

**医薬品インタビューフォーム**  
**日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成**

経口血糖降下剤

**デアメリン<sup>®</sup>S錠250mg**

**DEAMELIN<sup>®</sup>・S Tablets 250mg**

(グリクロピラミド錠)

剤 形	裸錠
製剤の規制区分	劇薬 処方箋医薬品：注意—医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1錠中 グリクロピラミド 250 mg 含有
一般名	和名：グリクロピラミド 洋名：Glycicypramide
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2007年9月28日 薬価基準収載年月日：2007年12月21日  旧名称「デアメリンS錠」 製造販売承認年月日：1965年8月19日 薬価基準収載年月日：1965年12月1日 発売年月日：1965年11月15日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売（輸入）元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	杏林製薬株式会社 くすり情報センター TEL 0120-409341 受付時間：9:00～17:30（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.kyorin-pharm.co.jp/medicalworker/">http://www.kyorin-pharm.co.jp/medicalworker/</a>

本IFは2013年5月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認下さい。

## I F 利用の手引きの概要－日本病院薬剤師会－

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I F と略す）の位置付け並びに I F 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受け、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F を紙媒体の冊子として提供する方式から、P D F 等の電磁的データとして提供すること（e – I F）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e – I F が提供されることとなった。

最新版の e – I F は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e – I F を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e – I F の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された I F は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

#### 【 I F の様式】

- ①規格は A 4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② I F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に統けて日病薬作成の「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

### 【IFの作成】

- ① IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」（以下、「IF記載要領2013」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

### 【IFの発行】

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

## 3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」に掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。

また、隨時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」で確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取扱いには十分留意すべきである。

## 4. 利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならぬ。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（2013年4月改訂・一部改変）

# 目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名(命名法)	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	4
1. 効能	4
2. 製剤の組成	4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4
4. 製剤の各種条件下における安定性	5
5. 調製法及び溶解後の安定性	5
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	5
7. 溶出性	5
8. 生物学的試験法	5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	5
10. 製剤中の有効成分の定量法	5
11. 力価	5
12. 混入する可能性のある夾雑物	6
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6
14. その他	6
V. 治療に関する項目	7
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
VI. 薬効薬理に関する項目	8
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	8
2. 薬理作用	8
VII. 薬物動態に関する項目	9
1. 血中濃度の推移・測定法	9
2. 薬物速度論的パラメータ	9
3. 吸収	10
4. 分布	10
5. 代謝	10
6. 排泄	11
7. トランスポーターに関する情報	11
8. 透析等による除去率	11

<b>VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	12
1. 警告内容とその理由	12
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	12
3. 効能又は効果に関する使用上の注意とその理由	12
4. 用法及び用量に関する使用上の注意とその理由	12
5. 慎重投与内容とその理由	12
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	13
7. 相互作用	13
8. 副作用	15
9. 高齢者への投与	16
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
11. 小児等への投与	16
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
13. 過量投与	16
14. 適用上の注意	16
15. その他の注意	16
16. その他	16
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	17
1. 薬理試験	17
2. 毒性試験	17
<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	18
1. 規制区分	18
2. 有効期間又は使用期限	18
3. 貯法・保存条件	18
4. 薬剤取扱い上の注意点	18
5. 承認条件等	18
6. 包装	18
7. 容器の材質	18
8. 同一成分・同効薬	18
9. 国際誕生年月日	18
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
11. 薬価基準収載年月日	19
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	19
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
14. 再審査期間	19
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
16. 各種コード	19
17. 保険給付上の注意	19
<b>XI. 文献</b>	20
1. 引用文献	20
2. その他の参考文献	20
<b>XII. 参考資料</b>	21
1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21
<b>XIII. 備考</b>	22
その他の関連資料	22

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、スルホニルウレア系のグリクロピラミドを主成分とする経口血糖降下剤である。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

デアメリン S 錠 250mg

#### (2) 洋名

DEAMELIN S Tablets 250mg

#### (3) 名称の由来

Diabetes mellitus から DEAMELIN, 更に「デアメリンS」とした。

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

グリクロピラミド (JAN)

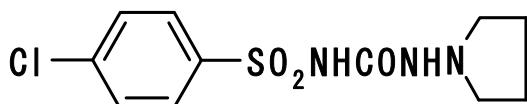
#### (2) 洋名 (命名法)

Glycicylpyramide (JAN, r-INN)

#### (3) ステム

gli (previously gly-) : antihyperglycaemics

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 : C<sub>11</sub>H<sub>14</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>S

分子量 : 303.77

### 5. 化学名 (命名法)

*N*-(*p*-Chlorobenzenesulfonyl) -*N'* -pyrrolidinourea

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

### 7. CAS 登録番号

63-27-6

### III. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末で、においはない。

##### (2) 溶解性

本品はジメチルホルムアミドにやや溶けやすく、アセトン又はクロロホルムに溶けにくく、水、エタノール(95)又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品は水酸化ナトリウム試液又はアンモニア試液に溶ける。

##### (3) 吸湿性

吸湿性はない

##### (4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：195～200°C

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

有機溶媒相	水相	分配係数
クロロホルム	pH6.9 Britton-Robinson 緩衝液	3.99 (25°C)

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

無色ビン入り自然経時

	Start	1年	2年	3年
外観	白色	白色	白色	白色
融点	198.8°C	198.1°C	198.8°C	199.0°C
含量	99.4%	99.9%	99.3%	99.6%

無色ビンに入れ、40°Cに加温、3箇月間保存では、外観、融点、含量に変化なく、TLCでも分解物は認められなかった。

#### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方外医薬品規格 グリクロピラミド 確認試験法による。

#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方外医薬品規格 グリクロピラミド 定量法による。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 効能

#### (1) 効能の区別、外観及び性状

成分・含量(1錠中)	グリクロピラミド 250mg		
効能形	裸錠		
色調	白色		
外形	長径 13.0mm	短径 5.5mm	厚さ 4.2mm
	KP 105 質量 約 325mg		
識別コード	KP-105		

#### (2) 製剤の物性

硬度：約 10kg/cm<sup>2</sup> (三力製作所製、錠剤硬度計で測定)

崩壊度：約 15 分 (日局法、試験液水)

#### (3) 識別コード

KP-105

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

1錠中にグリクロピラミドを 250 mg 含有する。

#### (2) 添加物

結晶セルロース、乳糖水和物、カルメロースカルシウム、バレイショデンプン、ステアリン酸マグネシウム

#### (3) その他

該当しない

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C(±2°C)、60%RH(±5%RH)	PTP 包装、紙箱入り	60 箇月	変化なし
加速試験	40°C(±1°C)、75%RH(±5%RH)	PTP 包装、紙箱入り	6 箇月	変化なし

##### [参考]

40°C・80%RHの加温加湿でPTP包装、開栓ビン入包装の外観が3箇月で黄色になったが、含量は正常値であった。5,000~7,000ルクスの蛍光灯下で3箇月間（8時間照射を1日とする）照射した場合、PTP包装、開放シャーレ中のものも何ら変化がなく、安定な製剤といえる。

#### 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

#### 6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

#### 7. 溶出性

日本薬局方外医薬品規格 グリクロピラミド錠 溶出試験法による。

#### 8. 生物学的試験法

該当しない

#### 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

(1) 本品を粉末とし、1.3gにクロロホルム10mLを加え、振り混ぜた後ろ過し、残留物にアンモニア試液10mL及び水10mLを加えかき混ぜた後ろ過する。  
ろ液に酢酸8mLを加え、30分間放置し、生じた結晶をろ取し、アセトニトリルで再結し、105°C、4時間乾燥し、融点を測定する。  
その融点は195~200°Cである。（グリクロピラミド）

(2) (1)で得た結晶につき、III-4「有効成分の確認試験法」を行う時、適合する。

#### 10. 製剤中の有効成分の定量法

錠剤を粉末とし、0.13gを希水酸化ナトリウム試液20mLに溶かし、水を加えて100mLとし、ろ過する。  
ろ液1mLを量り、水を加えて100mLとし、試料溶液とする。  
別にグリクロピラミド標準品0.1gを量り、試料溶液と同様に処理して標準溶液とする。  
試料溶液と標準溶液につき、水を対照として波長229nmにおける吸光度を求め、含量を計算する。

#### 11. 効価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雜物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

インスリン非依存型糖尿病  
(ただし、食事療法・運動療法のみで十分な効果が得られない場合に限る。)

### 2. 用法及び用量

通常、1日量グリクロピラミドとして125～250mgを経口投与し、必要に応じ適宜增量して維持量を決定する。ただし、1日最高投与量は500mgとする。  
投与方法は、1回投与の場合は朝食前又は後、2回投与の場合は朝夕それぞれ食前又は後に経口投与する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床効果

グリクロピラミドの一般臨床試験の報告は、55報、総計1,027例でこのうち成人型糖尿病は1,005例であった。

1,005例中効果判定された839例の有効率は85.0% (713/839) であった（医薬品再評価申請資料より集計）。

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6) 治療の使用

##### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

##### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

同一成分薬：なし

同 効 薬：トルブタミド、アセトヘキサミド、グリクラジド、グリベンクラミド、クロルプロパミド 等

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

スルホニルウレア系薬剤は、膵臓の $\beta$ 細胞からのインスリン分泌を促進する膵作用と、肝、骨格筋、脂肪細胞等でインスリン効果を増強する膵外作用が認められてはいるが<sup>1~2)</sup>、その作用のほとんどは膵作用によるものと考えられており<sup>3)</sup>本剤も同様と考えられる。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

家兎にグリクロピラミド 150mg/kg を経口投与した結果、薬物血中濃度と血糖低下のピークは一致し、共に 1 時間後にあらわれた。また、ラットにグリクロピラミド投与 1 時間後の dose response (12.5~100mg/kg) には直線性が認められ、血糖低下作用はトルブタミドの 2.66 倍であった<sup>4~5)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

#### [参考]

ビーグル犬（♂）に本剤 1錠を経口投与した結果、血中濃度は 3.3 時間後に  $70.7 \mu\text{g/mL}$  のピークを示し、生物学的半減期は 4.0 時間であった<sup>6)</sup>。

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

##### 1) 食事の影響

該当資料なし

##### 2) 併用薬の影響

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目、7. 相互作用の項を参照のこと。

#### (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当しない

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

#### (4) 消失速度定数

該当資料なし

#### (5) クリアランス

該当資料なし

#### (6) 分布容積

該当資料なし

#### (7) 血漿蛋白結合率

ヒト血清蛋白結合率は Glyclopypyramide 濃度 5 及び  $25 \mu\text{g/mL}$  のとき、それぞれ 94.1 及び 95.0% であった<sup>7)</sup>。

### 3. 吸収

該当資料なし

### 4. 分布

#### (1) 血液一脳関門通過性

該当資料なし

#### (2) 血液一胎盤関門通過性

該当資料なし

#### (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

#### (4) 髄液への移行性

該当資料なし

#### (5) その他の組織への移行性

該当資料なし

### 5. 代謝

#### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

[参考]

ラットにグリクロピラミド (11mg/body) を経口投与した結果、その尿からは未変化体と Sulfonamide が同定され、胆汁からはその他に acetylsulfonamide が同定された<sup>8)</sup>。

#### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

該当資料なし

#### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

#### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

#### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

[参考]

ラットのグリクロピラミド経口投与 24 時間尿には、未変化体及び代謝物が投与量の約 76%，胆汁中に約 4%，計 80% 排泄された。24 時間以降の排泄は少なく、約 5% 程度であり、主要排泄形は未変化体であった。なお、未変化体と Sulfonamide の排泄率は尿では 27 : 1、胆汁では 2.5 : 1 であった<sup>8)</sup>。

### (2) 排泄率

該当資料なし

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 8. 透析等による除去率

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

#### 【警告】

重篤かつ遷延性の低血糖症を起こすことがある。用法・用量、使用上の注意に特に留意すること。

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 重症ケトーシス、糖尿病性昏睡又は前昏睡、インスリン依存型糖尿病の患者  
〔インスリンの適用である。〕
2. 重篤な肝又は腎機能障害のある患者  
〔低血糖を起こすおそれがある。〕
3. 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者  
〔インスリンの適用である。〕
4. 下痢、嘔吐等の胃腸障害のある患者  
〔低血糖を起こすおそれがある。〕
5. 本剤の成分又はスルホンアミド系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者
6. 妊娠又は妊娠している可能性のある婦人  
（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1)既に肝又は腎機能障害のある患者
- (2)次に掲げる低血糖を起こすおそれのある患者又は状態
  - 1)肝又は腎機能障害
  - 2)脳下垂体機能不全又は副腎機能不全
  - 3)栄養不良状態、飢餓状態、不規則な食事摂取、食事摂取量の不足又は衰弱状態
  - 4)激しい筋肉運動
  - 5)過度のアルコール摂取者
  - 6)高齢者（「高齢者への投与」の項参照）
  - 7)「相互作用」の項に示す血糖降下作用を増強する薬剤との併用

## 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

### 重要な基本的注意

- (1) 糖尿病の診断が確立した患者に対してのみ適用を考慮すること。糖尿病以外にも耐糖能異常・尿糖陽性等、糖尿病類似の症状（腎性糖尿、老人性糖代謝異常、甲状腺機能異常等）を有する疾患があることに留意すること。
- (2) 適用はあらかじめ糖尿病治療の基本である食事療法、運動療法を十分に行ったうえで効果が不十分な場合に限り考慮すること。
- (3) 投与する場合には、少量より開始し、血糖、尿糖を定期的に検査し、薬剤の効果を確かめ、効果が不十分な場合には、速やかに他の治療法への切り替えを行うこと。
- (4) 投与の継続中に、投与の必要がなくなる場合や、減量する必要がある場合があり、また、患者の不養生、感染症の合併等により効果がなくなったり、不十分となる場合があるので、食事摂取量、体重の推移、血糖値、感染症の有無等に留意のうえ、常に投与継続の可否、投与量、薬剤の選択等に注意すること。
- (5) **重篤かつ遷延性の低血糖**を起こすことがあるので、高所作業、自動車の運転等に従事している患者に投与するときには注意すること。また、低血糖に関する注意について、患者及びその家族に十分徹底させること。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

### (2) 併用注意とその理由

#### 〔併用注意〕（併用に注意すること）

##### (1) 血糖降下作用を増強する薬剤

###### 1) 臨床症状

血糖降下作用の増強による低血糖症状（脱力感、高度の空腹感、発汗、動悸、振戦、頭痛、知覚異常、不安、興奮、神経過敏、集中力低下、精神障害、意識障害、痙攣等）が起こることがある。

###### 2) 措置方法

併用する場合には、血糖値その他患者の状態を十分観察し、必要に応じて本剤又は併用薬剤の投与量を調節するなど慎重に投与すること。低血糖症状が認められた場合には通常はショ糖を投与し、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤（アカルボース、ボグリボース等）との併用により低血糖症状が認められた場合にはブドウ糖を投与すること。

###### 3) 薬剤名：機序・危険因子

薬剤名等	機序・危険因子
インスリン製剤	血中インスリンの増加
ビグアナイド系薬剤	肝臓での糖の新生を抑制する。 腸管でのブドウ糖の吸収を抑制する。
インスリン抵抗性改善剤 トログリタゾン	インスリンの作用が増強される。
$\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤 アカルボース、ボグリボース 等	糖の吸収を抑制する。
DPP-4 阻害剤 シタグリップチルリシン酸塩水和物 ビルダグリップチル 等 GLP-1 受容体作動薬 リラグルチド	インスリン分泌促進、グルカゴン分泌抑制によると考えられている。
プロベネシド	本剤の腎排泄が抑制される。
クマリン系薬剤 ワルファリンカリウム	本剤の肝代謝が抑制される。
サリチル酸剤 アスピリン 等	本剤の血中蛋白との結合が抑制される。 また、サリチル酸剤は血糖降下作用を有する。

	ピラゾロン系消炎剤 ケトフェニルブタゾン 等	本剤の血中蛋白との結合、及び腎排泄が抑制される。
	$\beta$ -遮断剤 プロプロラノロール塩酸塩 等	糖の新生及びアドレナリンによる低血糖からの回復を抑制する。また、低血糖に対する交感神経症状を不顕化する。
	モノアミン酸化酵素阻害剤	糖の新生を抑制し、インスリンの分泌を促進する。
	サルファ剤	本剤の血中蛋白との結合、肝代謝及び腎排泄が抑制される。
	クロラムフェニコール	本剤の肝代謝が抑制される。
	テトラサイクリン系抗生物質	末梢組織のインスリン感受性を促進する。
	フィブラーート系薬剤 クロフィブラーート ベザフィブラーート 等	本剤の血中蛋白との結合、肝代謝及び腎排泄が抑制される。
	グアネチジン硫酸塩	機序は明確ではないが、組織カテコールアミン枯渇の関与等が考えられる。
	ミコナゾール、フルコナゾール	本剤の肝代謝が抑制される。

## (2) 血糖降下作用を減弱する薬剤

### 1) 臨床症状

血糖降下作用の減弱による高血糖症状（嘔気・嘔吐、脱水、呼気のアセトン臭等）が起こることがある。

### 2) 措置方法

併用する場合は、血糖値その他患者の状態を十分観察しながら投与すること。

### 3) 薬剤名：機序・危険因子

薬剤名等	機序・危険因子
アドレナリン	末梢組織でブドウ糖の取り込みの抑制、及び肝臓での糖新生を促進する。
副腎皮質ホルモン	肝臓での糖新生の促進、及び末梢組織のインスリン感受性を低下させる。
甲状腺ホルモン	腸管でのブドウ糖吸収を亢進させ、グルカゴンの分泌を促進させる。また、カテコールアミンの作用を増強させ、肝臓での糖新生を促進させる。
卵胞ホルモン	機序は明確ではないが、コルチゾール分泌変化、組織での糖利用変化、成長ホルモンの過剰生産、肝機能の変化等が考えられる。
利尿剤 チアジド系、 クロルタリドン エタクリン酸 アセタゾラミド トリアムテレン プロセミド 等	末梢組織のインスリン感受性の低下、及びインスリンの分泌を抑制する。
ピラジナミド	機序は明確ではないが、血糖値のコントロールが難しいとの報告がある。
イソニアジド	糖質代謝を障害し、血糖値上昇及び耐糖能異常をおこす。
リファンピシン	本剤の肝代謝を促進させる。
ニコチン酸	肝臓でのブドウ糖の同化を抑制する。
フェノチアジン系薬剤	インスリンの遊離抑制及び副腎からアドレナリンを遊離させる。
フェニトイン	インスリンの分泌を抑制する。
ブセレリン酢酸塩	機序は明確ではないが、ブセレリン酢酸塩投与により、インスリン非依存型糖尿病患者が依存型になったとの報告がある。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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ため、発現頻度については承認時までの調査及び文献を参考に集計した。

総症例 975 例中 53 例 (5.44%) に副作用 (臨床検査値異常を含む) が認められ、主な副作用は低血糖 23 件 (2.36%)、食欲不振 8 件 (0.82%)、AST (GOT) 上昇 4 件 (0.41%)、ALT (GPT) 上昇 4 件 (0.41%)、腹部不快感 4 件 (0.41%) 等であった。(再評価結果)

以下の副作用は、頻度が算出できない副作用報告を含む。

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### 重大な副作用

##### 1) 低血糖 (2.36%)

脱力感、高度の空腹感、発汗、動悸、振戦、頭痛、知覚異常、不安、興奮、神經過敏、集中力低下、精神障害、意識障害、痙攣等があらわれることがあるので、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。なお、徐々に進行する低血糖では、精神障害、意識障害等が主である場合があるので注意すること。

また、本剤の投与により低血糖症状が認められた場合には通常はショ糖を投与し、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤 (アカルボース、ボグリボース等)との併用により低血糖症状が認められた場合にはブドウ糖を投与すること。

##### 2) 再生不良性貧血、無顆粒球症 (頻度不明)

再生不良性貧血、無顆粒球症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと

### (3) その他の副作用

	0.1~5% 未満	頻度不明
血液		血小板減少
肝臓	肝機能障害	肝性ポルフィリン症
消化器	腹部不快感 等	
過敏症	発疹、光線過敏症 等	
その他	頭痛	アルコール耐性低下、甲状腺機能異常

### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

### (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

発疹、光線過敏症等の過敏症があらわれた場合には投与を中止すること。

#### 【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

5. 本剤の成分又はスルホンアミド系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者

## 9. 高齢者への投与

少量から投与を開始し定期的に検査を行うなど慎重に投与すること。  
〔高齢者では、生理機能が低下していることが多く、低血糖があらわれやすい。〕

## 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 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。  
〔スルホニルウレア系薬剤は胎盤を通過することが報告されており、新生児の低血糖、また、巨大児が認められている。〕  
(2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましい。  
〔他のスルホニルウレア系薬剤で母乳へ移行することが報告されている。〕

## 11. 小児等への投与

該当しない

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

## 13. 過量投与

(1) 微候・症状：低血糖が起こることがある。（副作用の低血糖の項を参照）  
(2) 処置：  
1) 飲食が可能な場合：通常はショ糖を、 $\alpha$ -グルコシダーゼ阻害剤（アカルボース、ボグリボース等）との併用により低血糖症状が認められた場合にはブドウ糖を経口投与すること。  
2) 意識障害のある場合：ブドウ糖液（50%20mL）を静注し、必要に応じて5%ブドウ糖液点滴により血糖値の維持を図る。  
3) その他：血糖上昇ホルモンとしてのグルカゴン投与もよい。

## 14. 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。〕

## 15. その他の注意

(1) スルホニルウレア系薬剤（トルブタミド 1 日 1.5g）を長期間継続使用した場合、食事療法単独の場合と比較して心臓・血管系障害による死亡率が有意に高かったとの報告がある。  
(2) インスリン又は経口血糖降下剤の投与中にアンジオテンシン変換酵素阻害剤を投与することにより、低血糖が起こりやすいとの報告がある。

## 16. その他

該当しない

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）

#### (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### (3) 安全性薬理試験

グリクロピラミドの一般薬理作用を試験した結果、血糖低下によると思われる自発運動の抑制（マウス）の他、尿中K<sup>+</sup>の減少（ラット）、抗オキシトシン作用（ラット摘出子宮）、抗浮腫作用（ラット）及び胆汁分泌促進作用（ラット）が認められた<sup>9)</sup>。

#### (4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

#### (1) 単回投与毒性試験<sup>10)</sup>

		LD <sub>50</sub> (g/kg)		
		経 口	皮 下	腹腔内
マウス	♂	8.91	5.50	1.60
	♀	14.10	5.74	1.94
ラット	♂	7.50	—	1.62
	♀	4.10	—	1.77

(Litchfield-Wilcoxon 法、7日間観察)

#### (2) 反復投与毒性試験

Wistar 系ラット（♂、♀）にグリクロピラミド 30, 150 及び 750mg/kg を 1 カ月間及び 6 カ月間連続経口投与した結果、若干の体重増加抑制が認められた以外は、血液検査、尿検査、病理組織学的に、特筆すべき変化は認められなかった<sup>10)</sup>。

#### (3) 生殖発生毒性試験

JCL 系マウス、日本白色種家兎の器官形成期にグリクロピラミド 80 及び 500mg/kg を経口投与し、マウスでは胎児、新生児につき、家兎では新生児につき影響を調べた結果、外表、内臓、骨格へのグリクロピラミドの影響は認められなかった<sup>11)</sup>。

#### (4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：デアメリン S 錠 250mg 効薬、処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

有効成分：グリクロピラミド 効薬

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造の翌月より 5 年

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目、14. 適用上の注意の項を参照のこと。

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

PTP 包装：100 錠（10 錠×10）、500 錠（10 錠×50）

### 7. 容器の材質

PTP 包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同 効 薬：トルブタミド、アセトヘキサミド、グリクラジド、グリベンクラミド、  
クロルプロパミド 等

### 9. 国際誕生年月日

1965 年 8 月 19 日「国内開発」

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売（輸入）承認年月日：2007年9月28日 (旧名称「デアメリンS錠」：1965年8月19日)  
承認番号 : 21900AMX01734000 (旧名称「デアメリンS錠」：(40A)4456)

「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について（平成16年6月2日付 薬食発第0602009号）」に基づき、販売名を変更した。

## 11. 薬価基準収載年月日

2007年12月21日 (旧名称「デアメリンS錠」：1965年12月1日)

## 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

## 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価：1978年3月24日（その14）  
効能・効果、用法・用量 変更あり  
1993年3月4日（平成4年度その2）  
効能・効果、用法・用量 変更あり

## 14. 再審査期間

該当しない

## 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

## 16. 各種コード

販売名	HOT（9桁）番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
デアメリンS錠 250mg	108711601	3961002F1031	620006030

## 17. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) Feldman JW, et al., Arch Intern Med, 123, 314, 1969.
- 2) Beck-Nielsen H, et al., Diabetic Med, 5, 613, 1988.
- 3) 西村正人、最新医学、53(6), 1160, 1998.
- 4) 織田 敏次、他、治療、47, 843, 1965.
- 5) 入倉 勉、他、薬学雑誌、85 (2) , 104, 1965.
- 6) 内田 広、グリクロピラミド製剤の吸収性比較試験（社内資料）
- 7) 松下和裕、他、杏林製薬(株)社内資料
- 8) 阿部 泰夫、他、基礎と臨床、11 (6), 1639, 1977.
- 9) 阿部 泰夫、他、基礎と臨床、11 (6), 1625, 1977.
- 10) 阿部 泰夫、他、基礎と臨床、11 (6), 1605, 1977.
- 11) 杉本 勉、他、基礎と臨床、11 (6), 1620, 1977.

### 2. その他の参考文献

なし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

海外では発売されていない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## XII. 備考

### その他の関連資料

なし

## 情報提供サービスのご案内

弊社製品の情報を電話、インターネットによりお届けしております。  
弊社製品についてお知りになりたい事などございましたら、お気軽にご利用ください。

### ●製品に関するお問い合わせ・ご意見

弊社製品に関するお問い合わせ、ご意見等はお電話でのお問い合わせのみとなります。  
下記の窓口までご連絡ください。

**電話 0120-409341**

受付時間 9:00～17:30（土・日・祝日・弊社休業日を除く）

担当部署 くすり情報センター

### ●キヨーリン製薬ホームページ

弊社ホームページの「医療用医薬品情報」に添付文書、インタビューフォーム、剤形写真などの製品情報を掲載しております。下記アドレスにアクセスしてください。

**URL <http://www.kyorin-pharm.co.jp/>**

＜掲載情報＞

#### ●医療用医薬品情報

添付文書、くすりのしおり、インタビューフォーム、剤形写真、規制区分など

#### ●添付文書等改訂情報

#### ●新発売製品情報

#### ●新薬開発情報