

心・腎疾患治療剤

** **ジラゼプ塩酸塩錠50mg「TCK」**
** **ジラゼプ塩酸塩錠100mg「TCK」**

《ジラゼプ塩酸塩錠》

DILAZEP HYDROCHLORIDE

処方せん医薬品：注意－医師等の処方せんにより使用すること
貯法：室温保存
使用期限：外装に表示

	錠 50mg	錠 100mg
** 承認番号	22400AMX00170000	22400AMX00171000
** 薬価収載	2012年6月	2012年6月
** 販売開始	1988年7月	2012年1月
** 再評価結果	1999年6月	
** 効能追加	2006年7月	







** 【組成・性状】

ジラゼプ塩酸塩錠 50mg 「TCK」 は 1 錠中にジラゼプ塩酸塩水和物を 50mg 含有する。

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

ジラゼプ塩酸塩錠 100mg 「TCK」 は 1 錠中にジラゼプ塩酸塩水和物を 100mg 含有する。

添加物として、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース Ca、ステアリン酸 Mg、タルク、酸化チタンを含有する。

販売名	外形			色調 剤形	識別コード
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)		
ジラゼプ塩酸塩錠 50mg 「TCK」	 7.6	 3.5	 150	白色～微黄白色 フィルムコーティング錠	Tu-CL 050
ジラゼプ塩酸塩錠 100mg 「TCK」	 8.1	 3.8	 200	白色フィルム コーティング錠	Tu-CL 100

【効能又は効果】

- 1) 狭心症、その他の虚血性心疾患（心筋梗塞を除く）
- 2) 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

【用法及び用量】

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にのみ使用すること。
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 ヶ月を目標として、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。）

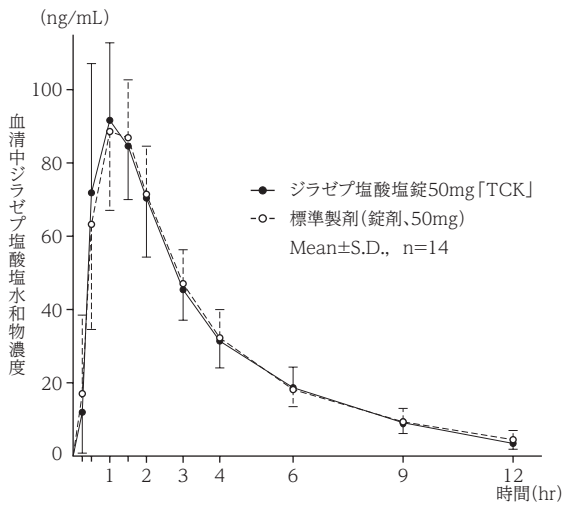
** 【薬物動態】

生物学的同源性試験

ジラゼプ塩酸塩錠 50mg 「TCK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ジラゼプ塩酸塩水和物 50mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 95% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、±20% の範囲内であり、両剤の生物学的同源性が確認された。〔1〕

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→12hr} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ジラゼプ塩酸塩錠 50mg 「TCK」	342.24±49.68	102.81±16.85	1.00±0.34	2.57±0.53
標準製剤 (錠剤、50mg)	344.82±50.88	97.80±15.98	1.14±0.31	2.87±0.76

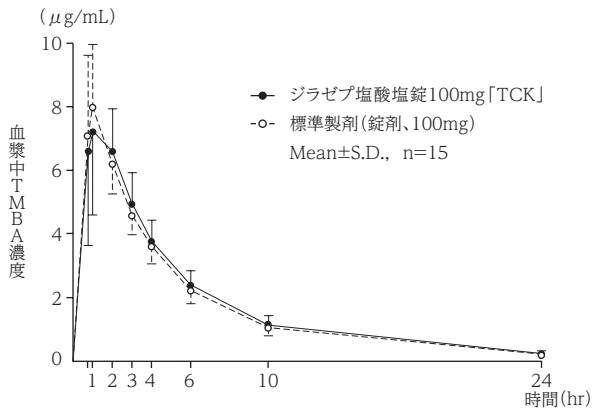
(Mean±S.D.,n=14)



ジラゼブ塩酸塩錠 100mg [TCK] と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (ジラゼブ塩酸塩水和物 100mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中 TMBA (3,4,5-トリメトキシ安息香酸) 濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 95% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、±20% の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ
	AUC _{0-24hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)
ジラゼブ塩酸塩錠 100mg [TCK]	43.43±7.75	8.40±1.20	1.20±0.51
標準製剤 (錠剤、100mg)	41.73±5.92	8.33±1.31	1.02±0.29

(Mean±S.D.,n=15)



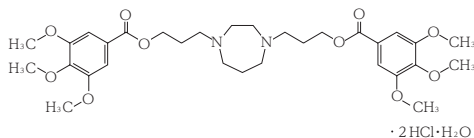
血清中及び血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

溶出挙動

ジラゼブ塩酸塩錠 50mg [TCK] 及びジラゼブ塩酸塩錠 100mg [TCK] は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。²⁾

【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：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

加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月) の結果、ジラゼブ塩酸塩錠 50mg [TCK] 及びジラゼブ塩酸塩錠 100mg [TCK] は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。³⁾

**【包装】

ジラゼブ塩酸塩錠 50mg [TCK] : 100 錠 (PTP)
 1,200 錠 (PTP・バラ)
 ジラゼブ塩酸塩錠 100mg [TCK] : 100 錠 (PTP)

【主要文献】

- 1) 辰巳化学株式会社：生物学的同等性試験
- 2) 辰巳化学株式会社：溶出試験
- 3) 辰巳化学株式会社：安定性試験

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。
 辰巳化学株式会社 薬事・学術課
 〒 921-8164 金沢市久安 3 丁目 406 番地
 TEL 076-247-2132
 FAX 076-247-5740



製造販売元
辰巳化学株式会社
 金沢市久安 3 丁目 406 番地