

※※2009年10月改訂 14
※2008年12月改訂 13

日本標準商品分類番号
8 7 2 1 7 1

※※＜規制区分＞
劇薬、処方せん医薬品*

＜貯 法＞

遮光、室温保存

＜使用期限＞

3 年（シート及び外箱に表示）

＜取扱い上の注意＞

【取扱い上の注意】の項参照

狭心症用舌下錠
ニトロペン[®] 舌下錠0.3mg
Nitropen Tab. 0.3mg
ニトログリセリン製剤

承認番号	21800AMX10508
薬価収載	2006年12月
販売開始	1988年 7 月

* 注意—医師等の処方せんにより使用すること

【禁 忌】（次の患者には投与しないこと）

- （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。]
- （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。]
- （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。]
- （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。]
- （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
- （6）ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤（シルデナフィルクエン酸塩、バルデナフィル塩酸塩水和物、タダラフィル）を投与中の患者
[本剤とこれらの薬剤との併用により降圧作用が増強され、過度に血圧を低下させることがある。（「3.相互作用」の項参照）]

【組成・性状】

1. 組成

ニトロペン舌下錠0.3mgは、1錠中に次の成分を含有する。

有効成分・含有量	ニトログリセリン 0.3mg
添加物	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Mg

2. 製剤の性状

ニトロペン舌下錠0.3mgは、白色の錠剤である。

識別コード	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(g)
NK2015	5.0	2.4	0.05

【効能・効果】

狭心症、心筋梗塞、心臓喘息、アカラジアの一時的緩解

【用法・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。

【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）低血圧の患者
[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）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。]
- （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。]
- （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。]

2. 重要な基本的注意

- （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。
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。
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。
- （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。
- （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。
- （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。
- （5）本剤とホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤（シルデナフィルクエン酸塩、バルデナフィル塩酸塩水和物、タダラフィル）との併用により降圧作用が増強し、過度に血圧を低下させることがあるので、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。

ニトロペン舌下錠0.3mg

3. 相互作用

(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 シルデナフィルクエン酸塩（バイアグラ） バルデナフィル塩酸塩水和物（レビトラ） タダラフィル（シアリス）	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。

(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I ₂ 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。

4. 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

5. 高齢者への投与

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ので注意すること。

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。]

(2) 授乳婦に投与する場合には授乳を中止させること。
[動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。]

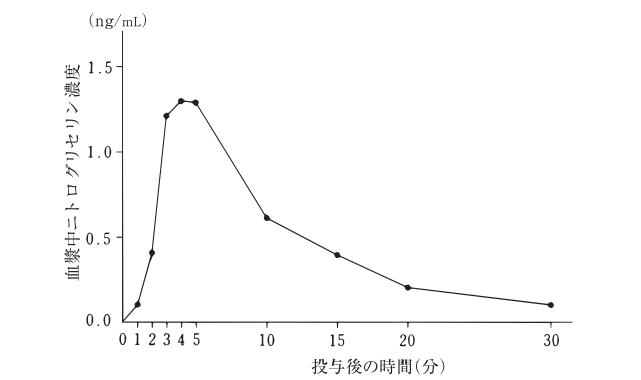
7. その他の注意

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、休薬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⁾

【薬物動態】

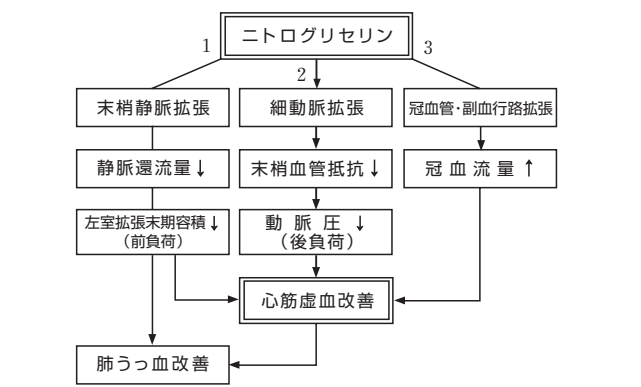
＜血漿中濃度＞²⁾

健康成人男子（N=10）にニトロペン錠（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。



【薬効薬理】^{3,4)}

- 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。
- 比較的弱い⁵⁾が、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O₂需要が減少する。
- 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パズム（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。



【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ニトログリセリン(nitroglycerin)
化学名：glyceryl trinitrate 又は1,2,3-propanetriol trinitrate
分子式：C₃H₅N₃O₉
分子量：227.09

構造式：CH₂ONO₂

|
CHONO₂

|
CH₂ONO₂

性 状：ニログリセリンは、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。

【取扱い上の注意】

1. 患者に対し、次項を守るよう注意すること。

＜患者に対する保存および使用上の注意＞

- (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。
- (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。
- (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。
2. 安定性試験：最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度60%、3年間）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ニトロペン舌下錠0.3mg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。⁵⁾

【包装】

100錠、500錠

※【主要文献及び文献請求先】

＜主要文献＞

- 1) Demots H. et al. : J. Am. Coll. Cardiol., 13, 786(1989)
- 2) 井津源市他：病院薬学, 15, 36 (1989)
- 3) 磯部光章他：Medical Practice, 4, 1463 (1987)
- 4) 野見山 証：臨床麻酔, 9, 13 (1985)
- 5) 日本化薬株式会社 社内資料：安定性試験

＜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。

日本化薬株式会社 医薬事業本部
営業本部 学術情報部 医薬品情報センター
(住所) 〒102-8172 東京都千代田区富士見一丁目11番2号
(TEL) 0120-505-282 (フリーダイヤル)
03-3237-5051

® 登録商標

製造販売元



日本化薬株式会社
東京都千代田区富士見一丁目11番2号