

不整脈治療剤

劇薬
処方箋医薬品^(注)

ピルシカイニド塩酸塩静注50mg「イセイ」

PILSICAINIDE HYDROCHLORIDE i.v. 50mg

(ピルシカイニド塩酸塩注射液)

日本標準商品分類番号	
872129	
承認番号	22000AMX01188000
薬価収載	2008年7月
販売開始	2008年9月

貯法：室温保存

使用期限：容器及び外箱に表示

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) うっ血性心不全のある患者〔不整脈（心室頻拍、心室細動等）の誘発又は増悪、陰性変力作用による心不全の悪化を来すおそれが高い。〕
- (2) 高度の房室ブロック、高度の洞房ブロックのある患者〔刺激伝導抑制作用により、これらの障害を更に悪化させるおそれがある。〕

【組成・性状】

販売名	ピルシカイニド塩酸塩静注50mg「イセイ」	
成分・含量	1管（5mL）中 ピルシカイニド塩酸塩水和物	50mg
添加物	D-ソルビトール pH調整剤	200mg 適量
性状・剤型	無色澄明の液（注射液）	
pH	4.8～6.5	
浸透圧 (生理食塩水に対する比)	約1	

【効能又は効果】

緊急治療を要する頻脈性不整脈（上室性及び心室性）

【用法及び用量】

期外収縮：通常、成人には1回0.075mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として0.75mg/kg）を必要に応じて日本薬局方生理食塩液又は5%ブドウ糖注射液などで希釈し、血圧ならびに心電図監視下に10分間で徐々に静注する。

なお、年齢、症状に応じて適宜減量する。

頻拍：通常、成人には1回0.1mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として1.0mg/kg）を必要に応じて日本薬局方生理食塩液又は5%ブドウ糖注射液などで希釈し、血圧ならびに心電図監視下に10分間で徐々に静注する。

なお、年齢、症状に応じて適宜減量する。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

1. 本剤を急速に静注した場合には、血中濃度が急激に上昇するので、本剤の投与に際しては**投与時間を厳守**すること。
2. 本剤の投与により効果を認めたものの、その後再発した場合には、初回用量がピルシカイニド塩酸塩水和物としての最大用量1.0mg/kg（頻拍）あるいは0.75mg/kg（期外収縮）の半量以下の場合を除き、再投与は行わないこと。
なお、再投与する際は1日総投与量としてピルシカイニド塩酸塩水和物の1回最大用量を超えないこと。

※【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) 基礎心疾患（心筋梗塞、弁膜症、心筋症等）のある患者（「重要な基本的注意」の項参照）
- (2) 心不全の既往のある患者〔心不全を来すおそれがある。〕
- (3) 刺激伝導障害（房室ブロック、洞房ブロック、脚ブロック等）のある患者〔刺激伝導抑制作用により、これらの障害を更に悪化させるおそれがある。〕
- (4) 著明な洞性徐脈のある患者〔高度の徐脈、洞停止を来すおそれがある。〕
- (5) 腎機能障害のある患者（「重要な基本的注意」の項参照）
- (6) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）
- (7) 重篤な肝機能障害のある患者〔AST（GOT）、ALT（GPT）、LDH等の上昇が報告されている。〕
- (8) 血清カリウム低下のある患者〔一般的に、血清カリウムの低下している状態では、催不整脈作用が発現するおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤の投与に際しては、患者の状態を観察し、必ず**心電図、脈拍、血圧等の連続監視**を行い、特に次の患者又は場合には慎重に観察しながら投与すること。また、PQの延長、QRS幅の増大、QTの延長、徐脈、血圧低下等の異常所見が認められた場合には、直ちに投与を中止すること。
 - 1) 基礎心疾患（心筋梗塞、弁膜症、心筋症等）があり、心不全を来すおそれのある患者（**心室頻拍、心室細動等**が発現するおそれが高い。）
 - 2) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）
 - 3) 他の抗不整脈薬との併用（有効性、安全性が確立していない。）
 - 4) 腎機能障害のある患者（本剤は腎臓からの排泄により体内から消失する薬剤であり、**血中濃度が高くなりやすく、また高い血中濃度が持続するおそれがある**ので患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。）
- (2) 発作性頻拍では投与中に不整脈が消失した場合は、患者の状態を観察しながら投与を終了すること。
- (3) 本剤は心臓ペースメーカー閾値を上昇させる可能性があるため、恒久的ペースメーカー使用中、あるいは一時的ペースメーカー中の患者に対しては十分注意して投与すること。異常が認められた場合には直ちに投与を中止すること。
- (4) 本剤が有効であり、かつ経口投与が可能となった後は速やかに経口投与に切り替えること。
- (5) 本剤の効果が発現が認められない場合は、他の治療方法に切り替えること。
- (6) 本剤投与後に他の抗不整脈薬の追加投与が必要な場合には、作用が増強する可能性があるため十分注意して投与すること。本剤投与後、心電図に変化が認められる間は特に注意して投与すること。

(7)本剤でBrugada症候群に特徴的な心電図変化（右脚ブロック及び右側胸部誘導（V₁～V₃）のST上昇）の顕在化、又はそれに伴う心室細動、心室頻拍、心室性期外収縮を発現させたとの報告があるので注意すること。

3. 相互作用

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
リファンピシン	本剤の作用を減弱させることがある。	リファンピシンによりチトクロームP450の産生が誘導され、本剤の代謝速度が促進し、血中濃度が低下する可能性が考えられている。
カルシウム拮抗薬（ベラパミル） β-受容体遮断薬（プロプラノロール） ジギタリス製剤（ジゴキシン） 硝酸・亜硝酸エステル系薬剤（ニトログリセリン）	動物実験（イヌ）において、本剤の作用が増強される可能性が報告されている。	機序は明らかではないが、本剤とこれらの薬剤との併用による作用増強の可能性が考えられている。
セチリジン	併用により両剤の血中濃度が上昇し、本剤の副作用が発現するおそれがある。	腎でのトランスポーターを介した排泄が競合するためと考えられている。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1)重大な副作用（頻度不明）

- 心室細動、心室頻拍（Torsades de pointesを含む）、洞停止、完全房室ブロック、失神、心不全：**このような副作用があらわれ、ショック、心停止に至る場合もあるので、心電図の連続監視等を行い、異常所見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。
- 急性腎不全：**ショック等による急性腎不全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

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

分類	頻度不明
循環器 ^{注1)}	QRS幅の増大、QT延長、徐脈、心室性期外収縮、上室性頻拍、胸部不快感、胸痛、血圧低下、房室ブロック、心房粗動、上室性期外収縮
消化器	口渇、悪心、嘔吐
精神・神経系	ふわふわ感
血液	白血球数減少、白血球数増加、好酸球増加、リンパ球減少、リンパ球増加
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、LDH上昇
過敏症	発疹
腎臓	BUN上昇、クレアチニン上昇、尿蛋白陽性
その他	CK(CPK)上昇、全身倦怠感

注1) 血圧測定、心電図検査を実施し異常所見が認められた場合には直ちに投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。

5. 高齢者への投与

高齢者では慎重に投与すること。[高齢者では肝・腎機能が低下していることが多く、また体重が少ない傾向があるなど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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、動物実験（ラット）で胎児に移行することが報告されている。]

(2)本剤投与中は授乳を避けさせること。[動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている。]

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

8. 過量投与

(1)**徴候・症状：**本剤の過量投与、高度の腎機能障害により、本剤の血中濃度が上昇した場合、刺激伝導障害（著明なQRS幅の増大等）、心停止、心不全、心室細動、心室頻拍（Torsades de pointesを含む）、洞停止、徐脈、ショック、失神、血圧低下等の循環器障害、構語障害等の精神・神経障害を引き起こすことがある。

(2)**処置等：**本剤の過量投与による兆候・症状がみられた場合には直ちに本剤の投与を中止し、次の処置を考慮する等適切な対症療法を行うこと。

- 体外ペーシングや直流除細動
- 血液透析による本剤の除去（本剤の血液透析による除去率は最大約30%と報告されている。）

9. 適用上の注意

アンプルカット時

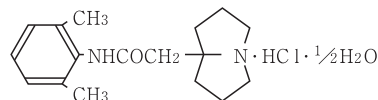
本剤はアンプルカット時のガラス片混入の少ないクリーンカットアンプルを使用しているが、さらに安全に使用するため、エタノール消毒綿等で清拭しカットすること。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ピルシカイニド塩酸塩水和物(Pilsicainide Hydrochloride Hydrate)

化学名：*N*-(2,6-dimethylphenyl)-8-pyrrolizidinylacetamide hydrochloride hemihydrate

構造式：



分子式：C₁₇H₂₄N₂O · HCl · 1/2H₂O

分子量：317.85

融点：210.5～213.5℃

性状：本品は白色の結晶性の粉末である。酢酸(100)に極めて溶けやすく、水、メタノール又はエタノール(95)に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

(安定性試験)

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、ピルシカイニド塩酸塩静注50mg「イセイ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。¹⁾

【包装】

ピルシカイニド塩酸塩静注50mg「イセイ」：5mL 10管

※※【主要文献】

1) コーアイセイ株式会社：社内資料（安定性試験）

※※【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

コーアイセイ株式会社 学術部

〒990-2495 山形市若葉町13番45号

TEL 023(622)7755

FAX 023(624)4717

※※

製造販売元



コーアイセイ株式会社

山形市若葉町13番45号