

日本標準商品分類番号
872172、871249

貯法	室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

脳・末梢血行動態改善剤、子宮鎮痙剤

**日本薬局方 イソクスプリン塩酸塩錠

ズファジラン®錠10mg

DUVADILAN® TABLETS

**承認番号	22000AMX00798
**薬価収載	2008年6月
**販売開始	2008年6月
再評価結果	1990年9月
効能追加	1964年3月

【組成・性状】

**1. 組成

1 錠中に次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
ズファジラン錠10mg	イソクスプリン塩酸塩(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

2. 製剤の性状

販売名	剤形	色	外形			識別コード
			直径(mm)	厚さ(mm)	重さ(mg)	
ズファジラン錠10mg	素錠(割線入)	白色		304	235	304
			9.0			

【効能・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、レイノー病及びレイノー症候群、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

【用法・用量】

- 循環器領域の適応には、イソクスプ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。
 - 子宮収縮の抑制には、イソクスプ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。
 - 月経困難症には、イソクスプ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。

【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
 - (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。]
 - (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。]
 - (3) 脳出血のある患者[症状が悪化するおそれがある。]
 - (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。]
- 重要な基本的注意
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。
- 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
β刺激薬	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	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。

4. 副作用[文献集計による(再審査対象外)]

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.1~1%未満	0.1%未満	頻度不明 ^(注)
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	

(注) 自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠12週未満の妊婦には投与しないこと。(12週未満の投与に関する安全性は確立していない。)

7. 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。)

【薬物動態】

イソクスプリンを経口投与した場合、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る。血漿中からの半減期は約1.5時間である。

【薬効薬理】

- 血液レオロジー的性状の改善作用
経口投与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する^{1~4)}。また、脳循環障害例に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ている⁵⁾。
- 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⁶⁾(イヌ)。臨床的には脳及び末梢の血液循環動態を改善する⁷⁾。
- 子宮筋弛緩作用
子宮筋の薬物受容体に直接作用し、β-mimetic作用(β受容体刺激作用)を主とした平滑筋弛緩作用を示す⁸⁾(ラット)。臨床的には子宮筋の異常収縮及び痙攣を改善する^{9,10)}。

**【有効成分に関する理化学的知見】

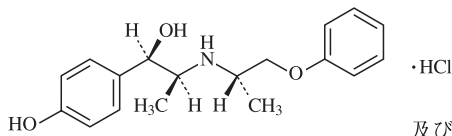
一般名：イソクスプリン塩酸塩 (Isoxsuprine Hydrochloride)

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

分子式：C₁₈H₂₃NO₃ · HCl

分子量：337.84

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℃(分解)

**【包装】

ズファジラン錠10mg (PTP) 1000錠
(プラスチックボトル) 100錠

(日本薬局方イソクスプリン塩酸塩錠)

【主要文献】

- 1) Schlichting K, et al. : VASA 1976 ; 5(1) : 51-53
- 2) de Quiros JF, et al. : Fortschr Med. 1976 ; 94(29) : 1661-1664
- 3) Di Perri T, et al. : Pharmatherapeutica 1977 ; 1(7) : 447-452
- 4) Di Perri T, et al. : Br J Clin Pharmacol. 1978 ; 5(3) : 255-260
- 5) 小松俊一ほか : Prog Med. 1982 ; 2(7) : 1123-1130
- 6) Manley ES, et al. : Arch Int Pharmacodyn. 1968 ; 175(1) : 239-250
- 7) Elliott CG, et al. : Curr Med Res Opin. 1973 ; 1(9) : 554-562
- 8) Amer MS, et al. : J Pharmacol Exp Ther. 1974 ; 190(2) : 243-248
- 9) Leep JH, et al. : West J Surg Obstet Gynecol. 1963 ; 71(6,8) : 103-104
- 10) 千村哲朗ほか : 産婦人科の世界 1993 ; 45(3) : 237-255

*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

第一三共株式会社 製品情報センター

〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3-5-1

TEL : 0120-189-132



製造販売元

第一三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3-5-1