

日本標準商品分類番号
872171

心・腎疾患治療剤

処方箋医薬品*

**ジラゼプ[®]塩酸塩錠50mg「サワイ」

**ジラゼプ[®]塩酸塩錠100mg「サワイ」

DILAZEP HYDROCHLORIDE

ジラゼプ塩酸塩錠

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

	錠50mg	錠100mg
**承認番号	22600AMX00731000	22600AMX00684000
薬価収載	2014年12月	2014年12月
販売開始	1987年10月	2008年11月
再評価結果	1999年6月	—
効能追加	2003年5月	—

※注意-医師等の処方箋により使用すること

【組成・性状】

・組成


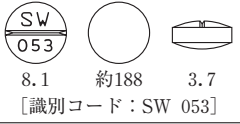
ジラゼプ塩酸塩錠50mg「サワイ」：1錠中に日局ジラゼプ塩酸塩水和物50mgを含有する。

添加物として、カルナウバロウ、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000を含有する。

ジラゼプ塩酸塩錠100mg「サワイ」：1錠中に日局ジラゼプ塩酸塩水和物100mgを含有する。

添加物として、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、デンプングリコール酸Na、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000を含有する。

・製剤の性状

品名	剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
ジラゼプ塩酸塩錠50mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 7.1 約124 3.8 [識別コード：SW 082]	白色
ジラゼプ塩酸塩錠100mg「サワイ」	割線入りフィルムコーティング錠	 8.1 約188 3.7 [識別コード：SW 053]	白色

【効能・効果】

・狭心症、その他の虚血性心疾患(心筋梗塞を除く)

・下記疾患における尿蛋白減少

腎機能障害軽度～中等度のIgA腎症

【用法・用量】

狭心症、その他の虚血性心疾患(心筋梗塞を除く)に用いる場合には1回ジラゼプ塩酸塩水和物として50mgを1日3回経口投与する。

腎疾患に用いる場合には1回ジラゼプ塩酸塩水和物として100mgを1日3回経口投与する。

年齢及び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)

重篤な肝機能障害のある患者(副作用として一過性のALT(GPT)上昇が報告されているため、肝機能障害を悪化させるおそれがある。)

2. 重要な基本的注意

腎疾患への適用にあたっては以下の点に留意すること。

1) 腎機能障害が軽度～中等度(クレアチニン・クリアランスとして50mL/min以上)のIgA腎症における尿蛋白減少の目的のみ使用すること。

2) 適切な病型診断(腎生検、あるいは血尿、尿蛋白、腎機能等多面的な検査に基づく臨床診断)のもとで使用を開始し、経過を見ながら投与開始後6ヵ月を目標として、尿蛋白・腎機能等を定期的に検査し以後の投薬継続の可否を検討する。病態の急速な進展がみられる場合には中止または他の療法を考慮するなど適切な処置をとること。尿蛋白減少が認められ、投薬継続が必要な場合は、以後定期的に尿蛋白・腎機能等を測定しながら投薬すること。

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

	頻度不明
精神神経系	頭痛、頭重感、めまい、ふらつき、不眠、いらいら感、眠気
循環器	動悸、頻脈、熱感、顔面潮紅感、胸部圧迫感、胸部異和感、起立性低血圧
消化器	悪心・嘔吐、便秘、腹痛、下痢、軟便、食欲不振、口渇
過敏症	発疹、痒痒感、紅斑
肝臓	一過性のALT(GPT)上昇
血液	白血球増多
感覚器	苦味感
その他	易疲労感、喉頭部息づまり感、発汗、手指の張る感じ、肩こり

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

6. 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。

7. 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、更には穿孔をお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)

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

○ジラゼプ塩酸塩錠50mg「サワイ」

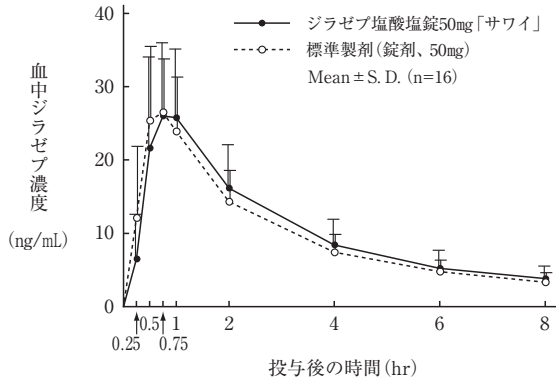
ジラゼプ塩酸塩錠50mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ジラゼプ塩酸塩水和物として50mg)空腹時単回経口投与(ク

ロスオーバー法)し、血中ジラゼブ濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (ng·hr/mL)
ジラゼブ塩酸塩錠 50mg「サワイ」	29.02±10.77	0.8±0.2	3.4±0.7	84.95±31.30
標準製剤 (錠剤、50mg)	29.15±8.02	0.7±0.2	3.5±0.7	80.09±22.65

(Mean±S.D.)



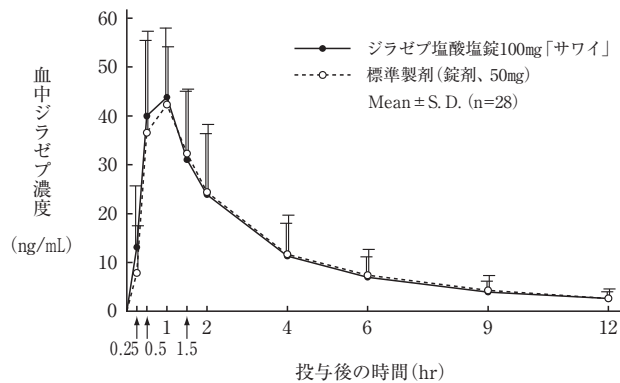
○ジラゼブ塩酸塩錠100mg「サワイ」

ジラゼブ塩酸塩錠100mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれジラゼブ塩酸塩水和物として100mg空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血中ジラゼブ濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾

各製剤投与時の薬物動態パラメータ

	製剤投与量 (ジラゼブ塩酸塩 水和物として)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-12hr} (ng·hr/mL)
ジラゼブ塩酸塩錠 100mg「サワイ」	1錠 (100mg)	46.96±13.38	0.8±0.2	4.0±0.4	141.52±65.93
標準製剤 (錠剤、50mg)	2錠 (100mg)	48.20±15.14	0.9±0.3	4.0±0.5	142.23±72.08

(Mean±S.D.)



血中濃度ならびにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

- 冠動脈及び腎動脈の血流量増加作用を示すと共に、側副血行路の形成を促す。³⁾
- 心臓の虚血部への血流増加と虚血部における酸素利用率の向上により、心筋保護作用を示す。これには虚血領域から遊離したアデノシンの作用の増強が重要とされている。³⁾

- 血小板凝集能・粘着能の異常亢進の抑制作用や、赤血球変形能と血液流動性の改善作用を有する。腎機能改善作用もある。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ジラゼブ塩酸塩水和物(Dilazep Hydrochloride Hydrate)

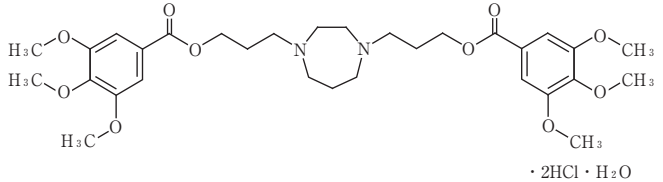
化学名：3,3'-(1,4-Diazepane-1,4-diyl)dipropyl bis(3,4,5-trimethoxybenzoate) dihydrochloride monohydrate

分子式：C₃₁H₄₄N₂O₁₀·2HCl·H₂O

分子量：695.63

融点：200~204℃

構造式：



性状：ジラゼブ塩酸塩水和物は白色の結晶性の粉末で、においはない。酢酸(100)又はクロロホルムに溶けやすく、水にやや溶けやすく、エタノール(95)又は無水酢酸に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

PTP包装したものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。^{4)、5)}

＊【包装】

ジラゼブ塩酸塩錠50mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

ジラゼブ塩酸塩錠100mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

- 1)、2) 沢井製薬(株)社内資料「生物学的同等性試験」
- 3) “第15改正日本薬局方 解説書,” 廣川書店, 東京, 2006, C-1832 ~C-1836.
- 4)、5) 沢井製薬(株)社内資料「安定性試験」

・文献請求先〔主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい〕

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K12 A141201