

貯法：室温保存
有効期間：〈錠50mg〉5年
〈錠100mg〉3年ジラゼプ塩酸塩錠50mg「日新」
ジラゼプ塩酸塩錠100mg「日新」処方箋医薬品^{注)}

Dilazep Hydrochloride Tablets 50mg・100mg “NISSIN”

	50mg	100mg
承認番号	22500AMX01172	22500AMX01171
販売開始	1987年10月	2011年11月

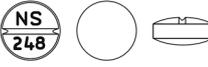
注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ジラゼプ塩酸塩錠50mg「日新」	ジラゼプ塩酸塩錠100mg「日新」
有効成分	1錠中 日本薬局方ジラゼプ塩酸塩水和物50mg	1錠中 日本薬局方ジラゼプ塩酸塩水和物100mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、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	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、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、タルク、酸化チタン

3.2 製剤の性状

販売名	ジラゼプ塩酸塩錠50mg「日新」	ジラゼプ塩酸塩錠100mg「日新」
性状	白色のフィルムコーティング錠	
外形		
大きさ	錠径：7.1mm 錠厚：3.9mm 重量：150mg	錠径：8.1mm 錠厚：3.8mm 重量：200mg
識別コード	NS 216	NS 248

4. 効能又は効果

○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

5. 効能又は効果に関連する注意

〈腎機能障害軽度～中等度のIgA腎症における尿蛋白減少〉

- 5.1 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。
- 5.2 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。

6. 用法及び用量

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者

副作用として一過性のALT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。

9.5 妊婦

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。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット：静脈内投与）で乳汁中へ移行することが報告されている。

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

11. 副作用

次の副作用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。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
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、胸部違和感、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

発現頻度は、申請時～1994年7月までの集計に基づく。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

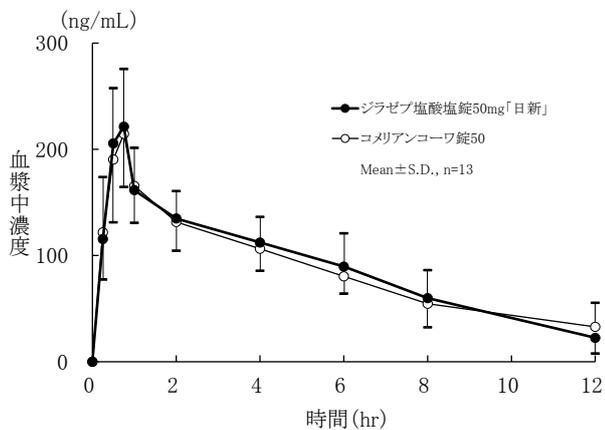
16.1.1 生物学的同等性試験

〈ジラゼプ塩酸塩錠50mg「日新」〉

ジラゼプ塩酸塩錠50mg「日新」とコメリアンコーワ錠50を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（ジラゼプ塩酸塩水和物として100mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿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、両製剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ジラゼプ塩酸塩錠50mg「日新」	1067.2±241.7	246.5±46.3	0.63±0.13	3.83±1.07
コメリアンコーワ錠50	1035.2±195.4	244.6±46.3	0.67±0.16	4.67±1.57

(Mean±S.D., n=13)



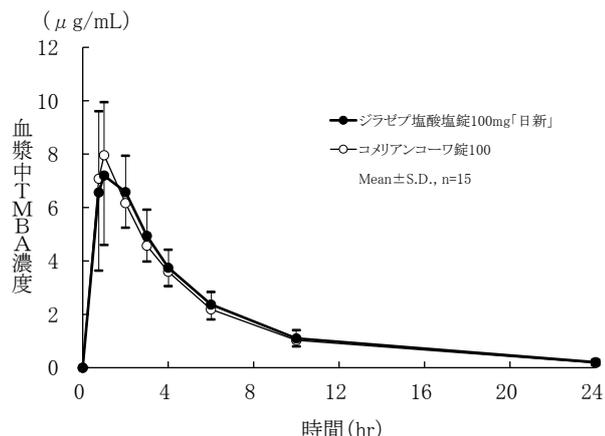
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

〈ジラゼブ塩酸塩錠100mg「日新」〉

ジラゼブ塩酸塩錠100mg「日新」とコメリアンコーワ錠100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100mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して代謝物3,4,5-trimethoxybenzoic acid (TMBA)の血漿中濃度を測定し、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、両製剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ジラゼブ塩酸塩錠100mg「日新」	43.43 ± 7.75	8.40 ± 1.20	1.20 ± 0.51	4.36 ± 0.57
コメリアンコーワ錠100	41.73 ± 5.92	8.33 ± 1.31	1.02 ± 0.29	4.24 ± 0.60

(Mean ± S.D., n=15)



血漿中濃度並びに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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ジラゼブ塩酸塩水和物は冠血管拡張薬と呼ばれ、作用機序は複雑であるが、アデノシン増強作用が重視されている。すなわち、虚血心筋から遊離されるアデノシンの細胞内への再取り込みを阻害することにより、アデノシンの血管拡張作用を増強して冠拡張作用をあらわす³⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ジラゼブ塩酸塩水和物

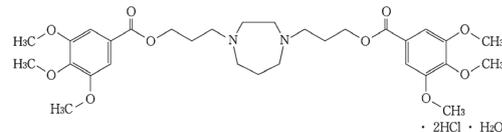
(Dilazep Hydrochloride Hydrate)

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

構造式：



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℃

22. 包装

〈ジラゼブ塩酸塩錠50mg「日新」〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

1000錠 [10錠 (PTP) × 100]

〈ジラゼブ塩酸塩錠100mg「日新」〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験（錠50mg）
- 社内資料：生物学的同等性試験（錠100mg）
- 第十六改正日本薬局方解説書、C-2088、廣川書店（2011）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日新製薬株式会社 安全管理部
〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号
TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419
E-mail: d-info@yg-nissin.co.jp

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



日新製薬株式会社

山形県天童市清池東二丁目3番1号