



※2023年2月改訂(第14版)
※2019年8月改訂

マイナートランクライザー

日本標準商品分類番号 871124

向精神薬 処方箋医薬品^{注1)}

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

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)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)、ニルマトレルビル・リトナビルを投与中の患者(「相互作用」の項参照)

【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[作用が強くなる。]
 - (3)乳児、幼児[作用が強くなる。]
 - (4)高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
 - (5)衰弱患者[作用が強くなる。]
 - (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

- (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。**
- (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(「重大な副作用」の項参照)。

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 ノビーア® ニルマトレルビル・リトナビル パキロビッド®	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 オピオイド鎮痛剤	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、エソメプラゾール、ランソプラゾール	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。本剤の代謝、排泄を遅延させるおそれがある。
** 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。

【組成・性状】

	セルシン注射液 5mg	セルシン注射液 10mg
容量	1管 1mL	1管 2mL
有効成分	ジアゼパム 5mg	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・抑うつ等の軽減

- 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。

注1) 処方箋医薬品：注意—医師等の処方箋により使用すること

	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。
**	強いCYP3Aを阻 害する薬剤 コピシタット を含有する 製剤、ポリコ ナゾール等	本剤の血中濃度が 上昇する可能性が ある。	これら薬剤のCYP3A 阻害作用により、本剤 の代謝が阻害されるた め。
**	CYP3A4で代謝さ れる薬剤 アゼルニジピ ン、ホスアン プレナビル等	本剤又はこれらの 薬剤の作用が増強 されるおそれがある。	本剤とこれらの薬剤が CYP3A4を競合的に阻 害することにより、相 互のクリアランスが低 下すると考えられる。
**	エトラピリン	本剤の血中濃度が 上昇する可能性が ある。	エトラピリンの CYP2C9、CYP2C19阻 害作用により、本剤の 代謝が阻害される。
	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 りあわられることが 考えられている。
**	ミルタザピン	鎮静作用が増強さ れるおそれがある。 また、ミルタザピ ンとの併用により 精神運動機能及び 学習獲得能力が減 退するとの報告が ある。	相加的な鎮静作用を示 すことが考えられる。
**	バルプロ酸ナトリ ウム	本剤の作用が増強 することがある。	本剤の非結合型の血中 濃度を上昇させる。
**	ダントロレンナト リウム水和物、 ボツリヌス毒素製 剤	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。
**	リファンピシン	本剤の血中濃度が 低下し、作用が減 弱するおそれがある。	リファンピシンの CYP3A4誘導作用によ り、本剤の代謝が誘導 され、血中濃度が低下 する可能性がある。
**	アパルタミド	本剤の血中濃度が 低下し、作用が減 弱するおそれがある。	アパルタミドの CYP2C19誘導作用に より、本剤の代謝が誘 導され、血中濃度が低 下する可能性がある。
**	シナカルセット、 エボカルセット	これら薬剤の血中 濃度に影響を与え るおそれがある。	血漿蛋白結合率が高い ことによる。
**	無水カフェイン	本剤の血中濃度が 減少することがあ る。	不明

4. 副作用

承認時までの調査では1,221例中315例(25.8%)に、製造販売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) 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、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) **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. 小児等への投与

低出生体重児、新生児に使用する場合には十分注意すること。[外国において、ベンジルアルコールの静脈内大量投与(99~234mg/kg)により、中毒症状(あえぎ呼吸、アシドーシス、痙攣等)が低出生体重児に発現したとの報告がある。本剤は添加剤としてベンジルアルコールを含有している。]

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

(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切りかえること。
- 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。
 - ①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。
 - ②神経走行部位を避けるよう注意すること。
 - ③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。

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

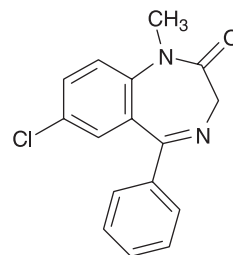
ストリキニーネ痙攣、メトラゾール痙攣、電気ショック痙攣に対して抗痙攣作用を示す(マウス)³⁾

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、味は僅かに苦い。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】

主要文献欄に記載の文献は下記にご請求下さい。
 武田テバ薬品株式会社 武田テバDIセンター
 〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
 TEL 0120-923-093
 受付時間 9:00~17:30(土日祝日・弊社休業日を除く)

販売

武田薬品工業株式会社

大阪市中央区道修町四丁目1番1号

製造販売元

武田テバ薬品株式会社

大阪市中央区道修町四丁目1番1号