

昼夜型抗不安薬

セダプラン^{コーワ錠5} セダプラン^{コーワ錠10}

SEDAPRAN^{KOWA} TAB.5・TAB.10
(日本薬局方プラゼパム錠)

セダプラン^{コーワ細粒1%}

SEDAPRAN^{KOWA} FINE GR.1%
(プラゼパム製剤)

規制区分: 向精神薬、
指定医薬品、
要指示医薬品
注意一医師等の処方せん・
指示により使用すること。
貯 法: 気密容器、室温保存
(開封後はなるべく速やかに
使用すること。)
使用期限: 外箱等に表示

	錠5	錠10	細粒1%
承認番号	(55AM)850	(55AM)851	(55AM)852
薬価収載	1980年12月		
販売開始	1980年12月		
再審査結果	1987年9月		
再評価結果	1997年6月		

禁忌(次の患者には投与しないこと)

- (1)急性狭隅角緑内障の患者〔弱い抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させるおそれがある。〕
- (2)重症筋無力症の患者〔筋弛緩作用により症状を悪化させるおそれがある。〕
- (3)本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

組成・性状

販売名	セダプラン ^{コーワ錠5}	セダプラン ^{コーワ錠10}	セダプラン ^{コーワ細粒1%}
成分・含量	1錠中 プラゼパム5mg	1錠中 プラゼパム10mg	1g中 プラゼパム10mg
色調・剤形	白色 割線を有する素錠	白色 割線を有する素錠	白色 細粒剤
添加物	トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース セルロース、カルメロースCa、 ステアリン酸Mg		タルク
外形	直径 6mm 厚さ 2.7mm 重量 約0.095g	直径 7mm 厚さ 3.0mm 重量 約0.14g	
識別コード	305	310	

*効能・効果

- 神経症における不安・緊張・抑うつおよび睡眠障害
- うつ病における不安・緊張および睡眠障害
- 心身症(消化器疾患、高血圧症、自律神経失調症)における身体症候並びに不安・緊張・抑うつおよび睡眠障害
- 麻酔前投薬

*用法・用量

1. 通常成人には、プラゼパムとして10~15mgを1日1回、または10~20mgを1日2~3回に分割して経口投与する。
ただし年齢、症状に応じ適宜増減する。
2. 麻酔前投薬の場合は、通常成人にプラゼパムとして1回15mgを就寝前または手術前に経口投与する。
ただし年齢、症状、疾患に応じ適宜増減する。

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)心障害のある患者〔ジアゼパムで心臓に対して抑制的な作用を及ぼすとの報告がある。〕
- (2)肝障害、腎障害のある患者〔代謝・排泄の遅延から、作用が強くなるおそれがある。〕
- (3)脳に器質的障害のある患者〔作用が強くなるおそれがある。〕
- (4)乳・幼児(「小児等への投与」の項参照)
- (5)高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
- (6)衰弱患者〔作用が強くなるおそれがある。〕
- (7)中等度又は重篤な呼吸不全のある患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

ねむけ、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注意すること。

**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
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 MAO阻害剤 アルコール	作用が増強されることがある。	ともに中枢神経抑制作用を有するため、相互に作用を増強する。
シメチジン	本剤の作用が増強されるおそれがある。	本剤の代謝が抑制されるとの報告がある。

4. 副作用

総症例数15709例中、副作用が報告されたのは539例(3.43%)で、ベンゾジアゼピン系抗不安薬に共通してみられる副作用であった。すなわち、ねむけ321件(2.04%)、ふらつき128件(0.81%)、疲労・倦怠・脱力感91件(0.58%)、口渇37件(0.24%)、めまい13件(0.08%)、発疹10件(0.06%)、食欲不振7件(0.04%)などであり、症状はほとんどの例で軽いものであった。また臨床検査値についてはAST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇(0.1%未満)がみられる以外異常な変動は示さなかった。(承認時~再審査結果)

(1)重大な副作用(頻度不明)

- 1)大量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、用量を越えないよう慎重に投与すること。また、大量投与又は連用中における投与量の急激な減少ないし投与中止により、痙攣発作、せん妄、振戦、不眠、不安、幻覚、妄想等の**禁断症状**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)精神分裂病等の精神障害者に投与すると逆に**刺激興奮、錯乱**等があらわれることがある。

(2)その他の副作用

	0.1%~5%未満	0.1%未満
精神神経系	ねむけ、 ふらつき	めまい・たちくらみ、言語障害(構音障害を含む)、気分高揚・易怒(抑制解除を含む)、頭痛・頭重、焦燥感、浮腫感、不眠、ぼんやり(頭がぼーっとする、仕事のミス)、眼症状(複視)、振戦、頭部圧迫感、意欲減退、舌のしびれ、歩行失調、四肢のふるえ
肝臓		AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇
循環器		発汗
消化器	口渇	嘔気・悪心、嘔吐、胃部不快感・膨満感、食欲不振、便秘、下痢、胃腸障害
過敏症 [※]		発疹、痒痒感
骨格筋	疲労・倦怠・ 脱力感	筋弛緩、筋痛
その他		性欲減退、陰萎、宿酔、目がだるい、身体がこわばって重い、顔がはれぼったい、脇がふさがり感、失禁、尿糖陽性、ウロビリノーゲン陽性

※症状があらわれた場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。〔高齢者では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にのみ投与すること。〔動物実験により催奇形作用が報告されており、また妊娠中に他のベンゾジアゼピン系化合物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出産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にのみ投与すること。〔新生児に哺乳困難、筋緊張低下、嗜眠、黄疸の増強等の症状を起こすことが他のベンゾジアゼピン系化合物(ジアゼパム、ニトラゼパム)で報告されている。〕

(3) 分娩前に連用した場合、出産後新生児に禁断症状(神経過敏、振戦、過緊張等)があらわれることがある。〔他のベンゾジアゼピン系化合物(ジアゼパム)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、他のベンゾジアゼピン系化合物(ジアゼパム)で報告されており、また黄疸を増強する可能性がある。〕

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。

8. 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。

*9. 適用上の注意

薬剤交付時(錠剤のみ)

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。)

10. 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

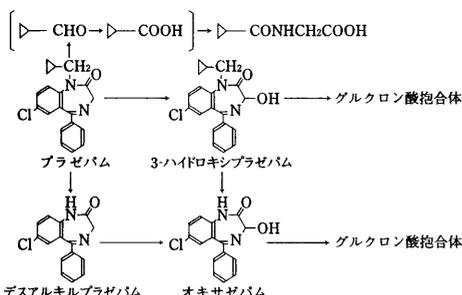
〈血中濃度〉¹⁾²⁾

1. 健康成人男子に1回経口投与(20mg)した時、吸収は速やかで、血中には主としてデスアルキルプラゼパムがあらわれる。この半減期は94時間である。

2. 健康成人男子に連続経口投与(1回10mg、1日2回、15日間)した時、デスアルキルプラゼパムの血漿中濃度は投与後6~9日でプラトーに達する。投与中止後の薬物の血中からの消失は速やかで、1回投与の場合と連続投与の場合と同じ推移を示す。

〈代謝及び排泄〉¹⁾

健康成人男子の場合プラゼパムは吸収された後、脱アルキル化および3位の水酸化を受ける。代謝過程で生成されるこれらデスアルキルプラゼパム、3-ハイドロキシプラゼパム、オキサゼパムはいずれも生物学的に活性をもつ化合物であり、プラゼパムの薬理作用に関与すると考えられる。尿中ではオキサゼパム、3-ハイドロキシプラゼパムのグルクロン酸抱合体が主代謝物であった。



臨床成績

国内27施設1418例について実施された5種の二重盲検比較試験を含む臨床試験の概要は次のとおりである。^{3)~9)}

1. 疾患別臨床効果

疾患名	有効率
神経症	62.2%(530/852)
うつ病	58.7%(37/63)
心身症	54.5%(212/389)
〔高血圧症 消化器疾患 自律神経失調症〕	55.2%(32/58)

2. 症状別臨床効果

症状	有効率
不安	81.5%(660/810)
緊張	79.7%(329/413)
抑うつ気分	69.2%(488/705)
睡眠障害	81.5%(520/638)

薬効薬理

ベンゾジアゼピン系の行動抑制の少ない抗不安薬である。

〈薬理作用〉

- 抗コンフリクト作用はジアゼパムに比し、強かつ選択的である(ラット)¹⁰⁾
- オープンフィールドにおける自発運動はジアゼパムに比し、増加している(マウス)¹⁰⁾
- 馴化作用、抗痙攣作用はジアゼパムに比し持続的である(ラット・マウス)¹⁰⁾
- 正向反射抑制、協調運動障害、運動失調、歩行失調などの作用はジアゼパムに比し弱い(マウス・ネコ・イヌ)^{10)~12)}

〈作用機序〉

大脳辺縁系ならびに視床下部に対して抑制的に作用し、質的にはジアゼパムに類似している。¹³⁾

有効成分に関する理化学的知見

一般名: プラゼパム(JAN) [Prazepam (WHO recommended INN)]

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

分子式: C₁₉H₁₇ClN₂O 分子量: 324.80

融点: 145~148°C

性状: 白色~淡黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。アセトンに溶けやすく、無水酢酸にやや溶けやすく、エタノール(99.5)又はジエチルエーテルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

包装

セダブランコ錠5 PTP: 100錠、500錠、1000錠
瓶: 1000錠

セダブランコ錠10 PTP: 100錠、500錠、1000錠
瓶: 1000錠

セダブランコ細粒1% 500g

主要文献

- 1) 伊藤昭文他: 医薬品研究, 9, 349 (1978)
- 2) 井上令一他: 薬理と治療, 8, 4789 (1980)
- 3) 伊藤公一他: 臨床精神医学, 7, 977 (1978)
- 4) 工藤義雄他: 医学のあゆみ, 105, 256 (1978)
- 5) 川上澄他: 臨床と研究, 55, 568 (1978)
- 6) 八杉忠男他: 薬理と治療, 6, 1117 (1978)
- 7) 吉村学他: 薬理と治療, 5, 3613 (1977)
- 8) 川澄正一他: 薬理と治療, 5, 3341 (1977)
- 9) 百瀬隆他: 薬理と治療, 5, 850 (1977)
- 10) 清水貞宏他: 医学研究, 48, 189 (1978)
- 11) 山内洋一他: 医学研究, 48, 210 (1978)
- 12) 中村政記他: 千葉医学雑誌, 53, 277 (1977)
- 13) 清水貞宏他: 医学研究, 48, 220 (1978)

文献請求先

興和株式会社 医薬事業部 医薬情報部

〒103-8433 東京都中央区日本橋本町3-4-14

本剤は厚生労働省告示第99号(平成14年3月18日付)に基づき、投薬量は1回30日分を限度とされています。

製造元 興和株式会社 名古屋市中区錦三丁目6-29