

貯法：室温保存
有効期間：3年

フルスルチアミン塩酸塩・ピリドキサルリン酸エステル

水和物・ヒドロキシコバラミン酢酸塩配合剤

ビタノイリン[®]カプセル25

ビタノイリン[®]カプセル50

VITANEURIN[®] CAPSULES

日本標準商品分類番号

873179

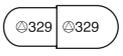
| | 承認番号 | 販売開始 |
|--------|---------------|---------|
| カプセル25 | 21300AMZ00623 | 1968年2月 |
| カプセル50 | 21300AMZ00624 | 1967年7月 |

3. 組成・性状

3.1 組成

| 販売名 | ビタノイリンカプセル25 | ビタノイリンカプセル50 |
|------|---|--|
| 有効成分 | 1カプセル中：ヒドロキシコバラミン酢酸塩 0.1305mg (ヒドロキシコバラミンとして0.125mg)、フルスルチアミン塩酸塩 27.285mg(フルスルチアミンとして25mg)、ピリドキサルリン酸エステル水和物 15mg、リボフラビン 2.5mg | 1カプセル中：ヒドロキシコバラミン酢酸塩 0.261mg (ヒドロキシコバラミンとして0.25mg)、フルスルチアミン塩酸塩 54.57mg(フルスルチアミンとして50mg)、ピリドキサルリン酸エステル水和物 30mg、リボフラビン 5mg |
| 添加剤 | トウモロコシデンプン、カルメロースカルシウム、結晶セルロース、ポリオキシエチレン(160)ポリオキシプロピレン(30)グリコール、セラセフェート、ヒマシ油、乳糖水和物(カプセル本体)ゼラチン、ラウリル硫酸ナトリウム | |

3.2 製剤の性状

| 販売名 | ビタノイリンカプセル25 | ビタノイリンカプセル50 |
|-------|--|--|
| 色・剤形 | 赤紫色、だいたい色、黄色及び白色の混合顆粒を充填した硬カプセル剤で、カプセルの頭部及び胴部は無色透明である。 | |
| 形状 |  3号カプセル 重量 210mg |  1号カプセル 重量 379mg |
| 識別コード | ⊕ 329 | ⊕ 330 |

4. 効能又は効果

- 本剤に含まれるビタミン類の需要が増大し、食事からの摂取が不十分な際の補給(消耗性疾患、妊産婦、授乳婦など)
- 下記疾患のうち、本剤に含まれるビタミン類の欠乏又は代謝障害が関与すると推定される場合
神経痛、筋肉痛、関節痛、末梢神経炎・末梢神経麻痺
効果がないのに月余にわたって漫然と使用すべきでない。

6. 用法及び用量

〈ビタノイリンカプセル25〉

通常成人1日1~4カプセルを経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈ビタノイリンカプセル50〉

通常成人1日1~2カプセルを経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

10. 相互作用

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 |
|------|--|---|
| レボドパ | ビタミンB ₆ がレボドパの作用を減弱することがある。 | 末梢でのレボドパの脱炭酸化が促進し、レボドパの中核への移行が減少することが考えられている。 |

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。

11.2 その他の副作用

| | 頻度不明 |
|-----|---------------------------------|
| 過敏症 | 発疹、そう痒感 |
| 消化器 | 悪心、嘔吐、食欲不振、胃痛、胃部不快感、腹部膨満感、口渇、下痢 |
| その他 | 不眠、頻尿 |

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

ビタミンB₂により、尿を黄変させ、臨床検査値に影響を与えることがある。

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。

17. 臨床成績

17.3 その他

17.3.1 国内臨床試験

「いわゆる神経痛」を対象に50カプセル剤及び対照薬としてフルスルチアミン50mgカプセル、2.5mg錠をそれぞれ1日2カプセル(錠)、2週間投与し痛みに対する効果を二重盲検比較対照試験により検討した試験において、50カプセル剤投与群が痛みの4症状(自発痛、放散痛、運動痛、圧痛)の合計改善度で、対照群に比しすぐれることが認められている¹⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

〈フルスルチアミン〉

18.1.1 ビタミンB₁は神経細胞の形態保持上重要であり²⁾、また、神経興奮伝導³⁾や神経細胞のエネルギー産生⁴⁾に関与している。フルスルチアミンは、ビタミンB₁に比べて消化管からの吸収がよく、高い血中⁵⁾・臓器内B₁濃度⁶⁾、長い体内貯留性、多量の結晶型B₁の生成⁷⁾等の特性を示し、生理学的・生化学的にビタミンB₁のmetabolic poolをみたしてビタミンB₁の欠乏又は代謝障害が関与する神経機能障害を改善する。試験的には、神経・筋に対して、神経細胞の増殖促進⁸⁾ (*in vitro*)、神経再生促進⁹⁾、¹⁰⁾ (ウサギ)、骨格筋活動電位の増加¹¹⁾ (ラット)等の作用が認められている。

〈ピリドキサルリン酸エステル〉

18.1.2 ビタミンB₆は神経細胞、神経線維の形態保持上重要であり、ビタミンB₆欠乏により末梢神経系ではスフィンゴリピド合成障害等によると考えられる軸索、髄鞘の変性・崩壊がみられる²⁾。ピリドキサルリン酸エステルは、ピリドキシンに比べて種々の特性を有する補酵素型ビタミンB₆¹²⁾で、ビタミンB₆の欠乏又は代謝障害が関与する末梢神経炎に用いられる。

〈ヒドロキシコバラミン〉

18.1.3 ビタミンB₁₂は神経細胞特に、核、Nissl物質、原線維の完全な保持に必須のビタミンで、ビタミンB₁₂は欠乏により中枢・末梢神経において神経細胞の萎縮・変性、髄鞘の膨脹を伴う神経線維の腫脹、ついで軸索の破壊、髄鞘の崩壊が起り神経症状を発症させる²⁾。

ヒドロキソコバラミンは、ビタミンB₁₂であるシアノコバラミンに比べ体内貯留性、持続性¹³⁾、補酵素型B₁₂への転換¹⁴⁾等で、よりすぐれた生物学的特性を示し、ビタミンB₁₂の欠乏又は代謝障害が関与すると推定される神経・筋疾患に用いられている。試験的には、神経線維の成長促進、glia細胞の増殖促進(*in vitro*)、神経の再生促進(ウサギ)等が報告されている¹⁵⁾。

18.2 フルスルチアミン、ピリドキサルリン酸エステル、ヒドロキソコバラミンの協同作用

神経細胞の増殖及び神経機能と密接な関連をもつ膜の構成成分であるリン脂質の合成促進⁸⁾ (*in vitro*)、神経の外科的損傷時の再生促進¹⁶⁾ (ウサギ)、アロキサン糖尿病の試験的神経炎における神経伝導速度の低下と神経線維の形態学的変化の正常化¹⁷⁾ (ラット)等において、フルスルチアミン、ピリドキサルリン酸エステル、ヒドロキソコバラミンの併用が、各単独投与よりもすぐれていることが示されている。

19. 有効成分に関する理化学的知見

〈フルスルチアミン塩酸塩〉

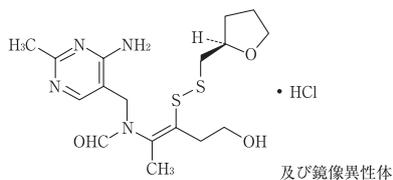
一般名：フルスルチアミン塩酸塩(Fursultiamine Hydrochloride)
 化学名：*N*-(4-Amino-2-methylpyrimidin-5-ylmethyl)-*N*'-(1*Z*)-4-hydroxy-1-methyl-2-[(2*RS*)-tetrahydrofuran-2-ylmethyl]disulfanylbuto-1-en-1-yl]formamide monohydrochloride

分子式：C₁₇H₂₆N₄O₃S₂・HCl

分子量：435.00

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはないか、又は僅かに特異なおいがあり、味は苦い。水、メタノール又はエタノール(95)に溶けやすい。結晶多形が認められる。

構造式：



〈ピリドキサルリン酸エステル水和物〉

一般名：ピリドキサルリン酸エステル水和物(Pyridoxal Phosphate Hydrate)

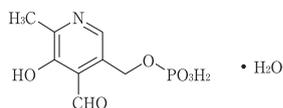
化学名：(4-Formyl-5-hydroxy-6-methylpyridin-3-yl)methyl dihydrogenphosphate monohydrate

分子式：C₈H₁₀NO₆P・H₂O

分子量：265.16

性状：微黄白色～淡黄色の結晶性の粉末である。水に溶けにくく、エタノール(99.5)にほとんど溶けない。希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。0.1gを水200mLに溶かした液のpHは3.0～3.5である。光によって淡紅色となる。

構造式：



〈ヒドロキソコバラミン酢酸塩〉

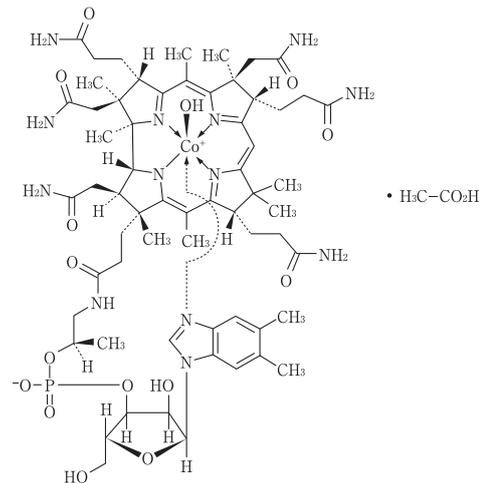
一般名：ヒドロキソコバラミン酢酸塩(Hydroxocobalamin Acetate)
 化学名：*Coa*-[α -(5,6-Dimethyl-1*H*-benzimidazol-1-yl)]-*Co* β -hydroxocobamide monoacetate

分子式：C₆₂H₈₉CoN₁₃O₁₅P・C₂H₄O₂

分子量：1406.41

性状：暗赤色の結晶又は粉末で、においはない。水又はメタノールに溶けやすく、エタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。吸湿性である。

構造式：



22. 包装

〈ビタノイリンカプセル25〉

100カプセル[10カプセル(PTP)×10]、
 500カプセル[アルミ袋、バラ]

〈ビタノイリンカプセル50〉

100カプセル[10カプセル(PTP)×10]、
 500カプセル[アルミ袋、バラ]

23. 主要文献

- 1) 阿部達夫 他：臨牀と研究. 1980；57：963-971
- 2) 陳 震東：実験治療. 1966；414：227-229
- 3) 糸川嘉則：ビタミン. 1975；49：415-427
- 4) Muralt A.：Ann N Y Acad Sci. 1962；98：499-507
- 5) 柴田長夫 他：Alinamin Symposium. 1961：5-11
- 6) Mitoma C.：Drug Metab Dispos. 1973；1：698-703
- 7) 阿部達夫：日本臨牀. 1962；20：1957-1966
- 8) 成実重彦 他：ビタミン. 1975；49：308
- 9) 中沢恒幸 他：アリナミン基礎文献集. 1966；3：117-120
- 10) 桐田良人：臨牀と研究. 1966；43：1889-1896
- 11) 中原正雄 他：新薬と臨牀. 1966；15：1297-1298
- 12) 山田弘三：現代内科学大系 代謝異常(Ⅲ). 中山書店：1966：273-309
- 13) Heinrich H.C. et al.：Klin Wochenschr. 1961；39：689-691
- 14) Yagiri Y.：J.Vitaminol. 1967；13：228-238
- 15) 中沢恒幸 他：ビタミン. 1966；34：576-586
- 16) 中沢恒幸：実験治療. 1966；414：230-232
- 17) 福田尚久 他：ビタミン. 1975；49：308-309

24. 文献請求先及び問い合わせ先

武田テバ薬品株式会社 武田テバDIセンター
 〒453-0801 名古屋市守山区太閤一丁目24番11号
 TEL 0120-923-093
 受付時間 9：00～17：30(土日祝日・弊社休業日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

武田テバ薬品株式会社
 大阪市中央区道修町四丁目1番1号

26.2 販売

武田薬品工業株式会社
 大阪市中央区道修町四丁目1番1号