

遷延性意識障害治療剤
脊髄小脳変性症治療剤

※ 処方箋医薬品^{注1)}

プロチレリン酒石酸塩注 1mg 「NP」 プロチレリン酒石酸塩注 2mg 「NP」

PROTIRELIN TARTRATE INJECTION

貯 法：室温保存
使用期限：容器等に記載
注 意：「取扱い上の注意」参照

	1 mg	2 mg
承認番号	22500AMX00808	22500AMX00809
薬価収載	2013年6月	2013年6月
販売開始	2011年6月	1997年7月

【組成・性状】

1. 組成、製剤の性状

販売名	プロチレリン酒石酸塩注 1mg 「NP」	プロチレリン酒石酸塩注 2mg 「NP」
容 量	1 mL	
有効成分 (1管中)	日本薬局方 プロチレリン酒石酸塩水和物 (プロチレリンとして)	
	1.464mg (1.0mg)	2.928mg (2.0mg)
添加物 (1管中)	D-ソルビトール 50mg	
	pH調整剤	—
	等張化剤	—

2. 製剤学的事項

	プロチレリン酒石酸塩注 1mg 「NP」	プロチレリン酒石酸塩注 2mg 「NP」
性 状	無色澄明の水性注射液	
容 器	無色のガラスアンプル	
pH	5.5～6.5	
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	約1	

【効能・効果】

- 下記疾患に伴う昏睡、半昏睡を除く遷延性意識障害
・頭部外傷
・くも膜下出血、ただし、意識障害固定期間3週以内
- 脊髄小脳変性症における運動失調の改善

【用法・用量】

- 遷延性意識障害の場合（ただし、昏睡、半昏睡を除く）
通常、成人には疾患に応じて、下記の用量を1日1回10日間静注又は点滴静注する。静脈内注射の場合は、生理食塩液、ブドウ糖注射液又は注射用水5～10mLに希釈して、徐々に注射する。
1) 頭部外傷：1回プロチレリン酒石酸塩水和物として0.732～2.92mg（プロチレリンとして0.5～2mg）
2) くも膜下出血（ただし、意識障害固定期間3週以内）：
1回プロチレリン酒石酸塩水和物として2.92mg（プロチレリンとして2mg）
- 脊髄小脳変性症の場合
通常、成人には1日1回プロチレリン酒石酸塩水和物として0.732～2.92mg（プロチレリンとして0.5～2mg）を筋肉内又は静脈内に注射するが、重症例にはプロチレリン酒石酸塩水和物として2.92mg（プロチレリンとして2mg）を注射する。
2～3週間連日注射した後、2～3週間の休業期間をおく。以後、これを反復するか、週2～3回の間歇注射を行う。静脈内注射の場合は、生理食塩液、ブドウ糖注射液又は注射用水5～10mLに希釈して、徐々に注射する。

※【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) 心障害のある患者 [本剤は、血圧及び脈拍数を一過性に上昇させることがある。]
- ※2) 遺伝性果糖不耐症の患者 [本剤の添加剤D-ソルビトールが体内で代謝されて生成した果糖が正常に代謝されず、低血糖、肝不全、腎不全等が誘発されるおそれがある。]

2. 副作用

本剤は、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) ショック様症状

一過性の血圧低下、意識喪失等のショック様症状があらわれることがある。

(2) 痙攣

痙攣があらわれることがある。

(3) 下垂体卒中

下垂体腺腫患者に投与した場合、頭痛、視力・視野障害等を伴う下垂体卒中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外科的治療等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、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。

2) その他の副作用

種類\頻度	頻度不明
循環器	脈拍数の変動、熱感、顔面潮紅感、動悸、胸部圧迫感、血圧の変動
消化器	悪心、心窩部不快感、嘔吐、食欲不振、腹痛、口渇、異味感
肝 臓	AST (GOT)、ALT (GPT)、Al-Pの上昇
血 液	貧血、白血球減少
精神神経系	興奮、多弁、頭痛、めまい、しびれ感、振戦、不安、不眠
過 敏 症 ^{注2)}	発疹、そう痒
そ の 他	尿意、発熱、発汗、悪寒、倦怠感、脱力感、咽頭違和感、浮腫、排尿障害、乳房腫大、乳汁分泌

注2) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

3. 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、用量に注意すること。

4. 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。]

5. 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。

6. 適用上の注意

1) 静脈内投与時

静脈内注射にあたっては、できるだけゆっくり注射すること。[急速に静脈内注射すると、一過性の尿意、悪心、熱感等があらわれやすい。]

2) 筋肉内投与時

筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響を避けるため、下記の点に注意すること。

- (1) 同一部位への反復注射は行わないこと。
なお、小児には特に注意すること。
- (2) 神経走行部位を避けるよう注意すること。
- (3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。

3) アンプルカット時

本剤は、ワンポイントカットアンプルを使用しているので、アンプル頭部のマークを上にして反対側（下の方向）に軽く力を加えてカットすること。なお、アンプルカット時の異物混入を避けるため、首部の周りをエタノール綿等で清拭すること。

7. その他の注意

- 1) 本剤の連用により、TRH^{注3)}に対するTSH^{注4)}分泌反応が低下するので、定められた投与期間を標準として投与すること。
- 2) 本剤の連用によるTSH分泌反応低下は連用中止1週ないし2週後に回復するので、TRHテストを施行する場合はその後に行うこと。
- 3) 甲状腺ホルモン剤、抗甲状腺剤、副腎皮質ステロイド剤を投与中の患者では、TRHに対するTSH分泌反応が変化することがある。

【薬物動態】

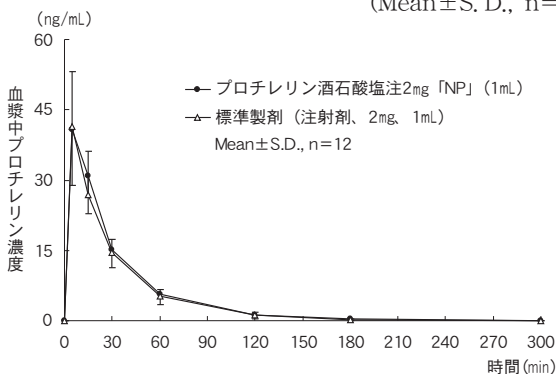
生物学的同等性試験

プロチレリン酒石酸塩注2mg「NP」

プロチレリン酒石酸塩注2mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1mL（プロチレリンとして2mg）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に筋肉内投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC_{0→300min}、C_{max}）の平均値の差の95%信頼区間は±20%の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→300min} (ng·min/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (min)	t _{1/2} (min)
プロチレリン酒石酸塩注2mg「NP」(1mL)	1,396.8±362.0	41.2±11.6	6.7±3.9	30.1±3.9
標準製剤(注射剤、2mg、1mL)	1,302.8±265.5	41.4±11.7	5.0±0.0	29.9±3.1

(Mean±S.D., n=12)



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。

【薬効薬理】

甲状腺刺激ホルモン放出ホルモンの誘導体で、脳下垂体前葉のTSH及びプロラクチン分泌能の診断薬として用いられる。他に、脳エネルギー代謝改善作用を示すので、脳血管障害などの際の意識障害等に用いられる。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：プロチレリン酒石酸塩水和物

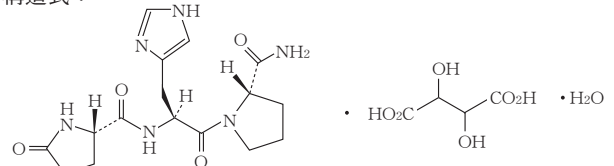
(Protirelin Tartrate Hydrate)

化学名：5-Oxo-L-prolyl-L-histidyl-L-prolinamide monotartrate monohydrate

分子式：C₁₆H₂₂N₆O₄·C₄H₆O₆·H₂O

分子量：530.49

構造式：



- 性状：・白色～微帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。
・水に溶けやすく、酢酸（100）にやや溶けにくく、エタノール（95）又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。
・融点：約187℃（分解）

【取扱い上の注意】

安定性試験

1. プロチレリン酒石酸塩注1mg「NP」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6カ月）の結果、プロチレリン酒石酸塩注1mg「NP」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。³⁾

2. プロチレリン酒石酸塩注2mg「NP」

最終包装製品を用いた長期保存試験〔室温（1～30℃）、3年間〕の結果、プロチレリン酒石酸塩注2mg「NP」は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。⁴⁾

【包装】

プロチレリン酒石酸塩注1mg「NP」：1mL×10管

プロチレリン酒石酸塩注2mg「NP」：1mL×10管

※【主要文献】

- 1) ニプロ（株）：社内資料（生物学的同等性試験）
- ※2) 第十七改正日本薬局方解説書
- 3) ニプロ（株）：社内資料（安定性試験）
- 4) ニプロ（株）：社内資料（安定性試験）

※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ニプロ株式会社 医薬品情報室
〒566-8510 大阪府摂津市千里丘新町3番26号
TEL 0120-226-898
FAX 050-3535-8939



製造販売 ニプロ株式会社
大阪府摂津市千里丘新町3番26号

注3) TRH (Thyrotropin Releasing Hormone)：プロチレリン

注4) TSH (Thyroid Stimulating Hormone)：甲状腺刺激ホルモン