

**2015年10月改訂（第8版）
*2014年9月改訂（第7版）

貯 法：室温保存、気密容器
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。

5-HT₂ブロッカー

日本薬局方 サルボグレレート塩酸塩錠

サルボグレレート塩酸塩錠50mg「オーハラ」

サルボグレレート塩酸塩錠100mg「オーハラ」

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 50mg OHARA

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 100mg OHARA

| 日本標準商品分類番号 | | |
|-------------|----------------------------|-----------------------------|
| 8 7 3 3 9 9 | | |
| | サルボグレレート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」 | サルボグレレート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」 |
| 承認番号 | 22100AMX02117000 | 22100AMX02118000 |
| 薬価収載 | 2009年11月 | 2009年11月 |
| 販売開始 | 2009年11月 | 2009年11月 |

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- 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、咯血、硝子体出血等）〔出血を更に増強する可能性がある。〕
- 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人（「6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）

**【組成・性状】

| 販売名 | サルボグレレート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」 | サルボグレレート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」 | | | | |
|-------|--|-------------------------------|-------------------|----|----|----|
| 成分・含量 | 1錠中日局サルボグレレート塩酸塩50mgを含有 | 1錠中日局サルボグレレート塩酸塩100mgを含有 | | | | |
| 添加物 | D-マンニトール、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、クエン酸水和物、ステアリン酸カルシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ | | | | | |
| 色調・剤形 | 白色 円形のフィルム コーティング錠 | 白色 割線入りの円形の フィルムコーティング錠 | | | | |
| 外形 | 表面 | 裏面 | 側面 | 表面 | 裏面 | 側面 |
| | 直径：7.6mm 厚さ：3.6mm | | 直径：8.6mm 厚さ：4.2mm | | | |
| 重量 | 145.0mg | | 227.0mg | | | |
| 識別コード | サルボグレレート 50 オーハラ | | サルボグレレート 100 オーハラ | | | |

【効能・効果】

慢性動脈閉塞症に伴う潰瘍、疼痛および冷感等の虚血性諸症状の改善

【用法・用量】

サルボグレレート塩酸塩として、通常成人1回100mgを1日3回食後経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- 月経期間中の患者〔出血を増強するおそれがある。〕
- 出血傾向並びにその素因のある患者〔出血傾向を増強するおそれがある。〕
- 抗凝固剤（ワルファリン等）あるいは血小板凝集抑制作用を有する薬剤（アスピリン、チクロピジン塩酸塩、シロスタゾール等）を投与中の患者〔出血傾向を増強するおそれがある。〕
- 重篤な腎障害のある患者〔排泄に影響するおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

本剤投与中は定期的に血液検査を行うことが望ましい。

3. 相互作用

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 ワルファリン等 | 出血傾向を増強するおそれがある。 | 相互に作用を増強する。 |
| 血小板凝集抑制作用を有する薬剤 アスピリン、チクロピジン塩酸塩、シロスタゾール等 | | |

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用（頻度不明）

- 脳出血、消化管出血**：脳出血、吐血や下血等の消化管出血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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 血小板減少**：血小板減少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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、γ-GTP、LDH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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 無顆粒球症**：無顆粒球症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し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

| | 副作用の頻度 | |
|----------------------|--|--|
| | 頻度不明 | |
| 過敏症 ^[注1] | 発疹、発赤、丘疹、痒疹、紅斑、蕁麻疹 | |
| 肝臓 ^[注2] | 肝機能障害（ビリルビン上昇、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、γ-GTP上昇、LDH上昇等） | |
| 出血傾向 ^[注2] | 出血（鼻出血、皮下出血等） | |
| 消化器 | 嘔気、胸やけ、腹痛、便秘、異物感（食道）、食欲不振、腹部膨満感、下痢、嘔吐、口内炎 | |
| 循環器 | 心悸亢進、息切れ、胸痛、ほてり | |
| 精神神経系 | 頭痛、眠気、味覚異常、めまい | |
| 腎臓 | 蛋白尿、尿潜血、BUN上昇、クレアチニン上昇 | |
| 血液 | 貧血、血小板減少、白血球減少 | |

| | |
|-----|---|
| | 副作用の頻度 |
| | 頻度不明 |
| その他 | 血清中性脂肪上昇、血清コレステロール上昇、血清アルブミン減少、尿糖、尿沈渣、体重増加、浮腫、倦怠感、血清カルシウム減少、しびれ感、発熱、咽頭痛、咽頭不快感、咽頭灼熱感 |

注1) このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。
注2) 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。

5. 高齢者への投与

高齢者では低用量（例えば150mg/日）より投与を開始するなど、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。〔一般に高齢者では腎、肝等の生理機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがある。〕

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。〔動物実験（ラット）で胚胎児死亡率増加及び新生児生存率低下が報告されている。〕
- (2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。〔動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。（使用経験がない。）

8. 適用上の注意

薬剤交付時：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、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

【薬物動態】

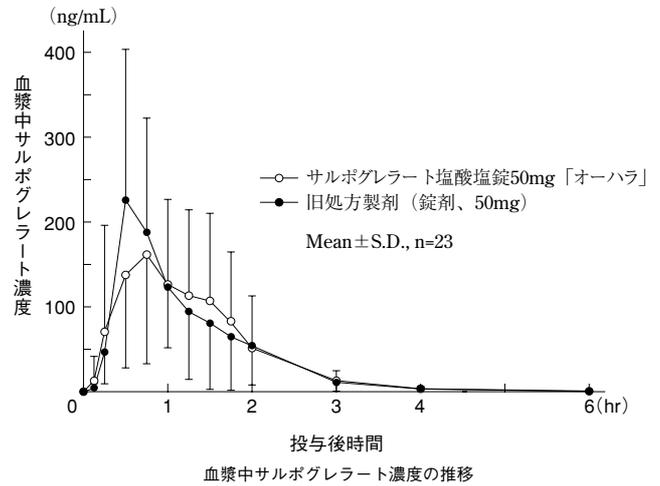
1. 生物学的同等性試験

- (1) サルボグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」
「経口固形剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に基づき、新処方剤のサルボグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」と、ヒトを対象とした生物学的同等性試験により標準剤（錠剤、50mg）との同等性が確認された旧処方剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（サルボグレラート塩酸塩としてそれぞれ50mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）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^{1),2)}。

薬物動態パラメータ

| | n | AUC ₀₋₆ (ng・hr/mL) | C_{max} (ng/mL) | t_{max} (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
|------------------------|----|----------------------------------|----------------------|-------------------|-------------------|
| サルボグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」 | 23 | 247.58±115.53 | 269.96±141.06 | 0.9±0.5 | 0.6±0.2 |
| 旧処方剤（錠剤、50mg） | 23 | 253.59±115.52 | 286.69±170.73 | 0.9±0.5 | 0.6±0.2 |

(Mean±S.D.)



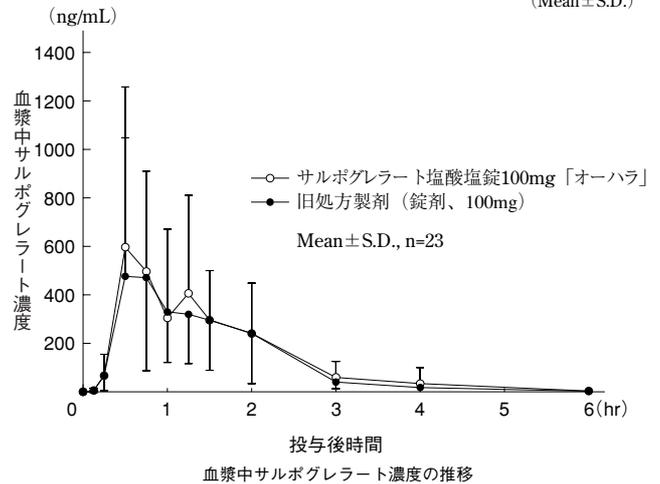
(2) サルボグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」

「経口固形剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に基づき、新処方剤のサルボグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」と、ヒトを対象とした生物学的同等性試験により標準剤（錠剤、100mg）との同等性が確認された旧処方剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（サルボグレラート塩酸塩としてそれぞれ100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）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^{1),2)}。

薬物動態パラメータ

| | n | AUC ₀₋₆ (ng・hr/mL) | C_{max} (ng/mL) | t_{max} (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
|-------------------------|----|----------------------------------|----------------------|-------------------|-------------------|
| サルボグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」 | 23 | 869.56±307.24 | 961.62±591.42 | 1.2±0.7 | 0.8±0.2 |
| 旧処方剤（錠剤、100mg） | 23 | 771.82±232.49 | 851.83±488.99 | 1.2±0.6 | 0.8±0.2 |

(Mean±S.D.)



血漿中濃度並びにAUC、 C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

サルボグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」及びサルボグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたサルボグレラート塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている³⁾。

【薬効薬理】

セロトニン (5-HT) は、血小板凝集及び血管収縮を増強させる。本剤は、血小板及び血管平滑筋における5-HT₂レセプターに対する特異的な拮抗作用を示すことにより、セロトニン (5-HT) の作用を阻害し、抗血小板作用及び血管収縮抑制作用を呈す。

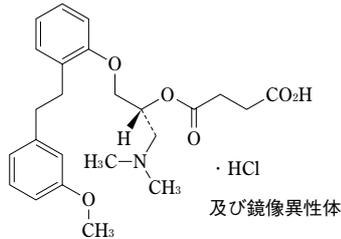
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：サルボグレラート塩酸塩

(Sarpogrelate Hydrochloride)

化学名：(2RS)-1-Dimethylamino-3-[2-[2-(3-methoxyphenyl) ethyl] phenoxy] propan-2-yl hydrogen succinate monohydrochloride

構造式：



分子式：C₂₄H₃₁NO₆ · HCl

分子量：465.97

性状：本品は白色の結晶性の粉末である。

本品は水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。

本品は0.01mol/L塩酸試液に溶ける。

本品の水溶液(1→100)は旋光性を示さない。

本品は結晶多形が認められる。

*【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(なりゆき温度及び湿度、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、サルボグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」及びサルボグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された⁴⁾。

*【包装】

サルボグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」：

(PTP) 100錠(10錠×10×1袋)

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」：

(PTP) 100錠(10錠×10×1袋)

500錠(10錠×10×5袋)

*【主要文献】

- 1) 陶易王ほか：新薬と臨床，58(9)，1674-1690(2009)
- 2) 大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(2012年)
- 3) 大原薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験(2012年)
- 4) 大原薬品工業株式会社 社内資料：長期安定性試験

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

大原薬品工業株式会社 安全管理部 お客様相談室

〒104-6591 東京都中央区明石町8-1聖路加タワー36階

☎0120-419-363 FAX 03-6740-7702

URL <http://www.ohara-ch.co.jp>

【問い合わせ先】

株式会社エッセンシャルファーマ お客様相談室

☎0120-350-803 (9:00~18:00/土日祝日も除く)

URL <http://www.essential-ph.co.jp>

販売  株式会社 エッセンシャルファーマ
東京都千代田区丸の内1-1-1

製造販売元  大原薬品工業株式会社
滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121-15

