

**2019年8月改訂(第14版, 薬生安通知に基づく禁忌の項の改訂)
*2018年10月改訂

日本標準商品分類番号
871124

貯法: 室温保存
使用期限: 外箱等に表示(使用期間5年)

抗不安剤

向精神薬, 処方箋医薬品^{注1)}

レスミット錠2

レスミット錠5

メダゼパム錠

Resmit[®]

	2	5
承認番号	14600AMZ01027	14600AMZ01026
薬価収載	1972年2月	1972年2月
販売開始	1971年9月	1971年9月
再評価結果	1989年3月	1989年3月

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】**









1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 急性閉塞隅角緑内障の患者 [抗コリン作用により眼圧が上昇し, 症状を悪化させることがある。]
3. 重症筋無力症の患者 [重症筋無力症の症状を悪化させるおそれがある。]

【組成・性状】

1. 組成

販売名	レスミット錠2	レスミット錠5
有効成分(1錠中)	メダゼパム 2mg	メダゼパム 5mg
添加物	乳糖水和物, トウモロコシデンプン, バレイショデンプン, ステアリン酸マグネシウム, タルク, 白糖, 沈降炭酸カルシウム, ゼラチン, アラビアゴム末, デンプングリコール酸ナトリウム, 安息香酸ナトリウム, カルナウバロウ	

2. 性状

販売名	レスミット錠2	レスミット錠5
性状・剤形	白色の糖衣錠である。	白色の糖衣錠である。
外形	表面  裏面  側面 	表面  裏面  側面 
大きさ	直径 約 6.1mm 厚さ 約 3.7mm	直径 約 6.1mm 厚さ 約 3.7mm
重量	約 0.12g	約 0.12g
識別コード	 083 2	 083 5

【効能・効果】

- 神経症における不安・緊張・抑うつ
- 心身症(消化器疾患, 循環器疾患, 内分泌系疾患, 自律神経失調症)における身体症候並びに不安・緊張・抑うつ

【用法・用量】

通常, 成人にはメダゼパムとして1日10~30mgを経口投与する。
ただし, 年齢, 症状により適宜増減する。

【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 [心障害が悪化するおそれがある。]
 - (2) 肝障害, 腎障害のある患者 [肝障害, 腎障害のある患者では一般に排泄が遅延する傾向があるので, 薬物の体内蓄積による副作用の発現に注意すること。]
 - (3) 脳に器質的障害のある患者 [作用が強くなる。]
 - (4) 高齢者 [「高齢者への投与」の項参照]
 - (5) 乳児, 小児 [「小児等への投与」の項参照]
 - (6) 衰弱者 [作用が強くなる。]
 - (7) 中等度又は重篤な呼吸不全のある患者 [呼吸不全を増悪するお

それがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1) 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, 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に注意すること。
- (2) 連用により薬物依存を生じることがあるので, 漫然とした継続投与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続する場合には, 治療上の必要性を十分に検討すること。[「重大な副作用」の項参照]

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
アルコール 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	中枢神経抑制作用が増強されることがあるので, 投与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。	共に中枢神経抑制作用を有する。
MAO阻害剤	中枢神経抑制作用が増強されることがあるので, 投与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。	本剤の代謝が抑制される。
シメチジン	本剤の作用が増強されるおそれがある。	本剤の代謝が抑制される。

4. 副作用

承認時における安全性評価対象例779例中, 副作用の発現件数は224件であり, 主なものは眠気79件, ふらつき・めまい34件等であった。
再評価結果における安全性評価対象例12563例中, 副作用の発現件数は1558件であり, 主なものは眠気761件, ふらつき・めまい312件等であった¹⁾。

(1) 重大な副作用

- 1) 依存性: 連用により薬物依存(0.1%未満)を生じることがあるので, 観察を十分に行い, 用量及び使用期間に注意し慎重に投与すること。また, 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(0.1%未満), 譫妄, 振戦, 不眠, 不安, 幻覚, 妄想等の離脱症状(0.1~5%未満)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(頻度不明): 刺激興奮, 錯乱等があらわれることがある。

(2) その他の副作用

種類/頻度	5%以上又は頻度不明	0.1~5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注1)}		発疹等	
精神神経系	眠気	ふらつき, 眩暈, 歩行失調, 頭重	気分昂揚感, 調節障害, 振戦, しびれ, 浅眠多夢, 言語障害
肝臓			黄疸, AI-P上昇
血液			貧血, 白血球減少

注1) 注意-医師等の処方箋により使用すること

種類\頻度	5%以上又は頻度不明	0.1~5%未満	0.1%未満
循環器			発汗, 熱感, のぼせ
消化器		食欲不振, 便秘, 下痢, 悪心・嘔吐, 胸やけ, 胃腸障害, 口渇	
骨格筋		筋弛緩, 易疲労感等の筋緊張低下症状	
その他		尿蛋白	浮腫, 性欲への影響, 生理異常

注1: 症状があらわれた場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では、運動失調等の副作用があらわれやすいので、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。

6. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与

(1) 妊婦 (3 ヶ月以内) 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回ると判断される場合のみ投与すること。[妊娠中に他のベンゾジアゼピン系薬剤の投与を受けた患者の中に、奇形を有する児等の障害児を出産した例が対照群と比較して有意に多いとの疫学的調査報告がある。]

(2) 妊娠後期の婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。[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。]

(3) 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。

(4) 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には授乳を避けさせること。[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) で報告されており, また黄疸を増強する可能性がある。]

7. 小児等への投与

低出生体重児, 新生児, 乳児, 幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8. 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。

9. 適用上の注意

薬剤交付時: 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, 更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。)

10. その他の注意

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. 血漿中濃度

健康成人男性 4 例にメダゼパム錠 10mg を軽食 2 時間後単回経口投与した²⁾。(外国人によるデータ)

(1) メダゼパムの薬物動態パラメータ

表 1 薬物動態パラメータ

投与量 (mg)	n	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)
10	4	0.14~0.26	0.5~1.5

(測定法: GLC)

(2) メダゼパムの代謝物の血漿中濃度

メダゼパムの主活性代謝物のジアゼパムは 0.5 時間後から検出され, 少なくとも 48 時間は低い濃度を維持した。同じく N-デスメチルジアゼパムは 0.5~9 時間後に出現し, 24~72 時間以上にわたってジアゼパムより血漿中濃度が高かった。

2. 代謝

N-脱メチル化により N-デスメチルメダゼパムを生じる経路と, 酸化によりジアゼパムを生成し更に N-脱メチル化され N-デスメチルジアゼパムを生成する経路がある³⁾。(外国人によるデータ)

3. 排泄

健康成人 2 例に ¹⁴C-標識メダゼパム 30mg を単回経口投与後, 尿中及び糞中排泄率を測定した。1 例は 18 日間の尿中及び糞中排泄率がそれぞれ 62.6%, 22.1%, 他例は 24 日間の測定値がそれぞれ 55.6%, 7.8%であった³⁾。(外国人によるデータ)

【臨床成績】

再評価結果における有効性評価対象例は 442 例であり, 有効率は 67.2% (297 例) であった⁴⁾。

表 2 臨床成績

疾患名		有効例数/有効性評価対象例数	有効率 (%)
神経症	不安神経症	66/85	77.6
	ヒステリー	8/11	72.7
	恐怖症	6/7	—
	神経衰弱	12/18	66.7
	心気症	22/42	52.4
	抑うつ神経症	27/47	57.4
	計	141/210	67.1
心身症	消化器疾患	120/181	66.3
	循環器疾患	23/34	67.6
	内分泌疾患	3/4	—
	自律神経失調症	10/13	76.9
	計	156/232	67.2

【薬効薬理】

薬理作用

表 3 クロルジアゼポキシド, ジアゼパムとの効力比⁵⁾

項目		動物	クロルジアゼポキシド	メダゼパム	ジアゼパム
条件反射抑制作用	弁別回避	ラット	1	>1	—
	非弁別回避 (1レバー型)	ラット	1	1	1
	非弁別回避 (2レバー型)		1	1	—
馴化作用		ラット	1	1	>1
自発運動抑制作用		マウス	1	0.7	3.6
懸垂試験		マウス	1	0.9	3.2
回転棒試験		マウス	1	0.7	1.9
強化麻酔作用		マウス	1	0.8	1.9
体温下降作用		マウス	1	1	>1
抗痙攣作用	抗最大電撃痙攣作用	マウス	1	0.5	3.0
	抗メトラゾール痙攣作用		1	2.3	5.3

(クロルジアゼポキシドの ED₅₀ 値で各薬剤の ED₅₀ 値を除いた値)

【有効成分に関する理化学的知見】

一般的名称：メダゼパム (JAN) [日局]

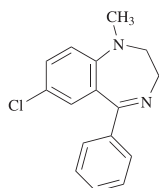
Medazepam

化学名：7-Chloro-1-methyl-5-phenyl-2,3-dihydro-1H-1,4-benzodiazepine

分子式：C₁₆H₁₅ClN₂

分子量：270.76

化学構造式：



性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノール、エタノール (99.5)、酢酸 (100) 又はジエチルエーテルに溶けやすく、水にほとんど溶けない。

光によって徐々に黄色に着色する。

融点：101～104 °C

分配係数：25704 [1-オクタノール/水]

【包装】

レスミット錠 2：PTP100 錠 (10 錠×10)

レスミット錠 5：PTP100 錠 (10 錠×10)


【主要文献】

- 1) 塩野義製薬集計；市丸精一ほか：医学のあゆみ，1970，73(2)，92 ほか
- 2) Hailey, D. M. et al. : Br. J. Anaesth., 1979, 51, 493
- 3) Rieder, J. et al. : Arzneim.-Forsch., 1968, 18(12), 1545
- 4) 塩野義製薬集計；西園昌久ほか：精神医学，1970，12(10)，59 を含む計 19 文献
- 5) 城戸良之助ほか：応用薬理，1970，4(2)，185

【文献請求先】*

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口

〒530-0005 大阪市北区中之島 3-2-4

 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

【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 107 号 (平成 18 年 3 月 6 日付) に基づき、投薬量は 1 回 30 日分を限度とされている。

発売元*

 **共和薬品工業株式会社**
大阪市北区中之島 3-2-4

製造販売元

塩野義製薬株式会社

〒541-0045 大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号

