

貯法：室温保存

有効期間：3年

|      | 20mg             | 40mg             | 80mg             |
|------|------------------|------------------|------------------|
| 承認番号 | 22400AMX00156000 | 22400AMX00159000 | 22400AMX00160000 |
| 販売開始 | 2004年8月          | 2004年8月          | 2004年8月          |

トロンボキサン合成酵素阻害剤

処方箋医薬品<sup>注)</sup>

日本薬局方 オザグレルナトリウム注射液

オザグレルNa静注液20mg 「日医工」

オザグレルNa静注液40mg 「日医工」

オザグレルNa静注液80mg 「日医工」

Ozagrel Sodium I.V. Injection

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

**2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）**

2.1 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。〕[8、9.1.2、11.1.1 参照]

2.2 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。〕

2.3 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

**3. 組成・性状****3.1 組成**

| 販売名  | オザグレルNa<br>静注液20mg<br>「日医工」        | オザグレルNa<br>静注液40mg<br>「日医工」        | オザグレルNa<br>静注液80mg<br>「日医工」        |
|------|------------------------------------|------------------------------------|------------------------------------|
| 有効成分 | 1管（2mL）中<br>オザグレルナ<br>トリウム<br>20mg | 1管（4mL）中<br>オザグレルナ<br>トリウム<br>40mg | 1管（8mL）中<br>オザグレルナ<br>トリウム<br>80mg |
| 添加剤  | 1管中<br>リン酸水素ナトリウム、pH調節剤            |                                    |                                    |

**3.2 製剤の性状**

| 販売名   | オザグレルNa<br>静注液20mg<br>「日医工」 | オザグレルNa<br>静注液40mg<br>「日医工」 | オザグレルNa<br>静注液80mg<br>「日医工」 |
|-------|-----------------------------|-----------------------------|-----------------------------|
| 剤形・性状 | 水性の注射剤<br>無色澄明の液            |                             |                             |
| pH    | 8.0～9.0                     |                             |                             |
| 浸透圧比  | 0.2～0.3<br>(生理食塩液に対する比)     |                             |                             |

**4. 効能又は効果**

○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

○脳血栓症（急性期）に伴う運動障害の改善

**6. 用法及び用量**

〈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で希釈し、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。

〈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で希釈し、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。

**8. 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。[2.1、11.1.1 参照]

**9. 特定の背景を有する患者に関する注意****9.1 合併症・既往歴等のある患者**

9.1.1 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ため、治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。

**9.1.2 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。[2.1、11.1.1 参照]

9.1.3 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。

**9.5 妊婦**

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

**9.6 授乳婦**

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

**9.7 小児等**

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

**9.8 高齢者**

一般に生理機能が低下している。

**10. 相互作用****10.2 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   |
|---|---|---|
| 抗血小板剤<br>チクロピジン<br>アスピリン等<br>血栓溶解剤<br>ウロキナーゼ<br>アルテプララーゼ等<br>抗凝血剤<br>ヘパリン<br>ワルファリン<br>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。 |

**11. 副作用**

次の副作用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など適切な処置を行うこと。

**11.1 重大な副作用****11.1.1 出血**

〈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〉

出血性脳梗塞・硬膜外血腫・脳内出血（1.9%）、消化管出血（0.8%）、皮下出血（0.8%）、血尿（頻度不明）等があらわれることがある。本剤は血小板凝集能を抑制する。[2.1、8、9.1.2 参照]

〈脳血栓症（急性期）に伴う運動障害の改善〉

出血性脳梗塞・硬膜外血腫・脳内出血（0.3%）、消化管出血（頻度不明）、皮下出血（0.3%）、血尿（頻度不明）等があらわれることがある。血小板凝集能を抑制する。[2.1、8、9.1.2 参照]

**11.1.2 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）**

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。

### 11.1.3 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

著しいAST・ALT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。

### 11.1.4 血小板減少（頻度不明）

### 11.1.5 白血球減少、顆粒球減少（いずれも頻度不明）

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。

### 11.1.6 腎機能障害（頻度不明）

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。腎機能障害時には血小板減少を伴うことが多い。

## 11.2 その他の副作用

|     | 0.1%～3%未満          | 頻度不明                              |
|-----|--------------------|-----------------------------------|
| 過敏症 | 発疹、蕁麻疹、紅斑          | 喘息（様）発作、痒痒                        |
| 循環器 | 上室性期外収縮、血圧下降       |                                   |
| 血液  | 貧血                 |                                   |
| 肝臓  |                    | AST・ALT、LDH、アルカリホスファターゼ、ビリルビンの上昇等 |
| 腎臓  |                    | BUN、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、注射部の発赤・腫脹・疼痛 | CK上昇、胸内苦悶感、ほてり、悪寒・戦慄、関節炎、CRP上昇    |

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤調製時の注意

カルシウムを含む輸液で希釈すると白濁することがあるので、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、本剤80mgあたり300mL以上の輸液で使用すること。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

#### 16.1.1 健康成人

健康成人にオザグレルナトリウムを1又は15  $\mu\text{g}/\text{kg}/\text{分}^{\text{注}}$ （それぞれ8例及び4例）で3時間静脈内持続投与した結果、血漿中濃度はそれぞれ2.1及び3.0時間で最高となり、その濃度は97.0及び1,657.3ng/mLであった。投与中止後の半減期は0.79及び0.66時間で、3時間後には6.7及び52.6ng/mLまで低下した<sup>1)</sup>。

| 投与量<br>( $\mu\text{g}/\text{kg}/\text{分}$ ) | $T_{\text{max}}$<br>(hr) | $C_{\text{max}}$<br>(ng/mL) | AUC<br>(ng·hr/mL) | $T_{1/2}$<br>(hr) |
|---|--------------------------|-----------------------------|-------------------|-------------------|
| 1   | 2.07±0.79                | 97.0±22.2                   | 281.0±58.5        | 0.79±0.56         |
| 15  | 3.00±0.00                | 1657.3±274.4                | 4659.2±867.2      | 0.66±0.04         |

平均±標準偏差

注) 本剤の承認用量は、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に対しては1日量80mg、脳血栓症に対しては1回量80mgである。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

アラキドン酸カスケード中のトロンボキサン $A_2$  (TXA $_2$ ) 合成酵素を選択的に阻害してトロンボキサンTXA $_2$ の産生を抑制し、TXA $_2$ 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<sup>2)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：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

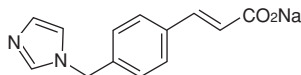
分子式：C $_{13}$ H $_{11}$ N $_2$ NaO $_2$

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。

化学構造式：



## 22. 包装

〈オザグレルNa静注液20mg「日医工」〉

2mL×10管

〈オザグレルNa静注液40mg「日医工」〉

4mL×10管

4mL×50管

〈オザグレルNa静注液80mg「日医工」〉

8mL×10管

## 23. 主要文献

- 1) 福島雅夫 他：薬理と治療。1986；14（3）：1373-1403
- 2) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021；C1234-C1238

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

日医工株式会社 お客様サポートセンター  
〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21  
TEL (0120) 517-215  
FAX (076) 442-8948

## 26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



NICHIKO 富山市総曲輪1丁目6番21