

貯法：室温保存
使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること
規制区分：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）

	50mg	100mg
承認番号	22500AMX00626000	22500AMX00627000
薬価収載	2013年6月	2013年6月
販売開始	2013年6月	2013年6月

心・腎疾患治療剤

ジラゼプ塩酸塩錠50mg 「日医工」

ジラゼプ塩酸塩錠100mg 「日医工」

Dilazep Hydrochloride

ジラゼプ塩酸塩水和物錠

【組成・性状】

1. 組成

ジラゼプ塩酸塩錠50mg 「日医工」

1錠中ジラゼプ塩酸塩水和物50mgを含有する。

添加物として乳糖，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ナトリウム，ヒドロキシプロピルセルロース，ステアリン酸マグネシウム，ヒプロメロース，マクロゴール，酸化チタン，タルク，カルナウバロウを含有する。

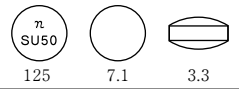
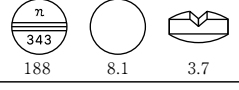
ジラゼプ塩酸塩錠100mg 「日医工」

1錠中ジラゼプ塩酸塩水和物100mgを含有する。

添加物として乳糖，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ナトリウム，ヒドロキシプロピルセルロース，ステアリン酸マグネシウム，ヒプロメロース，マクロゴール，酸化チタン，タルクを含有する。

2. 製剤の性状

ジラゼプ塩酸塩錠50mg 「日医工」及びジラゼプ塩酸塩錠100mg 「日医工」は白色のフィルムコーティング錠である。

販売名	形状 重量(mg) 直径(mm) 厚さ(mm)	本体 コード	包装 コード
ジラゼプ塩酸塩錠 50mg 「日医工」	 125 7.1 3.3	n SU50	㉞ 342
ジラゼプ塩酸塩錠 100mg 「日医工」	 188 8.1 3.7	n 343	㉞ 343

【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，掻痒感，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。）

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

ジラゼプ塩酸塩錠50mg 「日医工」及び標準製剤を，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として50mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血中ジラゼプ濃度を測定し，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。¹⁾

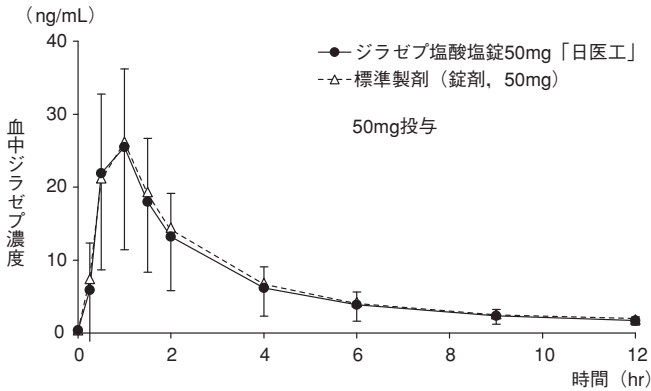
また，ジラゼプ塩酸塩錠100mg 「日医工」及び標準製剤を，クロスオーバー法によりそれぞれジラゼプ塩酸塩水和物とし

て100mgを投与した場合においても、同様に両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

<ジラゼブ塩酸塩錠50mg「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ジラゼブ塩酸塩錠 50mg「日医工」	75.05±32.81	27.10± 11.29	0.82± 0.28	4.19± 0.98
標準製剤 (錠剤, 50mg)	81.04±46.69	28.77± 15.25	0.78± 0.30	3.94± 0.58

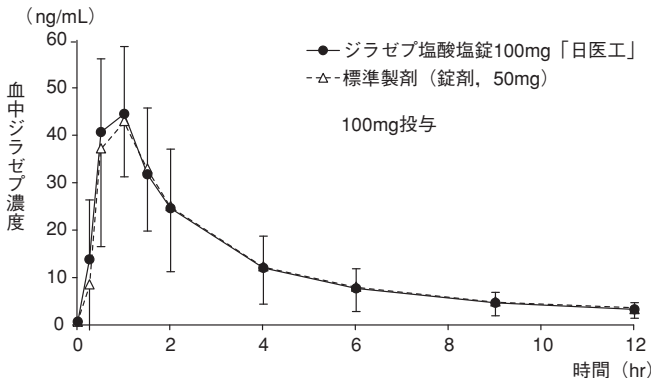
(Mean±S.D., n=28)



<ジラゼブ塩酸塩錠100mg「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ジラゼブ塩酸塩錠 100mg「日医工」	141.52±65.93	46.96± 13.38	0.80± 0.25	4.04± 0.42
標準製剤 (錠剤, 50mg)	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, 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

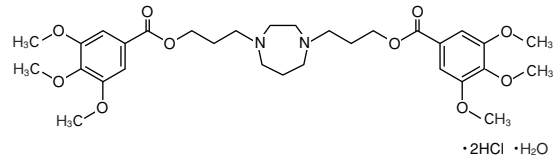
ジラゼブ塩酸塩錠50mg「日医工」及びジラゼブ塩酸塩錠100mg「日医工」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩酸ジラゼブ錠(50mg錠, 100mg錠)の溶出規格に適合していることが確認されている。²⁾

【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

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。

本品1.0gを水100mLに溶かした液のpHは3.0~4.0である。

融点：200~204℃

【取扱い上の注意】

安定性試験

本品につき加速試験(40℃, 相対湿度75%, 6ヵ月)を行った結果、ジラゼブ塩酸塩錠50mg「日医工」及びジラゼブ塩酸塩錠100mg「日医工」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「日医工」

100錠(10錠×10; PTP)

1000錠(10錠×100; PTP)

ジラゼブ塩酸塩錠100mg「日医工」

100錠(10錠×10; PTP)

1000錠(10錠×100; PTP)

【主要文献】

- 1) 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948