

* 2023年12月作成(第2版)
2022年11月作成(第1版)

日本標準商品分類番号
872172、871249

脳・末梢血行動態改善剤、子宮鎮痙剤
日本薬局方 イソクスブリン塩酸塩錠
ズファジラン[®]錠10mg

貯 法：室温保存
有効期間：3年

DUVADILAN[®] Tablets 10mg

承認番号 22000AMX00798
販売開始 1963年5月

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.1 妊娠12週未満の妊婦 [9.5参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

| 販売名 | 有効成分 | 添加剤 |
|-------------|------------------------|--|
| ズファジラン錠10mg | 1錠中イソクスブリン塩酸塩(日局) 10mg | 乳糖水和物、トウモロコシデンプン、メチルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム |

3.2 製剤の性状

| 販売名 | 色・剤形 | 外形 | | | 識別コード |
|--------------|-----------|---|---|---|---------|
| | | 直径(mm) | 厚さ(mm) | 質量(mg) | |
| *ズファジラン錠10mg | 白色の割線入り素錠 |  |  |  | AFP 304 |
| | | 9.0 | 2.8 | 235 | |

4. 効能又は効果

- 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、レイノー病およびレイノー症候群、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)
- 月経困難症

6. 用法及び用量

〈循環器領域の適応〉

イソクスブリン塩酸塩として通常成人1回10~20mgを1日3~4回経口投与する。

〈子宮収縮の抑制〉

イソクスブリン塩酸塩として通常1日量30~60mgを3~4回に分けて経口投与する。

〈月経困難症〉

イソクスブリン塩酸塩として通常1回10~20mg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。

7. 用法及び用量に関連する注意

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。

9.1.2 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。

9.1.3 脳出血のある患者

症状が悪化するおそれがある。

9.1.4 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。

9.5 妊婦

妊娠12週未満の妊婦には投与しないこと。[2.1参照]

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。

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ことが多い。

10. 相互作用

10.2 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 |
|------------------|--------------------|-----------------------|
| β刺激薬 サルブタモール等 | 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 メプロロール等 | 本剤の作用が減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。 |

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

| | 頻度不明 |
|-------|-------------------------|
| 消化器 | 悪心、食欲不振、下痢、胃痛、嘔吐、口内炎、舌炎 |
| 循環器 | 心悸亢進、顔面潮紅、血圧低下 |
| 精神神経系 | 頭痛(頭重感)、めまい、眠気、倦怠感 |
| 皮膚 | 発汗、発疹等 |
| その他 | 月経過多 |

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

イソクスブリンを経口投与したところ、胃腸管から速やかに吸収され、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た。

血漿中からの半減期は約1.5時間であった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

イソクスブリン塩酸塩には中枢作用、神経節遮断作用及び副交感神経興奮作用はなく、血管平滑筋のアドレナリン系薬物受容体のβ-受容体を興奮させ、α-受容体を抑制する。microcirculatory regulatorとして働き、脳・末梢血行動態を改善する^{1,2)}。また子宮筋に対しても鎮痙作用を示す。

18.2 血液レオロジー的性状の改善作用

末梢閉塞性動脈疾患患者へ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した³⁻⁵⁾。

また、脳循環障害患者に1日60mgを連続経口投与した場合、2週及び4週後に赤血球変形能の有意な改善が認められた⁶⁾。

18.3 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⁷⁾(イヌ)。また、脳血管疾患患者を対象とした海外臨床試験において、脳及び末梢の血液循環動態を改善した⁸⁾。

18.4 子宮筋弛緩作用

子宮筋の薬物受容体に直接作用し、 β 受容体刺激作用を主とした平滑筋弛緩作用を示す⁹⁾(ラット)。また、切迫流産患者を対象とした国内及び海外臨床試験において、子宮筋の異常収縮及び痙攣を改善した¹⁰⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：イソクスプリン塩酸塩

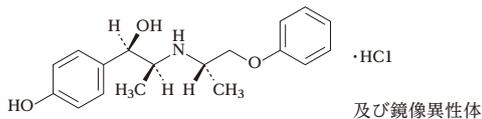
(Isoxsuprine Hydrochloride)

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

分子式：C₁₈H₂₃NO₃ · HCl

分子量：337.84

化学構造式：



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°C(分解)

22. 包装

1000錠 [10錠(PTP)×100]

100錠 [プラスチック瓶、バラ]

23. 主要文献

- 1) Ariëns, E. J. et al. : Arzneimittelforschung. 1963 ; 13 : 541-546
- 2) Waelen, M. J. et al. : Arzneimittelforschung. 1964 ; 14 : 11-19
- 3) Schlichting, K. et al. : VASA. 1976 ; 5(1) : 51-53
- 4) de Quiros, J. F. et al. : Fortschr Med. 1976 ; 94(29) : 1661-1664
- 5) Di Perri, T. et al. : Br J Clin Pharmacol. 1978 ; 5(3) : 255-260
- 6) 小松俊一 他 : Prog Med. 1982 ; 2(7) : 1123-1130
- 7) Manley, E. S. et al. : Arch Int Pharmacodyn. 1968 ; 175(1) : 239-250
- 8) Elliott, C. G. et al. : Curr Med Res Opin. 1973 ; 1(9) : 554-562
- 9) Amer, M. S. et al. : J Pharmacol Exp Ther. 1974 ; 190(2) : 243-248
- 10) 千村哲朗 他 : 産婦人科の世界. 1993 ; 45(3) : 237-255

24. 文献請求先及び問い合わせ先

アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

alfresa アルフレッサ ファーマ株式会社
大阪市中央区石町二丁目2番9号

®登録商標