

貯法：室温保存  
有効期間：3年

向精神薬(第三種)  
処方箋医薬品<sup>注)</sup>

# メダゼパム錠2（ツルハラ）

# メダゼパム錠5（ツルハラ）

## Medazepam Tablets（TSURUHARA）

	錠2	錠5
承認番号	15600AMZ0 0424000	15400AMZ0 1723000
販売開始	1984年6月	1984年6月

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

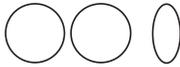
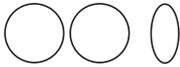
- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 急性閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕
- 2.3 重症筋無力症の患者〔重症筋無力症の症状を悪化させるおそれがある。〕

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

販売名	メダゼパム錠2（ツルハラ）	メダゼパム錠5（ツルハラ）
有効成分	1錠中メダゼパム2mg	1錠中メダゼパム5mg
添加剤	青色1号、乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、白糖、沈降炭酸カルシウム、アラビアゴム末、ヒプロメロース、マクロゴール6000、硫酸カルシウム、ポリオキシエチレン(105)、ポリオキシプロピレン(5)、グリコール、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ	黄色4号（タートラジン）、青色1号、乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、白糖、沈降炭酸カルシウム、アラビアゴム末、ヒプロメロース、マクロゴール6000、硫酸カルシウム、ポリオキシエチレン(105)、ポリオキシプロピレン(5)、グリコール、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ

### 3.2 製剤の性状

販売名	メダゼパム錠2（ツルハラ）	メダゼパム錠5（ツルハラ）
剤形	糖衣錠	糖衣錠
色調	淡青色	淡緑色
外形		
大きさ	直径	約6.0mm
	厚さ	約3.9mm
質量	約100mg	約100mg

## 4. 効能又は効果

- 神経症における不安・緊張・抑うつ
- 心身症（消化器疾患、循環器疾患、内分泌系疾患、自律神経失調症）における身体症候ならびに不安・緊張・抑うつ

## 6. 用法及び用量

通常成人はメダゼパムとして1日10～30mgを経口投与する。  
ただし、年齢、症状により適宜増減する。

## 8. 重要な基本的注意

- 8.1 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。
- 8.2 連用により薬物依存を生じることがあるので、漫然とした継続投与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続する場合には、治療上の必要性を十分に検討すること。〔11.1.1 参照〕

## 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 心障害のある患者

症状が悪化するおそれがある。

#### 9.1.2 脳に器質的障害のある患者

作用が強くあらわれる。

#### 9.1.3 衰弱者

作用が強くあらわれる。

#### 9.1.4 中等度又は重篤な呼吸不全のある患者

呼吸不全を増悪するおそれがある。

## 9.2 腎機能障害患者

一般に排泄が遅延する傾向があるので、薬物の体内蓄積による副作用の発現に注意すること。

## 9.3 肝機能障害患者

一般に排泄が遅延する傾向があるので、薬物の体内蓄積による副作用の発現に注意すること。

## 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

### 9.5.1 妊娠中に他のベンゾジアゼピン系薬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。

### 9.5.2 ベンゾジアゼピン系薬剤で新生児に哺乳困難、嘔吐、活動低下、筋緊張低下、過緊張、嗜眠、傾眠、呼吸抑制・無呼吸、チアノーゼ、易刺激性、神経過敏、振戦、低体温、頻脈等を起こすことが報告されている。なお、これらの症状は、離脱症状あるいは新生児仮死として報告される場合もある。また、ベンゾジアゼピン系薬剤で新生児に黄疸の増強を起こすことが報告されている。

### 9.5.3 分娩前に連用した場合、出産後新生児に離脱症状があらわれることが、ベンゾジアゼピン系薬剤で報告されている。

## 9.6 授乳婦

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薬剤（ジアゼパム）で報告されている。また、黄疸を増強する可能性がある。

## 9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

## 9.8 高齢者

少量から投与を開始するなど注意すること。運動失調等の副作用があらわれやすい。

## 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
アルコール 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	中枢神経抑制作用が増強されることがあるので、投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与すること。	共に中枢神経抑制作用を有する。
MAO阻害剤		本剤の代謝が抑制される。
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。

## 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。

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 依存性（0.1%未満）

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、用量及び使用期間に注意し慎重に投与すること。また、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（0.1%未満）、譫妄、振戦、不眠、不安、幻覚、妄想等の離脱症状（0.1～5%未満）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。  
〔8.2 参照〕

#### 11.1.2 刺激興奮、錯乱（いずれも頻度不明）

## 11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症		発疹等	
精神神経系	眠気	ふらつき、眩暈、歩行失調、頭重	気分昂揚感、調節障害、振戦、しびれ、浅眠多夢、言語障害
肝臓			黄疸、Al-P上昇
血液			貧血、白血球減少
循環器			発汗、熱感、のぼせ
消化器		食欲不振、便秘、下痢、悪心・嘔吐、胸やけ、胃腸障害、口渇	
骨格筋		筋弛緩、易疲労感等の筋緊張低下症状	
その他		尿蛋白	浮腫、性欲への影響、生理異常

## 13. 過量投与

### 13.1 処置

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を必ず読むこと。

## 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。

## 15. その他の注意

### 15.1 臨床使用に基づく情報

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。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

#### 16.1.1 単回投与

(1) 健康成人男性4例にメダゼパム錠10mgを軽食2時間後単回経口投与した。メダゼパムの薬物動態パラメータを表に示す<sup>1)</sup>（外国人データ）。

薬物動態パラメータ

投与量 (mg)	n	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)
10	4	0.14～0.26	0.5～1.5

(測定法：GLC)

(2) メダゼパムの主活性代謝物のジアゼパムは0.5時間後から検出され、少なくとも48時間は低い濃度を維持した。同じくN-デスメチルジアゼパムは0.5～9時間後に出現し、24～72時間以上にわたってジアゼパムより血漿中濃度が高かった<sup>2)</sup>。

### 16.4 代謝

N-脱メチル化によりN-デスメチルメダゼパムを生じる経路と、酸化によりジアゼパムを生成し更にN-脱メチル化されN-デスメチルジアゼパムを生成する経路がある<sup>2)</sup>（外国人データ）。

### 16.5 排泄

健康成人2例に<sup>14</sup>C-標識メダゼパム30mgを単回経口投与後、尿中及び糞中排泄率を測定した。1例は18日間の尿中及び糞中排泄率がそれぞれ62.6%、22.1%、他例は24日間の測定値がそれぞれ55.6%、7.8%であった<sup>2)</sup>（外国人データ）。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

作用部位は、大脳辺縁系（扁桃核、海馬）、視床下部、脊髄のGABAニューロンシナプス後膜である<sup>3)</sup>。GABAニューロンの機能増強を介して、大脳辺縁系、視床下部の過剰興奮を鎮めることにより、抗不安作用、鎮静・催眠作用、抗痙攣作用、自律神経調整作用等を示す<sup>3)-5)</sup>。

## 18.2 薬理作用

各動物実験（ラット、マウス）において、クロルジアゼポキシド、ジアゼパムとの効力比は表のとおりであった<sup>6)</sup>。

クロルジアゼポキシド、ジアゼパムとの効力比

項目	動物	クロルジアゼポキシド	メダゼパム	ジアゼパム	
条件反射抑制作用	弁別回避	ラット	1	>1	—
	非弁別回避 (1レバー型)	ラット	1	1	1
	非弁別回避 (2レバー型)		1	1	—
馴化作用	ラット	1	1	>1	
自発運動抑制作用	マウス	1	0.7	3.6	
懸垂試験	マウス	1	0.9	3.2	
回転棒試験	マウス	1	0.7	1.9	
強化麻酔作用	マウス	1	0.8	1.9	
体温下降作用	マウス	1	1	>1	
抗痙攣作用	抗最大電撃痙攣作用	マウス	1	0.5	3.0
	抗メトラゾール痙攣作用		1	2.3	5.3

(クロルジアゼポキシドのED<sub>50</sub>値で各薬剤のED<sub>50</sub>値を除いた値)

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：メダゼパム（Medazepam）

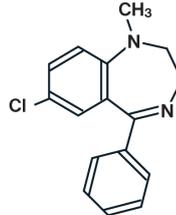
化学名：7-Chloro-1-methyl-5-phenyl-2,3-dihydro-1H-1,4-benzodiazepine

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>15</sub>ClN<sub>2</sub>

分子量：270.76

性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。メタノール、エタノール（99.5）、酢酸（100）又はジエチルエーテルに溶けやすく、水にほとんど溶けない。光によって徐々に黄色に着色する。

化学構造式：



融点：101～104℃

## 20. 取扱い上の注意

光により錠剤表面の色が退色することがあるので、アルミ袋開封後は、遮光して保存すること。なお、退色しても主成分には影響はない。

## 22. 包装

〈メダゼパム錠2（ツルハラ）〉

PTP：100錠（10錠×10）、1,000錠（10錠×100）

〈メダゼパム錠5（ツルハラ）〉

PTP：100錠（10錠×10）、1,000錠（10錠×100）

## 23. 主要文献

- 1) Hailey, D. M., et al.: Br. J. Anaesth. 1979; 51: 493-496
- 2) Rieder, J., et al.: Arzneim.-Forsch. 1968; 18 (12): 1545-1556
- 3) 田中正敏: 精神医学. 1994; 36 (1): 43-48
- 4) 山本研一, 他: 応用薬理. 1971; 5 (3): 377-387
- 5) 城戸良之助, 他: 応用薬理. 1972; 6 (4): 627-633
- 6) 城戸良之助, 他: 応用薬理. 1970; 4 (2): 185-193

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

鶴原製薬株式会社 医薬情報部  
〒563-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号  
TEL: 072-761-1456 (代表) FAX: 072-760-5252

## 25. 保険給付上の注意

本剤は厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）に基づき、1回30日分を限度として投薬する。

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**鶴原製薬株式会社**

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号