

貯 法：室温保存  
有効期間：3年承認番号 23000AMX00078  
販売開始 2011年11月劇薬  
処方箋医薬品

(注意-医師等の処方箋により使用すること)

プロスタグランジンE<sub>1</sub>製剤  
注射用アルプロスタジル アルファデクスアルプロスタジルアルファデクス注射用20 $\mu$ g「タカタ」

Alprostadil Alfadex Injection "TAKATA"



## 1. 警告

〈動脈管依存性先天性心疾患〉

1.1 本剤投与により無呼吸発作が発現することがあるの  
で、呼吸管理設備の整っている施設で投与すること。

〈勃起障害の診断〉

1.2 本剤投与により4時間以上の勃起の延長又は持続勃  
起症(6時間以上持続する勃起)が発現することがある  
ので、勃起が4時間以上持続する症状がみられた場合、  
速やかに適切な処置を行うこと。持続勃起症に対する  
処置を速やかに行わないと陰茎組織の損傷又は勃起機  
能を永続的に損なうことがある。1.3 本剤投与により勃起の延長又は持続勃起症、不整脈、  
一過性の低血圧等が発現することがあるので、本剤を用  
いた勃起障害の診断は、勃起障害の診断及び治療に精通  
し、本剤投与時の副作用への対処が可能な医師が、緊急  
時の対応が可能な状況で行うこと。

## 2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.1 重篤な心不全、肺水腫のある患者(ただし、動脈管依  
存性先天性心疾患の患者は除く)[心不全、肺水腫を増  
悪させることがある。]2.2 出血(頭蓋内出血、出血性眼疾患、消化管出血、咯血  
等)している患者[出血を助長するおそれがある。]

2.3 妊婦又は妊娠している可能性のある女性[9.5 参照]

2.4 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

有効成分	添加剤
1バイアル中 日局 アルプロスタジル アルフ ァデクス 666.7 $\mu$ g (アルプロスタジルとして20 $\mu$ g)	クエン酸水和物、乳糖水 和物(適量)

## 3.2 製剤の性状

性状	pH	浸透圧比
白色の粉末 又は塊	4.0~6.5 〔アルプロスタジル 0.04mg/生理食塩液 10mL〕	約1 〔アルプロスタジル 0.04mg/生理食塩液 10mL〕

## 4. 効能又は効果

## 動脈内投与

○慢性動脈閉塞症(バージャー病、閉塞性動脈硬化症)に  
おける四肢潰瘍ならびに安静時疼痛の改善

## 静脈内投与

○振動病における末梢血行障害に伴う自覚症状の改善なら  
びに末梢循環・神経・運動機能障害の回復

○血行再建術後の血流維持

○動脈内投与が不適と判断される慢性動脈閉塞症(バー  
ジャー病、閉塞性動脈硬化症)における四肢潰瘍ならびに  
安静時疼痛の改善

○動脈管依存性先天性心疾患における動脈管の開存

## 陰茎海綿体内投与

○勃起障害の診断

## 6. 用法及び用量

## 動脈内投与

〈慢性動脈閉塞症(バージャー病、閉塞性動脈硬化症)にお  
ける四肢潰瘍ならびに安静時疼痛の改善〉(1) 本品1バイアル(アルプロスタジル20 $\mu$ g)を生理食  
塩液5mLに溶かし、通常成人1日量アルプロスタジルとし  
て10~15 $\mu$ g(およそ0.1~0.15ng/kg/分)をシリンジポ  
ンプを用い持続的に動脈内へ注射投与する。

(2) 症状により0.05~0.2ng/kg/分の間で適宜増減する。

## 静脈内投与

〈振動病における末梢血行障害に伴う自覚症状の改善なら  
びに末梢循環・神経・運動機能障害の回復、血行再建術後の  
血流維持、動脈内投与が不適と判断される慢性動脈閉塞症  
(バージャー病、閉塞性動脈硬化症)における四肢潰瘍なら  
びに安静時疼痛の改善〉(1) 通常成人1回量本品2~3バイアル(アルプロスタジル  
40~60 $\mu$ g)を輸液500mLに溶解し、2時間かけて点滴静  
注する(5~10ng/kg/分)。なお、投与速度は体重1kg2時間あたり1.2 $\mu$ gをこえない  
こと。

(2) 投与回数は1日1~2回。

(3) 症状により適宜増減する。

## 〈動脈管依存性先天性心疾患における動脈管の開存〉

通常、アルプロスタジルとして50~100ng/kg/分の速度で  
静脈内投与を開始し、症状に応じて適宜増減し、有効最小  
量で持続投与する。

## 陰茎海綿体内投与

## 〈勃起障害の診断〉

本品1バイアル(アルプロスタジル20 $\mu$ g)を生理食塩液  
1mLに溶かし、通常、成人1回量アルプロスタジルとして  
20 $\mu$ gを陰茎海綿体へ注射する。

## 7. 用法及び用量に関連する注意

## 〈動脈管依存性先天性心疾患〉

観察を十分行い慎重に投与量の調整を行うこと。効果が得  
られた場合には減量し、有効最小量で投与を継続すること。  
動脈管開存の維持には10ng/kg/分でも有効な場合がある。

## 8. 重要な基本的注意

## 〈振動病、血行再建術後の血流維持、慢性動脈閉塞症〉

8.1 本剤による治療は対症療法であり投与中止後再燃する  
ことがあるので注意すること。8.2 心不全、肺水腫、胸水があらわれることがあるので、輸  
液量に留意するとともに、循環状態(血圧、脈拍等)を十分  
に観察すること。また、動悸、胸苦しさ、呼吸困難、浮  
腫等の症状があらわれた場合には本剤の投与を中止し、適  
切な処置を行うこと。特に高齢者は心機能等生理機能が低  
下しているため、患者の状態を観察しながら慎重に投与す  
ること。[11.1.2 参照]8.3 慢性動脈閉塞症における四肢潰瘍の改善を治療目的とす  
る場合、静脈内投与は動脈内投与に比し治療効果がやや劣  
るので、動脈内投与が非適応と判断される患者(高位血管  
閉塞例等)又は動脈内投与操作による障害が、期待される  
治療上の効果を上まわると判断される患者に行うこと。

## 〈動脈管依存性先天性心疾患〉

8.4 本剤による治療は対症療法であり投与中止後症状が悪化  
することがあるので注意すること。8.5 本剤の投与を継続しても、状態の改善がみられなければ、  
緊急手術等、適切な処置を行うこと。

- 8.6 本剤の高用量投与により、副作用発現率が高まるおそれがあるため、有効最小量にて使用すること。
- 8.7 本剤の長期投与により長管骨膜に肥厚、多毛及び脱毛がみられるとの報告があるので観察を十分にを行い、必要以上の長期投与は避けること。
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  
(**効能共通**)
- 9.1.1 心不全のある患者  
循環状態に対する観察を十分にを行い、慎重に投与すること。心不全の増強傾向があらわれるとの報告がある。
- 9.1.2 重症糖尿病患者  
網膜症等、脆弱血管からの出血を助長することがある。
- 9.1.3 出血傾向のある患者  
出血を助長するおそれがある。
- 9.1.4 胃潰瘍の合併症及び既往歴のある患者  
出血を助長するおそれがある。
- 9.1.5 緑内障、眼圧亢進のある患者  
動物実験(ウサギ)で眼圧上昇が報告されている<sup>1)</sup>。  
(**勃起障害の診断**)
- 9.1.6 陰茎の構造上欠陥(屈曲、陰茎の線維化、Peyronie病等)のある患者  
陰茎痛を伴うおそれがある。
- 9.1.7 持続勃起症の素因となり得る疾患(鎌状赤血球性貧血、多発性骨髄腫、白血病等)のある患者
- 9.2 腎機能障害患者
- 9.2.1 腎不全の患者  
腎不全を増悪することがある。
- 9.5 妊婦  
妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。アルプロスタジールには子宮収縮作用が認められている<sup>2)</sup>。[2.3 参照]
- 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  
動脈管依存性先天性心疾患以外の効能について、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  
減量するなど注意すること。一般に心機能等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 アスピリン チクロピジン シロスタゾール	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。	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ことが考えられる。
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	観察を十分にを行い、用量を調節するなど注意すること。	

## 11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分にを行い、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

#### (**効能共通**)

- 11.1.1 ショック、アナフィラキシー (いずれも頻度不明)  
観察を十分にを行い、血圧低下、意識障害、呼吸困難、発疹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。
- 11.1.2 心不全、肺水腫、胸水 (いずれも頻度不明)  
観察を十分にを行い、動悸、胸苦しさ、呼吸困難、浮腫等の症状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。[8.2 参照]
- 11.1.3 脳出血 (頻度不明)、消化管出血 (0.13%)
- 11.1.4 心筋梗塞 (頻度不明)  
観察を十分にを行い、胸痛、胸部圧迫感、心電図異常等が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 11.1.5 無顆粒球症、白血球減少 (いずれも頻度不明)
- 11.1.6 肝機能障害、黄疸 (いずれも頻度不明)  
AST、ALT、 $\gamma$ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害や黄疸があらわれることがある。

### 11.1.7 間質性肺炎 (頻度不明)

観察を十分にを行い、発熱、咳嗽、呼吸困難等があらわれた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

### (**動脈管依存性先天性心疾患**)

#### 11.1.8 無呼吸発作 (頻度不明)

観察を十分に行うこと。なお、発現した場合は、人工呼吸器の装着、皮膚への刺激等、適切な処置を行うこと。

注) 動脈管依存性先天性心疾患への投与において、上記等の副作用が発現した場合には、患者の状態を観察し、本剤の投与継続の必要性について考慮した上で、適切な処置を行うこと。

### (**勃起障害の診断**)

#### 11.1.9 持続勃起症 (頻度不明)

観察を十分にを行い、発現した場合には $\alpha$ 刺激剤の投与、脱血と生理食塩水による洗浄等、適切な処置を行うこと。

### 11.2 その他の副作用

#### (**動脈内投与：慢性動脈閉塞症**)

	10~35%未満	10%未満	頻度不明
注射部	疼痛、腫脹	発赤、発熱、脱力感、瘙癢	
その他		頭痛	発熱、動悸、血漿蛋白分画の変動

#### (**静脈内投与：振動病、血行再建術後の血流維持、動脈内投与が不適と判断される慢性動脈閉塞症**)

	0.5~10%未満	0.5%未満	頻度不明
過敏症			掻痒、発疹、蕁麻疹
循環器	胸部絞扼感	顔面潮紅	血圧低下、動悸、発赤
出血傾向			眼底出血、皮下出血
注射部	血管痛、発赤	腫脹、瘙癢	静脈炎、疼痛
呼吸器			咳嗽、喘息
消化器	悪心・嘔吐	下痢	胃部不快感、食欲不振、腹痛
精神神経系		めまい	発熱、悪寒
肝臓			AST・ALTの上昇等
腎臓			腎不全の増悪
血液			血小板減少、貧血
その他	熱感、四肢疼痛(増強を含む)	頭痛・頭重、乳房硬結	浮腫、関節痛、しびれ、CRP上昇、低ナトリウム血症

#### (**静脈内投与：動脈管依存性先天性心疾患**)

	5~15%未満	5%未満	頻度不明
循環器		頻脈、低血圧	肺動脈中膜の菲薄化、浮腫、発赤、徐脈
中枢神経系	発熱		痙攣、振戦、多呼吸
注射部			血管痛、静脈炎、疼痛、発赤、腫脹、瘙癢
その他		下痢、口腔内・気道分泌液の増加、アシドーシス、低ナトリウム血症	胃粘膜肥厚、低クロール血症、CRP上昇、脱毛、多毛、腹水、骨膜肥厚、低カリウム血症、出血傾向

#### (**陰茎海绵体内投与：勃起障害の診断**)

	頻度不明
過敏症	発疹、掻痒
泌尿、生殖器	勃起の延長、陰茎痛、陰茎腫脹

	頻度不明
注射部	疼痛、血腫、出血、腫脹、灼熱感、発赤、瘙痒
循環器	低血圧、胸部絞扼感、発赤
消化器	悪心、嘔吐、腹痛
その他	めまい、発熱、頭痛、悪寒

#### 14. 適用上の注意

##### 14.1 薬物調製時の注意

シリンジポンプ使用に際しては、シリンジ内に気泡が混入しないように注意すること。

##### 14.2 薬物投与時の注意

本剤投与により、副作用があらわれた場合には、すみやかに投与速度を遅くするか又は投与を中止すること。

#### 15. その他の注意

##### 15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 本剤の投与により脳梗塞がみられたとの報告がある。

15.1.2 適応外であるが、勃起障害の治療目的で PGE<sub>1</sub> 製剤を複数回投与した症例において、陰茎海綿体の線維化が生じたとの報告がある。

15.1.3 適応外であるが、勃起障害の治療目的で PGE<sub>1</sub> 製剤をパバペリン等の勃起不全治療剤と併用投与した症例において、勃起の延長又は持続勃起症があらわれたとの報告がある。

#### 18. 薬効薬理

##### 18.1 作用機序

アルプロスタジル アルファデクスは、プロスタグランジン E<sub>1</sub> を安定化させた製剤である。局所血流増加、肉芽形成促進、表皮角化細胞増殖などの PGE<sub>1</sub> の作用を示す<sup>3)</sup>。

#### 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：アルプロスタジル アルファデクス  
(Alprostadil Alfadex)

化学名：7- [(1*R*2*R*3*R*) -3-Hydroxy-2- [(1*E*,3*S*) -3-hydroxyoct-1-en-1-yl] -5-oxocyclopentyl] heptanoic acid- $\alpha$ -cyclodextrin

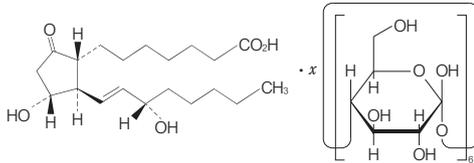
分子式：C<sub>20</sub>H<sub>34</sub>O<sub>5</sub> · xC<sub>36</sub>H<sub>60</sub>O<sub>30</sub>

分子量：354.48 (アルプロスタジル)

性状：白色の粉末である。

水に溶けやすく、エタノール (95)、酢酸エチル又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。  
吸湿性である。

化学構造式：



旋光度：[ $\alpha$ ]<sub>D</sub><sup>20</sup>：+126～+138° (脱水物に換算したもの0.1g、希エタノール、20mL、100mm)

pH：0.10g を水 20mL に溶かした液の pH は 4.0～5.0 である。

#### 20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。

#### 22. 包装

10 バイアル [ガラスバイアル]

#### 23. 主要文献

- 1) Chiang T.S. et al. : Arch Ophthalmol. 1972 ; 88 : 418-420
- 2) 川崎晃義他：応用薬理 1979 ; 17 (5) : 859-880
- 3) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十八改正 日本薬局方解説書 2021 : C-400-405

#### 24. 文献請求先及び問い合わせ先

高田製薬株式会社 文献請求窓口  
〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号  
電話 0120-989-813  
FAX 048-816-4183

#### 26. 製造販売業者等

##### 26.1 製造販売元

**高田製薬株式会社**  
さいたま市西区宮前町203番地1