

貯法	室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

劇薬、処方箋医薬品*

ズファジラン[®]筋注5mg

DUVADILAN[®] INTRAMUSCULAR INJECTION

イソクスプリン塩酸塩注

**承認番号 22100AMX00857
**薬価収載 2009年9月
**販売開始 2009年9月
再評価結果 1990年9月
効能追加 1964年3月

※注意—医師等の処方箋により使用すること

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

1. 脳出血のある患者[症状が悪化するおそれがある。]
2. 分娩直後の患者[分娩直後の出血を助長するおそれがある。]
3. 胎盤の早期剥離患者[疼痛、出血、止血障害、急性貧血及びショック症状等が悪化するおそれがある。]

【組成・性状】

*1. 組成

1 アンプル中に次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
ズファジラン筋注5mg	イソクスプリン塩酸塩(日局) 5mg / 1mL (0.5 ^w /%)	濃グリセリン 25.2mg

2. 製剤の性状

販売名	pH	浸透圧比 (生理食塩液対比)	外観
ズファジラン筋注5mg	4.9~6.0	約1	無色澄明の液

【効能・効果】

- 下記に伴う随伴症状
頭部外傷後遺症
- 下記に伴う末梢循環障害
ビュルガー病、閉塞性動脈硬化症、血栓性静脈炎、静脈血栓症、レイノー病及びレイノー症候群、凍瘡・凍傷、特発性脱疽、糖尿病による末梢血管障害
- 子宮収縮の抑制(切迫流・早産、過強陣痛)
- 月経困難症

【用法・用量】

- 循環器領域の適応の重症・急性の場合には、イソクスプリン塩酸塩として通常成人1回5~10mg(1~2アンプル)を1日2~3回筋肉内注射する。
 - 子宮収縮の抑制には、イソクスプリン塩酸塩として通常1回5~10mg(1~2アンプル)を1~2時間ごとに筋肉内注射する。
 - 月経困難症の重症の場合には、イソクスプリン塩酸塩として通常1回5~10mg(1~2アンプル)を筋肉内注射する。
- なお、年齢、症状により適宜増減する。
また、いずれの場合も症状がおさまったら経口投与に切り替えること。

【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)
 - (1) 心悸亢進のある患者[心拍数、心拍出量が増大するため、症状が悪化するおそれがある。]
 - (2) 低血圧の患者[一過性の血圧低下があらわれることがある。]
2. 重要な基本的注意
頭蓋内出血の疑いのある患者には、止血が完成したと推定される発作後10日ないし2週間頃から投与すること。

3. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
β刺激薬	本剤の作用が増強されるおそれがある。	β受容体刺激の増強によると考えられている。
β遮断薬	本剤の作用が减弱されるおそれがある。	β受容体での阻害によると考えられている。

4. 副作用[文献集計による(再審査対象外)]

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満
消化器		悪心、嘔吐	
循環器	心悸亢進	血圧低下、顔面潮紅	
精神神経系		めまい、眠気	
皮膚			発疹等
その他		月経過多	

5. 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。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠12週未満の妊婦には投与しないこと。[12週未満の投与に関する安全性は確立していない。]

7. 適用上の注意

(1) 筋肉内注射時：筋肉内注射にあたっては、組織、神経等への影響を避けるため下記の点に注意すること。

- 1) 注射部位については、神経走行部位を避けて慎重に投与すること。
- 2) くりかえし注射する場合には、左右交互に注射するなど、同一部位を避けること。なお、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児には特に注意すること。
- 3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。

(2) 開封時：アンプルカット時の異物混入を避けるため、エタノール消毒綿等で清拭しカットすること。

8. その他の注意

海外で本剤の点滴静注により、新生児に低血糖症、腸閉塞があらわれたとの報告がある。

【薬物動態】

イソクスプリンを筋肉内注射した場合、1時間以内に最高血漿中濃度に達し、主に尿中へ排泄される。血漿中からの半減期は約1.5時間である。

【薬効薬理】

1. 血液レオロジー的性状の改善作用

イソクスプリン塩酸塩の点滴静注により血液粘度低下作用が認められ、血液の流動性を高め、微小循環領域における血流を確保する^{1~4)}。

また、赤血球変形能改善作用が認められている。

2. 血管拡張作用

血管拡張作用は神経節の遮断作用によるものではなく、主として血管平滑筋への直接作用による(イヌ⁵⁾)。臨床的には脳及び末梢の血液循環動態を改善する⁶⁾。

3. 子宮筋弛緩作用

子宮筋の薬物受容体に直接作用し、 β -mimetic作用(β 受容体刺激作用)を主とした平滑筋弛緩作用を示す(ラット⁷⁾)。臨床的には子宮筋の異常収縮及び痙攣を改善する^{8,9)}。

*【有効成分に関する理化学的知見】

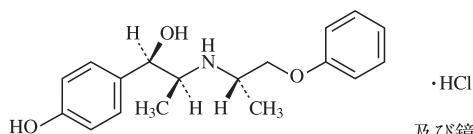
一般名：イソクスプリン塩酸塩(Isoxsuprine Hydrochloride)

化学名：(1RS,2SR)-1-(4-Hydroxyphenyl)-2-[[(2SR)-1-phenoxypropan-2-yl] amino] propan-1-ol monohydrochloride

分子式：C₁₈H₂₃NO₃ · HCl

分子量：337.84

構造式：



性状：白色の粉末又は結晶性の粉末である。ギ酸又はメタノールにやや溶けやすく、水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。メタノール溶液(1→50)は旋光性を示さない。

融点：約204℃(分解)

【取扱い上の注意】

本品は、「ワンポイントカットアンプル」を使用しているため、アンプル枝部のマークを上にして、反対方向に折りとること。

【包装】

ズファジラン筋注 5 mg (1 mL) 20アンプル

【主要文献】

- 1) Schlichting K, et al. : VASA 1976 ; 5(1) : 51-53
- 2) de Quiros JF, et al. : Fortschr Med. 1976 ; 94(29) : 1661-1664
- 3) Di Perri T, et al. : Pharmatherapeutica 1977 ; 1(7) : 447-452
- 4) Di Perri T, et al. : Br J Clin Pharmacol. 1978 ; 5(3) : 255-260
- 5) Manley ES, et al. : Arch Int Pharmacodyn. 1968 ; 175(1) : 239-250
- 6) Elliott CG, et al. : Curr Med Res Opin. 1973 ; 1(9) : 554-562
- 7) Amer MS, et al. : J Pharmacol Exp Ther. 1974 ; 190(2) : 243-248
- 8) Leep JH, et al. : West J Surg Obstet Gynecol. 1963 ; 71(6,8) : 103-104
- 9) 千村哲郎ほか：産婦人科の世界 1993 ; 45(3) : 237-255

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

第一三共株式会社 製品情報センター
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3-5-1
TEL : 0120-189-132