

# 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2018（2019年更新版）に準拠して作成

筋緊張性疾患治療剤  
アフロクアロン錠  
**アロフト錠 20mg**  
*AROFUTO Tablets*

剤形	糖衣錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（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 日本薬局方 アフロクアロン 20mg 含有
一般名	和名：アフロクアロン 洋名：Afloqualone
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007年3月6日 （販売名変更に伴う再承認） 薬価基準収載年月日：2007年6月15日 （変更銘柄名での収載日） 販売開始年月日：1983年2月3日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL：0120-226-898 FAX：050-3535-8939 医療関係者向けホームページ： <a href="https://www.nipro.co.jp/">https://www.nipro.co.jp/</a>

本IFは2025年4月作成の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

### 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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

### 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b>	5. 臨床成績	9
1. 開発の経緯	1	
2. 製品の治療学的特性	1	
3. 製品の製剤学的特性	1	
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	
6. RMPの概要	2	
<b>II. 名称に関する項目</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	
1. 販売名	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	11
2. 一般名	2. 薬理作用	11
3. 構造式又は示性式	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	
4. 分子式及び分子量	1. 血中濃度の推移	12
5. 化学名（命名法）又は本質	2. 薬物速度論的パラメータ	12
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3. 母集団（ポピュレーション）解析	13
<b>III. 有効成分に関する項目</b>	4. 吸収	13
1. 物理化学的性質	5. 分布	13
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6. 代謝	14
3. 有効成分の確認試験法，定量法	7. 排泄	15
<b>IV. 製剤に関する項目</b>	8. トランスポーターに関する情報	15
1. 剤形	9. 透析等による除去率	15
2. 製剤の組成	10. 特定の背景を有する患者	15
3. 添付溶解液の組成及び容量	11. その他	15
4. 力価	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	
5. 混入する可能性のある夾雑物	1. 警告内容とその理由	16
6. 製剤の各種条件下における安定性	2. 禁忌内容とその理由	16
7. 調製法及び溶解後の安定性	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	16
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	16
9. 溶出性	5. 重要な基本的注意とその理由	16
10. 容器・包装	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	16
11. 別途提供される資材類	7. 相互作用	17
12. その他	8. 副作用	17
<b>V. 治療に関する項目</b>	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
1. 効能又は効果	10. 過量投与	18
2. 効能又は効果に関連する注意	11. 適用上の注意	18
3. 用法及び用量	12. その他の注意	18
4. 用法及び用量に関連する注意	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	
	1. 薬理試験	19
	2. 毒性試験	20
	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	
	1. 規制区分	22
	2. 有効期間	22

3. 包装状態での貯法	22	14. 保険給付上の注意	23
4. 取扱い上の注意	22		
5. 患者向け資材	22	<b>X I . 文献</b>	
6. 同一成分・同効薬	22	1. 引用文献	24
7. 国際誕生年月日	22	2. その他の参考文献	24
8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価 基準収載年月日, 販売開始年月日	22	<b>X II . 参考資料</b>	
9. 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	23	1. 主な外国での発売状況	25
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	23	2. 海外における臨床支援情報	25
11. 再審査期間	23	<b>X III . 備考</b>	
12. 投薬期間制限に関する情報	23	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行う にあたっての参考情報	26
13. 各種コード	23	2. その他の関連資料	26

---

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

田辺製薬株式会社（現 田辺ファーマ株式会社）では Quinazoline あるいは Quinazolinone 誘導体について研究を行い、ある種の 6-aminoquinazolinone 誘導体に強い筋弛緩作用のあることを見出した。更に研究を進めた結果、アフロクアロンが見出され、1983年2月に「アロフト」として販売を開始した。

その後、1987年5月に頸肩腕症候群、腰痛症における筋緊張状態の改善の効能追加が承認された。

1991年3月に「薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない」との再審査結果が得られ、「効能又は効果」並びに「用法及び用量」は承認事項のとおり変更はない旨通知された。

平成12年9月19日付医薬発第935号「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」に基づき、2007年3月「アロフト錠 20mg」として再承認され、同年6月に変更銘柄名にて薬価収載された。

2011年4月には田辺製薬販売株式会社（後のニプロ ES ファーマ株式会社（現 ニプロファーマ株式会社））が田辺三菱製薬株式会社（現 田辺ファーマ株式会社）より移管を受け販売を開始した。

2018年6月にニプロ ES ファーマ株式会社（現 ニプロファーマ株式会社）が田辺三菱製薬株式会社（現 田辺ファーマ株式会社）より製造販売承認を承継した。

2025年4月にニプロ株式会社がニプロ ES ファーマ株式会社（現 ニプロファーマ株式会社）より製造販売承認を承継した。

### 2. 製品の治療学的特性

(1) 動物実験において筋緊張異常亢進の改善作用が認められている。

1) マウスによる筋弛緩作用。

2) ネコによる脊髄反射電位抑制作用。

3) ラットの実験的固縮緩解作用。

(2) 脊髄切断ネコによる実験において、神経-筋接合部に対する作用は認められなかった。

(3) 内服後速やかに吸収され、効果を発揮する。

(4) 総症例 15,884 例中、副作用が報告されたのは 413 例（2.6%）で、主な副作用は発疹 0.40%、脱力感 0.33%、ふらつき・めまい 0.32%、眠気 0.29%であった。（再審査終了時）

### 3. 製品の製剤学的特性

糖衣錠である。

#### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として 作成されている資材	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

#### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

##### (1) 承認条件

該当しない

##### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

#### 6. RMPの概要

該当しない

---

## Ⅱ. 名称に関する項目

---

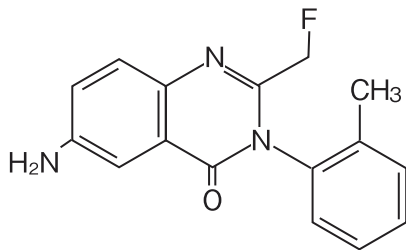
### 1. 販売名

- (1) 和 名 : アロフト錠 20mg
- (2) 洋 名 : AROFUTO Tablets
- (3) 名称の由来 : 成分の一般名による。

### 2. 一般名

- (1) 和 名(命名法) : アフロクアロン (JAN)
- (2) 洋 名(命名法) : Afloqualone (JAN)
- (3) ステム (stem) : 不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 :  $C_{16}H_{14}FN_3O$

分子量 : 283.30

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

6-Amino-2-fluoromethyl-3-(2-tolyl)-3H-quinazolin-4-one (JAN)

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

HQ-495

### 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～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

光によって徐々に着色する。

##### (2) 溶解性

アセトニトリルにやや溶けやすく、エタノール (99.5) にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点

融点: 約 197°C (分解)。

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa: 約 2.65

##### (6) 分配係数

緩衝液の pH	クロロホルム層の アフロクアロンの量 (%)	水層の アフロクアロンの量 (%)	分配係数
1.15	93.1	6.9	14
3.00	約 100.0	0	∞
5.00	約 100.0	0	∞
第 1 液 (pH1.2)	95.3	4.7	20.3
第 2 液 (pH7.5)	約 100.0	0	∞

##### (7) その他の主な示性値

吸光度:  $E_{1\text{cm}}^{1\%} (\lambda_{\text{max}} 231\text{nm}) \doteq 1160$

$E_{1\text{cm}}^{1\%} (\lambda_{\text{max}} 310\text{nm}) \doteq 546$

[溶媒: 無水エタノール]

旋光性を示さない。

## 2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験の種類	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	室温		ポリエチレン袋 +鉄製缶*1	4年 1ヵ月	変化なし
			褐色瓶*2	3年	変化なし
			無色瓶*2	3年	6ヵ月目以降外観の変色（微黄色→微褐色→淡褐色）が認められ、経時的に透過率が減少した。
苛酷試験*2	温度	40℃	褐色瓶	1年	変化なし
		60℃	褐色瓶	1年	変化なし
	湿度	25℃、 79%RH	褐色瓶	3年	変化なし
		40℃、 79%RH	褐色瓶	3年	変化なし
	光	太陽光	褐色瓶	6ヵ月	2ヵ月目以降外観の変色（微黄色→微褐色）が認められ、経時的に透過率が低下した。
			無色瓶	6ヵ月	10日目から外観の変色（微黄色→微褐色→褐色）が認められ、経時的に透過率が大きく低下した。

\*1. 試験項目：性状、確認試験、純度試験、乾燥減量、強熱残分、含量

\*2. 試験項目：性状、確認試験、純度試験、乾燥減量、強熱残分、紫外吸収スペクトル、赤外吸収スペクトル、薄層クロマトグラフィー、液体クロマトグラフィー、含量

## 3. 有効成分の確認試験法、定量法

### 確認試験法

日局「アフロクアロン」の確認試験法による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

### 定量法

日局「アフロクアロン」の定量法による。

電位差滴定法又は電流滴定法（0.1mol/L 亜硝酸ナトリウム液）




#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

糖衣錠

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	性状	外形・大きさ		
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
		識別コード		
アロフト錠 20mg	白色の糖衣錠			
		7.9	4.2	205
		TA007		

###### (3) 識別コード

上記表に記載

###### (4) 製剤の物性

硬度：約 6kg/cm<sup>2</sup> 以上

###### (5) その他

該当しない

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分	添加剤
アロフト錠 20mg	1錠中 日本薬局方 アフロクアロン 20mg	アラビアゴム、カルナウバロウ、サラシミツロウ、酸化チタン、ジメチルポリシロキサン、ステアリン酸マグネシウム、セルロース、タルク、炭酸カルシウム、トウモロコシデンプン、二酸化ケイ素、白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール

###### (2) 電解質等の濃度

該当資料なし

###### (3) 熱量

該当資料なし

##### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

#### 4. 力価

該当しない

#### 5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

#### 6. 製剤の各種条件下における安定性

試験の種類	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験*1	25℃、60%RH		PTP + ポリエチレン袋 + 紙箱	6 年	変化なし
	室温		ガラス瓶+紙箱	5 年 1 ヶ月	変化なし
苛酷試験*2	温度	40℃	PTP	1 年	外観の僅かな変色（白色→微淡褐色）が認められた。
			褐色瓶（密栓）	1 年	6 ヶ月目以降外観の変色（白色→微淡褐色→淡褐色）が認められた。
		室温、 75%RH	PTP	1 年	変化なし
			褐色瓶（開栓）	1 年	変化なし
	湿度	40℃、 75%RH	PTP	6 ヶ月	外観の僅かな変色（白色→微淡褐色）が認められた。
			褐色瓶（開栓）	6 ヶ月	外観の僅かな変色（白色→微淡褐色）が認められた。
	光	室内散光	PTP	1 年	変化なし
			褐色瓶（密栓）	1 年	変化なし
			透明瓶（密栓）	1 年	糖衣層と素錠との境界に僅かな変色（微淡褐色）が認められた。

\*1. 試験項目：性状、確認試験、純度試験、崩壊試験、含量

\*2. 試験項目：性状、確認試験、純度試験、硬度、乾燥減量、崩壊試験、紫外吸収スペクトル、液体クロマトグラフィー、含量

〈無包装状態での安定性〉

保存条件		保存形態	保存期間	結果
温度	40℃	遮光気密容器	6 ヶ月	変化なし
湿度	25℃、75%RH	(開放)	6 ヶ月	変化なし
光	白色蛍光灯 (1,000lx)	気密容器	120 万 lx・h	60 万 lx・h 時点で、外 観が灰白色 (規格外) に変色した。

試験項目：外観、硬度、崩壊試験、含量

#### 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

#### 8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当しない

#### 9. 溶出性

局外規「アフロクアロン錠」の溶出試験による。すなわち、試験液に水 900mL を用い、日局「溶出試験法のパドル法」により、毎分 50 回転で試験を行うとき、90 分間の溶出率が 80% 以上である。

#### 10. 容器・包装

##### (1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

##### (2) 包装

##### 22. 包装

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

##### (3) 予備容量

該当しない

##### (4) 容器の材質

PTP 包装：PTP (ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔)

#### 11. 別途提供される資材類

該当しない

#### 12. その他

該当しない

---

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 効能又は効果

#### 4. 効能・効果

- 下記疾患における筋緊張状態の改善

頸肩腕症候群、腰痛症

- 下記疾患による痙性麻痺

脳血管障害、脳性麻痺、痙性脊髄麻痺、脊髄血管障害、頸部脊椎症、後縦靭帯骨化症、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、脊髄小脳変性症、外傷後遺症（脊髄損傷、頭部外傷）、術後後遺症（脳・脊髄腫瘍を含む）、その他の脳脊髄疾患

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

#### 6. 用法・用量

アフロクアロンとして、通常成人1日量60mg（3錠）を3回に分けて経口投与する。年齢、症状により適宜増減する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

健康成人10名に対し本剤初回10mg、1週間後20mg又は40mgを各単回投与したが、一般症状、血圧、脈拍数及び臨床検査所見に影響は認められなかった<sup>1)</sup>。

また、5mg、20mgを1週間の間隔で単回投与<sup>2)</sup>及び1回20mgを1日3回7日間投与<sup>3)</sup>した結果も単回投与と同様の結果であった。

注) 本剤の承認された用法・用量は1日60mgを3回に分けて経口投与である。

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

〈頸肩腕症候群、腰痛症における筋緊張状態の改善〉

###### 17.1.1 国内臨床試験

全国 72 施設で、514 例について実施された 3 種の二重盲検比較試験を含む臨床試験の結果、頸肩腕症候群及び腰痛症における筋緊張状態の改善に対し有用性が認められている。

〈痙性麻痺〉

###### 17.1.2 国内臨床試験

全国 70 施設で、475 例について実施された 2 種の二重盲検比較試験を含む臨床試験の結果、脳血管障害、頸部脊椎症等の神経疾患に伴う痙性麻痺に対し、有用性が認められている。

##### 2) 安全性試験

該当資料なし

#### (5) 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（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

#### (7) その他

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

トルペリゾン塩酸塩、バクロフェン

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

脊髄から上位の中枢にかけての広範囲の部位に作用して、筋緊張亢進状態を緩解させる。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 筋弛緩作用

マウスに対する筋弛緩作用は、回転棒法、懸垂法及び傾斜板法により、トルペリゾン塩酸塩の約10倍の作用をもつことが認められている<sup>4)</sup>。

(マウス、経口投与)

薬物	方法	筋弛緩作用 ED <sub>50</sub> (mg/kg)		
		回転棒法	懸垂法	傾斜板法
アフロクアロン		22.4	20.7	19.3
トルペリゾン塩酸塩		200以上	200以上	200以上

##### 18.3 脊髄反射電位に対する作用

脊髄切断ネコに対し、5mg/kg以上の静脈内投与において、多シナプス、単シナプス反射電位を用量依存的に抑制する。特に多シナプス反射経路に対する抑制が強い<sup>5)</sup>。

##### 18.4 実験的固縮緩解作用

ラット除脳固縮 ( $\gamma$ -固縮) 及び虚血性除脳固縮 ( $\alpha$ -固縮) に対する緩解作用 ED<sub>50</sub> (経口投与) は、それぞれ 17.2 及び 25.7mg/kg である。特に  $\gamma$ -線維系に対する選択性が高い<sup>5)</sup>。

#### (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

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 16.1 血中濃度

健康成人男子にアフロクアロンを 20mg 経口投与したとき、血漿中濃度は約 1 時間後に最高に達する。血漿中濃度の半減期は、約 3.3 時間である<sup>3)</sup>。

##### 1) 単回経口投与

アロフト錠 20mg の 1 錠を健康成人男子 5 名に単回経口投与したときの血漿中濃度は、投与後 1.29 時間で 37.9ng/mL を示し、その後消失半減期 3.34 時間で血漿中より消失した<sup>3)</sup>。

$C_{max}$ (ng/mL)	37.9±9.7
$T_{max}$ (hr)	1.29±0.93
$T_{1/2}$ (hr)	3.34±1.37
$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)	245±80

(mean±SD, n=5)

##### 2) 反復投与時

アロフト錠 20mg の 1 錠を 1 日 1 回 15 日間、健康成人男子 5 名に反復経口投与した。投与 8 および 15 日目の投与後 1 および 24 時間における血漿中濃度は、投与 1 日目のそれらと有意な差は無く、反復投与による蓄積は認められなかった<sup>3)</sup>。

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし

#### (4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

ラットに<sup>3</sup>H-アフロクアロン 20mg/kg を経口投与したとき、消化管内残存量から算出した吸収率は投与後1時間で約90%であった（消化管からの消失半減期：17分）<sup>6)</sup>。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

通過する。

〈参考〉動物でのデータ

マウス、ラットに<sup>3</sup>H-アフロクアロン 20mg/kg を経口投与したときの脳内放射能濃度は、マウスでは血中のそれとほぼ同程度、ラットでは若干低かった<sup>6)</sup>。

(2) 血液－胎盤関門通過性

通過する。

〈参考〉動物でのデータ

マウス、ラットに<sup>3</sup>H-アフロクアロン 20mg/kg を経口投与したとき、投与後早期から胎盤を通過して胎児に移行し、その放射能濃度は母獣の骨格筋と同程度であった<sup>7)、8)</sup>。

(3) 乳汁への移行性

移行する。

〈参考〉動物でのデータ

授乳中のラットに<sup>3</sup>H-アフロクアロン 20mg/kg を経口投与後、直ちに乳仔に哺乳させたところ、投与後早期から乳汁を介して乳児に移行したが、その量は少なかった<sup>8)</sup>。

(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

〈参考〉動物でのデータ

マウスに<sup>3</sup>H-アフロクアロン 20mg/kg を経口投与したとき、組織内放射能濃度のピークは投与後 15～30 分にみられた。ピーク時の分布状態は、肝>腎>副腎>血漿>肺>心>脳～他の臓器の順であった。組織内濃度は血中濃度の推移にほぼ平行して推移した<sup>6)、7)</sup>。

(6) 血漿蛋白結合率<sup>6)</sup>

動物	蛋白結合率 (%)
ヒト	54
ラット	57
イヌ	55
家兎	85

ラット、イヌ、家兎：血漿  
ヒト：ヒト血清アルブミン  
方法：In vitro 平衡透析法

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位：肝臓

代謝経路：N-アセチル化に続く側鎖の水酸化と生成した水酸基のグルクロン酸あるいは硫酸抱合化である<sup>9)</sup>。

アロフト錠 20mg の 1 錠を健康成人男性 5 名に単回経口投与したとき、投与後 32 時間までに尿中に投与量の 19.9% が排泄された。主要な代謝物と投与量に対する割合は下記の通りであった<sup>9)</sup>。

アフロクアロンおよび代謝物	投与量に対する割合 (%)
アフロクアロン	3.5
アフロクアロン抱合体	8.0
N-アセチル体	0.3
N-アセチル-ヒドロキシメチル体	5.5
N-グルコイル体	0.9
N-グルコイル体の抱合体	0.4
N-グルコイル-ヒドロキシメチル体	1.3

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種, 寄与率

該当資料なし

(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活性比, 存在比率

アフロクアロンの主要代謝物に筋弛緩作用はほとんど認められず、中枢神経系、呼吸・循環器系及び消化器系にもほとんど影響を及ぼさなかった<sup>10)</sup>。

7. 排泄

排泄率

アロフト錠 20mg の 1 錠を健康成人男性 5 名に単回経口投与したとき、投与後 32 時間までに尿中に 19.9%が排泄された<sup>9)</sup>。

〈参考〉動物でのデータ

ラットに <sup>3</sup>H-アフロクアロン 20mg/kg を経口投与したとき、投与後 24 時間までに 55%が胆汁中に排泄され、その一部は再吸収される (腸肝循環)<sup>6)</sup>。

マウス、ラットに <sup>3</sup>H-アフロクアロン 20mg/kg を経口投与したとき、投与後 72 時間までにそれぞれ 53.1 および 49.5%が尿中に、38.9 および 44.6%が糞中に排泄され、72 時間までの総排泄率はそれぞれ約 92 および 94.1%であった<sup>6)</sup>。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### 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

〈解説〉

過敏症の既往歴のある患者に再投与した場合に、重篤な過敏症が発現するおそれがある。本剤では重篤な過敏症状の報告はないが、光線過敏症がこれに類似するものと考え、記載した。

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

反射運動能力の低下、眠気等が起こることがあるので、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注意すること。

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### (1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

#### (5) 妊婦

#### 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。

(6) 授乳婦

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、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

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。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に高齢者では生理機能が低下している。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

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、異常が認められる場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
精神神経系	ふらつき、めまい、眠気	頭痛
消化器	悪心、食欲不振、腹痛、胃部不快感	嘔吐、下痢、口渇、便秘、腹部膨満感、胃炎
皮膚		光線過敏症
過敏症	発疹、そう痒	
その他	脱力感、倦怠感	浮腫、耳鳴、頻尿、口内炎

注：使用成績調査を含む

## 副作用の概要

総症例 15,884 例中、副作用が報告されたのは 413 例（2.6%）で、主な副作用は発疹 0.4%、脱力感 0.33%、ふらつき・めまい 0.32%、眠気 0.29%であった。（再審査終了時）

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

## 10. 過量投与

設定されていない

## 11. 適用上の注意

### 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。

〈解説〉

平成 8 年 3 月 27 日付日薬連発第 240 号に基づき PTP 誤飲対策の一環として、「薬剤交付時」の注意を記載している。

## 12. その他の注意

### （1）臨床使用に基づく情報

設定されていない

### （2）非臨床試験に基づく情報

設定されていない

---

## Ⅹ. 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」の項参照。

#### (2) 安全性薬理試験

##### 1) 中枢神経系

マウスまたはラットにおいて 3.5~20mg/kg 以上の経口投与で正常体温下降、麻酔増強、自発運動量減少、抗痙攣、闘争反応抑制、条件回避反応抑制などの中枢抑制作用を示すが、これらの作用と筋弛緩作用を比較するとクロルメザノンやメフェネシンよりも筋弛緩作用に特異性が高い<sup>11)</sup>。

##### 2) 呼吸・循環器系

ネコにおいて 1~2mg/kg 以上の静脈内投与で呼吸抑制、心拍数減少、血圧下降、末梢動脈血流量軽度増大を示すが、心電図には影響を与えない。10mg/kg の静脈内投与でイヌの腎動脈血流量を一過性に上昇後下降させ、家兎の心運動を一過性に抑制する。いずれも経口または十二指腸内投与では顕著な作用を示さない<sup>12)</sup>。

##### 3) 消化器系

ラット、ネコまたはマウスにおいて 50mg/kg の経口投与で腸管輸送能、胃酸分泌を軽度抑制し、胃腸管運動、胆汁分泌、胃粘膜および幽門結紮潰瘍 (50mg/kg×2、皮下投与) に対して作用を示さない<sup>12)</sup>。

##### 4) 自律神経系

ネコにおいて 20mg/kg の静脈内投与で節前線維刺激による瞬膜収縮を軽度抑制し、アドレナリン収縮を抑制しない。50mg/kg の経口投与で、アドレナリン、ノルアドレナリン、ドパミンの昇圧、アセチルコリン、ヒスタミン、イソプレナリンの降圧作用に影響を与えない<sup>12)</sup>。

##### 5) 生殖・泌尿器系

ラットにおいて 1 $\mu$ g/mL 以上の濃度で発情期間、発情期、妊娠期の摘出子宮自動運動を抑制するが、50mg/kg の経口投与で生体位子宮自動運動に作用を示さない。ネコにおいて 20mg/kg の静脈内投与で膀胱内圧を低下する。ラットにおいて 50mg/kg の経口投与で尿量を増加するが、尿電解質には作用を示さない<sup>12)</sup>。

##### 6) その他

局所麻酔作用：モルモットにおいて 2% の高濃度で表面および浸潤麻酔作用を示さない<sup>12)</sup>。

#### (3) その他の薬理試験

##### 副次的薬理試験

##### 1) 消炎作用

ラットのカラゲニン浮腫に対し、10mg/kg 以上の経口投与において、用量依存的に消炎作用を示す<sup>12)</sup>。

## 2) 鎮痛作用

マウスを用いた酢酸ライジング法において、10mg/kg 以上の経口投与で用量依存的に鎮痛作用を示す<sup>11)</sup>。

## 2. 毒性試験

### (1) 単回投与毒性試験

ラット及びマウスを用いてアフロクアロンの急性毒性を経口、皮下及び腹腔内投与につき7日間観察で検討したところ、表に示す結果が得られた<sup>13)</sup>。

LD<sub>50</sub> (mg/kg)

動物種	投与法		経口	皮下	腹腔内
	性別				
マウス	雄		556	784	439
	雌		397	591	272
ラット	雄		249	1090	394
	雌		260	823	385

### (2) 反復投与毒性試験

1) ラットに3、12、50及び200mg/kg/日1ヵ月間経口投与において、3及び12mg/kg投与群においては、一般症状及び血液、尿、病理組織学的所見において、対照群と比較し有意な変化は認められなかった。

50mg/kg以上の投与群で、筋弛緩作用、正向反射消失作用、軽度の体重増加抑制及び摂水量の増加（休薬で消失）が、さらに200mg/kg投与群では死亡が認められた<sup>13)</sup>。

イヌに1、4、16及び50mg/kg/日1ヵ月間経口投与で、1及び4mg/kg投与群においては一般症状及び血液、尿、病理組織学的所見において、対照群と比較し有意な変化は認められなかった。16mg/kg以上の投与群で筋弛緩作用及び前立腺の萎縮（休薬で消失）が、さらに50mg/kg投与群では死亡が認められた<sup>13)</sup>。

2) ラットに3、8、20、50mg/kg/日6ヵ月間経口投与、イヌに1、3、10、20、30mg/kg/日6ヵ月間経口投与において、血液所見で対照群に比較して有意な変化は認められないが、ラット20mg/kg以上の投与量群で、摂水量の増加と尿量の増加が、また、イヌ20mg/kg以上で前立腺の萎縮が、さらに30mg/kgで死亡の発現が認められた<sup>13)</sup>。

### (3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

### (4) がん原性試験

該当資料なし

## (5) 生殖発生毒性試験

### 1) 妊娠前及び妊娠初期投与試験

ラットに 12.5、25、及び 50mg/kg を経口投与したところ、最高投与量群の 50mg/kg 群に軽度な胎仔致死作用が認められたが、生殖細胞の形成、妊娠の成立への影響、および次世代での催奇形性ならびに発育遅延などはみられなかった<sup>14)</sup>。

### 2) 器官形成期投与試験

ラットに 12.5、25、及び 50mg/kg を経口投与したところ、催奇形作用は示さず、出産児に対する影響は認められなかった<sup>15)</sup>。

ウサギに 12.5、25、及び 50mg/kg を経口投与したところ、胎仔致死作用、催奇形作用および胎仔発育抑制作用はないものと判断された<sup>16)</sup>。

### 3) 周産期及び授乳期投与試験

ラットに 12.5、25、及び 50mg/kg を経口投与した。そのうち 12.5mg/kg 投与群において、母体、分娩、哺育及び出産児の生後発育に対する影響は認められなかった<sup>17)</sup>。

## (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

## (7) その他の特殊毒性

### 1) 依存性

ラットに 15～70mg/kg を 1 日 2 回 28 日間漸増的に反復経口投与したところ、退薬症候の発現は認められず、身体依存性は認められなかった<sup>18)</sup>。

### 2) 抗原性

モルモットに 5mg/kg を皮下、筋肉内、足蹠、筋肉内及び皮下の順で投与し、全身性アナフィラキシー反応、PCA 反応及び Schultz-Dale 反応による抗原性試験を行ったところ何れも陰性であり、抗原性は認められなかった<sup>19)</sup>。

マウスに 1mg/body を 6 回腹腔内投与したところ、IgE 抗体の産生は認められなかった<sup>20)</sup>。

### 3) 遺伝毒性

細菌変異株を用いて修復試験及び復帰変異試験を試みたところ、DNA 損傷誘発能及び復帰変異誘発能は何れも認められなかった<sup>21)</sup>。

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：アロフト錠 20mg 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

有効成分：日本薬局方 アフロクアロン 該当しない

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間

4年6ヵ月

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

#### 20. 取扱い上の注意

外箱開封後は光を避けて保存すること。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド : なし

くすりのしおり : あり

その他の患者向け資材 : なし

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬 : なし

同 効 薬 : バクロフェン

### 7. 国際誕生年月日

1982年10月7日

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準収載年月日, 販売開始年月日

製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
アロフト錠 20mg	2007年3月6日 (販売名変更に伴う再承認)	21900AMX00231
アロフト (旧販売名)	1982年10月7日	(57AM) 第1125号

[注 1]2018 年 6 月にニプロ ES ファーマ株式会社が田辺三菱製薬株式会社より製造販売承認を承継

[注 2]2025 年 4 月にニプロ株式会社がニプロ ES ファーマ株式会社より製造販売承認を承継  
薬価基準収載年月日

アロフト錠 20mg : 2007 年 6 月 15 日

アロフト (旧販売名) : 1983 年 2 月 3 日

(2008 年 3 月 31 日経過措置期間終了)

販売開始年月日

1983 年 2 月 3 日

#### 9. 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

効能・効果追加承認年月日 : 1987 年 5 月 29 日

内容 : 「下記疾患における筋緊張状態の改善

頸肩腕症候群、腰痛症」を追加

#### 10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果公表年月日 : 1991 年 3 月 6 日

内容 : 薬事法第 14 条第 2 項各号 (承認拒否事由) のいずれにも該当しない。

#### 11. 再審査期間

1982 年 10 月 7 日～1988 年 10 月 6 日 (終了)

#### 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬 (あるいは投与) 期間に関する制限は定められていない。

#### 13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
アロフト錠 20mg	1249008F1215	1249008F1215	101914803	620004920

#### 14. 保険給付上の注意

該当しない

---

## X I . 文 献

---

### 1. 引用文献

- 1) 神戸成美 他:薬理と治療 1978;6 (6) :1902-1914
- 2) 井奥匡彦 :薬理と治療 1978;6 (6) :1897-1901
- 3) Miura, Y. et al. : 臨床薬理 1985 ; 16 (4) : 649-657 (L20240045)
- 4) Ochiai, T. et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1981 ; 31 : 491-501 (L20240046)
- 5) Ochiai, T. et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1982 ; 32 : 427-438 (L20240047)
- 6) 大塚峯三 他:応用薬理 1981;22:243-255
- 7) 大塚峯三 他:応用薬理 1981;22:257-263
- 8) 大塚峯三 他:応用薬理 1981;22:265-272
- 9) Furuuchi, S. et al.:Drug Metab. Dispos. 1983;11 (4) :371-376
- 10) 福地 勲 他:田辺製薬研究報告 1981:14-18
- 11) 落合 喬 他:日薬理誌 1981;78:347-357
- 12) 落合 喬 他:日薬理誌 1981;78:359-380
- 13) 武下政一 他:基礎と臨床 1983;17:991-999
- 14) Afloqualone (HQ-495) の生殖に及ぼす影響 ラットにおける妊娠前および妊娠初期経口投与試験 (社内資料)
- 15) Afloqualone (HQ-495) の生殖に及ぼす影響 ラットにおける胎仔の器官形成期経口投与試験 (社内資料)
- 16) Afloqualone (HQ-495) の生殖に及ぼす影響 ウサギにおける胎仔の器官形成期経口投与試験 (社内資料)
- 17) Afloqualone (HQ-495) の生殖に及ぼす影響 ラットにおける周産期および授乳期経口投与試験 (社内資料)
- 18) 落合喬 他:応用薬理 1981;21 (3) :417-426
- 19) Afloqualone の抗原性試験 (社内資料)
- 20) Afloqualone の抗原性試験 (第2報) (社内資料)
- 21) HQ-495 の細菌変異株を用いた系での突然変異試験 (社内資料)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

---

## X II. 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

---

#### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

##### (1) 粉碎

該当資料なし

##### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

#### 2. その他の関連資料

該当資料なし

**ニフ.オ**株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号