

** 2003年12月改訂(第5版)

* 2003年4月改訂

日本標準商品分類番号 871124

マイナートランキライザー

貯法: 室温保存
使用期限: 外箱に表示の使用期限内に使用すること。
 (使用期限内であっても開封後はなるべく速やかに使用すること。)

向精神薬 指定医薬品 要指示医薬品^{注1)}

2mgセルシン錠

5mgセルシン錠

10mgセルシン錠

セルシン散1%

「タケタ」

2・5・10 mg. CERCINE® TABLETS & POWDER 1%

ジアゼパム錠・散

	承認番号	薬価収載	販売開始
2mg錠	13900AZY00372	1965年11月	1964年11月
5mg錠	13900AZY00373	1965年11月	1964年11月
10mg錠	13900AZY00374	1965年11月	1964年11月
散1%	21300AMZ00621	2001年9月	1964年11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)

- 急性狭隅角緑内障のある患者[本剤の弱い抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状が悪化するおそれがある。]
- 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。]
- 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)

【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。

*【組成・性状】

	2mgセルシン錠	5mgセルシン錠	10mgセルシン錠
1錠中の有効成分	ジアゼパム2mg	ジアゼパム5mg	ジアゼパム10mg
剤形	片面	割線入りの素錠	
錠剤の色	白色～黄みの白色	淡黄色～淡だいだい黄色	白色～黄みの白色
識別コード	⊙ 110	⊙ 111	⊙ 112
形状	上面		
	下面		
	側面		
直径(mm)	6.1	7.1	8.1
厚さ(mm)	2.4	2.3	2.6

添加物: トウモロコシデンプン、ステアリン酸マグネシウム、乳糖(以上全製剤に含有)、リボフラビン(5mg錠にのみ含有)

セルシン散1%: 1g中ジアゼパム10mgを含有する白色の細粒を含む粉末である。

添加物: 乳糖、トウモロコシデンプン、軽質無水ケイ酸

【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)における身体症状並びに不安・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

【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)

- 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。]
- 脳に器質的障害のある患者[作用が強くあらわれる。]
- 乳児、幼児[作用が強くあらわれる。]
- 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
- 衰弱患者[作用が強くあらわれる。]
- 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

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。

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。

注1) 要指示医薬品: 注意-医師等の処方せん・指示により使用すること。

(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。
** マレイン酸フルボキサミン	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65%減少することが報告されている。
塩酸マプロチリン	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塩酸マプロチリン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	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ため、発現頻度については文献等を参考に集計した。(再審査対象外)

(1) 重大な副作用 (いずれも頻度不明)・

- 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、用量を超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の中止により、痙攣発作、せん妄、振せん、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。
- 統合失調症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。
- 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・

	0.1～5%未満	0.1%未満
1)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、振せん	霧視、複視、多幸症
2)肝臓 ^{注2)}		黄疸
3)血液 ^{注2)}		顆粒球減少、白血球減少
4)循環器	頻脈、血圧低下	
5)消化器	悪心、嘔吐、食欲不振、便秘、口渇	
6)過敏症 ^{注3)}	発疹	
7)その他	倦怠感、脱力感、浮腫	

注2) 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3) 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カ月以内)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まわると判断される場合にのみ投与すること。[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まわ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ある。]

(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、振せん、過緊張等)があらわれることがある。

(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。

【薬効薬理】

1. 馴化、鎮静作用・

大脳辺縁系に特異的に作用し²⁾、正常な意識・行動に影響をおよぼすことなく、馴化、鎮静作用をあらわす。

- 粗暴猿、闘争マウスに対する馴化作用³⁾
- ラット³⁾、ウサギ⁴⁾における条件刺激に対する回避行動の抑制作用
- 中隔野損傷ラットの興奮に対する鎮静作用³⁾

2. 筋弛緩作用

主として脊髄反射を抑制することにより³⁾筋の過緊張を緩解する。

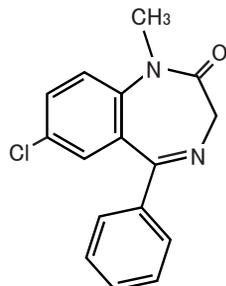
●マウス傾斜板法、除脳硬直ネコ³⁾

3. 抗痙攣作用

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て抗痙攣作用を示す(マウス)。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

化学構造式:



一般名:ジアゼパム(diazepam)[JAN]

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

分子式: C₁₆H₁₃ClN₂O

分子量: 284.74

融点: 130~134°C

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。

【包装】

2mg錠 : 100錠(10錠×10)、500錠(バラ)、
1,000錠(10錠×100)、2,100錠(21錠×100)

5mg錠 : 100錠(10錠×10)、500錠(バラ)、
1,000錠(10錠×100)、2,100錠(21錠×100)

10mg錠: 100錠(バラ、10錠×10)

散 1% : 100g、500g(100g×5)

【主要文献】

- 1) Arrigo, A. et al.: Arch. Intern. Pharmacodyn., **154**:364, 1965.
- 2) Brockmann, A. W.: Arch. Pharm., **299**:229, 1966.
- 3) Randall, L. O. et al.: Curr. Ther. Res. Clin. Exp., **3**:405, 1961.
- 4) 宇根岡啓基: 脳と神経, **21**:129, 1969.
- 5) Ngai, S. H. et al.: J. Pharmacol. Exp. Therap., **153**:344, 1966.

【文献請求先】

武田薬品工業株式会社

医薬開発本部 日本開発センター 医薬情報部

〒540-8645 大阪府中央区道修町四丁目1番1号

製造発売元

武田薬品工業株式会社

〒540-8645 大阪府中央区道修町四丁目1番1号