

貯 法：室温保存
有効期間：3年

日本標準商品分類番号

873399
872189

EPA製剤

日本薬局方 イコサペント酸エチルカプセル

イコサペント酸エチルカプセル300mg「サワイ」

ETHYL ICOSAPENTATE Capsules [SAWAI]

承認番号 22300AMX00462000

販売開始 1998年7月


2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 出血している患者(血友病、毛細血管脆弱症、消化管潰瘍、尿路出血、喀血、硝子体出血等)[止血が困難となるおそれがある。]
- 2.2 ミフェプリストン・ミソプロストールを投与中の患者 [10.1参照]

3. 組成・性状**3.1 組成**

有効成分 [1カプセル中]	日局イコサペント酸エチル 300mg
添加剤	グリセリン、コハク化ゼラチン、ゼラチン、中鎖脂肪酸トリグリセリド、トコフェロール

3.2 製剤の性状

外形	
剤形	軟カプセル剤
性状	淡黄色透明 内容物：無色～微黄色の澄明な液体
長径(mm)	17.8
短径(mm)	6.5
重量(mg)	約541
識別コード	SW-365(PTPに表示)

4. 効能又は効果

- 閉塞性動脈硬化症に伴う潰瘍、疼痛および冷感の改善
- 高脂血症

5. 効能又は効果に関連する注意**〈高脂血症〉**

適用の前に十分な検査を実施し、高脂血症であることを確認した上で本剤の適用を考慮すること。

6. 用法及び用量**〈閉塞性動脈硬化症に伴う潰瘍、疼痛および冷感の改善〉**

イコサペント酸エチルとして、通常、成人1回600mg(2カプセル)を1日3回、毎食直後に経口投与する。
なお、年齢、症状により、適宜増減する。

〈高脂血症〉

イコサペント酸エチルとして、通常、成人1回900mg(3カプセル)を1日2回又は1回600mg(2カプセル)を1日3回、食直後に経口投与する。
ただし、トリグリセリドの異常を呈する場合には、その程度により、1回900mg(3カプセル)、1日3回まで増量できる。

8. 重要な基本的注意**〈閉塞性動脈硬化症に伴う潰瘍、疼痛および冷感の改善〉**

8.1 治療にあたっては経過を十分に観察し、本剤で効果がみられない場合には、投与を中止し、他の療法に切り替えること。また、本剤投与中は定期的に血液検査を行うことが望ましい。

〈高脂血症〉

8.2 あらかじめ高脂血症治療の基本である食事療法を行い、更に運動療法や高血圧・喫煙等の虚血性心疾患のリスクファクターの軽減等も十分に考慮すること。

8.3 投与中は血中脂質値を定期的に検査し、治療に対する反応が認められない場合には投与を中止すること。

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 出血を助長するおそれのある患者**

(1)月経期間中の患者

(2)出血傾向のある患者

(3)手術を予定している患者

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)で乳汁中に移行することが報告されている。

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

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
ミフェプリストン・ミソプロストール メフィーゴバック [2.2参照]	ミフェプリストン・ミソプロストールによる子宮出血の程度が悪化するおそれがある。	イコサペント酸エチルの抗血小板作用により出血が増強するおそれがある。

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
抗凝固剤 ワルファリンカリウム等 血小板凝集を抑制する薬剤 アスピリン インドメタシン チクロピジン塩酸塩 シロスタゾール等	出血傾向をきたすおそれがある。	イコサペント酸エチルは抗血小板作用を有するので、抗凝固剤、血小板凝集を抑制する薬剤との併用により相加的に出血傾向が増大すると考えられる。

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。

11.1 重大な副作用**11.1.1 肝機能障害(頻度不明)、黄疸(頻度不明)**

AST、ALT、Al-P、 γ -GTP、LDH、ビリルビン等の上昇を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	頻度不明
過敏症	発疹、そう痒感等	
出血傾向	皮下出血	血尿、歯肉出血、眼底出血、鼻出血、消化管出血等
血液		貧血等
消化器	悪心、胸やけ、腹部不快感、下痢、便秘、腹部膨満感、腹痛	嘔吐、食欲不振、口内炎、口渇、鼓腸等
肝臓	AST・ALT・Al-P・ γ -GTP・LDH・ビリルビンの上昇等の肝機能障害	
腎臓	BUN・クレアチニンの上昇	
呼吸器		咳嗽、呼吸困難
精神神経系	頭痛・頭重感、ふらつき、しびれ	めまい、眠気、不眠

	0.1～5%未満	頻度不明
筋骨格系		関節痛、筋肉痛、四肢痛、筋痙攣(こむら返り等)
その他	浮腫、尿酸上昇、CKの上昇、動悸	顔面潮紅、ほてり、発熱、頻尿、全身倦怠感、血圧上昇、女性化乳房、耳鳴、発汗、ざ瘡

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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。

14.1.2 本剤は空腹時に投与すると吸収が悪くなるので食直後に服用させること。

14.1.3 本剤は嚙まずに服用させること。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 コントロール不良の高血圧症を有し、他の抗血小板剤を併用した症例において、脳出血があらわれたとの報告がある。

15.1.2 本剤と同一有効成分(4g/日²⁾)を含有する製剤の海外臨床試験において、心房細動又は心房粗動のリスク増加が認められたとの報告がある¹⁾。

注)高脂血症において本剤の承認された1日最高用量は、2,700mgである。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

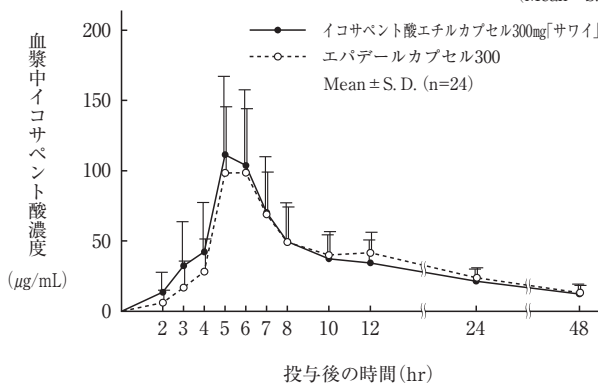
16.1.1 生物学的同等性試験

イコサペント酸エチルカプセル300mg「サワイ」とエバデールカプセル300を健康成人男子にそれぞれ6カプセル(イコサペント酸エチルとして1,800mg²⁾)食後単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中イコサペント酸濃度を測定した。投与前値で補正した値より得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

各製剤6カプセル投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-48hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)
イコサペント酸エチルカプセル300mg「サワイ」	121±54	5.4±0.8	28.8±19.5	1303±504
エバデールカプセル300	114±43	5.7±0.9	23.5±7.8	1350±316

(Mean±S. D.)



血漿中濃度ならびにAUC、Cmax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。

注)高脂血症において本剤の承認された1回用量は、900mgまでである。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

EPA-Eは小腸で脱エチル化を受けてEPAに代謝された後、以下の作用を示す³⁾⁻⁵⁾。

- ・リポ蛋白に取り込まれ、リポ蛋白の代謝を促進する。
- ・肝ミクロソームに取り込まれ、脂質の生合成・分泌を抑制する。

19. 有効成分に関する理化学的知見

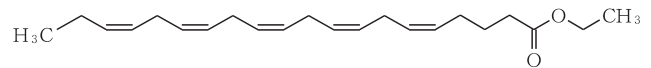
一般名：イコサペント酸エチル(Ethyl Icosapentate)

化学名：Ethyl (5Z,8Z,11Z,14Z,17Z)-icosa-5,8,11,14,17-pentaenoate

分子式：C₂₂H₃₄O₂

分子量：330.50

構造式：



性状：無色～微黄色の澄明な液で、わずかに特異なにおいがある。エタノール(99.5)、酢酸(100)、ヘキサンと混和する。水又はエチレングリコールにほとんど溶けない。

20. 取扱い上の注意

開封後は、高温・湿気・光を避けて保存すること。高温・高湿下ではカプセルが軟化することがある。

22. 包装

PTP：100カプセル(10Cap×10)

23. 主要文献

- 1) Bhatt, D. L. et al. : N. Engl. J. Med., 2019 ; 380(1) : 11-22
- 2) 社内資料：生物学的同等性試験
- 3) 作用機序(エバデールEMカプセル：2022年6月20日承認、申請資料概要2.6.1)
- 4) Mizuguchi, K. et al. : Eur. J. Pharmacol., 1993 ; 231(1) : 121-127
- 5) Mizuguchi, K. et al. : Eur. J. Pharmacol., 1993 ; 235(2-3) : 221-227

24. 文献請求先及び問い合わせ先

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

メディサ新薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-27

26.2 発売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30