

貯 法：遮光した気密容器、室温保存
使用期限：外箱に表示

トロンボキサン合成酵素阻害剤
気管支喘息治療剤

オザグレル錠100「KN」 オザグレル錠200「KN」

OZAGREL Tablets 100「KN」・200「KN」
オザグレル塩酸塩水和物錠

	100「KN」	200「KN」
承認番号	22200.AMX00465000	21500.AMZ00295000
薬価収載	2010年11月	2003年7月
販売開始	2010年12月	2003年7月

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1)小児等(「小児等への投与」の項参照)
- (2)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

品名	オザグレル錠100「KN」	オザグレル錠200「KN」
成分・含量	1錠中、オザグレル塩酸塩水和物100mg含有	1錠中、オザグレル塩酸塩水和物200mg含有
添加物	乳糖水和物、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ヒプロメロース、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、マクロゴール400	
性状	白色のフィルムコート錠	白色のフィルムコート錠
大きさ	直径：約7.1mm 厚さ：約3.2mm 重量：約131mg	直径：約9.1mm 厚さ：約4.0mm 重量：約260mg
外形		
識別コード	KN313	KN415

【効能・効果】

気管支喘息

【用法・用量】

通常、成人にはオザグレル塩酸塩水和物として1日量400mg(100mg錠4錠又は200mg錠2錠)を朝食後及び就寝前の2回に分けて経口投与する。

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)
出血している患者[出血を助長する可能性がある。]
2. 重要な基本的注意
 - (1)本剤は気管支拡張剤、ステロイド剤等と異なり、すでに起きている発作を緩解する薬剤ではないので、このことは患者に十分説明しておく必要がある。
 - (2)気管支喘息患者に本剤を投与中、大発作をみた場合は、気管支拡張剤あるいはステロイド剤を投与する必要がある。
 - (3)長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。
 - (4)本剤投与によりステロイド維持量を減量し得た患者で、本剤の投与を中止する場合は、原疾患再発のおそれがあるので、注意すること。
 - (5)本剤投与により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

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
抗血小板剤 チクロピジン 血栓溶解剤 ウロキナーゼ 抗凝血剤 ヘパリン ワルファリン	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、用量を調節するなど注意すること。	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。

	頻度不明
過敏症 ^(注)	発疹、痒痒等
消化器	嘔気、胃・腹部不快感、嘔吐、腹痛、食欲不振、便秘、下痢、腹部膨満感
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等、アルカリフォスファターゼの上昇
循環器	心悸亢進
血液	出血傾向、血小板減少
精神神経系	頭痛、めまい、眠気、しびれ感、振戦
その他	浮腫、発熱、倦怠感、下肢痛、筋肉痛、胸部圧迫感、関節痛、月経異常(月経過多・月経延長)

注) 発現した場合には、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

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

- (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。]
- (2)授乳中の婦人には大量投与を避けること。[ラットの周産期及び授乳期投与で新生児に体重の増加抑制(1000mg/kg)が報告されている。]

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児には投与しないこと。[小児等に対する安全性は確立していない。]

8. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

【薬物動態】

<生物学的同等性試験>

1. オザグレル錠100「KN」

オザグレル錠100「KN」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、オザグレル錠200「KN」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。¹⁾

2. オザグレル錠200「KN」

オザグレル錠200「KN」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(オザグレル塩酸塩水和物200mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(図、表)。²⁾

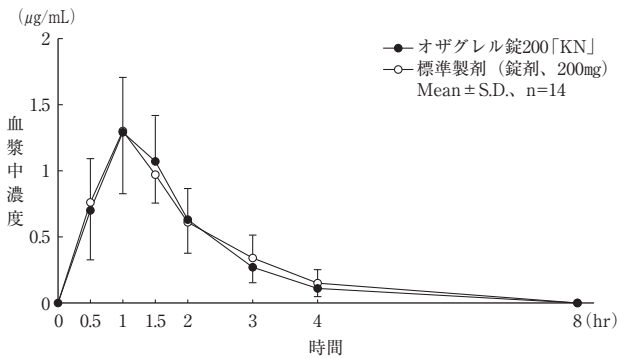


図 オザグレル塩酸塩の血漿中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→8hr} (μg·hr/mL)	C _{max} (μg/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
オザグレル錠 200「KN」	2.54±0.68	1.41±0.40	1.2±0.3	0.8±0.1
標準製剤 (錠剤、200mg)	2.68±0.51	1.33±0.37	1.1±0.2	1.1±0.7

(Mean ± S.D., n = 14)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<溶出挙動>

オザグレル錠100「KN」及びオザグレル錠200「KN」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オザグレル塩酸塩水和物

(Ozagrel Hydrochloride Hydrate)

化学名：(E)-3-[p-(1H-imidazol-1-ylmethyl)phenyl]-2-propenoic acid hydrochloride monohydrate

分子式：C₁₃H₁₂N₂O₂·HCl·H₂O

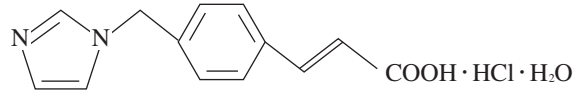
分子量：282.72

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

メタノールに溶けやすく、水にやや溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、アセトン又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

融点：227～233℃(分解)

構造式：



【取扱い上の注意】

<安定性試験>⁴⁾

オザグレル錠100「KN」

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)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。

オザグレル錠200「KN」

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、3年間)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確認された。

**【包装】

オザグレル錠100「KN」 パラ：100錠

オザグレル錠200「KN」 PTP：100錠

【主要文献】

- 1) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- 3) 小林化工株式会社・社内資料(品質再評価溶出試験)
- 4) 小林化工株式会社・社内資料(安定性試験)

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

小林化工株式会社 安全管理部

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15

☎ 0120-37-0690 TEL 0776-73-0911

FAX 0776-73-0821



製造販売元

小林化工株式会社

福井県あわら市矢地5-15