

貯法：室温保存
有効期間：3年

承認番号	販売開始
22100AMX0113000	1972年2月

血行改善剤 ヘプロニカート錠100mg「CH」 Hepronicate Tablets

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5 参照]
2.2 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

販売名	ヘプロニカート錠100mg「CH」
有効成分	1錠中 ヘプロニカート 100mg
添加剤	トウモロコシデンプン、メチルセルロース、ステアリン酸マグネシウム

3.2 製剤の性状

販売名	ヘプロニカート錠100mg「CH」		
色調・剤形	白色の素錠		
外形			
大きさ	直径	7.0mm	
	厚さ	3.3mm	
重量	125mg		
識別コード	ch40		

4. 効能又は効果

- レイノー病・バージャー病・閉塞性動脈硬化症などの末梢循環障害
○凍瘡・凍傷

6. 用法及び用量

通常成人には1日量ヘプロニカートとして300～600mg（3～6錠）を毎食後3回に分け経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。
[2.1 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

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。一般に生理機能が低下している。

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

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器	嘔吐、口渇、胃痛、胃部膨満感、胃部不快感、食欲不振、下痢	便秘	
精神神経系	頭痛		
過敏症	痒痒感等		発疹
皮膚	発赤、熱感、蟻走感		
その他		のぼせ	

注）発現頻度は使用成績調査を含む

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

類似化合物（ニコチン酸）の過量投与により肝機能の異常が、また糖尿病及び消化性潰瘍を悪化させたとの報告がある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

ラットにニコチン酸換算で10mg/kgを単回経口投与した場合、血中濃度は1時間後に最高となり、その後減少するが、ニコチン酸にみられるような一過性の高い血中濃度を示さず、持続的である¹⁾。

16.2 吸収

ラット及びウサギに経口投与した場合、小腸内で加水分解を受けてニコチン酸となり吸収される¹⁾。

16.3 分布

ラットに経口投与した場合、肝、腎に比較的多く分布し、2時間後に最高濃度となる¹⁾。

16.5 排泄

ウサギに経口投与した場合、ほとんどが尿中へ排泄され、48時間以内のニコチン酸排泄量は投与量の40%である¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

二重盲検比較試験を含む国内17施設、192例について実施された臨床試験の概要は次のとおりである。

〈末梢循環障害〉

レイノー病・バージャー病・閉塞性動脈硬化症などの末梢循環障害に対しては、有効率64.0%（55例/86例）である^{2)、3)}。

〈凍瘡・凍傷〉

凍瘡・凍傷に対しては、有効率76.4%（81例/106例）である。また二重盲検比較試験によって、本剤の有用性が認められている^{4)～7)}。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ヘプロニカートはニコチン酸と脂肪側鎖からなるエステル体のプロドラッグであり、経口投与後、主に小腸で吸収され、加水分解によりニコチン酸となって緩徐に血中へ移行する。一過性の急激な血中濃度の上昇を認めず持続的に作用し、筋膜の興奮性を低下させることにより、血管平滑筋を始めとする各種平滑筋を弛緩し血管拡張作用を示すと考えられるほか^{1)、8)}、線溶系では*in vitro*でAdenosine diphosphateによる血小板凝集抑制作用が確認されており、これらの作用により血行改善効果を示すと考えられている⁹⁾。

18.2 薬理作用

18.2.1 血行改善作用

ヘプロニカートは、レイノー病（成人男性及び成人女性）・バージャー病（成人男性）・閉塞性動脈硬化症（成人男性）などの末梢循環障害の患者に経口投与した場合、サーモグラフィ、脈波検査及び血管造影法により血行改善作用が認められている^{1)、2)、10)、11)}。

18.2.2 血流改善作用

イヌを用いた実験で、後肢血流量の増加が、またウサギを用いた実験で、耳介血流量の増加が認められた^{1)、12)、13)}。モルモット摘出大動脈片及び摘出腸管に対して抗バリウム作用を示すことから、血管平滑筋に直接作用して末梢血管を拡張し、血流量を増加させるものと考えられる¹⁾。

18.2.3 血小板・線溶系に対する作用

ウサギ血漿を用いた*in vitro*試験で、血小板凝集抑制作用、線維素溶解作用が認められている¹⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ヘプロニカート (Hepronicate)

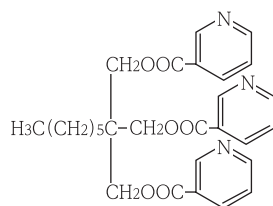
化学名：2-Hydroxymethyl-2-hexyl-1, 3-propandiol trinicotinate

分子式：C₂₈H₃₁N₃O₆

分子量：505.56

性状：白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。クロロホルムに極めて溶けやすく、酢酸（100）又は無水酢酸に溶けやすく、メタノール又はエタノール（95）にやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

構造式：



融点：96.0～100.0℃

22. 包装

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

1000錠 [10錠 (PTP) ×100]

23. 主要文献

- 1) 栗山経渡他：メグリン文献集基礎編
- 2) 西村徳之他：診療と新薬. 1968；5：511-517
- 3) 守永典彦：薬物療法. 1971；4：1389-1391
- 4) 井村春光他：新薬と臨床. 1971；20：333-334
- 5) 道部 秉：未発表
- 6) 針生敬三：新薬と臨床. 1971；20：491-492
- 7) 加藤裕二：未発表
- 8) 松岡幸彦他：基礎と臨床. 1988；22 (14)：568-575
- 9) 磯部淳一：臨床と研究. 1976；53 (6)：1793-1797
- 10) 永島 誠他：未発表
- 11) 神谷喜作：メグリン文献集No.1
- 12) 今村 博他：応用薬理. 1969；3：19-25
- 13) 中西 晃他：未発表

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **Chosei 長生堂製薬株式会社**
徳島市国府町府中92番地

26.2 販売元

 **日本ジェネリック株式会社**
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号