

マイナートランキライザー

向精神薬・処方箋医薬品*

日本薬局方 ジアゼパム錠

ジアゼパム錠2「サワイ」

DIAZEPAM

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

日本標準商品分類番号
871124

承認番号	(46AM)0849
薬価収載	1972年2月
販売開始	1972年2月
再評価結果	1997年6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) 急性閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕
 - 2) 重症筋無力症のある患者〔本剤の筋弛緩作用により症状が悪化するおそれがある。〕
 - 3) リトナビル(HIVプロテアーゼ阻害剤)を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

【組成・性状】

・組成

ジアゼパム錠2「サワイ」は、1錠中に日局ジアゼパム2mgを含有する。添加物として、アルファー化デンプン、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、乳糖を含有する。

・製剤の性状

剤形	外直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
割線入り素錠	 8.0 約170 2.6 [識別コード：SW 021]	白色

【効能・効果】

- ・神経症における不安・緊張・抑うつ
- ・うつ病における不安・緊張
- ・心身症(消化器疾患、循環器疾患、自律神経失調症、更年期障害、腰痛症、頸肩腕症候群)における身体症候並びに不安・緊張・抑うつ
- ・下記疾患における筋緊張の軽減
脳脊髄疾患に伴う筋痙攣・疼痛
- ・麻酔前投薬

【用法・用量】

通常、成人には1回ジアゼパムとして2～5mgを1日2～4回経口投与する。ただし、外来患者は原則として1日量ジアゼパムとして15mg以内とする。

また、小児に用いる場合には、3歳以下は1日量ジアゼパムとして1～5mgを、4～12歳は1日量ジアゼパムとして2～10mgを、それぞれ1～3回に分割経口投与する。

筋痙攣患者に用いる場合は、通常成人には1回ジアゼパムとして2～10mgを1日3～4回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

麻酔前投薬の場合は、通常成人には1回ジアゼパムとして5～10mgを就寝前または手術前に経口投与する。なお、年齢、症状、疾患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)

- 1) 心障害、肝障害、腎障害のある患者〔心障害では症状が悪化、肝・腎障害では排泄が遅延するおそれがある。〕

- 2) 脳に器質的障害のある患者〔作用が強くあらわれる。〕
- 3) 乳児、幼児〔作用が強くあらわれる。〕
- 4) 高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕
- 5) 衰弱患者〔作用が強くあらわれる。〕
- 6) 中等度又は重篤な呼吸不全のある患者〔症状が悪化するおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

- 1) 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないように注意すること。
- *2) 連用により薬物依存を生じることがあるので、漫然とした継続投与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続する場合には、治療上の必要性を十分に検討すること〔「重大な副作用」の項参照〕。

3. 相互作用

1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リトナビル (ノービーア)	過度の鎮静や呼吸抑制等が起こる可能性がある。	チトクロームP450に対する競合的阻害により、本剤の血中濃度が大幅に上昇することが予測されている。

2) 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
中枢神経抑制剤 フェノチアジン誘導体 バルビツール酸誘導体 等 モノアミン酸化酵素阻害剤	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が増強することがある。	相互に中枢神経抑制作用を増強することが考えられている。
アルコール (飲酒)	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が増強することがある。	相互に中枢神経抑制作用を増強することが考えられている。
シメチジン オメプラゾール	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が増強することがある。	本剤のクリアランスがシメチジンとの併用により27～51%、オメプラゾールとの併用により27～55%減少することが報告されている。
シプロフロキサシン	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が増強することがある。	本剤のクリアランスが37%減少することが報告されている。
フルボキサミンマレイン酸塩	眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が増強することがある。	本剤のクリアランスが65%減少することが報告されている。

薬 剤 名 等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
マプロチリン塩酸塩	1) 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が増強することがある。 2) 併用中の本剤を急速に減量又は中止すると痙攣発作がおこる可能性がある。	1) 相互に中枢神経抑制作用を増強することが考えられている。 2) 本剤の抗痙攣作用により抑制されていたマプロチリン塩酸塩の痙攣誘発作用が本剤の減量・中止によりあらわれることが考えられている。
ダントロレンナトリウム水和物	筋弛緩作用が増強する可能性がある。	相互に筋弛緩作用を増強することが考えられている。

4. 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。

1) 重大な副作用(頻度不明)

- * (1) 連用により**薬物依存**を生じることがあるので、観察を十分に行い、用量及び使用期間に注意し慎重に投与すること。また、連用中における投与量の急激な減少ないし投与の中止により、痙攣発作、せん妄、振戦、不眠、不安、幻覚、妄想等の**離脱症状**があらわれることがあるので、投与を中止する場合には徐々に減量するなど慎重に行うこと。
- * (2) **刺激興奮、錯乱**等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するなど適切な処置を行うこと。
- (3) 慢性気管支炎等の呼吸器疾患に用いた場合、**呼吸抑制**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するなど適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
精神神経系	眠気、ふらつき、眩暈、歩行失調、頭痛、失禁、言語障害、振戦、霧視、複視、多幸症
肝 臓 ^{注1)}	黄疸
血 液 ^{注1)}	顆粒球減少、白血球減少
循 環 器	頻脈、血圧低下
消 化 器	悪心、嘔吐、食欲不振、便秘、口渇
過 敏 症 ^{注2)}	発疹
そ の 他	倦怠感、脱力感、浮腫

注1) 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するなど適切な処置を行うこと。

注2) このような場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者へ投与する場合には、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。〔運動失調等の副作用が発現しやすい。〕

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦(3ヵ月以内)又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。〔妊娠中に本剤の投与を受けた患者の中に奇形を有する児等の障害児を産出した例が対照群と比較して有意に多いとの疫学的調査報告がある。〕
- 2) 妊娠後期の婦人には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。〔ベンゾジアゼピン系薬剤で新生児に哺乳困難、嘔吐、活動低下、筋緊張低下、過緊張、嗜眠、傾眠、呼吸抑制・無呼吸、チアノーゼ、易刺激性、神

經過敏、振戦、低体温、頻脈等を起こすことが報告されている。なお、これらの症状は、離脱症状あるいは新生児仮死として報告される場合もある。また、ベンゾジアゼピン系薬剤で新生児に黄疸の増強を起こすことが報告されている。〕

- 3) 分娩前に連用した場合、出産後新生児に離脱症状があらわれることが、ベンゾジアゼピン系薬剤で報告されている。
- 4) 授乳婦への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。〔ヒト母乳中へ移行し、新生児に嗜眠、体重減少等を起こすことがあり、また、黄疸を増強する可能性がある。〕

7. 過量投与

本剤の過量投与が明白又は疑われた場合の処置としてフルマゼニル(ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤)を投与する場合には、使用前にフルマゼニルの使用上の注意(禁忌、慎重投与、相互作用等)を必ず読むこと。

8. 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)

9. その他の注意

投与した薬剤が特定されないままにフルマゼニル(ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤)を投与された患者で、新たに本剤を投与する場合、本剤の鎮静・抗痙攣作用が変化、遅延するおそれがある。

【薬物動態】

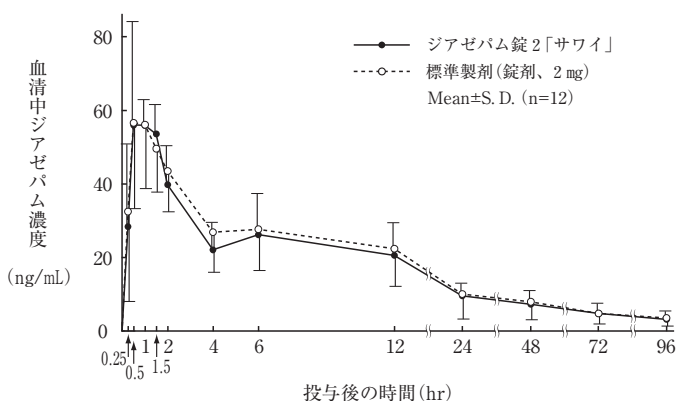
1. 生物学的同等性試験

ジアゼパム錠2「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ジアゼパムとして2mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血清中ジアゼパム濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-96hr} (ng・hr/mL)
ジアゼパム錠2「サワイ」	69.4 ± 12.9	0.9 ± 0.4	47.4 ± 34.6	969.2 ± 292.6
標準製剤(錠剤、2mg)	68.1 ± 10.9	1.0 ± 0.6	51.7 ± 40.6	1033.7 ± 340.9

(Mean ± S. D.)



血清中濃度ならびに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

本製剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたジアゼパム錠の溶出規格(a)に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

1. 大脳辺縁系に特異的に作用し、正常な意識・行動に影響を及ぼさずに馴化、鎮静作用を現す。
2. 主として脊髓反射の抑制により筋緊張を寛解する。
3. 実験動物におけるストリキニーネ痙攣、メトラゾール痙攣、電気ショック痙攣に対し、抗痙攣作用を現す。
4. 抑制性のGABAニューロンのシナプス後膜に存在するベンゾジアゼピン受容体にアゴニストとして高い親和性で作用し、GABAの作用を増強すると考えられる。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ジアゼパム (Diazepam)

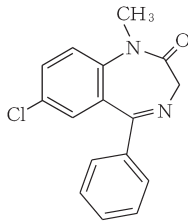
化学名：7-Chloro-1-methyl-5-phenyl-1,3-dihydro-2H-1,4-benzodiazepin-2-one

分子式：C₁₆H₁₃ClN₂O

分子量：284.74

融点：130～134℃

構造式：



性状：ジアゼパムは白色～淡黄色の結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。アセトンに溶けやすく、無水酢酸又はエタノール(95)にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

- ・安定性試験
包装品を用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。²⁾

【包装】

PTP：100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

バラ：1,000錠

【主要文献及び文献請求先】

- ・主要文献
 - 1) 沢井製薬(株)社内資料 [生物学的同等性試験]
 - 2) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]
- ・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]
沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

本剤は、厚生労働省告示第97号(平成20年3月19日付)により、投薬量が1回90日分を限度とされています。

製造販売元
沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K15 A190676