

**2011年8月改訂(第9版)
*2008年12月改訂

日本標準商品分類番号
872171

使用期限 外箱、容器に使用期限を表示

* 承認番号	22000AMX01985000
* 薬価収載	2008年12月
販売開始	1960年5月
再評価結果	1998年3月

処方せん医薬品^(注)

* ペルサンチン[®] 静注10mg

Persantin[®] Injection 10mg

(ジピリダモール製剤)



®=登録商標

(注) 注意-医師等の処方せんにより使用すること

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

* 販売名	ペルサンチン静注10mg
成分・含量	1管(2mL)中ジピリダモール 10mg
添加物	酒石酸 4mg、マクロゴール600 100mg、希塩酸 適量
剤形	無色アンプル入り注射剤 アンプル上部に赤色カラーリング
内容物	黄色注射液
pH	2.5~3.0
浸透圧比	約0.5

【効能・効果】

狭心症、心筋梗塞、その他の虚血性心疾患、うっ血性心不全

【用法・用量】

ジピリダモールとして、通常成人1回10mgを1日1~3回徐々に静脈内注射する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【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) 低血圧の患者
[更に血圧を低下させることがある。]
- (2) 心筋梗塞の急性期の患者
[血圧低下により症状を悪化させるおそれがある。]
- (3) 重篤な冠動脈疾患(不安定狭心症、亜急性心筋梗塞、左室流出路狭窄、心代償不全等)のある患者
[症状を悪化させることがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1) 本薬の経口剤を投与中の患者に本剤を追加投与した場合、本剤の作用が増強され、副作用が発現するおそれがあるため、併用しないこと。(「過量投与」の項参照)
- (2) 本剤との併用によりアデノシンの有害事象が増強されることから、本剤を投与されている患者にアデノシン(アデノスキャン)を投与する場合は、12時間以上の間隔をあけること。(「相互作用」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
アデノシン (アデノスキャン)	完全房室ブロック、心停止等が発現することがある。本剤の投与を受けた患者にアデノシン(アデノスキャン)を投与する場合には少なくとも12時間の間隔をおく。もし完全房室ブロック、心停止等の症状があらわれた場合はアデノシン(アデノスキャン)の投与を中止する。	本剤は体内でのアデノシンの血球、血管内皮や各臓器での取り込みを抑制し、血中アデノシン濃度を増大させることによりアデノシンの作用を増強する。

(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
キサンチン系製剤 テオフィリン アミノフィリン	本剤の作用が減弱されるので、併用にあたっては患者の状態を十分に観察するなど注意すること。	テオフィリン等のキサンチン系製剤は、本剤のアデノシンを介した作用を阻害する。
アデノシン三リン酸二ナトリウム	本剤はアデノシンの血漿中濃度を上昇させ、心臓血管に対する作用を増強するので、併用にあたっては患者の状態を十分に観察するなど注意すること。	本剤は体内でのアデノシンの血球、血管内皮や各臓器での取り込みを抑制し、血中アデノシン濃度を増大させることによりアデノシンの作用を増強する。
降圧剤	本剤は降圧剤の作用を増強することがあるので、併用にあたっては患者の状態を十分に観察するなど注意すること。	本剤の血管拡張作用により、降圧剤の作用が増強されることがある。
** 抗凝固剤 ダビガトラン エデキシラン トヘパリン 等	出血傾向が増強するおそれがあるため、併用にあたっては患者の状態を十分に観察するなど注意すること。	これら薬剤は抗凝固作用を有するためと考えられる。

4. 副作用

調査症例148例(再評価結果)中副作用が報告されたのは、15例(10.1%)であった。主な副作用は、心悸亢進7件(4.73%)、頭痛5件(3.38%)、嘔気2件(1.35%)、胸部不快感1件(0.68%)であった。また、臨床検査値においては特に一定の傾向を示す変動は認められていない。

(1) 重大な副作用

- 1) 狭心症状の悪化(0.1%未満)：狭心症状が悪化することがあるので、このような場合には、投与を中止すること。
- 2) 出血傾向(頻度不明)：眼底出血、消化管出血、脳出血等の出血傾向があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 3) **血小板減少(頻度不明)**：血小板減少があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) **過敏症(頻度不明)**：気管支痙攣、血管浮腫、アナフィラキシー様症状等の過敏症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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2)その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^(注)		発疹	蕁麻疹
精神神経系	頭痛、めまい、熱感、倦怠感		
循環器	心悸亢進、胸部不快感		血圧低下
消化器	嘔気、嘔吐		
その他			胸痛、筋肉痛

注)発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

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

- (1)妊婦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回ると判断される場合にのみ投与すること。
[動物実験(マウス)でわずかに胎児への移行が報告されている。]
- (2)授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には、授乳を中止させること。
[動物実験(ウサギ)で母乳中へ移行することが報告されている。]

7. 過量投与

- (1)症状
本剤の過量投与により一過性の血圧低下、心停止、心臓死、致死性及び非致死性の心筋梗塞、胸痛/狭心症、心電図異常(ST低下、洞停止、心ブロック、徐脈、頻脈、細動等)、失神発作、脳血管障害(一過性脳虚血症、脳卒中等)、急性気管支痙攣があらわれることがある。
- (2)処置
一般的な対症療法が望ましいが、激しい胸痛が発現した場合は、アミノフィリンの静注等の適切な処置を行うこと。

8. 適用上の注意

- (1)投与時
急速に静脈内注射をすると、特に高血圧のある患者において血圧が下がることがあるので、ゆっくり注射すること。
- (2)調製時
ジピリダモールの化学的性質により配合変化を起こしやすいので、他の薬剤との混合注射はしないこと。なおブドウ糖注射液とは混合注射が可能である。
- (3)アンプルカット時
本剤は「ワンポイントカットアンプル」を使用しているので、カット部をエタノール綿等で清拭した後、ヤスリを用いず、アンプル枝部のマークの反対方向に折り取ること。

9. その他の注意

- (1)海外において慢性安定狭心症の患者を対象にβ遮断剤、カルシウム拮抗剤、および長時間型硝酸剤投与中の本剤の追加投与の効果を検討するため、二重盲検法にてジピリダモール徐放カプセル(1回200mg 1日2回)またはブラセボを24週間追加投与したところ、「運動耐容時間」に対する本剤の追加投与の効果は認められなかったとの試験成績がある。

- (2)本剤を承認外の薬物負荷試験の目的で承認用量を超えて静脈内投与した場合、一過性の血圧低下、心停止、心臓死、致死性及び非致死性の心筋梗塞、胸痛/狭心症、心電図異常(ST低下、洞停止、心ブロック、徐脈、頻脈、細動等)、失神発作、脳血管障害(一過性脳虚血症、脳卒中等)、急性気管支痙攣があらわれることがある。

【薬物動態】

代謝・排泄
健康成人にジピリダモール20mgを静脈内投与した場合、急速に組織へ移行する。半減期は24.6分である。
主代謝産物は、ジピリダモールのモノグルクロン酸抱合体であり、24時間尿中には未変化体は認められず、1～3%のモノグルクロン酸抱合体が認められる。¹⁾
[参考：1)は外国人でのデータ]

【臨床成績】

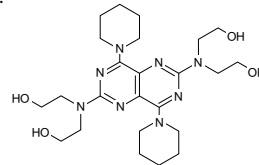
国内で実施された臨床試験の結果、承認された効能・効果に対する本剤の臨床効果が認められた。

【薬効薬理】

- 抗血小板作用**
血小板凝集能・粘着能及び放出反応等の血小板機能を抑制する(ウサギ^{2,3)})。
- 心筋保護作用**
ヒポキシアによる心筋内ATP濃度の低下及び心筋ミトコンドリアの形態学的変化を抑制する(イヌ^{4,5)})。
- 冠動脈の副血行路発達促進作用**
冠動脈の副血行路系の発達を促進する(ミニチュアピッグ⁶⁾)。
- 冠循環改善作用**
冠血管を選択的に拡張し、冠血流量を増加する(イヌ⁷⁾)。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ジピリダモール(JAN)
Dipyridamole(JAN)
化学名：2,2',2'',2'''-[4,8-Di(piperidin-1-yl)pyrimido[5,4-d]pyrimidine-2,6-diyl]dinitrilo]tetraethanol
化学構造式：



分子式：C₂₄H₄₀N₈O₄
分子量：504.63
性状：
・黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。
・クロロホルムに溶けやすく、メタノール又はエタノール(99.5)にやや溶けにくく、水又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。
融点：165～169℃

***【包装】**

ベルサンチン静注10mg：10管

【主要文献】

- 1) Beisenherz G et al : Arzneimittelforschung 10 : 307, 1960
- 2) 小山哲夫ほか：日腎誌 24 : 27, 1982
- 3) Philp R B et al : Nature 218 : 1072, 1968
- 4) Hockerts Th et al : Arzneimittelforschung 9 : 47, 1959
- 5) Lozada B B et al : Cardiologia 49 : 33, 1966
- 6) Nakagawa Y et al : Jpn J Pharmacol 29 : 271, 1979
- 7) Kadatz R : Arzneimittelforschung 9 : 39, 1959

【文献請求先】

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
DIセンター
〒141-6017 東京都品川区大崎2丁目1番1号
ThinkPark Tower
フリーダイヤル：0120-189-779
(受付時間) 9:00～18:00
(土・日・祝日・弊社休業日を除く)

製造販売
日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
東京都品川区大崎2丁目1番1号

0319