

脳・末梢血行動態改善剤、子宮鎮痙剤  
イソクスプリン塩酸塩注

日本標準商品分類番号  
872172、871249

劇薬  
処方箋医薬品<sup>注)</sup>

**ズファジラン<sup>®</sup>筋注5mg**

DUVADILAN<sup>®</sup> Intramuscular Injection 5mg

貯 法：室温保存

有効期間：3年

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

|      |               |
|------|---------------|
| 承認番号 | 22100AMX00857 |
| 販売開始 | 1963年5月       |

**2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）**

- 1 脳出血のある患者〔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 胎盤の早期剥離患者〔疼痛、出血、止血障害、急性貧血及びショック症状等が悪化するおそれがある。〕
- 4 妊娠12週未満の妊婦〔9.5参照〕

**3. 組成・性状**

**3.1 組成**

| 販売名         | 有効成分                         | 添加剤                      |
|-------------|------------------------------|--------------------------|
| ズファジラン筋注5mg | 1アンプル(1mL)中イソクスプリン塩酸塩(日局)5mg | 1アンプル(1mL)中濃グリセリン 25.2mg |

**3.2 製剤の性状**

| 販売名         | 性状     | pH      | 浸透圧比<br>(生理食塩液対比) |
|-------------|--------|---------|-------------------|
| ズファジラン筋注5mg | 無色澄明の液 | 4.9～6.0 | 約1                |

**4. 効能又は効果**

- 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、レイノー病およびレイノー症候群、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、過強陣痛)
- 月経困難症

**6. 用法及び用量**

〈循環器領域の適応の重症・急性〉

イソクスプリン塩酸塩として通常成人1回5～10mgを1日2～3回筋肉内注射する。

〈子宮収縮の抑制〉

イソクスプリン塩酸塩として通常1回5～10mgを1～2時間ごとに筋肉内注射する。

〈月経困難症の重症〉

イソクスプリン塩酸塩として通常1回5～10mgを筋肉内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

また、いずれの場合も症状がおさまったら経口投与に切り替えること。

**7. 用法及び用量に関連する注意**

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。

**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。

**9.1.2 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。

**9.5 妊婦**

妊娠12週未満の妊婦には投与しないこと。〔2.4参照〕

**9.6 授乳婦**

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

**9.8 高齢者**

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下していることが多い。

**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               |
|------------------|--------------------|-----------------------|
| β刺激薬<br>サルブタモール等 | 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<br>メトプロロール等 | 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。  |

**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。

**11.2 その他の副作用**

|       | 頻度不明           |
|-------|----------------|
| 消化器   | 悪心、嘔吐          |
| 循環器   | 心悸亢進、血圧低下、顔面潮紅 |
| 精神神経系 | めまい、眠気         |
| 皮膚    | 発疹等            |
| その他   | 月経過多           |

**14. 適用上の注意**

**14.1 薬剤投与時の注意**

14.1.1 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次の点に注意すること。

- ・ 注射部位については、神経走行部位を避けて慎重に投与すること。
- ・ くりかえし注射する場合には、左右交互に注射するなど、同一部位を避けること。なお、小児等には特に注意すること。
- ・ 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。

**15. その他の注意**

**15.1 臨床使用に基づく情報**

海外で本剤の点滴静注により、新生児に低血糖症、腸閉塞があらわれたとの報告がある。

**16. 薬物動態**

**16.1 血中濃度**

イソクスプリンを筋肉内注射したところ、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た。血漿中からの半減期は約1.5時間であった。

**18. 薬効薬理**

**18.1 作用機序**

イソクスプリン塩酸塩には中枢作用、神経節遮断作用及び副交感神経興奮作用はなく、血管平滑筋のアドレナリン系薬物受容体のβ-受容体を興奮させ、α-受容体を抑制する。microcirculatory regulatorとして働き、脳・末梢血行動態を改善する<sup>1,2)</sup>。また子宮筋に対しても鎮痙作用を示す。

## 18.2 血液レオロジー的性状の改善作用

末梢閉塞性動脈疾患患者への点滴静注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した<sup>3-5)</sup>。

また、脳循環障害患者に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た<sup>6)</sup>。

## 18.3 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<sup>7)</sup> (イヌ)。また、脳血管疾患患者を対象とした海外臨床試験において、脳及び末梢の血液循環動態を改善した<sup>8)</sup>。

## 18.4 子宮筋弛緩作用

子宮筋の薬物受容体に直接作用し、 $\beta$ 受容体刺激作用を主とした平滑筋弛緩作用を示す<sup>9)</sup> (ラット)。また、切迫流産患者を対象とした国内及び海外臨床試験において、子宮筋の異常収縮及び痙攣を改善した<sup>10)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

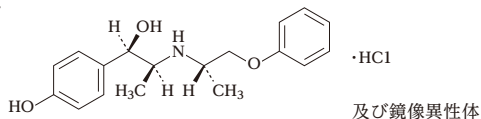
一般的名称：イソクスプリン 塩酸塩  
(Isoxsuprine Hydrochloride)

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

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>23</sub>NO<sub>3</sub> · HCl

分子量：337.84

化学構造式：



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)

## 22. 包装

1mL [20アンプル]

## 23. 主要文献

- 1) Ariëns, E. J. et al. : Arzneimittelforschung. 1963 ; 13 : 541-546
- 2) Waelen, M. J. et al. : Arzneimittelforschung. 1964 ; 14 : 11-19
- 3) Schlichting, K. et al. : VASA. 1976 ; 5(1) : 51-53
- 4) de Quiros, J. F. et al. : Fortschr Med. 1976 ; 94(29) : 1661-1664
- 5) Di Perri, T. et al. : Br J Clin Pharmacol. 1978 ; 5(3) : 255-260
- 6) 小松俊一 他 : Prog Med. 1982 ; 2(7) : 1123-1130
- 7) Manley, E. S. et al. : Arch Int Pharmacodyn. 1968 ; 175(1) : 239-250
- 8) Elliott, C. G. et al. : Curr Med Res Opin. 1973 ; 1(9) : 554-562
- 9) Amer, M. S. et al. : J Pharmacol Exp Ther. 1974 ; 190(2) : 243-248
- 10) 千村哲朗 他 : 産婦人科の世界. 1993 ; 45(3) : 237-255

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部  
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号  
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**alfresa** アルフレッサ ファーマ株式会社  
大阪市中央区石町二丁目2番9号

®登録商標