

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。)

セルシン®注射液 5mg セルシン®注射液 10mg 「タケダ」

CERCINE® INJECTION 5mg. & 10mg.

ジアゼパム注射液

	承認番号	薬価収載	販売開始
5mg	21300AMZ00651	2001年9月	1971年2月
10mg	21300AMZ00652	2001年9月	1969年10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。]
- (2)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。]
- (3)ショック、昏睡、バイタルサインの悪い急性アルコール中毒の患者 [ときに頻脈、徐脈、血圧低下、循環性ショックがあらわれることがある。]
- (4)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]

【組成・性状】

	セルシン注射液 5 mg	セルシン注射液 10 mg
容 量	1 管 1 mL	1 管 2 mL
1 管 中 の 有 効 成 分	ジアゼパム 5 mg	ジアゼパム 10mg
性 状	淡黄色～黄色澄明なわずかに粘性のある注射液	
pH	6.0～7.0	
浸 透 圧 比	約30 (生理食塩液に対する比)	

添加物：本剤1管中にベンジルアルコール(5mg：0.015mL、10mg：0.03mL)、プロピレングリコール(5mg：0.4mL、10mg：0.8mL)、無水エタノール(5mg：0.1mL、10mg：0.2mL)、安息香酸(5mg：42.8mg、10mg：85.6mg)、水酸化ナトリウム(5mg：13.05mg、10mg：26.1mg)、pH調整剤を含有

【効能・効果】

神経症における不安・緊張・抑うつ

下記疾患及び状態における不安・興奮・抑うつ軽減

- 麻酔前、麻酔導入時、麻酔中、術後
- アルコール依存症の禁断(離脱)症状
- 分娩時

てんかん様重積状態におけるけいれんの抑制

【用法・用量】

本剤は、疾患の種類、症状の程度、年齢及び体重などを考慮して用いる。

一般に成人には、初回2mL(ジアゼパムとして10mg)を静脈内又は筋肉内に、できるだけ緩徐に注射する。以後、必要に応じて3～4時間ごとに注射する。

静脈内に注射する場合には、なるべく太い静脈を選んで、できるだけ緩徐に(2分間以上の時間をかけて)注射する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

- (1)低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児には、筋肉内注射しないこと。
- (2)痙攣の抑制のために本剤を投与する時、特に追加投与を繰り返す際には、呼吸器・循環器系の抑制に注意すること。

【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、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。]
- (2)脳に器質的障害のある患者 [作用が強くあらわれる。]
- (3)乳児、幼児 [作用が強くあらわれる。]
- (4)高齢者 [「高齢者への投与」の項参照]
- (5)衰弱患者 [作用が強くあらわれる。]
- (6)高度重症患者、呼吸予備力の制限されている患者 [静脈内注射時、無呼吸、心停止が起こり易い。]

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。

(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。
フルボキサミンマレイン酸塩	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。

マプロチリン塩酸塩	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マプロチリン塩酸塩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水和物	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

承認時までの調査では1,221例中315例(25.8%)に、市販後の副作用の頻度調査(1973年9月時点)では1,091例中263例(24.1%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

(1) 重大な副作用

- ※(1) 大量連用により、**薬物依存**(頻度不明)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、振戦、不眠、不安、幻覚、妄想等の**離脱症状**(頻度不明)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) **舌根の沈下による上気道閉塞**(0.1～5%未満)が、また、慢性気管支炎等の呼吸器疾患に用いた場合、**呼吸抑制**(頻度不明)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。
- ※(3) 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**(0.1～5%未満)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。
- ※(4) **循環性ショック**(頻度不明)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

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満
1) 精神神経系	眠気	ふらつき、眩暈、頭痛、言語障害	振戦、複視、霧視、眼振、失神、失禁、歩行失調、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		血圧低下	頻脈、徐脈
5) 消化器		悪心、嘔吐、便秘、口渇	食欲不振
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。[ベンゾジアゼピン系化合物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。ベンゾジアゼピン系化合物で新生児に黄疸の増強を起こすことが報告されている。また、分娩時に静脈内注射した例にSleeping babyが報告されている。]

※(3) 分娩前に連用した場合、出産後新生児に離脱症状があらわれることが、ベンゾジアゼピン系化合物で報告されている。

(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

(1) 投与経路

- 経口投与が困難な場合や、緊急の場合、また、経口投与で効果が不十分と考えられる場合にのみ使用すること。なお、経口投与が可能で効果が十分と判断された場合には、速やかに経口投与にきりかえること。
- 投与経路は静脈内注射を原則とすること。

(2) 投与方法

- 筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響を避けるため下記の点に注意すること。
 - 筋肉内注射は、やむを得ない場合にのみ、必要最少限に行うこと。なお、特に同一部位への反復注射は行わないこと。
 - 神経走行部位を避けるよう注意すること。
 - 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
- 急速に静脈内に注射した場合、あるいは細い静脈内に注射した場合には、血栓性静脈炎を起こすおそれがある。
- 動脈内に注射した場合には、末梢の壊死を起こすおそれがあるので、動脈内には絶対に注射しないこと。

(3) 投与部位

静脈内注射時に血管痛が、また、筋肉内注射時に注射部痛、硬結がみられることがある。

(4) 配合変化

他の注射液と混合又は希釈して使用しないこと。

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^{1,2)}、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⁵⁾ 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

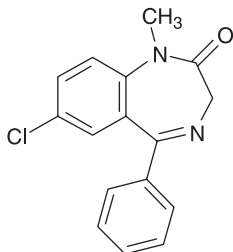
ストリキニーネ痙攣、メトラゾール痙攣、電気ショック痙攣に対して抗痙攣作用を示す(マウス)。³⁾

4. 子宮筋弛緩作用

子宮筋に作用して、子宮筋の異常緊張を除去する (マウス摘出子宮、ヒト子宮)。⁶⁾

【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-methyl-5-phenyl-1,3-dihydro-2H-1,4-benzodiazepin-2-one

分子式：C₁₆H₁₃ClN₂O

分子量：284.74

融 点：130～134℃

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。

【取扱い上の注意】

【注意】本品は「ワンポイントカットアンプル」を使用しているので、ヤスリを用いず、アンプル枝部のマーク（白）の反対方向に折り取ること。

【包 装】

5 mg ・ 1 mL：10管

10mg ・ 2 mL：10管

【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.
- 6) 井 上 正 二 他：診療と新薬, **2** : 979, 1965.

*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

武田薬品工業株式会社 医薬学術部 くすり相談室

〒103-8668 東京都中央区日本橋二丁目12番10号

フリーダイヤル 0120-566-587

受付時間 9:00～17:30 (土日祝日・弊社休業日を除く)

製造販売元

武田薬品工業株式会社

〒540-8645 大阪市中央区道修町四丁目1番1号

D9