

貯 法：室温保存
 使用期限：外箱等に表示(3年)

	50mg	100mg
承認番号	22200AMX00143	22200AMX00144
薬価収載	2010年5月	2010年5月
販売開始	2010年5月	2010年5月

5-HT₂ブロッカー

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「タカタ」

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「タカタ」

日本薬局方 サルポグレラート塩酸塩錠

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE



【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(「6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

【組成・性状】

1. 組成

品 名	サルポグレラート塩酸塩錠50mg「タカタ」
成分・分量	1錠中 サルポグレラート塩酸塩 50mg
添 加 物	乳糖水和物、米粉、クエン酸水和物、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール6000、タルク、カルナウバロウ

品 名	サルポグレラート塩酸塩錠100mg「タカタ」
成分・分量	1錠中 サルポグレラート塩酸塩 100mg
添 加 物	乳糖水和物、米粉、クエン酸水和物、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール6000、タルク、カルナウバロウ

2. 製剤の性状

品 名	サルポグレラート塩酸塩錠50mg「タカタ」		
性 状	白色のフィルムコーティング錠		
外 形	表 面 直 径	裏 面 重 さ	側 面 厚 さ
	約6.1mm	約0.0885g	約3.0mm
識別コード	TTS-502		

品 名	サルポグレラート塩酸塩錠100mg「タカタ」		
性 状	白色のフィルムコーティング錠		
外 形	表 面 直 径	裏 面 重 さ	側 面 厚 さ
	約7.6mm	約0.1755g	約3.7mm
識別コード	TTS-503		

【効能・効果】

慢性動脈閉塞症に伴う潰瘍、疼痛及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(50mg錠：2錠、100mg錠：1錠)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)、AI-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

	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、発赤、丘疹、掻痒、紅斑、蕁麻疹
肝臓 ^{注2)}	肝機能障害(ビリルビン、AST(GOT)、ALT(GPT)、AI-P、 γ -GTP、LDHの上昇等)
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	血清中性脂肪の上昇、血清コレステロールの上昇、血清アルブミンの減少、尿糖、尿沈渣、体重の増加、浮腫、倦怠感、血清カルシウムの減少、しびれ感、発熱、咽頭痛、咽頭不快感、咽頭灼熱感

注1) 症状があらわれた場合には、投与を中止すること。(太字)

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。(太字)

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】

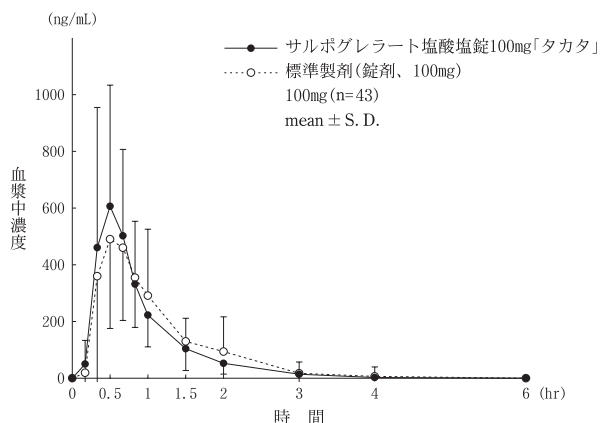
1. 生物学的同等性試験

(1) サルボグレラート塩酸塩錠50mg「タカタ」¹⁾

本剤はサルボグレラート塩酸塩錠100mg「タカタ」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた。

(2) サルボグレラート塩酸塩錠100mg「タカタ」²⁾

本剤と標準製剤(錠剤、100mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子43名にそれぞれ1錠(サルボグレラート塩酸塩として100mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.17、0.33、0.5、0.67、0.83、1、1.5、2、3、4及び6時間に前腕静脈から採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したサルボグレラートの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、AUC及びCmaxについて統計的評価を行った結果、判定パラメータの対数値の平均値の差が $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ で、かつ、溶出試験で規定する全ての条件で溶出挙動が類似していることから、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	
	AUCt (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「タカタ」	509.0±157.2	821.9±483.4	0.6±0.4	0.5±0.3
標準製剤 (錠剤、100mg)	540.3±199.8	711.1±367.2	0.7±0.5	0.5±0.5

(mean ± S. D.)

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^{3,4)}

本剤は、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。

【薬効薬理】

サルボグレラート塩酸塩は、血小板及び血管平滑筋の5-HT₂受容体に対して特異的に拮抗し、抗血小板作用及び血管収縮抑制作用を示す。

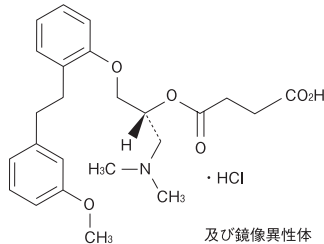
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：サルボグレラート塩酸塩〔日局〕

Sarpogrelate Hydrochloride

化学名：(2RS)-1-Dimethylamino-3-[(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：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^{5,6)}

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、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「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

【主要文献】*

- 1) 高田製薬(株)社内資料(50mg：生物学的同等性)
- 2) 高田製薬(株)社内資料(100mg：生物学的同等性)
- 3) 高田製薬(株)社内資料(50mg：溶出性)
- 4) 高田製薬(株)社内資料(100mg：溶出性)
- 5) 高田製薬(株)社内資料(50mg：安定性)
- 6) 高田製薬(株)社内資料(100mg：安定性)

【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。

高田製薬株式会社 文献請求窓口

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

今回改訂
→

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1

