

貯 法：室温保存  
有効期間：3年

## 心選択性βブロッカー

劇薬、処方箋医薬品<sup>注1</sup>

日本薬局方 メトプロロール酒石酸塩錠

# ロプレソール<sup>®</sup>錠20mg

# ロプレソール<sup>®</sup>錠40mg

## Lopresor<sup>®</sup> Tablets

承認番号	錠20mg：15700AMZ01132000 錠40mg：15700AMZ01133000
販売開始	1983年2月

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

### 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）







- 2.1 本剤の成分及び他のβ遮断剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 糖尿病性ケトアシドーシス、代謝性アシドーシスのある患者〔本症でみられる心筋収縮力抑制を増強するおそれがある。〕
- 2.3 高度の徐脈（著しい洞性徐脈）、房室ブロック（Ⅱ、Ⅲ度）、洞房ブロック、洞不全症候群のある患者〔心刺激伝導系を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。〕
- 2.4 心原性ショック、肺高血圧による右心不全、うっ血性心不全の患者〔心筋収縮力を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。〕
- 2.5 低血圧症の患者〔降圧作用により症状を悪化させるおそれがある。〕
- 2.6 重症の末梢循環障害（壊疽等）のある患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕
- 2.7 未治療の褐色細胞腫又はパラガングリオーマの患者〔7.、9.1.8 参照〕
- 2.8 妊婦又は妊娠している可能性のある女性〔9.5 参照〕

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

販売名	ロプレソール錠20mg	ロプレソール錠40mg
有効成分	1錠中メトプロロール酒石酸塩（日局）20mg	1錠中メトプロロール酒石酸塩（日局）40mg
添加剤	ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、カルメロース、セルロース、乳糖、マクロゴール、酸化チタン、ヒプロメロース	ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、カルメロース、セルロース、乳糖、マクロゴール、酸化チタン、ヒプロメロース

#### 3.2 製剤の性状

販売名	ロプレソール錠20mg	ロプレソール錠40mg
性状	白色のフィルムコート錠	白色のフィルムコート錠
外形	  	  
識別コード	SJ 116	SJ 117
大きさ（約）	直径：6.1mm 厚さ：3.1mm 質量：0.09g	直径：8.1mm 厚さ：3.6mm 質量：0.19g

### 4. 効能又は効果

- 狭心症
- 頻脈性不整脈
- 本態性高血圧症（軽症～中等症）

### 6. 用法及び用量

〈狭心症、頻脈性不整脈〉

通常成人にはメトプロロール酒石酸塩として1日60～120mgを1日2～3回に分割経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。

〈本態性高血圧症（軽症～中等症）〉

通常成人にはメトプロロール酒石酸塩として1日60～120mgを1日3回に分割経口投与する。効果不十分な場合は240mgまで増量することができる。なお、年齢・症状により適宜増減する。

### 7. 用法及び用量に関連する注意

褐色細胞腫又はパラガングリオーマの患者では、α遮断剤で初期治療を行った後に本剤を投与し、常にα遮断剤を併用すること。〔2.7、9.1.8 参照〕

### 8. 重要な基本的注意

- 8.1 投与は少量より開始し、長期投与の場合は心機能検査（脈拍・血圧・心電図・X線等）を定期的に行うこと。特に徐脈になったとき及び低血圧を起こした場合には減量又は中止すること。また、必要に応じアトロピンを投与するなど対症療法を行うこと。なお、肝機能、腎機能、血液像等に注意すること。
- 8.2 類似化合物（プロプラノロール塩酸塩）使用中の狭心症の患者で急に投与を中止したとき、症状が悪化したり、心筋梗塞を起こした症例が報告されているので、休薬を要する場合は徐々に減量し、観察を十分に行うこと。また、患者に医師の指示なしに服薬を中止しないよう注意すること。狭心症以外の適用で投与する場合でも、特に高齢者においては同様の注意をすること。〔9.8 参照〕
- 8.3 手術前24時間は投与しないことが望ましい。
- 8.4 めまい、ふらつきがあらわれることがあるので、本剤投与中の患者（特に投与初期）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。

### 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 気管支喘息、気管支痙攣のおそれのある患者  
気管支拡張剤を併用するなど慎重に投与すること。喘息等の症状を誘発・悪化させるおそれがある。
  - 9.1.2 うっ血性心不全のおそれのある患者  
観察を十分に行い、ジギタリス剤を併用するなど慎重に投与すること。心筋収縮力を抑制し、症状を誘発するおそれがある。
  - 9.1.3 低血糖症、コントロール不十分な糖尿病、長期間絶食状態の患者  
血糖値に注意すること。低血糖症状を起こしやすく、かつ低血糖の前駆症状である頻脈等の症状をマスクしやすい。
  - 9.1.4 徐脈、房室ブロック（Ⅰ度）のある患者  
心機能に注意すること。心刺激伝導系を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。
  - 9.1.5 異型狭心症の患者  
症状を悪化させるおそれがある。
  - 9.1.6 甲状腺中毒症の患者
    - (1) 休薬を要する場合には徐々に減量し、観察を十分に行うこと。急に投与を中止すると、症状を悪化させることがある。
    - (2) 頻脈等の中毒症状をマスクするおそれがある。

9.1.7 末梢循環障害（レイノー症候群、間欠性跛行症等）のある患者

症状を悪化させるおそれがある。

9.1.8 褐色細胞腫又はパラングリオーマの患者

本剤の単独投与により急激に血圧が上昇することがある。  
[2.7、7. 参照]

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重篤な腎障害のある患者

排泄が遅延するおそれがある。

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝障害のある患者

代謝が遅延するおそれがある。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。[2.8 参照]

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続または中止を検討すること。母乳中へ移行することが報告されている。

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

次の点に注意し、少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。  
・一般に過度の降圧は好ましくないとされている。脳梗塞等が起こるおそれがある。  
・休薬を要する場合は、徐々に減量する。[8.2 参照]

10. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素 CYP2D6 で代謝されることから、本酵素の活性に影響する薬剤との併用には注意すること。  
[16.4 参照]

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
交感神経系に対し抑制的に作用する他の薬剤 レセルピン β遮断剤（チモロール等の点眼剤を含む）等	過剰の交感神経抑制を来し、徐脈、血圧低下等があらわれるおそれがあるので、用量に注意すること。	共に交感神経抑制作用を有するため。
血糖降下剤 インスリン グリベンクラミド等	血糖降下作用を増強することがある。また、低血糖症状（頻脈等）をマスクすることがあるので、血糖値に注意すること。	本剤のβ遮断作用により、低血糖からの回復が遅れることがあり、また、低血糖に伴う交感神経系の症状をマスクする。
カルシウム拮抗剤 ベラパミル ジルチアゼム等	相互に作用が増強され、過度の降圧又は心機能抑制があらわれることがあるので、用量に注意すること。	共に陰性変時・変力作用、降圧作用を有するため。
クロニジン	クロニジンの投与中止後のリバウンド現象（血圧上昇）を増強するおそれがある。クロニジンの投与を中止する場合には、本剤を数日前に中止し、経過を観察してから行うこと。	クロニジンの投与中止により血中ノルアドレナリンが増加した場合、本剤のβ遮断作用によりα刺激作用（血管収縮作用）が優位となるため。
Class I 抗不整脈剤 ジソピラミド プロカインアミド アジマリン等 Class III 抗不整脈剤 アミオダロン等	過度の心機能抑制があらわれることがあるので、用量に注意すること。	共に心機能抑制作用を有するため。
抗不整脈剤 キニジン プロパフェノン アミオダロン等	本剤の血中濃度が上昇し、作用が増強することがあるので、用量に注意すること。	これらの薬剤の肝代謝酵素阻害作用により本剤の代謝が抑制されると考えられる。
ミラベグロン	本剤のAUCが3.29倍上昇したとの報告があり、本剤の作用が増強するおそれがある。	ミラベグロンのCYP2D6阻害作用により、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。
麻酔剤 セボフルラン等	過剰の交感神経の抑制を起こす可能性があるため心機能等に注意すること。	共に交感神経抑制作用を有するため。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジギタリス製剤	房室伝導時間が延長し、徐脈、房室ブロック等があらわれるおそれがあるので、心機能に注意すること。	共に刺激伝導速度の抑制作用を有するため。
非ステロイド性抗炎症剤 インドメタシン等	本剤の降圧作用が減弱することがあるので、用量に注意すること。	非ステロイド性抗炎症剤は、血管拡張作用を有する腎プロスタグランジンの合成・遊離を阻害し血圧を上昇させることがある。
降圧作用を有する他の薬剤 ニトログリセリン タラフィル等	過度の降圧を来すおそれがあるので、用量に注意すること。	共に降圧作用を有するため。
シメチジン	本剤の血中濃度が上昇し、作用が増強することがあるので、用量に注意すること。	これらの薬剤の肝代謝酵素阻害作用により本剤の代謝が抑制されると考えられる。
選択的セロトニン再取り込み阻害剤 パロキセチン等	本剤の血中濃度が上昇し、作用が増強することがあるので、用量に注意すること。	これらの薬剤の肝代謝酵素阻害作用により本剤の代謝が抑制されると考えられる。
抗ヒスタミン剤 ジフェンヒドラミン等	本剤の血中濃度が上昇し、作用が増強することがあるので、用量に注意すること。	これらの薬剤の肝代謝酵素阻害作用により本剤の代謝が抑制されると考えられる。
ヒドララジン	本剤の血中濃度が上昇し、作用が増強することがあるので、用量に注意すること。	ヒドララジンは肝血流量を増加させ、本剤の初回通過効果を減少させると考えられる。
リファンピシン	本剤の血中濃度が低下し、作用が弱まる可能性があるため、用量に注意すること。	リファンピシンの肝代謝酵素誘導作用により本剤の代謝が促進されると考えられる。
リドカイン	リドカインの血中濃度を上昇させることがあるので、用量に注意すること。	本剤による肝血流量の減少及び肝代謝酵素活性阻害によりリドカインの代謝が遅延させると考えられる。
フィンゴリモド	フィンゴリモドの投与開始時に本剤を併用すると重度の徐脈や心ブロックが認められることがある。	共に徐脈や心ブロックを引き起こすおそれがある。

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 心源性ショック（頻度不明）

11.1.2 うっ血性心不全（0.2%）、房室ブロック（頻度不明）、徐脈（2.4%）、洞機能不全（頻度不明）

11.1.3 喘息症状の誘発・悪化（0.3%）

11.1.4 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
眼	視覚障害（霧視等）		涙液分泌減少、結膜炎
過敏症	発疹（乾癬型等）	そう痒	光線過敏症
血液			血小板減少
循環器	動悸	末梢循環障害（四肢の冷え・しびれ等）	心室性期外収縮、起立性低血圧 <sup>注1)</sup> 、低血圧
呼吸器	息切れ		鼻閉、鼻炎、気管支痙攣
精神神経系	めまい・ふらつき、頭痛、不眠、眠気、抑うつ	悪夢、不安	幻覚、感覚異常、注意力障害、神経過敏、健忘、錯乱
消化器	腹痛、食欲不振、便秘、下痢、胸やけ、口渇		悪心・嘔吐、腹部膨満感
肝臓			AST上昇、ALT上昇



	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
その他	胸部圧迫感、浮腫、疲労感、耳鳴	性欲減退	倦怠感、トリグリセライドの上昇、発汗、CK (CPK)の上昇、筋痙直、勃起障害、味覚異常、脱毛、難聴、関節痛、体重増加、乾癬悪化

注) ごくまれに失神を伴うことがある。

### 13. 過量投与

#### 13.1 症状

重度の低血圧、洞性徐脈、房室ブロック、心筋梗塞、心不全、心原性ショック、心停止、気管支痙攣、意識障害 (又は昏睡)、痙攣、悪心、嘔吐、チアノーゼ等の症状が起こるおそれがある。

#### 13.2 処置

##### 13.2.1 過度の徐脈

アトロピンを静注する。効果不十分な場合には  $\beta_1$  刺激剤 (ドブタミン等) を投与する。又は一時的にペースメーカーを使用する。

##### 13.2.2 過度の低血圧

低血圧には昇圧剤 (アドレナリン、ドパミン、ドブタミン等) を投与する。

##### 13.2.3 心不全

利尿剤、ジギタリス製剤を投与する。

##### \* 13.2.4 気管支痙攣

$\beta_2$  刺激剤又はアミノフィリンを静注する。

これらの処置の間は患者を常に観察下におくこと。

また、過度の徐脈、過度の低血圧、心不全の処置には、グルカゴンが有効な場合もある。

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

### 15. その他の注意

#### 15.1 臨床使用に基づく情報

$\beta$  遮断剤服用中の患者では、他の薬剤によるアナフィラキシー反応がより重篤になることがあり、また、通常用量のアドレナリンによる治療に抵抗するとの報告がある。

### 16. 薬物動態

#### 16.1 血中濃度

健康成人にメトプロロール酒石酸塩 40mg を単回経口投与した場合の薬物動態パラメータは次のとおりである<sup>1)</sup>。

メトプロロール酒石酸塩 40mg 単回経口投与後の薬物動態パラメータ

Tmax (h)	Cmax (ng/mL)	AUC <sub>0-∞</sub> (ng·h/mL)	T <sub>1/2</sub> (h)
1.9	41.8	241.9	2.8

#### 16.4 代謝

メトプロロールは主として肝において代謝される。<sup>3</sup>H-メトプロロールを経口又は静脈内投与した場合の AUC の比は 0.38 であり、経口投与量の約 60% が初回通過効果を受けたものと考えられる<sup>2)-4)</sup>。メトプロロールの主な代謝酵素は CYP2D6 (70～80%) とされている<sup>5)</sup> (外国人のデータ)。<sup>[10. 参照]</sup>

#### 16.5 排泄

メトプロロールは主として腎から排泄される。<sup>3</sup>H-メトプロロールを経口投与した場合の尿中総排泄率は 24 時間後で投与量の 90% 以上であり、未変化体として 3～5% が排泄される<sup>2)-4)</sup> (外国人のデータ)。

### 17. 臨床成績

#### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

##### <本態性高血圧症、狭心症>

##### 17.1.1 国内一般臨床試験

本態性高血圧症患者 388 例を対象に本剤 1 日 20～360mg を最長 202 週間単独投与又は他の降圧剤との併用投与した結

果、有効率は 63.0% (242/384) であった。単独投与による有効率は 59.3% (140/236) で、チアジド系利尿降圧剤又は血管拡張性降圧剤との併用投与による有効率は 67.6% (92/136) であった (単独、併用不明の 12 例を除く)。

本剤の降圧効果は 2 週間後から認められ、4 週間には最大に達する<sup>6)</sup>。

本剤を 1 年以上投与した長期投与試験において安定した血圧が維持されている<sup>7)</sup>。

(本剤の承認された用法・用量は「通常成人にはメトプロロール酒石酸塩として 1 日 60～120mg を 1 日 3 回に分割経口投与する。効果不十分な場合は 240mg まで増量することができる。なお、年齢・症状により適宜増減する。」である。)

狭心症患者 155 例を対象に本剤 1 日 40～180mg を最長 233 週間投与した結果、有効率は 65.3% (94/144) であり、労作性狭心症に対する有効率は 67.2% (84/125) であった。

狭心症患者を対象に本剤 60mg/日 2 週間連続投与により狭心発作回数、ニトログリセリン使用錠数の有意な減少が認められた。また、増量による効果の増強も確認された<sup>8)</sup>。

(本剤の承認された用法・用量は「通常成人にはメトプロロール酒石酸塩として 1 日 60～120mg を 1 日 2～3 回に分割経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。」である。)

副作用発現率は、577 例 (本態性高血圧症以外の高血圧を含む) 中 71 例 (12.3%) であった。主な副作用はめまい・ふらつき 13 例 (2.3%)、頭痛・頭重感 8 例 (1.4%)、不眠 6 例 (1.0%)、全身倦怠感 7 例 (1.2%)、悪心・嘔吐・嘔気 6 例 (1.0%)、喘息様発作・喘鳴 6 例 (1.0%) 等であったが重篤なものはなかった。

(本剤の承認された効能・効果は「狭心症、頻脈性不整脈、本態性高血圧症 (軽症～中等症)」である。)

#### 17.1.2 国内二重盲検比較試験

本態性高血圧症患者 421 例を対象とする二重盲検比較試験として、本剤の単独投与時にレセルピンおよびピンドロールを対照薬とした 2 試験、本剤とチアジド系利尿降圧剤の併用投与においてレセルピン、ピンドロールおよびプラセボを対照薬とした 3 試験を実施し (本剤 1 日 120～240mg を 8～12 週間投与)、本剤の有用性が認められ、チアジド系利尿降圧剤との併用により効果の増強が認められた<sup>9)、10)</sup>。

狭心症患者 157 例を対象にクロスオーバー法による二重盲検比較試験として、プロプラノロールを対照薬とした 1 試験、アルプレノロールを対照薬とした 2 試験を実施した。(本剤 1 日 60～120mg を 2～4 週間投与) その結果、本剤の有用性が認められた<sup>11)-13)</sup>。

比較試験において、本剤投与例 530 例 (単独比較 67 例を含む) 中 127 例 (24.0%) に副作用が認められた。主な副作用は徐脈 19 例 (3.6%)、胃腸障害 18 例 (3.4%)、全身倦怠感 18 例 (3.4%)、悪心・嘔吐 15 例 (2.8%)、めまい 14 例 (2.6%)、浮腫 13 例 (2.5%)、ふらつき 12 例 (2.3%) 等であったが重篤なものはなかった。

#### <頻脈性不整脈 (洞性頻脈、心房細動・粗動に伴う頻脈、発作性上室性頻拍、上室性期外収縮、心室性期外収縮)>

##### 17.1.3 国内一般臨床試験

各種不整脈を有する患者 145 例を対象に、本剤を 1 日 20～180mg を投与した結果、頻脈性不整脈に対する有効率は 68.0% (104/153) であり、頻脈群のうち、洞性頻脈での有効率は 74.4% (29/39)、心房細動・粗動に伴う頻脈及び発作性上室性頻拍では 63.6% (14/22)、上室性期外収縮では 75.7% (28/37)、心室性期外収縮では 60.0% (33/55) であった。副作用発現率は、7.6% (11/145) であり、うちわけは徐脈 6 例 (4.1%)、めまい・ふらつき 2 例 (1.4%)、立ちくらみ、悪心、眠気、倦怠感、腹部膨満感、胸部不快感各 1 例 (0.7%) であった<sup>14)-21)</sup>。

(本剤の承認された用法・用量は「通常成人にはメトプロロール酒石酸塩として 1 日 60～120mg を 1 日 2～3 回に分割経口投与する。なお、年齢・症状により適宜増減する。」である。)

##### 17.1.4 国内二重盲検比較試験

不整脈 (心室性期外収縮) 患者 43 例を対象に、プロプラノロールを対照薬として本剤 1 日 60～120mg を 3 週間反復投与

した二重盲検比較試験において、本剤投与時の期外収縮改善度及び有用性はプロプラノロールと同等であった。

副作用発現率は、9.8% (4/41) であり、その内訳は徐脈 2 例 (4.9%)、心窩部不快感、嘔声各 1 例 (2.4%) であった。

### 17.3 その他

17.3.1 本剤の降圧効果は、姿勢・体位による差はない<sup>22)</sup>。

17.3.2 血管拡張性降圧剤との併用により効果の増強が認められている<sup>23)</sup>。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

#### 18.1.1 降圧作用

本剤の降圧作用機序については、まだ十分に解明されていないが、従来の  $\beta$  遮断剤と同様、長期投与による心拍出量の減少に適応した末梢血管抵抗の減少、レニン分泌抑制、中枢神経抑制、交感神経末端のシナプス前  $\beta$  受容体遮断作用等が考えられている。

#### 18.1.2 抗狭心症作用

狭心症に対する  $\beta$  遮断剤の主な作用機序は、狭心痛発作の重要な誘因の一つであるカテコールアミンの  $\beta_1$  受容体を介する心臓興奮作用を抑制し、心筋収縮能の低下、心拍数・1 回拍出量の減少、血圧の低下などにより心仕事量を減じ、酸素需要を節減して酸素需給のバランスを改善するためと考えられている。

#### 18.1.3 抗不整脈作用

一般的に  $\beta$  遮断剤の抗不整脈作用機序は、 $\beta$  遮断作用そのものと膜安定化作用 (キニジン様作用) が単独または同時に作用するためとされている。本剤は膜安定化作用が弱く、その抗不整脈作用には  $\beta$  遮断作用が関与しているものと考えられている。

#### 18.2 $\beta$ 遮断作用一心行動態に対する作用

メトプロロール酒石酸塩は健康成人の運動負荷による心拍数の増加、収縮期血圧の上昇をプロプラノロールと同程度に抑制する。その最大効果は投与後 1~2 時間にみられ、6~8 時間後においても抑制効果が認められている<sup>24)-27)</sup>。一方、イソプロテレノール負荷による頻脈を抑制する作用はプロプラノロールより弱い<sup>25)</sup>。

健康成人に 1 回経口投与すると、安静時の心拍数、心拍出量は投与 1 時間後をピークとして有意に減少するが、血圧はほとんど変化を示さない<sup>28)</sup>。高血圧症患者に連続経口投与した場合には、心拍数、心拍出量の減少と共に血圧の有意な低下が認められている<sup>29)</sup>。なお、メトプロロール酒石酸塩には、内因性  $\beta$  受容体刺激作用は認められていない (ネコ)<sup>30)</sup>。

#### 18.3 $\beta_1$ 選択性

通常、臨床投与量のメトプロロール酒石酸塩は、気管支平滑筋、血管平滑筋等に分布する  $\beta_2$  受容体にはほとんど影響を与えないことが下記のごとく認められている。

18.3.1 1 回経口投与では、気管支喘息患者の安静時呼吸機能あるいはイソプロテレノール負荷時の気道反応性には、ほとんど影響を与えない<sup>31),32)</sup>。

また、軽症ないし中等症の気管支喘息患者にテルブタリン硫酸塩と連続併用投与した場合、喘息症状及び肺機能の悪化は認められていない<sup>33)-35)</sup>。

18.3.2 アドレナリン負荷時の前腕血流量の増加に対する影響は少ない<sup>36)</sup>。

#### 18.4 降圧効果

自然発症高血圧ラット (SHR)、副腎再生高血圧ラットにおいて、メトプロロール酒石酸塩の連続投与により明らかな抗高血圧作用が認められている。また、血漿レニン活性の有意な低下が認められている (健康成人<sup>28)</sup>、高血圧症例<sup>7)</sup>)。

#### 18.5 抗狭心症効果

労作性狭心症患者で、アドレナリン負荷により誘発された狭心痛あるいは心電図上の ST 低下を明らかに抑制する<sup>37)</sup>。

#### 18.6 抗不整脈効果

活動電位に対する作用 (ヒツジ) 及び膜安定化作用 (カエル、モルモット) は極めて弱いが、ウバイン誘発不整脈 (モルモット) 及びアドレナリン誘発不整脈 (モルモット) 等の実験的不整脈に対し明らかな抑制作用が認められている。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称: メトプロロール酒石酸塩 (Metoprolol Tartrate)

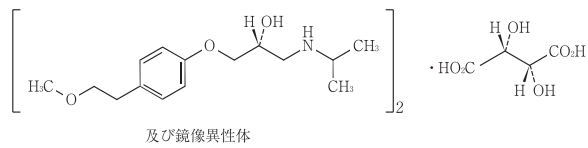
化学名: (2*RS*)-1-[4-(2-Methoxyethyl)phenoxy]-3-[(1-methylethyl)amino]propan-2-ol hemi-(2*R,3R*)-tartrate

分子式: (C<sub>15</sub>H<sub>25</sub>NO<sub>3</sub>)<sub>2</sub> · C<sub>4</sub>H<sub>6</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 684.81

性状: 白色の結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく、メタノール、エタノール (95) 又は酢酸 (100) に溶けやすい。

化学構造式:



分配係数: 0.98 (1-オクタノール/pH7.4 緩衝液, 37°C)  
旋光度  $[\alpha]^{20}_D$ : +7.0 ~ +10.0° (乾燥後、1.0g、水、50mL、100mm)

## 20. 取扱い上の注意

苛酷条件下 (高湿度) では錠剤が膨潤~軟化するおそれがあるので注意すること。

## 22. 包装

〈ロプレソール錠 20mg〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

〈ロプレソール錠 40mg〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

## 23. 主要文献

- 1) 岸本千晴ほか: 薬理と治療,1984;12 (10) :4451-4463
- 2) Regårdh, C.G. et al. : J. Pharmacokinet. Biopharm.,1974;2 (4) :347-364
- 3) Borg, K.O. et al. : Acta Pharmacol. Toxicol.,1975;36 (Suppl.V) :125-135
- 4) Kendall, M.J. et al. : Eur. J. Drug Metab. Pharmacokinet.,1977;2 (2) :73-80
- 5) Bertz, R.J. et al. : Clin. Pharmacokinet.,1977;32 (3) :210-258
- 6) 吉利 和ほか: 臨牀と研究,1979;56 (2) :574-583
- 7) 山下秀光ほか: 臨牀と研究,1980;57 (3) :907-914
- 8) 前田如矢ほか: 臨牀と研究,1978;55 (4) :1278-1288
- 9) 吉利 和ほか: 医学のあゆみ,1980;114 (11) :954-976
- 10) 木下康民ほか: 医学のあゆみ,1978;105 (11) :964-979
- 11) 花岡和一郎ほか: 臨床評価,1979;7:109-135
- 12) 高安正夫ほか: 内科宝函,1978;25 (2) :45-58
- 13) 前田如矢ほか: 医学のあゆみ,1978;104 (2) :142-153
- 14) 竹村喜弘ほか: 臨牀と研究,1982;59 (3) :1036-1038
- 15) 宮下英夫ほか: 薬理と治療,1981;9 (10) :4259-4268
- 16) 浦岡忠夫ほか: 薬理と治療,1981;9 (10) :4233-4237
- 17) 藤田 静ほか: 新薬と臨床,1981;30 (11) :1885-1893
- 18) 土肥和紘ほか: 薬理と治療,1981;9 (5) :1997-2010
- 19) 鍋木恒男ほか: 診療と新薬,1981;18 (11) :2423-2427
- 20) 小川宏一ほか: 薬理と治療,1981;9 (6) :2351-2357
- 21) 富山靖一ほか: 薬理と治療,1981;9 (8) :3273-3282
- 22) 海老原昭夫ほか: 薬理と治療,1978;6 (7) :2101-2108
- 23) 宮原光夫ほか: 薬理と治療,1979;7 (5) :1443-1462
- 24) 榎原 博ほか: 薬理と治療,1979;7 (5) :1334-1340
- 25) Johnsson, G. et al. : Acta Pharmacol. Toxicol.1975;36 (Suppl.V) :69-75
- 26) Johnsson, G. et al. : Acta Pharmacol. Toxicol.1975;36 (Suppl.V) :31-44
- 27) Regårdh, C.G. et al. : Acta Pharmacol. Toxicol.1975;36 (Suppl.V) :45-58
- 28) 松下 哲ほか: 心臓,1978;10 (7) :676-680
- 29) 築山久一郎ほか: 心臓,1977;9 (8) :698-707
- 30) Åblad, B. et al. : Life Sci.,1973;12/I (3) :107-119
- 31) 滝島 任ほか: 臨牀と研究,1977;54 (10) :3353-3360
- 32) Thiringer, G. et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol.,1976;10 (3/4) :163-170
- 33) 可部順三郎ほか: アレルギー,1981;30 (1) :33-76
- 34) 牧野莊平ほか: アレルギーの臨床,1981;1 (5) :57-64
- 35) 滝島 任ほか: 薬理と治療,1980;8 (7) :2451-2457

- 36) Johnsson, G. : Acta Pharmacol. Toxicol.,1975;36  
(Suppl.V) :59-68  
37) 宮原光夫ほか：臨床薬理,1978;9 (2) :191-203

**24. 文献請求先及び問い合わせ先**

サンファーマ株式会社 くすり相談センター  
〒141-0031 東京都品川区西五反田 8-9-5  
受付時間：9時～17時30分  
(土、日、祝日、その他当社の休業日を除く)  
TEL：0120-22-6880  
ホームページ：https://jp.sunpharma.com/

**26. 製造販売業者等**

**26.1 製造販売元**

 **サンファーマ株式会社**  
東京都港区芝公園1-7-6

(05)