

# 日本初！ "足のむくみを改善する内服薬" "西洋ハーブ医薬品" 「アンチスタックス」新発売

発売日：2013年 6月3日（月）

エスエス製薬株式会社（本社：東京都中央区、代表取締役社長：石橋利哉）は、内服薬として日本初となる軽度の静脈還流障害による足のむくみを改善する「アンチスタックス」（第1類医薬品）を、全国のドラッグストア、薬局・薬店を通じて2013年6月3日（月）に発売致します。

「アンチスタックス」は、2007年3月に厚生労働省が通知※1で西洋ハーブを有効成分とする医薬品承認申請ルールを定めて以来、2011年1月に第一号として承認された「西洋ハーブ医薬品」であり、ダイレクトOTC医薬品※2となります。有効成分は赤ブドウ葉を原材料とした「赤ブドウ葉乾燥エキス混合物」です。

※1 2007年3月22日付 薬食審査発第0322001号 厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知

※2 ダイレクトOTC医薬品とは、新規有効成分が医療用医薬品としての承認を経ずに一般用医薬品として直接承認された医薬品です。また、OTC医薬品とは「一般用医薬品」を指します



「アンチスタックス」

2013年5月22日  
エスエス製薬株式会社

## ■日本初1：血管を強化し、血流を促進することによって足のむくみを改善する内服薬

足のむくみは多くの人が悩んでいる症状ですが、実は静脈の還流障害が主な原因となっていることはいまだあまり知られていません。足のむくみには、静脈還流障害（慢性静脈不全）※3という病気が隠れていることがあり、その罹患率は一般人口の40～50%程度にもものぼるとも言われますが、日本国内ではこれまで有効な治療薬はありませんでした。

静脈還流障害（慢性静脈不全）の初期症状は足のむくみや、重さ、だるさ、つっぱり感、痛みといった症状があげられますが、これらは血流の滞りが主な原因であるとされています。「アンチスタックス」は1日1回2カプセルを朝服用することにより、血管を強化し血流を促進することで軽度の静脈還流障害（慢性静脈不全）の初期症状を改善します。

※3 静脈還流障害は、放置しておくと次第に進行し、次には下肢の静脈瘤を引き起こし、さらに症状を重症化させ、足の皮膚に褐色の色素が沈着したり、皮膚が破れたりする皮膚潰瘍の原因にもなってきます。

## ■日本初2：「西洋ハーブ医薬品」として第一号のOTC医薬品

ヨーロッパにおいて古くから血管（静脈）の病に良いとされている赤ブドウ葉を原材料として、医薬品としての有効性と安全性、品質を確保した天然由来の「赤ブドウ葉乾燥エキス混合物」（AS195）が「アンチスタックス」の有効成分です。長い間、ヨーロッパを中心に海外では赤ブドウ葉をはじめとする西洋ハーブの医薬品が様々な症状の治療に広く使われてきましたが、日本では2007年3月に厚生労働省の通知により、西洋ハーブを有効成分とする医薬品承認申請のルールが定められました。その第一号「アンチスタックス」が2011年1月にダイレクトOTC医薬品として製造販売承認を取得し、日本で初めての西洋ハーブ医薬品として発売する運びとなりました。

## ■製品概要

製品名	アンチスタックス
OTC医薬品分類	第1類医薬品
剤型	赤褐色硬カプセル剤
成分・分量	2カプセル（1日量）中 赤ブドウ葉乾燥エキス混合物 450mg （赤ブドウ葉乾燥純エキスとして360mgに相当）
用法・用量	成人（20才以上）1回2カプセルを1日1回、朝に水又はぬるま湯で服用してください。
効能・効果	軽度の静脈還流障害（静脈の血流が滞ること）による次の諸症状の改善： 足（ふくらはぎ、足首など）のむくみ、むくみに伴う足のだるさ・重さ・疲れ・つっぱり感・痛み
包装・価格	希望小売価格（税込み）： 40カプセル/3,045円 60カプセル/4,095円
発売日	2013年6月3日（月）
製造販売元	エスエス製薬株式会社
備考	この医薬品は、薬剤師から説明を受け、「使用上の注意」をよく読んでお使い下さい。 ダイレクトOTC医薬品として2011年1月21日承認  ダイレクトOTC医薬品とは、新規有効成分が、医療用医薬品としての承認を経ずに一般用医薬品として直接承認された医薬品です。また、OTC医薬品とは、「一般用医薬品」を指します。

#### <有効成分について>

「アンチスタックス」の有効成分は、ポリフェノール類などを含有した独自の天然成分「赤ブドウ葉乾燥エキス混合物（AS195）」で、医薬品としては初めて静脈還流障害による足のむくみの改善に効果が確認されたものです。欧州医薬品庁の薬の規格書となるモノグラフ（Well-established use）にも収載され、基原植物（Teinturier）、採取地域、採取時期、採取部位等を独自に規定した赤ブドウ葉を原料として使用しています。溶媒組成、抽出温度、抽出時間など、独自の条件で抽出することにより、効果の優れた赤ブドウ葉乾燥エキスを生成しています。



#### <グローバルに展開するアンチスタックス>

アンチスタックスは、1969年にその原型となる製品がドイツで誕生し、1971年に販売が始まりました。現在では「アンチスタックス」ブランドとしてベーリンガーインゲルハイムによって世界25カ国以上で販売されています。

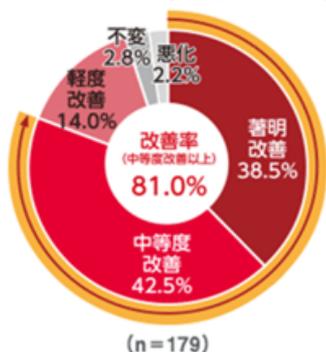
#### ■アンチスタックスの臨床試験結果 <出典：承認申請時添付資料>

「アンチスタックス」の有効性と安全性を確認するために、足にむくみ等を有する方を対象に、臨床試験を実施しています。その結果、**81.0%の改善率**（全般改善度：「中等度改善」以上）が得られており、足の静脈還流障害によるむくみ、およびそれに伴う諸症状に対する、有効性および安全性が示されています。

#### <投与終了時の全般改善度>

足に重さや疲れ（だるさ）などの症状を感じている方で、医師の触診により足の静脈の血流の滞りでふくらはぎ等にむくみがあると診断された方を対象に「アンチスタックス」を1日1回2カプセル、12週間服用していただきました。この投与試験では、症状別に重症度をスコア等で判定して分類し、その重症度の段階がどの程度改善したかにより、評価しています。なお、「著明改善」「中程度改善」「軽度改善」は判定基準に基づき改善度がみられたもの、「不変」は重症度が変化しなかったもの、「悪化」は重症度の段階が高まったものを指しています。

#### 全般改善度（投与終了時）



#### 足のむくみに伴う自覚症状の改善率<sup>※1</sup>

重量感・疲れ（だるさ）	59.8%
つっぱり感	69.9%
痛み	74.0%

※1 各自覚症状毎の全般改善度の改善率（「中等度改善」以上）  
（承認を受けた自覚症状のみ表示）

【対象】 下肢の静脈還流障害により、ふくらはぎやくるぶし等のむくみを有し、触診による圧痕を呈し、かつ「重量感・疲れ（だるさ）」、「つっぱり感」、「ビリビリ感」、「痛み」、「熱感」、「かゆみ」の症状を有し、Porter's分類※2のクラス1に該当する患者 180名

※2 現在の診断分類にはCEAP分類が用いられます。

【方法】 アンチスタックスを1日1回、2カプセルを朝（午前中）に服用する。

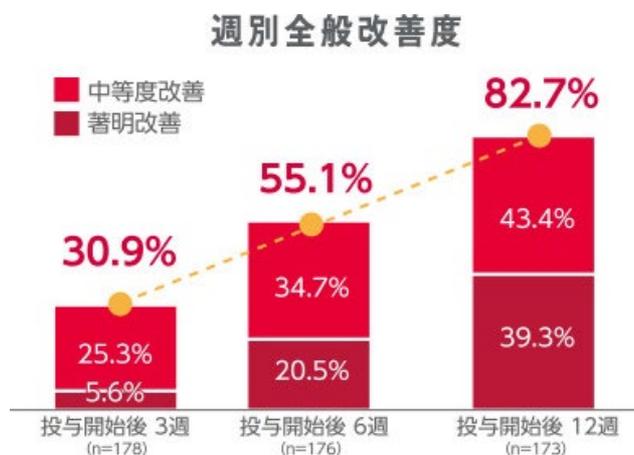
投薬期間：12週間（84日） 評価時点：投与開始前日、投与開始後3、6及び12週

この結果、「著明改善」と「中程度改善」をあわせた改善率（全般改善率）は**81.0%**であり、**8割以上**の改善率が認められています。また、足のむくみに伴う自覚症状別の改善率（全般改善度）では、足に重さや疲れ（だるさ）を感じていた方は約**6割**、足につっぱり感を感じていた方は約**7割**、痛みを感じていた方は**7割以上**の改善率が認められています。

#### <週別全般改善度>

アンチスタックスの改善率を服用期間ごとにみると、**3週後では30.9%、6週後では55.1%、12週後では82.7%**と改善率が高くなっていることがわかります。「アンチスタックス」は継続服用より改善率が高まること が示されています。

なお、このグラフでは各評価時点（投与開始後**3週、6週および12週**）の解析対象症例に基づいた全般改善度を示しています。評価時点の症例数は、試験中止および脱落者により異なります。投与開始後**12週目**の解析症例数は**173例**であり、その改善度は**82.7%**でした。



#### <安全性>

国内の臨床試験（安全性の解析対象例数**180例**）において、**12例（6.7%）13件**の副作用（自覚症状・他覚初見）が認められました。主なものは、便秘、上腹部痛、腸炎の「胃腸障害」等でしたが、いずれも軽度であり、回復または軽快しています。

#### <ご参考資料>

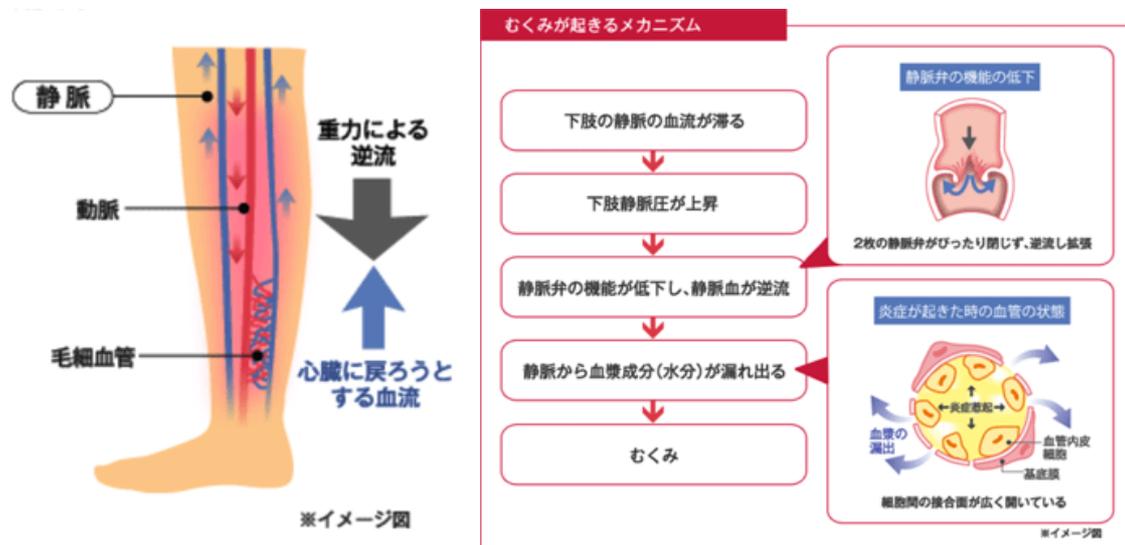
##### ■足がむくむメカニズムとアンチスタックスが効く仕組み

#### <足がむくむメカニズム>

足の血液が心臓に戻る（静脈還流する）ための最も大きな原動力は、ふくらはぎの筋肉によるポンプ作用です。正常な状態では、ふくらはぎの筋肉の収縮が静脈を圧迫することで血液は加圧され、その押し出す力によって血液が心臓に戻されていきます。また、下肢（足）の静脈には、血流が重力によって逆流することなく心臓に戻るように静脈弁があり、血液を心臓に戻す循環を助けています。

立ったままや座ったままの姿勢が長く続くと、下肢の筋ポンプは機能しなくなり、そのために血液が心臓に向かって流れる血流は停滞します。また、血液自体の重量が静脈内にかかるため、静脈圧（静脈内の圧力）が上昇し、静脈が拡張した状態となります。この静脈の拡張により、静脈内の血液は下肢に溜まりやすくなります。

下肢で静脈還流が滞ると、下肢静脈内の圧力が上昇し、血管内皮細胞は炎症を起こし（下図参照）、血管内から血管外へ血液の血漿成分（水分）が浸み出て、皮膚の下の細胞外に水分が貯留します。これが、下肢にむくみが起こる原因となります。



<静脈還流障害（慢性静脈不全）とは>

下肢の静脈の血流が滞ることによって「静脈還流障害（慢性静脈不全）」が引き起こされる可能性があります。この疾患の初期症状には、上述のような下肢のむくみをはじめ、自覚症状として、だるさ・重さ・疲れ・つっぱり感・痛みなどがみられます。これらを放置しておくと症状が次第に進行し、下肢の静脈瘤を引き起こし、さらに症状を重症化させ、足の皮膚に褐色の色素が沈着したり、皮膚を破って皮膚潰瘍の原因にもなってしまいます。

<アンチスタックスが効く仕組み>

アンチスタックスは、血管を強化し、血流を促進し、足のむくみの原因に直接働きかけることで、むくみをはじめとする軽度の静脈還流障害による初期症状を改善し、足を健康な状態に近づけていきます。

<p>1.シーリング作用</p>	<p>健康な静脈の毛細血管の内皮細胞は、細胞間がきちんと閉じ、結合された状態ですが、血流が滞り炎症が起きると、細胞間の接合部が広く開き、血液中の血漿成分（水分）が流出してしまいます。アンチスタックスは、シーリング作用により細胞間の接合部を密着させ、健康な状態に近づけていきます。</p> <div style="text-align: center;"> <p>●健康な血管</p> <p>●炎症が起きたときの血管の状態</p> <p>●アンチスタックス処理後 &lt;シーリング作用&gt;</p> </div>
<p>2.血流の改善</p>	<p>血小板凝集抑制作用を有することから、滞りがちだった血流のめぐりに働きかけると考えられます。</p>
<p>3.むくみの抑制</p>	<p>炎症によるむくみの軽減作用を有することから、下肢（足）のむくみが抑制されると考えられます。</p>

西洋ハーブ医薬品

足にむくみのある全国の女性**1,000**人に聞いた足のむくみに関する実態調査  
(2013年4月24日 ニュースリリース)