

日本薬局方

オザグレルナトリウム注射液

オザグレルNa点滴静注80mg/100mLバッグ「IP」

OZAGREL Na

処方箋医薬品^(注)

貯法：遮光、室温保存（バッグを外袋より取り出した後は、直射日光を避けて保存すること）

使用期限：ラベル及び外箱に表示

注意：「取扱い上の注意」の項参照

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

| | |
|------|---------------|
| 承認番号 | 22700AMX00732 |
| 薬価収載 | 2015年12月 |
| 販売開始 | 2015年12月 |

*【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)重篤な意識障害を伴う大梗塞の患者、脳塞栓症の患者 [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）】

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。]

【組成・性状】

1. 組成

本剤は1袋（100mL）中に下記成分を含む。

| | | |
|------|------------|-------|
| 有効成分 | オザグレルナトリウム | 80mg |
| 添加物 | 塩化ナトリウム | 900mg |
| | pH調整剤 | 適量 |

2. 製剤の性状

本剤は無色澄明の水性注射液で、pH及び浸透圧比は次のとおりである。

| | |
|------------------|---------|
| pH | 6.7～7.7 |
| 浸透圧比（生理食塩液に対する比） | 0.9～1.1 |

【効能又は効果】

- 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

【用法及び用量】

- 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 [循環血液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) 血栓溶解剤 (ウロキナーゼ、アルテプラゼ等) 抗凝血剤 (ヘパリン、ワルファリン、アルガトロバン等) | 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。 観察を十分に行い、減量するなど用量を調節すること。 | 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。 |

* 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（急性腎障害等）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)上昇、LDH上昇、アルカリホスファターゼ上昇、ビリルビン上昇等 |
| 腎臓 | BUN上昇、クレアチニン上昇 |
| 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まわ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】

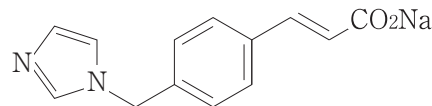
オザグレルナトリウムは、アラキドン酸カスケード中のトロンボキサン₂ (TXA₂) 合成酵素を選択的に阻害してTXA₂の産生を抑制し、TXA₂による血小板凝集能を抑制すると共に、プロスタサイクリンの産生を促進して、両者のバランス異常を改善する。また、脳血管攣縮や脳血流量低下の抑制作用も認められているが、これらに関する詳細な機序は確定していない。¹⁾

【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 (2E)-3-[4-(1H-imidazol-1-ylmethyl)phenyl]prop-2-enoate

構造式：



分子式：C₁₃H₁₁N₂NaO₂

分子量：250.23

性状：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】

- (1) 外袋は遮光性の包材を使用しているため、使用直前に開封すること。また開封後は速やかに使用すること。
- (2) 外袋が破損している場合や内容液が漏出している場合は使用しないこと。
- (3) 内容液に混濁など異常が認められた場合は使用しないこと。
- (4) 注射針はゴム栓の○印にまっすぐ刺すこと。
- (5) 容器の目盛りは目安として使用すること。
- (6) 通気針は不要である。
- (7) ゴム栓部のカバーシールが万一はがれている場合は使用しないこと。

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ヶ月) の結果、オザグレルNa点滴静注80mg/100mLバッグ「IP」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。²⁾

【包装】

オザグレルNa点滴静注80mg/100mLバッグ「IP」：
100mL×10袋

**【主要文献及び文献請求先】

** (主要文献)

- 1) 第十六改正日本薬局方解説書、C-1021、2011
- 2) ネオクリティケア製薬社内資料：安定性試験(2014)

** (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。
ネオクリティケア製薬株式会社 学術情報フリーダイヤル
〒112-0006 東京都文京区小日向4-2-8
TEL 0120-265-321 FAX 03-5840-5145

****ネオクリティケア製薬株式会社**
神奈川県厚木市旭町四丁目 18 番 29 号

F2207