

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2013 に準拠して作成

アルドース還元酵素阻害剤

日本薬局方 エパルレスタット錠

## エパルレスタット錠50mg「ケミファ」

# Epalrestat

剤形	フィルムコーティング錠	
製剤の規制区分	処方箋医薬品 注意－医師等の処方箋により使用すること	
規格・含量	1錠中（日局）エパルレスタット 50mg 含有	
一般名	和名：エパルレスタット（JAN） 英名：Epalrestat（JAN、INN）	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日	2013年12月11日
	薬価基準収載年月日	2014年6月20日
	発売年月日	2005年7月28日
開発・製造販売（輸入） ・提携・販売会社名	販売元：日本ケミファ株式会社 製造販売元：メディサ新薬株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	日本ケミファ株式会社 おくすり相談室 TEL.0120-47-9321 03-3863-1225/FAX. 03-3861-9567 受付時間：9:00～17:30（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.nc-medical.com/">http://www.nc-medical.com/</a>	

本 IF は 2014 年 6 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。  
最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ  
<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

# IF 利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

### [IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体では、これに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし 2 頁にまとめる。

## [IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

## [IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

## 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則ある。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより、薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

## 4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことのできない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意して作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

# 目 次

I. 概要に関する項目		
1. 開発の経緯	1	
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	
II. 名称に関する項目		
1. 販売名	2	
2. 一般名	2	
3. 構造式又は示性式	2	
4. 分子式及び分子量	2	
5. 化学名（命名法）	2	
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	
7. CAS登録番号	2	
III. 有効成分に関する項目		
1. 物理化学的性質	3	
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	
3. 有効成分の確認試験法	3	
4. 有効成分の定量法	3	
IV. 製剤に関する項目		
1. 剤形	4	
2. 製剤の組成	4	
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に関する注意	4	
4. 製剤の各種条件下における安定性	4	
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	
7. 溶出性	5	
8. 生物学的試験法	6	
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	6	
10. 製剤中の有効成分の定量法	6	
11. 力価	6	
12. 混入する可能性のある夾雑物	6	
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	
14. その他	6	
V. 治療に関する項目		
1. 効能又は効果	7	
2. 用法及び用量	7	
3. 臨床成績	7	
VI. 薬効薬理に関する項目		
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	8	
2. 薬理作用	8	
VII. 薬物動態に関する項目		
1. 血中濃度の推移・測定法	9	
2. 薬物速度論的パラメータ	10	
3. 吸収	10	
4. 分布	10	
5. 代謝	10	
6. 排泄	10	
7. トランスポーターに関する情報	11	
8. 透析等による除去率	11	
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目		
1. 警告内容とその理由	12	
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	12	
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	12	
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	12	
5. 慎重投与内容とその理由	12	
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	12	
7. 相互作用	12	
8. 副作用	12	
9. 高齢者への投与	13	
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	13	
11. 小児等への投与	13	
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	13	
13. 過量投与	13	
14. 適用上の注意	13	
15. その他の注意	13	
16. その他	13	
IX. 非臨床試験に関する項目		
1. 薬理試験	14	
2. 毒性試験	14	
X. 管理的事項に関する項目		
1. 規制区分	15	
2. 有効期間又は使用期限	15	
3. 貯法・保存条件	15	
4. 薬剤取扱い上の注意点	15	
5. 承認条件等	15	
6. 包装	15	
7. 容器の材質	15	
8. 同一成分・同効薬	15	
9. 国際誕生年月日	15	
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	15	
11. 薬価基準収載年月日	15	
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	15	
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	15	
14. 再審査期間	16	
15. 投与期間制限医薬品に関する情報	16	
16. 各種コード	16	
17. 保険給付上の注意	16	
XI. 文献		
1. 引用文献	17	
2. その他の参考文献	17	
XII. 参考資料		
1. 主な外国での発売状況	18	
2. 海外における臨床支援情報	18	
XIII. 備考		
その他の関連資料	19	

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

エパルレスタット製剤はアルドース還元酵素阻害薬であり、本邦では 1992 年に上市されている。

キネグルコ錠 50mg は後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、生物学的同等性試験、加速試験を実施し、2005 年 3 月に承認を得て、2006 年 7 月に日本ケミファ株式会社が販売するに至った。

医療事故防止のため 2014 年 6 月販売名をエパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」に変更し現在に至る。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) アルドース還元酵素を阻害して、ソルビトールの細胞内蓄積を抑制する。
- (2) 糖尿病性末梢神経障害に伴う自覚症状（しびれ感、疼痛）、振動覚異常、心拍変動異常を改善する。（8 頁参照）
- (3) 重大な副作用として、血小板減少、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全があらわれることがある（頻度不明）。（12 頁参照）

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

エパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」

#### (2) 洋名

Epalrestat

#### (3) 名称の由来

「有効成分」+「剤形」+「含量」+「屋号」より命名した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

エパルレスタット（JAN）

#### (2) 洋名（命名法）

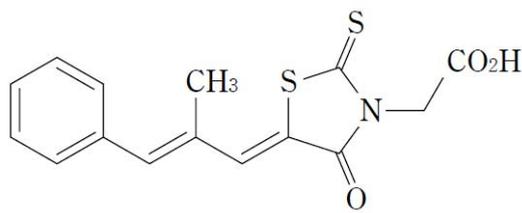
Epalrestat（JAN、INN）

#### (3) ステム

酵素還元阻害剤：-stat

### 3. 構造式又は示性式

構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>15</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>3</sub>S<sub>2</sub>

分子量：319.40

### 5. 化学名（命名法）

2-[(5*Z*)-5-[(2*E*)-2-Methyl-3-phenylprop-2-en-1-ylidene]-4-oxo-2-thioxothiazolidin-3-yl]acetic acid

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

### 7. CAS 登録番号

82159-09-9

### III. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

黄色～だいたい色の結晶又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

###### 1) 各種溶媒における溶解度

溶 媒	日局の溶解度表記
<i>N,N</i> -ジメチルホルムアミド	やや溶けやすい
メタノール エタノール(99.5)	溶けにくい
水	ほとんど溶けない

###### 2) 各種 pH 溶媒における溶解度

条件	溶解度 ( $\mu$ g/mL)
pH1.2	0.1
pH4.0	3
pH6.8	496
水	9

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：222～227 °C

##### (5) 酸塩基解離定数

$pK_a$ ：4.3

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

pH：遮光しない場合、pH6.8、6時間で5.8%分解する。

光：本品は光により徐々に退色し、分解する。

#### 3. 有効成分の確認試験法

(1) 紫外可視吸光度測定法（参照スペクトルと同一波長、同様の強度を認める）

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）（両者のスペクトルが同様）

(3) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）（原薬特有の参照スペクトルが同様）

#### 4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

区別：エパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」 フィルムコーティング錠  
 性状：エパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」 白色のフィルムコーティング錠

サイズ	表	裏	側面	識別コード
直径 6.7mm				<b>MED 130</b>
厚さ 3.8mm				
重量 120mg				

#### (2) 製剤の物性

該当資料無し

#### (3) 識別コード

エパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」：MED130

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

エパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」：1錠中(日局)エパルレスタットを 50mg 含有

#### (2) 添加物

カルナウバロウ、カルメロースカルシウム、コポリビドン、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、D-マンニトール

#### (3) その他

該当しない

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に関する注意

該当しない

### 4. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

エパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40℃ 75%RH	6ヵ月	PTP包装	適合
長期保存試験	室温	3年	PTP包装+ピロー包装	適合
無包装 安定性試験	温度 (40℃)	3ヵ月	ガラス容器密栓	適合
	湿度 (25℃75%RH)	3ヵ月	ガラス容器開放	適合
	光 (なりゆき温湿度 総照射量60万Lux・hr)	—	シャーレ開放	適合
	なりゆき (室温散光)	3ヵ月	シャーレ開放	適合
粉碎後 安定性試験	室温	1ヵ月	透明瓶開放	適合
	室温	1ヵ月	透明瓶密栓	適合
	室温	1ヵ月	褐色瓶密栓	適合

## 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

## 7. 溶出性

### (1) 溶出挙動の類似性<sup>2)</sup>

エパルレスタット錠50mg「ケミファ」

方法：日局一般試験法パドル法

回転数：50rpm、100rpm

試験液：50rpm pH1.2、pH5.0、pH6.8、水

結果：<50rpm:pH1.2>

測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあった。（標準製剤および試験製剤共に全ての測定時点における平均溶出率は0%であった。）

<50rpm:pH5.0>

標準製剤の平均溶出率は規定された時間以内に85%に達しなかった。

標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(溶出時間15分)及び規定された試験時間(溶出時間360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあった。

<50rpm:pH6.8>

標準製剤の平均溶出率が40%付近(溶出時間10分)及び85%付近(溶出時間40分)の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあった。

<50rpm:水>

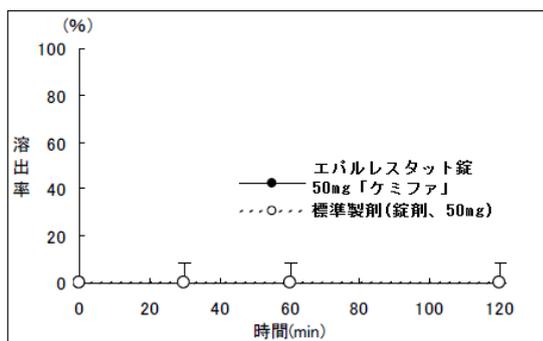
標準製剤の平均溶出率は規定された時間以内に85%に達しなかった。

標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(溶出時間10分)及び規定された試験時間(溶出時間360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 8\%$ の範囲にあった。

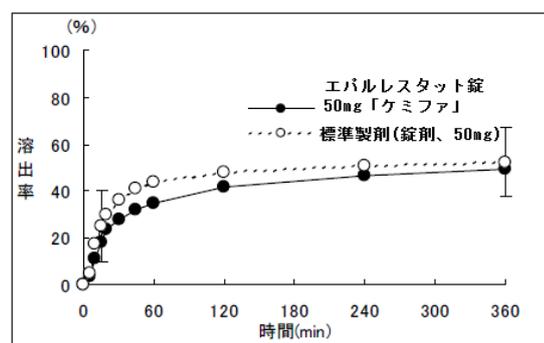
<100rpm:pH6.8>

標準製剤は15分以内に平均85%以上溶出し、15分における試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあった。

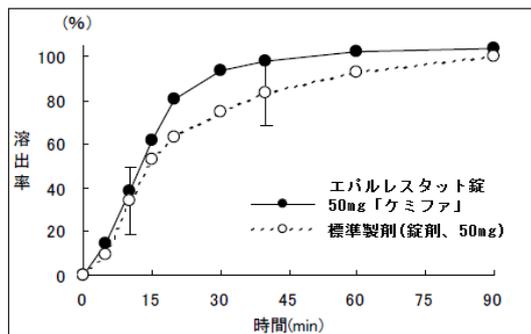
< 50rpm : pH1.2 >



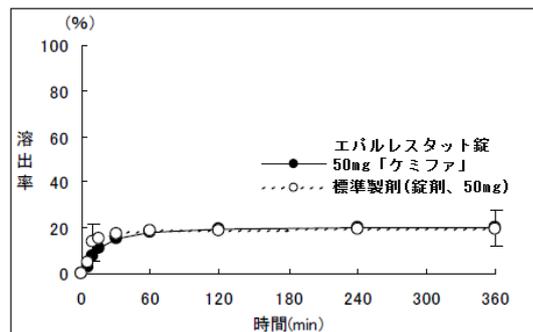
< 50rpm : pH5.0 >



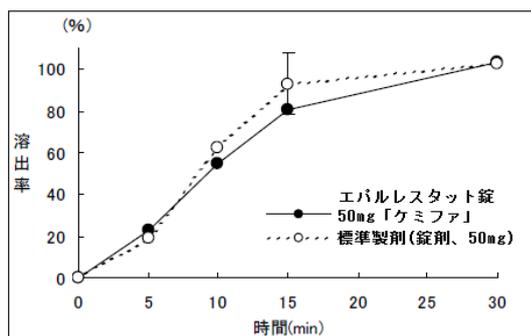
< 50rpm : pH6.8 >



< 50rpm : 水 >



< 100rpm : pH6.8 >



以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断された。

(2) 公的溶出規格への適合

エパルレスタット錠50mg「ケミファ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたエパルレスタット錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

(1) 紫外可視吸光度測定法 (235~239nm、290~294nm、387~391nmに吸収極大)

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当しない

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

糖尿病性末梢神経障害に伴う自覚症状（しびれ感、疼痛）、振動覚異常、心拍変動異常の改善（糖化ヘモグロビンが高値を示す場合）

### 2. 用法及び用量

通常、成人にはエパルレスタットとして1回 50mg（本剤1錠）を 1日3回毎食前に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6) 治療的使用

##### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

##### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

なし

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>3)</sup>

グルコースからソルビトールへの変換を司るアルドース還元酵素を阻害して、高血糖によって生ずるソルビトールの細胞内蓄積を抑制する。

これにより糖尿病性末梢神経障害に伴う手足のしびれや痛みを改善する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

「VII-1-(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

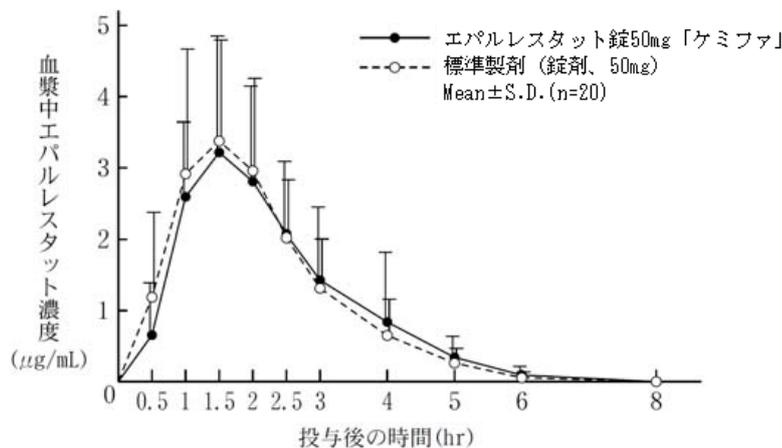
生物学的同等性試験<sup>4)</sup>

エパルレスタット錠 50mg「ケミファ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エパルレスタットとして 50mg）健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中エパルレスタット濃度を測定し、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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax ( $\mu\text{g/mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-8hr</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$ )
エパルレスタット錠 50mg「ケミファ」	4.08 $\pm$ 1.20	1.7 $\pm$ 0.8	0.8 $\pm$ 0.2	8.06 $\pm$ 2.04
標準製剤(錠剤、50mg)	4.36 $\pm$ 1.29	1.6 $\pm$ 0.6	0.8 $\pm$ 0.3	8.20 $\pm$ 2.22

(Mean $\pm$ S.D., n=20)



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。

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

#### (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

## 2. 薬物速度論的パラメータ

### (1) 解析方法

該当資料なし

### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

### (3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

### (4) 消失速度定数

$0.89 \pm 0.20 \text{ hr}^{-1}$

### (5) クリアランス

該当資料なし

### (6) 分布容積

該当資料なし

### (7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 3. 吸収

該当資料なし

## 4. 分布

### (1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

### (2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

### (3) 乳汁への移行性

動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。

### (4) 髄液への移行性

該当資料なし

### (5) その他の組織への移行性

該当資料なし

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

### (2) 排泄率

該当資料なし

### (3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報  
該当資料なし
8. 透析等による除去率  
該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由  
該当しない
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）  
該当しない
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由  
該当しない
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由  
該当しない
5. 慎重投与内容とその理由  
該当しない
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 糖尿病治療の基本である食事療法、運動療法、経口血糖降下剤、インスリン等の治療を行った上でなお、糖化ヘモグロビンが高値を示す患者に対して適用を考慮する。
- (2) 本剤の投与の対象となる患者の糖化ヘモグロビンは、HbA1c(NGSP 値)7.0%以上(JDS 値 6.6%以上)を目安とする。
- (3) 不可逆的な器質的変化を伴う糖尿病性末梢神経障害の患者では効果が確立されていない。
- (4) 投与中は経過を十分に観察し、12 週間投与して効果が認められない場合には他の適切な治療に切り換えること。

7. 相互作用
  - (1) 併用禁忌とその理由  
該当しない
  - (2) 併用注意とその理由  
該当しない

8. 副作用
  - (1) 副作用の概要

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。

- (2) 重大な副作用と初期症状

- 1) 血小板減少：血小板減少があらわれることがあるので、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。
- 2) 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全：劇症肝炎、著しいAST(GOT)・ALT(GPT)の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸、肝不全があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には投与を中止し適切な処置を行うこと。

- (3) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹、そう痒、紅斑、水疱等
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)・ $\gamma$ -GTPの上昇、ビリルビン上昇等
消化器	腹痛、嘔気、嘔吐、下痢、食欲不振、腹部膨満感、便秘、胸やけ
腎臓	BUN上昇、クレアチニン上昇、尿量減少、頻尿
血液	貧血、白血球減少
その他	倦怠感、めまい、頭痛、こわばり、脱力感、四肢疼痛、胸部不快感、動悸、浮腫、ほてり、しびれ、脱毛、紫斑、CK(CPK)上昇、発熱

注) 発現した場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

- (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧  
該当資料なし

- (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度  
該当資料なし
- (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法  
該当資料なし
9. 高齢者への投与  
該当資料なし
10. 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、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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 本剤投与中は授乳を避けさせること。  
[動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。]
11. 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。
12. 臨床検査結果に及ぼす影響
- 本剤の投与により尿は黄褐色又は赤色を呈するため、ビリルビン及びケトン体の尿定性試験に影響することがある。
13. 過量投与  
該当資料なし
14. 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。]
15. その他の注意
- 本剤の投与により、黄褐色又は赤色の着色尿があらわれることがある。  
[本剤及び代謝物の影響による。]
16. その他

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験  
(「IV. 薬効薬理に関する項目」参照)
- (2) 副次的薬理試験  
該当資料なし
- (3) 安全性薬理試験  
該当資料なし
- (4) その他の薬理試験  
該当資料なし

### 2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験  
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験  
該当資料なし
- (3) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
- (4) その他の特殊毒性  
該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤： 処方箋医薬品<sup>注)</sup> 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること  
有効成分： 該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

気密容器（室温保存）

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ-14.適用上の注意」の項参照

くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

エパルレスタット錠 50mg「ケミファ」：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：キネダック錠 50mg

同 効 薬：なし

### 9. 国際誕生年月日

1992年1月21日

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
エパルレスタット錠 50mg「ケミファ」	2013年12月11日	22500AMX01936000

旧販売名

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
キネグルコ錠 50mg	2005年3月14日	21700AMZ00551000

### 11. 薬価基準収載年月日

エパルレスタット錠 50mg「ケミファ」：2014年6月20日

旧販売名：キネグルコ錠 50mg：2005年7月8日

### 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

### 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
エパルレスタット錠 50mg 「ケミファ」	116823501	3999013F1347	621682301

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) メディサ新薬(株)：安定性に関する資料（社内資料）
- 2) メディサ新薬(株)：溶出試験に関する資料（社内資料）
- 3) 第十六改正日本薬局方第一追補解説書 C-60，廣川書店，東京，2012
- 4) メディサ新薬(株)：生物学的同等性に関する資料（社内資料）

### 2. その他の参考文献

## XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況  
該当しない
2. 海外における臨床支援情報  
該当資料なし

## XIII. 備考

その他の関連資料

