

貯法：室温保存
有効期間：3年

狭心症用舌下錠
ニトログリセリン製剤

日本標準商品分類番号
872171

ニトロペン® 舌下錠0.3mg

Nitrophen Sublingual Tablets 0.3mg

劇薬、処方箋医薬品^注

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

承認番号	21800AMX10508
販売開始	1988年7月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 重篤な低血圧又は心原性ショックの患者〔血管拡張作用により、さらに血圧を低下させ、症状を悪化させるおそれがある。〕 [9.1.1 参照]
- 2.2 閉塞隅角緑内障の患者〔眼圧を上昇させるおそれがある。〕
- 2.3 頭部外傷又は脳出血の患者〔頭蓋内圧を上昇させるおそれがある。〕
- 2.4 高度な貧血の患者〔血圧低下により貧血症状（めまい、立ちくらみ等）を悪化させるおそれがある。〕
- 2.5 硝酸・亜硝酸エステル系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.6 ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤（シルденаフィルクエン酸塩、バルデナフィル塩酸塩水和物、タダラフィル）又はグアニル酸シクラーゼ刺激作用を有する薬剤（リオシグアト）を投与中の患者 [10.1 参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ニトロペン舌下錠0.3mg
有効成分	1錠中 ニトログリセリン0.3mg
添加剤	乳糖水和物、セルロース、シクロデキストリン、トウモロコシデンプン、ポビドン、ステアリン酸マグネシウム

3.2 製剤の性状

販売名	ニトロペン舌下錠0.3mg	
性状	白色の錠剤	
外形	表面	○
	側面	⊖
直径	5.0mm	
厚さ	2.4mm	
質量	0.05g	
識別コード	NK2015	

4. 効能又は効果

狭心症、心筋梗塞、心臓喘息、アカラジアの一時的緩解

6. 用法及び用量

ニトログリセリンとして、通常成人0.3～0.6mg（本剤1～2錠）を舌下投与する。狭心症に対し投与後、数分間で効果のあらわれない場合には、更に0.3～0.6mg（本剤1～2錠）を追加投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 狭心症に対し本剤を用いる場合には、次の事項に留意すること。
 - 8.1.1 投与後、数分間で効果をあらわすが、効果があらわれない場合には更に1～2錠を追加投与すること。
 - 8.1.2 1回の発作に3錠まで投与しても効果があらわれない場合、発作が15～20分以上持続する場合には、直ちに主治医に連絡するよう患者を指導すること。
- 8.2 起立性低血圧を起こすことがあるので注意すること。また、めまいや失神等を起こすことがあるので、椅子に腰掛けるか、座って服用させること。

- 8.3 過度の血圧低下が起こった場合には、下肢の挙上あるいは昇圧剤の投与等、適切な処置を行うこと。
- 8.4 本剤の投与開始時には、他の硝酸・亜硝酸エステル系薬剤と同様に血管拡張作用による頭痛等の副作用が起こりやすく、これらの副作用のために注意力、集中力、反射運動等の低下が起こることがあるので、このような場合には、自動車の運転等の危険を伴う機械の操作には従事させないように注意すること。

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 低血圧の患者（重篤な低血圧の患者を除く）

血管拡張作用により、さらに血圧を低下させるおそれがある。 [2.1 参照]

9.1.2 心筋梗塞の急性期の患者

血圧を低下させるおそれがある。

9.1.3 原発性肺高血圧症の患者

心拍出量が低下し、ショックを起こすおそれがある。

9.1.4 閉塞性肥大型心筋症の患者

心室内圧較差の増強をもたらす、症状を悪化させるおそれがある。

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。動物実験（ラット）で、乳汁中への移行が報告されている。

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら用量に留意して慎重に投与すること。本剤は、主として肝臓で代謝されるが、高齢者では一般に肝機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続し、血圧低下等が発現するおそれがある。

10. 相互作用

10.1 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤	併用により、降圧作用を増強することがある。	本剤はcGMPの産生を促進し、一方、ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤はcGMPの分解を抑制することから、両剤の併用によりcGMPの増大を介する本剤の降圧作用が増強する。
シルденаフィルクエン酸塩（バイアグラ、レバチオ） バルデナフィル塩酸塩水和物（レビトラ） タダラフィル（シアルリス、アドシルカ、ザルティア）	本剤投与前にこれらの薬剤を服用していないことを十分確認すること。また、本剤投与中及び投与後においてこれらの薬剤を服用しないよう十分注意すること。	
[2.6 参照]		
グアニル酸シクラーゼ刺激作用を有する薬剤 リオシグアト（アデムパス）	[2.6 参照]	本剤とグアニル酸シクラーゼ刺激作用を有する薬剤は、ともにcGMPの産生を促進することから、両剤の併用によりcGMPの増大を介する本剤の降圧作用が増強する。

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
降圧作用及び血管拡張作用を有する薬物 Ca拮抗剤 ACE阻害剤 β遮断剤 利尿剤 三環系抗うつ剤 メジャートランキライザー 等	血圧低下が増強されることがある。	血圧低下作用が相加的に増強される。
他の硝酸・亜硝酸エステル系薬剤	頭痛、血圧低下等の副作用が増強されることがある。	血管拡張作用が増強される。
非ステロイド性抗炎症剤 アスピリン等	本剤の作用が減弱されるおそれがある。	プロスタグランジン _{I₂} 等の合成が阻害され、血管拡張作用が減弱される可能性がある。
アルコール摂取	血圧低下が増強されることがある。	血圧低下作用が相加的に増強される。

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。

11.2 その他の副作用

	5%以上又は頻度不明	0.1%未満
循環器	脳貧血、血圧低下、熱感、潮紅、動悸	めまい
精神神経系	頭痛	失神
消化器	悪心・嘔吐	
その他		発汗、尿失禁、便失禁

14. 適用上の注意

14.1 患者に対し次項を守るよう注意すること。

- 14.1.1 幼小児、特に乳児の手のとどかない所に保存するよう注意すること。
- 14.1.2 本剤は舌下で溶解させ、口腔粘膜より吸収されて速やかに効果を発現するもので、内服では効果がない。
- 14.1.3 本剤を初めて使用する患者は、最初の数回は必ず1錠を投与すること。このとき一過性の頭痛が起こることがあるが、この症状は投与を続ける間に起こらなくなる。

15. その他の注意

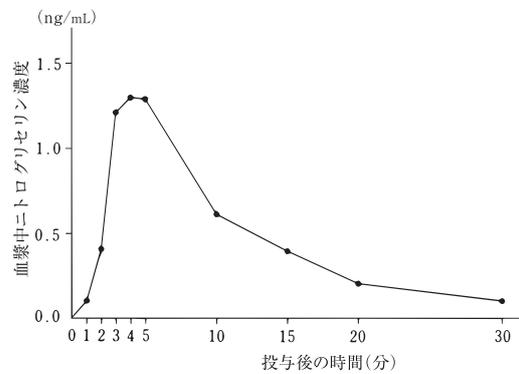
15.1 臨床使用に基づく情報

本剤使用中に本剤又は他の硝酸・亜硝酸エステル系薬剤に対し、耐薬性を生じ、作用が減弱することがある。なお、ニトログリセリンの経皮吸収型製剤での労作狭心症に対するコントロールされた外国の臨床試験成績によると、休業時間を置くことにより、耐薬性が軽減できたとの報告がある¹⁾。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人男子（N=10）にニトロペン舌下錠（ニトログリセリン0.3mg含有）を1錠ずつ舌下投与後の血漿中濃度を測定した結果、投与後4分で最高値に到達し、以後二相性で消失した²⁾。

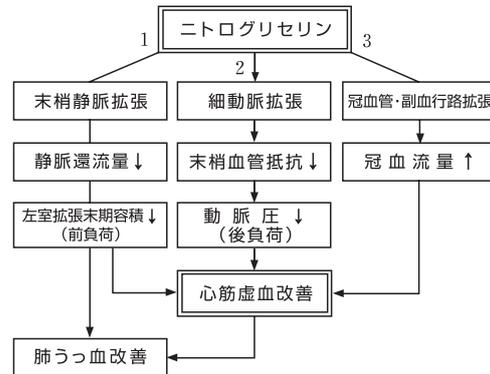


18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ニトログリセリンは直接血管平滑筋に作用し、低用量では静脈の、高用量では静脈及び動脈の拡張作用を示すとされている³⁾。その機序として、ニトログリセリンが細胞内で一酸化窒素に変換され、グアニル酸シクラーゼを介してcGMPを増加することにより、細胞外へカルシウムが排出されること及び収縮蛋白のカルシウム感受性が低下することなどが考えられている⁴⁾。

- 18.1.1 ニトログリセリンは容量血管である静脈系に強く作用して静脈還流量を減少させ肺うっ血を軽減し左室充満圧や左室拡張末期容積を減少させる^{5,6)}。
- 18.1.2 比較的弱いながら、抵抗血管である細動脈に作用して末梢血管抵抗を減少させ後負荷を軽減する。この結果心仕事量、心筋 O_2 需要が減少する^{5,6)}。
- 18.1.3 直接冠動脈を拡張し冠血流量を増加させ心筋虚血を改善する。さらに、側副血行路を拡張して、虚血に陥りやすい心筋内膜の血流を改善する。また、ニトログリセリンは冠血管スバズム（攣縮）を緩解し冠血流の減少を抑制する作用や、比較的太い冠動脈を拡張することでCoronary Steal（盗流現象）を起こさないことが知られている^{5,6)}。



19. 有効成分に関する理化学的知見

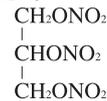
一般的名称：ニトログリセリン（Nitroglycerin）

化学名：1,2,3-propanetriol trinitrate

分子式：C₃H₅N₃O₉

分子量：227.09

化学構造式：



性状：ニトログリセリンは、常温では無色澄明の粘稠性の液体で、味は甘く灼熱感があり、衝撃により爆発する。

22. 包装

100錠 [10錠 (SP) × 10]

500錠 [10錠 (SP) × 50]

23. 主要文献

- Demots H, et al. : J Am Coll Cardiol. 1989 ; 13 : 786-793
- 井津源市ほか 病院薬学 1989 ; 15 : 36-42
- Mason DT, et al. : Am J Med. 1978 ; 65 : 106-125

- 4) 平則夫 医学と薬学 1991 ; 25 : 73-78
- 5) 磯部光章ほか Medical Practice 1987 ; 4 : 1463-1467
- 6) 野見山 臨床麻酔 1985 ; 9 : 13-20

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本化薬株式会社 医薬品情報センター
〒100-0005 東京都千代田区丸の内二丁目1番1号
TEL.0120-505-282

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

