

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示(期限内に使用すること。)

5-HT₂ブロッカー

日本薬局方 サルポグレラート塩酸塩錠

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」


SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE Tablets “KYORIN”

	錠50mg	錠100mg
承認番号	22600AMX00673000	22600AMX00674000
薬価収載	2014年12月	
販売開始	2009年11月	

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

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)[出血を更に増強する可能性がある。]
2. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

【組成・性状】

販売名	サルポグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」	サルポグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」
成分・分量(1錠中)	日局サルポグレラート塩酸塩 50mg	日局サルポグレラート塩酸塩 100mg
添加物	D-マンニトール、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	
剤形	フィルムコーティング錠	割線入りフィルムコーティング錠
色調	白色	白色
外観		
直径(mm)	7.6	8.6
厚さ(mm)	3.6	4.2
重量(mg)	145	227
識別コード	KRM106	KRM107

【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】

サルポグレラート塩酸塩として、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)
 - (1) 月経期間中の患者[出血を増強するおそれがある。]
 - (2) 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。]
 - (3) 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。]
 - (4) 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)

- 1) 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。
- 2) 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。
- 3) 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。
- 4) 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

分類	副作用(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
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

小児等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】「*」

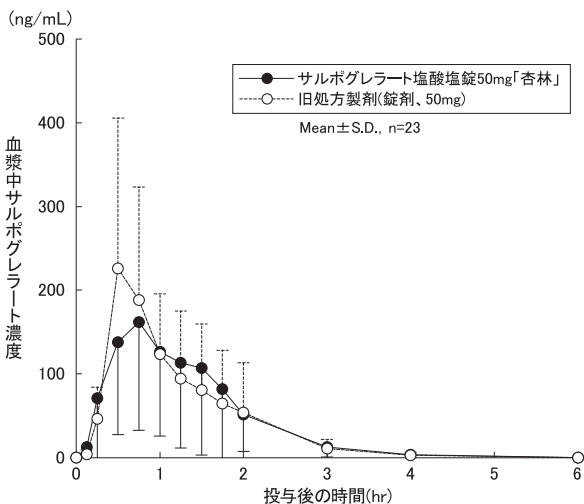
* 1. 生物学的同等性試験¹⁾

(1)サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」

「経口固形剤製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、新処方製剤のサルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」と、ヒトを対象とした生物学的同等性試験により標準製剤(錠剤、50mg)との同等性が確認された旧処方製剤を、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、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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₆ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」	247.58 ±115.53	269.96 ±141.06	0.9 ±0.5	0.6 ±0.2
旧処方製剤 (錠剤、50mg)	253.59 ±115.52	286.69 ±170.73	0.9 ±0.5	0.6 ±0.2

(Mean±S.D., n=23)

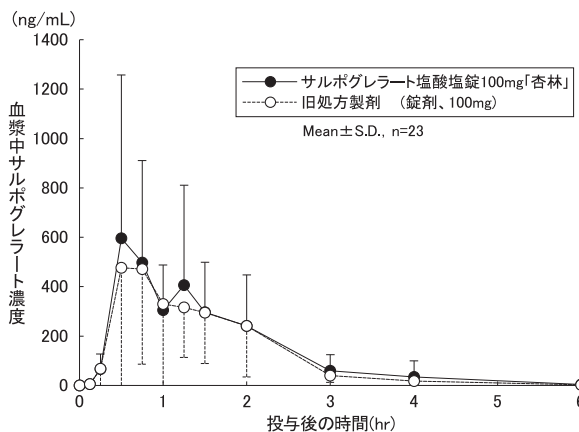


(2)サルボグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」

「経口固形剤製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1124004号)に基づき、新処方製剤のサルボグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」と、ヒトを対象とした生物学的同等性試験により標準製剤(錠剤、100mg)との同等性が確認された旧処方製剤を、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、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。

	判定パラメータ				参考パラメータ
	AUC ₀₋₆ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)	
サルボグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」	869.56 ±307.24	961.62 ±591.42	1.2 ±0.7	0.8 ±0.2	
旧処方製剤 (錠剤、100mg)	771.82 ±232.49	851.83 ±488.99	1.2 ±0.6	0.8 ±0.2	

(Mean±S.D., n=23)



血漿中濃度並びに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。

2. 溶出挙動²⁾

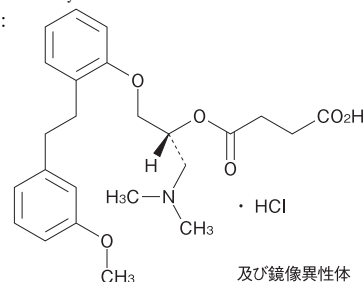
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」及びサルボグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」は、日本薬局方医薬品各条に定められたサルボグレラート塩酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【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：C₂₄H₃₁N₀₆・HCl

分子量：465.97

性状：サルボグレラート塩酸塩は白色の結晶性の粉末である。水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。0.01mol/L塩酸試液に溶ける。水溶液(1→100)は旋光性を示さない。結晶多形が認められる。

【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」及びサルボグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

【包装】

サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」

PTP：100錠

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「杏林」

PTP：100錠、500錠

【主要文献】

- 1)キョーリンメディオ株式会社社内資料：
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」・100mg「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
- 2)キョーリンメディオ株式会社社内資料：
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」・100mg「杏林」の溶出性に関する資料
- 3)キョーリンメディオ株式会社社内資料：
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「杏林」・100mg「杏林」の安定性試験に関する資料

【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。

キョーリンメディオ株式会社 学術部

〒920-0017 金沢市諸江町下丁287番地1

TEL 0120-960189

FAX 0120-189099

販売元
杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

製造販売元

キョーリンリメディオ株式会社

富山県南砺市井波885番地