

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 オザグレルナトリウム注射液

オザグレルNa注射液 80mg バッグ「サワイ」 OZAGREL Na

日本標準商品分類番号

87219

承認番号	21900AMX00480000
薬価収載	2007年7月
販売開始	2007年7月

* 貯法：遮光室温保存
使用期限：外箱等に表示
注意：「取扱い上の注意」の項参照

※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) 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注射液80mgバッグ「サワイ」
有効成分・含量	1袋(200mL)中 日局オザグレルナトリウム 80mg
添加物	塩化ナトリウム 1.8g クエン酸 pH調節剤
剤形・性状	無色澄明の注射液
pH	6.7～7.7
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	約1

【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) オザグレルナトリウムに関する注意

- (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) 塩化ナトリウム液に関する注意

- (1) 心臓、循環器系機能障害のある患者〔循環血流量を増すことから心臓に負担をかけ、症状が悪化するおそれがある。〕
- (2) 腎障害のある患者〔水分、塩化ナトリウムの過剰投与に陥りやすく、症状が悪化するおそれがある。〕

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

- 1) **調製時**：カルシウムを含む製剤と混合すると白濁するおそれがあるので注意すること。
- 2) **投与前**：
 - (1) 使用後の残液は使用しないこと。
 - (2) 液が澄明でないもの、着色したものは使用しないこと。

【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。

【有効成分に関する理化学的知見】

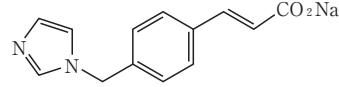
一般名：オザグレルナトリウム(Ozagrel Sodium)

化学名：Monosodium (2E)-3-[4-(1H-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】

- ・ソフトバッグの取扱い上の注意
 - 1) 外袋は遮光性の包材を使用しているため、使用直前まで開封しないこと。また、開封後は速やかに使用すること。
 - 2) 次の場合は使用しないこと。
 - (1) 外袋が破損している場合。
 - (2) 外袋の内側に水滴や薬液の漏出が認められる場合。
 - (3) 薬液に着色や混濁が認められる場合。
 - (4) 排出口をシールしているフィルムがはがれている場合。
 - 3) 使用時には排出口をシールしているフィルムをはがすこと。
 - 4) 穿刺の際にはゴム栓の刺針部(凹部)にまっすぐ刺すこと。斜めに刺すと、排出口内壁を削り、削り片が薬液中に混入したり、排出口側壁を刺通し、液漏れをおこすことがある。
なお、同一箇所を繰り返し刺さないこと。
 - 5) 通気針は不要である。
 - 6) 連結管(U字管)による連続投与は行わないこと。
 - 7) 容器の目盛はおよその目安として使用すること。
- ・安定性試験
包装品を用いた加速試験(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。¹⁾

【包装】

10袋

【主要文献及び文献請求先】

- ・ **主要文献**
 - 1) 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

K05 A160806