]1,000錠

■主要文献

- 1) 工藤義雄^{ほか}：医学のあゆみ，86：344，1973.
- 2) 栗原雅直^{ほか}：臨床評価，2：385，1974.
- 3) 伊藤栄一^{ほか}：臨床薬理，4：61，1973.
- 4) Sakai, S. et al.：Arzneim-Forsch., 22：534，1972.

■文献請求先、製品に関するお問い合わせ先

大日本住友製薬株式会社
〒541-0045 大阪市中央区道修町2-6-8

くすり情報センター

TEL 0120-034-389

**■投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は厚生労働省告示第75号(平成24年3月5日付)に基づき、投薬は1回30日分を限度とされています。

製造販売元
大日本住友製薬株式会社
大阪市中央区道修町2-6-8

