＊ 2024年11月作成(第1版)

禁煙補助薬
α4β2ニコチン受容体部分作動薬

バレニクリン酒石酸塩錠 0.5mg/1mg

スモスト™-0.5/1

Varenicline Tartrate Tablets 0.5mg/1mg
SMOSTO™-0.5/1

販売開始	2024年11月
貯　法	室温保存
使用期限	外装に表示

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

[redacted]

【組成・性状】

販売名	スモスト™-0.5	スモスト™-1
有効成分	1錠中バレニクリン0.5mg	1錠中バレニクリン1mg
剤形	フィルムコーティング錠	
色調	淡青色	淡黄色
識別コード	-	
外形	上面　下面　側面	
直径	約6mm	
厚さ	約3mm	
質量	約120mg	

【効果・効能】

ニコチン依存症の喫煙者に対する禁煙の補助

【効能・効果に関連する注意】

本剤の投与にあたって、事前にニコチン依存症を判定するスクリーニングテスト(TDS)を実施すること。

本剤の投与にあたって、事前に患者の禁煙意志を確認すること。

【用法・用量】

通常、成人にはバレニクリンとして1日目～3日目は0.5mgを1日1回食後に経口投与、4日目～7日目は0.5mgを1日2回朝夕食後に経口投与、8日目以降は1mgを1日2回朝夕食後に経口投与する。

本剤の投与期間は12週間とする。

【用法・用量に関連する注意】

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

1.小児等への投与

12歳未満の小児等に関する安全性は確立していない。

2.高齢者への投与

本剤は主に腎臓から排泄されるが、薬物動態試験において、高齢者と非高齢者における薬物動態に有意な差は認められなかった。

ただし、一般的に高齢者は腎機能が低下しており、副作用の発現が高い傾向が認められているため、経過を十分に観察し、慎重に投与すること。

3.妊婦(妊娠している可能性のある女性を含む)

妊婦(妊娠している可能性のある女性を含む)に関する安全性は確立していない。

妊婦(妊娠している可能性のある女性を含む)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。

4.授乳婦

授乳婦には、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、または中止を検討すること。

本剤の授乳婦における乳汁(ヒト母乳)中への移行については不明である。

【重要な基本的注意】

1.医師等による禁煙治療プログラムに基づいた指導の下、本剤を適切に投与すること。

2.患者が禁煙を開始する日を設定し、その日から1週間前に本剤の投与を開始すること。

3.本剤を投与しても効果が不十分な場合は、より適切と考えられる禁煙治療への変更を考慮すること。

4.めまい、傾眠、意識障害等を引き起こす恐れがあるため、自動車の運転や危険を伴う機械の操作に従事しないこと。

5.本剤の投与後、基礎疾患として有している精神疾患の悪化に注意すること。

6.本剤との因果関係は明らかではないが、抑うつ気分、不安、焦燥、興奮、行動や思考の変化、精神障害、気分変動、攻撃的行動、敵意、自殺念慮、自殺が報告されているため、本剤を投与する際には十分に注意し、これらの症状が現れた場合には、本剤の服用を中止して速やかに医師等に連絡すること。

7.本剤は噛まずに舐めずに服用すること。

8.本剤を1日2回(1回1mg)を超えて投与しないこと。

【相互作用】

併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法・機序等
他の禁煙補助薬	本剤の有効性、及び安全性は単剤投与により確認されており、他の禁煙補助薬と併用した際の有効性は検討されていない。また、安全性についても経皮吸収ニコチン製剤との併用によって副作用の発現率上昇が認められている。

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・機序等
シメチジンを含む薬剤	シメチジンを含む薬剤との併用により本剤の腎クリアランスが低下して、全身曝露量が増加する恐れがある。

その他の相互作用

1.メトホルミンを含む薬剤

臨床試験においてメトホルミンを含む薬剤の薬物動態に変化は認められていない。

2.ジゴキシンを含む薬剤

臨床試験においてジゴキシンを含む薬剤の薬物動態に変化は認められていない。

3.ワルファリンを含む薬剤

臨床試験においてワルファリンを含む薬剤の薬物動態に変化は認められていない。

【副作用】

重大な副作用

1.**皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、多形紅斑**(頻度不明)

皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)や多形紅斑を引き起こした例が報告されている。

皮疹等の症状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。

2.**血管浮腫**(頻度不明)

血管浮腫を引き起こした例が報告されている。

顔面、舌、口唇、咽頭、喉頭等に浮腫の症状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。

3.**意識障害**(頻度不明)

意識障害を引き起こした例が報告されている。

意識レベルの低下、意識消失等の意識障害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。

4.**肝機能障害、黄疸**(頻度不明)

肝機能障害や黄疸を引き起こした例が報告されている。

AST、ALT、γ-GTP等の上昇を伴う肝機能障害や黄疸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。

本剤の投与後は観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

その他の副作用

次の副作用が認められた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

部位	頻度不明
感染症 寄生虫症	上気道感染、気管支炎
代謝障害 栄養障害	食欲不振、食欲亢進、多飲症
精神障害	不眠症、異常な夢、リビドー減退、易刺激性、感情不安定、激越、睡眠障害、不安、抑うつ、落ち着きのなさ、精神緩慢、気分変動、思考異常、不快気分、精神障害、攻撃的行動、敵意
神経系障害	頭痛、傾眠、振戦、注意力障害、味覚異常、嗜眠、協調運動異常、構語障害、感覚鈍麻、記憶障害、健忘、一過性健忘、痙攣
心臓障害	心房細動、動悸、狭心症
血管障害	ほてり、高血圧
眼障害	眼痛、羞明、暗点、結膜炎
耳障害 迷路障害	耳鳴
呼吸器障害 胸郭障害 縦隔障害	咽喉刺激感、咳嗽、呼吸困難、嗄声、鼻漏、気道うっ血、副鼻腔うっ血、いびき
胃腸障害	嘔気、鼓腸、便秘、胃食道逆流性疾患、胃不快感、下痢、口内乾燥、消化不良、軟便、腹痛、腹部膨満、嘔吐、おくび、胃炎、歯肉痛、吐血、血便排泄、口内炎、イレウス
皮膚障害 組織障害	ざ瘡、そう痒症、発疹、紅斑、多汗症
筋骨格系障害 結合組織障害	筋痛、筋痙攣、関節硬直、関節痛、背部痛
腎障害 尿路障害	頻尿、夜間頻尿、糖尿、多尿
生殖系障害 乳房障害	月経過多、性機能不全
全身障害 投与局所様態	胸痛、倦怠感、口渇、無力症、めまい、胸部不快感、発熱、浮腫、末梢性浮腫
臨床検査	肝機能検査値異常(AST上昇、ALT上昇、ALP上昇、血中ビリルビン上昇)、心電図ST部分下降、心電図T波振幅減少、心拍数増加、血小板数減少、体重増加

【過量投与】

1日2回(1回1mg)を超える用量(過量投与)によって追加の効果は得られない。

過量投与した場合には、臨床実績はないが、人工透析により除去できることが示されている。

【薬物動態】

本剤は主に腎臓で代謝される。

吸収

バレニクリン1mgを空腹時、及び食後に単回経口投与し、薬物動態を比較した。Cmax、及びAUCは空腹時投与と食後投与の間でほぼ同値であり、バレニクリンの薬物動態に対する食事の影響は認められなかった。

分布

バレニクリンは20.3%が血漿タンパク質に結合していた。

高齢者、及び腎機能障害患者の血漿タンパク質結合率も同様であった。

代謝

バレニクリンはin vitroにおいてヒト肝ミクロソームでは代謝されなかったため、ヒト肝CYP3A4系による代謝を受けないことが示された。

UGT2B7によりN-カルバモイルグルクロン酸抱合体のみが生成された。

排泄

バレニクリンは投与量の87.1%が尿中に排泄された。

尿中に排泄された放射能のほとんどが未変化体(投与放射能の80.5%、尿中に排泄された放射能の91.6%)であった。

経口投与されたバレニクリンの吸収率は高く、肝代謝をほとんど受けず、主に未変化体として尿中に排泄されることが示された。

【薬効薬理】

作用機序

バレニクリンはα4β2ニコチン受容体に対して高い結合親和性を持つ、ニコチン受容体の部分作動薬である。

バレニクリンが脳内のα4β2ニコチン受容体に結合すると、ニコチンを遮断して喫煙による満足感を抑制する(拮抗作用)。

また、ニコチンの作用で放出されるよりも少量のドパミンを放出させ、禁煙に伴う離脱症状やタバコ(喫煙)に対する切望感を軽減する(刺激作用)。

ニコチン摂取の抑制作用

バレニクリンはニコチンと併用するとニコチンによるドパミン遊離作用を抑制できるため、ニコチン依存症の喫煙者におけるニコチン自己摂取行動の抑制が期待できる。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名:バレニクリン酒石酸塩(Varenicline Tartrate)

化学名:7,8,9,10-Tetrahydro-6H-6,10-methanoazepino[4,5-g]quinoxaline mono[(2R,3R)-tartrate]

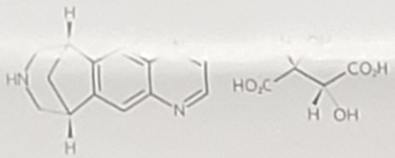
分子式:$C_{13}H_{13}N_3 \cdot C_4H_6O_6$

分子量:361.35g/mol

性　状:バレニクリン酒石酸塩は白色～微黄色の結晶性の粉末である。

水に溶けやすい。
N,N-ジメチルアセトアミドに溶けにくい。
エタノール(99.5)にほとんど溶けない。

構造式



【包装】

スモスト™-0.5
11錠(11錠(PTP)×1)
スモスト™-1
14錠(14錠(PTP)×1)

【製造元】

Centurion Remedies Pvt. Ltd. (センチュリオン レメディロズ プライベート リミテッド)
G -5 & 6, B.I.D.C, Gorwa, Vadodara - 390 016
Code No.: GUJ/DRUGS/G/25/1325

【販売元】

Express Works Ltd.(エクスプレスワークス)
公式Webサイト https://jp.ex-works.biz/

簡単服用ガイド

服用方法

0.5mg から服用を開始し、最初の 8 日目までに徐々に服用回数と服用量を増やしていきます。

経過日数	服用回数	服用タイミングと服用量（1 回）
1 日目 〜 3 日目	1 日 1 回	食後 0.5mg
4 日目 〜 7 日目	1 日 2 回	朝食後 0.5mg 夕食後 0.5mg
8 日目※1 〜 84 日目	1 日 2 回	朝食後 1mg 夕食後 1mg
85 日目※2	禁煙成功	

※1 8 日目までに禁煙を開始してください。
※2 85 日目以降で禁煙が成功できなかった場合のみ、服用を継続してください。