

心・腎疾患治療剤

処方せん医薬品<sup>※</sup>

ジラゼブ 塩酸塩錠 50mg「トーフ」

※ ジラゼブ 塩酸塩錠 100mg「トーフ」







《ジラゼブ塩酸塩錠》

DILAZEP HYDROCHLORIDE TABLETS 50mg “TOWA” / TABLETS 100mg “TOWA”

日本標準商品分類番号 872171						
	承認番号	薬価収載	販売開始	再評価結果	再評価(品質)	効能追加
錠50mg	21900AMX01525	2007年12月	1988年7月	1999年6月	2002年3月	2003年9月
錠100mg	22000AMX01717	2008年11月	2008年11月	—	—	—

貯 法：室温保存  
 使用期限：外箱、ラベルに記載

※【組成・性状】

		ジラゼブ塩酸塩錠 50mg 「トーフ」	ジラゼブ塩酸塩錠 100mg 「トーフ」
1錠中の有効成分		日局 ジラゼブ塩酸塩水和物 ……50mg	日局 ジラゼブ塩酸塩水和物 ……100mg
添加物		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、クロスカルメロースNa、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、タルク、酸化チタン	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、セルロース、デンプングリコール酸Na、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、タルク
性状		白色のフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠
識別コード	本体	Tw/PZ(表/裏)	Tw334
	包装	Tw, PZ	
外形	表		
	裏		
	側面		
錠径(mm)		7.1	8.1
厚さ(mm)		3.4	3.7
質量(mg)		145	188

【効能・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・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回ジラゼブ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回ジラゼブ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又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、そう痒感、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女性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。〕

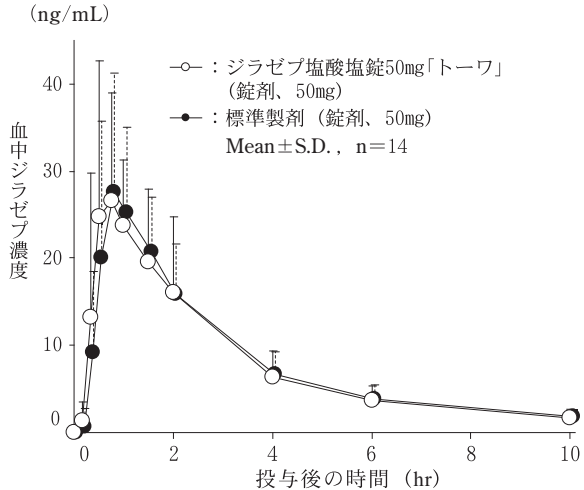
注) 注意－医師等の処方せんにより使用すること

※【薬物動態】

※ 1. 生物学的同等性試験

1) ジラゼブ塩酸塩錠50mg「トーワ」

ジラゼブ塩酸塩錠50mg「トーワ」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として50mg)健康成人男子(n=14)に絶食単回経口投与して血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(昭和55年5月30日薬審第718号に基づく)<sup>1)</sup>。



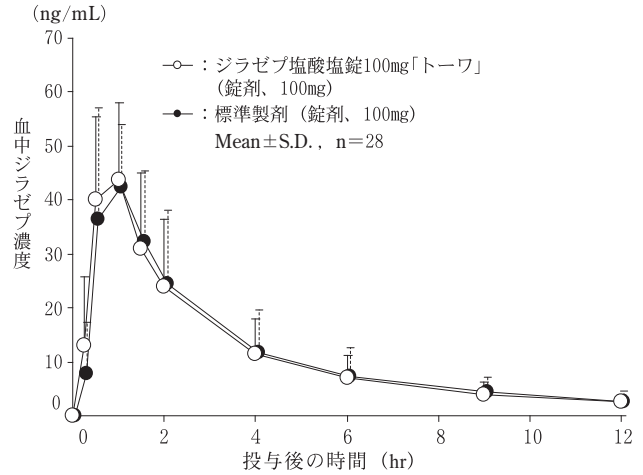
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>10</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ジラゼブ塩酸塩錠 50mg「トーワ」 (錠剤, 50mg)	80.0 ± 32.4	32.7 ± 14.2	0.82 ± 0.45	3.03 ± 0.77
標準製剤 (錠剤, 50mg)	81.4 ± 27.1	32.3 ± 13.5	0.88 ± 0.42	3.32 ± 0.64

(Mean ± S. D., n=14)

血中濃度並びに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。

2) ジラゼブ塩酸塩錠100mg「トーワ」

ジラゼブ塩酸塩錠100mg「トーワ」(1錠中ジラゼブ塩酸塩水和物として100mg含有)と標準製剤(1錠中ジラゼブ塩酸塩水和物として50mg含有)を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠及び2錠(共にジラゼブ塩酸塩水和物として100mg)健康成人男子(n=28)に絶食単回経口投与して血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(昭和55年5月30日薬審第718号に基づく)<sup>2)</sup>。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>12</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ジラゼブ塩酸塩錠 100mg「トーワ」 (錠剤, 100mg)	141.52 ± 65.93	46.96 ± 13.38	0.80 ± 0.25	4.04 ± 0.42
標準製剤 (錠剤, 100mg)	142.23 ± 72.08	48.20 ± 15.14	0.89 ± 0.34	4.02 ± 0.52

(Mean ± S. D., n=28)

血中濃度並びに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。

※ 2. 溶出挙動

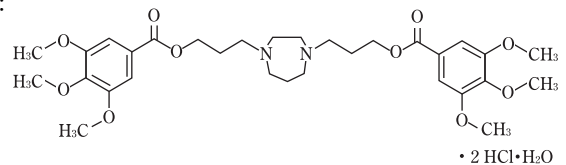
ジラゼブ塩酸塩錠50mg「トーワ」及びジラゼブ塩酸塩錠100mg「トーワ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩酸ジラゼブ錠の溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている<sup>3)4)</sup>。

※【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。心の虚血部への血流増加と虚血部における酸素利用効率の向上により、心筋保護作用を示す。作用機序としては、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考えられている。また、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。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式:



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

別名: 塩酸ジラゼブ

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

分子式: C<sub>31</sub>H<sub>44</sub>N<sub>2</sub>O<sub>10</sub> · 2HCl · H<sub>2</sub>O

分子量: 695.63

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。

融点: 200~204°C

※【取扱い上の注意】

※安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、ジラゼブ塩酸塩錠50mg「トーワ」及びジラゼブ塩酸塩錠100mg「トーワ」は通常の市場流通下においてそれぞれ3年間安定であることが推測された<sup>5)6)</sup>。

※【包装】

ジラゼブ塩酸塩錠50mg「トーワ」：100錠、1000錠（PTP）

1000錠（バラ）

※ジラゼブ塩酸塩錠100mg「トーワ」：100錠（PTP）

※【主要文献】

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験（錠50mg）
- ※2) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験（錠100mg）
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験（錠50mg）
- ※4) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験（錠100mg）
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験（錠50mg）
- ※6) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験（錠100mg）

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献（社内資料を含む）は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター（24時間受付対応）

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



製造販売元  
**東和薬品株式会社**  
大阪府門真市新橋町2番11号