

トロンボキサン合成酵素阻害剤

処方箋医薬品*

日本薬局方 注射用オザグレルナトリウム

*オザグレルNa注射用20mg「SW」

*オザグレルNa注射用40mg「SW」

OZAGREL Na

日本標準商品分類番号

87219

	20mg	40mg
*承認番号	22300AMX00449000	22300AMX00450000
薬価収載	2011年11月	2011年11月
販売開始	2002年7月	2002年7月
効能追加	2003年1月	2003年1月

※注意 - 医師等の処方箋により使用すること

貯法：室温保存
使用期限：外箱等に表示

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 出血している患者：出血性脳梗塞、硬膜外出血、脳内出血又は原発性脳室内出血を合併している患者〔出血を助長する可能性がある。〕
- 2) 脳塞栓症の患者〔脳塞栓症の患者は出血性脳梗塞が発現しやすい。〕
- 3) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【原則禁忌】(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)

- 1) 脳塞栓症のおそれのある患者：心房細動、心筋梗塞、心臓弁膜疾患、感染性心内膜炎及び瞬時完成型の神経症状を呈する患者〔脳塞栓症の患者は出血性脳梗塞が発現しやすい。〕
- 2) 重篤な意識障害を伴う大便秘の患者〔大便秘の患者は出血性脳梗塞が発現しやすい。〕

【組成・性状】

品名	オザグレルNa注射用20mg「SW」	オザグレルNa注射用40mg「SW」
有効成分含量	1バイアル中 日局オザグレルナトリウム 20mg	1バイアル中 日局オザグレルナトリウム 40mg
添加物	pH調節剤	pH調節剤
剤形・性状	白色の塊又は粉末、凍結乾燥品 用時溶解して用いる注射剤	
pH	7.7～8.7(10mg/mL注射用水)	
浸透圧比	0.2～0.3(10mg/mL注射用水)	

(浸透圧比：生理食塩液に対する比)

【効能・効果】

1. クモ膜下出血術後の脳血管攣縮およびこれに伴う脳虚血症状の改善
2. 脳血栓症(急性期)に伴う運動障害の改善

【用法・用量】

1. クモ膜下出血術後の脳血管攣縮およびこれに伴う脳虚血症状の改善
通常成人に、オザグレルナトリウムとして1日量80mgを適当量の電解質液または糖液に溶解し、24時間かけて静脈内に持続投与する。投与はクモ膜下出血術後早期に開始し、2週間持続投与することが望ましい。なお、年齢、症状により適宜増減する。
2. 脳血栓症(急性期)に伴う運動障害の改善
通常成人に、オザグレルナトリウムとして1回量80mgを適当量の電解質液または糖液に溶解し、2時間かけて1日朝夕2回の持続静注を約2週間行う。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) 出血している患者：消化管出血、皮下出血等〔出血を助長する可能性がある。〕
- 2) 出血の可能性のある患者：脳出血の既往歴のある患者、重症高血圧患者、重症糖尿病患者、血小板の減少している患者等〔出血を助長する可能性がある。〕
- 3) 抗血小板剤、血栓溶解剤、抗凝血剤を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

2. 重要な基本的注意

本剤の投与により出血性脳梗塞、硬膜外出血、脳内出血を助長する可能性があるため、救急処置のとれる準備を行い投与すること。また、臨床症状及びコンピュータ断層撮影による観察を十分に行い、出血が認められた場合には直ちに投与を中止し適切な処置を行うこと。

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
抗血小板剤 チクロピジン アスピリン 等	これらの薬剤と併用することにより出血傾向の増強をきたすおそれがある。	本剤は血小板凝集能を抑制するため、類似の作用を持つ薬剤を併用することにより作用を増強する可能性がある。
血栓溶解剤 ウロキナーゼ アルテプラザーゼ 等	観察を十分に行い、減量するなど用量を調節すること。	
抗凝血剤 ヘパリン ワルファリン アルガトロバン 等		

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)

- (1) 出血：出血性脳梗塞・硬膜外血腫・脳内出血、消化管出血、皮下出血、血尿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こと。〔血小板凝集能を抑制するため〕
- (2) ショック、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、喉頭浮腫、冷感等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) 肝機能障害、黄疸：著しいAST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等を伴う重症な肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には投与を中止し適切な処置を行うこと。

- (4) **血小板減少**：血小板減少があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には減量又は投与を中止すること。
- (5) **白血球減少、顆粒球減少**：白血球減少、顆粒球減少があらわれることがあるので、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。発症時には発熱や悪寒等がみられることが多いので、これらの症状があらわれた時は本症を疑い血液検査を行うこと。
- (6) **腎機能障害**：重篤な腎機能障害(急性腎不全等)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し適切な処置を行うこと。なお、腎機能障害時には血小板減少を伴うことが多い。

2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、蕁麻疹、紅斑、喘息(様)発作、痒痒等
循環器 ^{注2)}	上室性期外収縮、血圧下降
血液	貧血
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)、LDH、アルカリフォスファターゼ、ビリルビンの上昇等
腎臓	BUN、クレアチニンの上昇
消化器	嘔気、嘔吐、下痢、食欲不振、膨満感
その他	発熱、頭痛、胸内苦悶感、注射部の発赤・腫脹・疼痛、ほてり、悪寒・戦慄、関節炎、CRP上昇、CK(CPK)上昇

注1) 発現した場合には投与を中止すること。

注2) 発現した場合には減量又は投与を中止すること。

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慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8. 適用上の注意

調製時：カルシウムを含む輸液での直接溶解は白濁するので避けること。なお、カルシウムを含む輸液(リンゲル液等)を希釈に用いるときは、カルシウムを含まない輸液又は注射用水であらかじめ溶解した後、本剤80mgあたり300mL以上の輸液で希釈すること。

【薬効薬理】

- オザグレルナトリウムはトロンボキサン合成酵素を選択的に阻害して、血管平滑筋収縮作用および血小板凝集作用をもつトロンボキサンA₂(TXA₂)の産生を著明に抑制する一方、血管平滑筋弛緩作用および血小板凝集抑制作用を有するプロスタサイクリン(PGI₂)の産生を促進する。この両者のバランス異常の改善により、血小板凝集ならびに血管平滑筋の収縮を抑制し、脳虚血部位の微小循環を改善する。
- ラット両側総頸動脈閉塞-再開通モデルにおいて、本剤投与群はコントロール群に比し、血中TXA₂の産生抑制と血中PGI₂の産生亢進が認められた。また、動脈閉塞-再開通後の脳血流の低下を抑制した(*in vivo*)¹⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

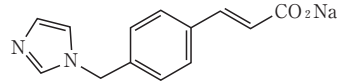
一般名：オザグレルナトリウム(Ozagrel Sodium)

化学名：Monosodium (2*E*)-3-[4-(1*H*-imidazol-1-ylmethyl)phenyl]prop-2-enoate

分子式：C₁₃H₁₁N₂NaO₂

分子量：250.23

構造式：



性状：オザグレルナトリウムは白色の結晶又は結晶性の粉末である。水に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(99.5)にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

バイアルに充てんしたものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、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。^{2), 3)}

【包装】

オザグレルNa注射用20mg「SW」：10バイアル

オザグレルNa注射用40mg「SW」：10バイアル

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

- 田中祥之他、薬理と治療、**32**(2)、81(2004)。
- 2)、3) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]

・文献請求先〔主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい〕

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元
沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K09 B160610