

医薬品インタビューフォーム  
日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2008 に準拠して作成

5-HT<sub>2</sub>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 「TSU」**  
**サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」**  
Sarpogrelate Hydrochloride Tablets 50mg/100mg 「TSU」

剤形	50mg：白色のフィルムコート錠 100mg：白色のフィルムコート錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	50mg：1錠中サルポグレラート塩酸塩 50mg 100mg：1錠中サルポグレラート塩酸塩 100mg
一般名	和名：サルポグレラート塩酸塩 洋名：Sarpogrelate Hydrochloride
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：2009年7月13日 薬価基準収載年月日：2009年11月13日 販売年月日：2009年11月13日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：鶴原製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	鶴原製薬株式会社 医薬情報部 TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/">http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/</a>

本 I F は 2011 年 8 月 改 訂 （ 第 2 版 ） 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。

## I F 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年が経過した現在、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新たなIF記載要領が策定された。

### 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「IF 記載要領 2008」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「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）は、平成21年4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2008」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

「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、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で、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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が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。

(2008年9月)

## 目 次

[ I ] 概要に関する項目	1
[ II ] 名称に関する項目	2
[ III ] 有効成分に関する項目	3
[ IV ] 製剤に関する項目	4
[ V ] 治療に関する項目	12
[ VI ] 薬効薬理に関する項目	13
[ VII ] 薬物動態に関する項目	14
[ VIII ] 安全性(使用上の注意等)に関する項目	23
[ IX ] 非臨床試験に関する項目	26
[ X ] 管理的事項に関する項目	27
[ X I ] 文 献	29
[ X II ] 参考資料	29
[ X III ] 備 考	29

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

血小板のセロトニン受容体（5-HT<sub>2</sub>受容体）においてセロトニンに拮抗し、血小板凝集や血管収縮を抑制して微小循環を改善する。

慢性動脈閉塞症に伴う虚血性諸症状の改善。

## Ⅱ. 名称に関する項目

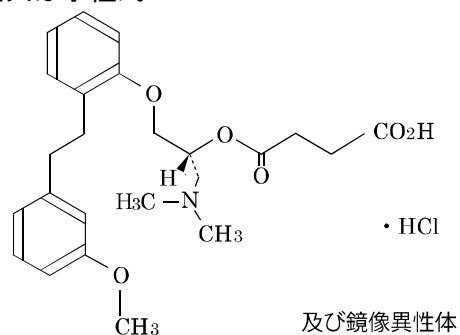
### 1. 販売名

- 1) 和名  
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」  
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」
- 2) 洋名  
Sarpogrelate Hydrochloride Tablets 50mg 「TSU」  
Sarpogrelate Hydrochloride Tablets 100mg 「TSU」
- 3) 名称の由来

### 2. 一般名

- 1) 和名（命名法）：サルポグレラート塩酸塩
- 2) 洋名（命名法）：Sarpogrelate Hydrochloride
- 3) ステム：

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量



### 5. 化学名（命名法）

(2*RS*)-1-Dimethylamino-3-{2-[2-(3-methoxyphenyl)ethyl]phenoxy}propan-2-yl hydrogen succinate monohydrochloride

### 6. 慣用名，別名，略号，記号番号

塩酸サルポグレラート

### 7. CAS登録番号

125926-17-2

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

- 1) 外観・性状  
白色の結晶性の粉末である。
- 2) 溶解性  
水又はエタノール(99.5)溶けにくい。本品は0.01mol/L塩酸試液に溶ける。
- 3) 吸湿性  
該当資料なし
- 4) 融点（分解点），沸点，凝固点  
該当資料なし
- 5) 酸塩基解離定数  
該当資料なし
- 6) 分配係数  
該当資料なし
- 7) その他の主な示性値  
本品の水溶液(1→100)は旋光性を示さない。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「サルポグレラート塩酸塩」による

#### 4. 有効成分の定量法

日局「サルポグレラート塩酸塩」による

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### 1) 剤形の区別及び性状

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」：白色のフィルムコート錠

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」：白色のフィルムコート錠

#### 2) 製剤の物性

記載事項なし

#### 3) 識別コード

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」： 50

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」： 100

#### 4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

記載事項なし

### 2. 製剤の組成

#### 1) 有効成分（活性成分）の含量

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」：1錠中サルポグレラート塩酸塩 50mg 含有

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」：1錠中サルポグレラート塩酸塩 100mg 含有

#### 2) 添加物

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」：乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン造粒物、カンテン末、ヒドロキシプロピルセルロース、酒石酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」：乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン造粒物、カンテン末、ヒドロキシプロピルセルロース、酒石酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ

#### 3) その他

記載事項なし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当資料なし



#### 4. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

##### サルボグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」

試験条件 及び保管	試験 期間	保存包装	試験項目	ロット
温度 40±1℃ 湿度 75±5%RH	6ヶ月	①PTP包装：PTP包装後、セロニウム袋に乾燥剤（シリカゲル）とともに入れ、紙箱に入れたものを使用した。 ②バラ包装：セロニウム袋に錠剤を充填し、乾燥剤（シリカゲル）を入れ、ブリキ缶に入れバラ包装とする。	I：性状 II：確認試験 III：純度試験 IV：製剤均一性 （質量偏差） V：溶出性 VI：定量法	S26-1 S26-2 S26-3

- I. 性状  
全ての検体において、規格に適合した。
- II. 確認試験  
全ての検体において、規格に適合した。
- III. 純度試験  
全ての検体において、規格に適合した。
- IV. 製剤均一性（質量偏差）  
全ての検体において、規格に適合した。
- IV. 溶出性  
全ての検体において、規格に適合した。
- V. 定量法  
全ての検体において、規格に適合した。

以上、加速条件で6ヵ月間保存した本品のPTP包装品及びバラ包装品の全ての検体で、全ての規格に適合していた。よってこの包装形態にて安定であると判断し、室温で3年間は安定な薬剤であると判断した。

	経過 日数	ロット	性状			確認試験			純度試験			質量偏差			溶出性			定量		
			1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回
P T P	製造時	S26-1	白色の フィルム コート錠	白色の フィルム コート錠	白色の フィルム コート錠	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	99.9	101.0
		S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.2	100.2	99.6
		S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.3	100.7	101.6
	1ヶ月	S26-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	99.5	100.0	101.1
		S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	99.9	98.6	99.5
		S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.3	101.3	101.4
	3ヶ月	S26-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	101.8	99.7
		S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.8	101.5	99.5
		S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	99.3	100.2	100.0
	6ヶ月	S26-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.7	100.3	100.2
		S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.2	100.6	100.2
		S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.4	100.5	100.1
バ ラ	製造時	S26-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	99.9	101.0
		S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.2	100.5	99.6
		S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.3	100.7	101.6
	1ヶ月	S26-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	101.0	100.1	100.4
		S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	99.9	100.1
		S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.1	100.5	99.8
	3ヶ月	S26-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.6	100.7	100.2
		S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	100.8	100.4
		S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.6	100.7	100.5
6ヶ月	S26-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.1	100.5	100.5	
	S26-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.1	100.5	100.2	
	S26-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.0	100.1	100.4	

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」

試験条件 及び保管	試験 期間	保存包装	試験項目	ロット
温度 40±1℃ 湿度 75±5%RH	6ヶ月	①PTP包装：PTP包装後、セロニウム袋に乾燥剤（シリカゲル）とともに入れ、紙箱に入れたものを使用した。 ②バラ包装：セロニウム袋に錠剤を充填し、乾燥剤（シリカゲル）を入れ、ブリキ缶に入れバラ包装とする。	I：性状 II：確認試験 III：純度試験 IV：製剤均一性 （質量偏差） V：溶出性 VI：定量法	S27-1 S27-2 S27-3

I. 性状

全ての検体において、規格に適合した。

II. 確認試験

全ての検体において、規格に適合した。

III. 純度試験

全ての検体において、規格に適合した。

IV. 製剤均一性（質量偏差）

全ての検体において、規格に適合した。

IV. 溶出性

全ての検体において、規格に適合した。

V. 定量法

全ての検体において、規格に適合した。

以上、加速条件で6ヶ月間保存した本品のPTP包装品及びバラ包装品の全ての検体で、全ての規格に適合していた。よってこの包装形態にて安定であると判断し、室温で3年間は安定な薬剤であると判断した。

	経過 日数	ロット	性状			確認試験			純度試験			質量偏差			溶出性			定量		
			1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回	1回	2回	3回
P T P	製造時	S27-1	白色の フィルム コート錠	白色の フィルム コート錠	白色の フィルム コート錠	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	100.1	100.2
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	100.0	100.5	101.0
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	101.0	100.4	99.2
	1ヶ月	S27-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	100.3	101.7	100.7
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	100.9	100.4	100.9
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	99.1	99.1	99.2
	3ヶ月	S27-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	101.1	100.4	100.6
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	100.2	101.7	100.2
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	99.4	99.0	98.6
	6ヶ月	S27-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	99.6	102.3	98.0
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.6	99.5	98.0
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.8	99.4	98.5
バ ラ	製造時	S27-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	100.1	100.2
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.0	100.5	101.0
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	101.0	100.4	99.2
	1ヶ月	S27-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	98.3	99.4	99.3
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	99.2	99.0	100.3
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	100.8	101.8	102.5
	3ヶ月	S27-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	100.4	100.0	100.2
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	98.9	101.2	99.7
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	/	/	/	適	適	適	101.3	100.8	101.5
	6ヶ月	S27-1	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.9	100.6	100.6
		S27-2	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.7	101.2	100.7
		S27-3	同上	同上	同上	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	適	100.7	100.6	101.1

## 5. 調整法及び溶解後の安定性

該当資料なし

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 7. 溶出性<sup>2)</sup>

### サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」

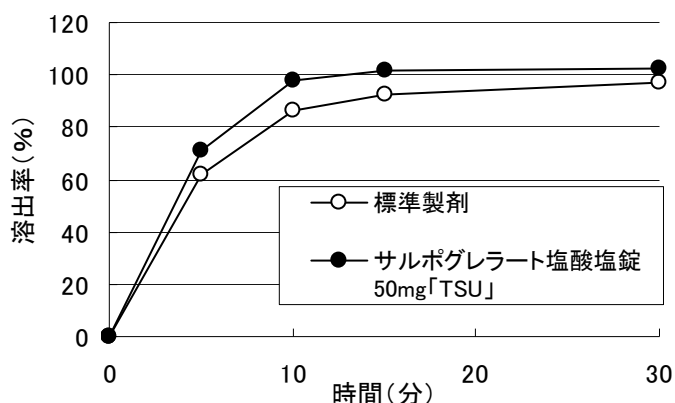
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」の溶出は、日本薬局方医薬品各条に定められたサルポグレラート塩酸塩錠の溶出規格に適合した。

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

回転数：毎分50回転

試験液：水

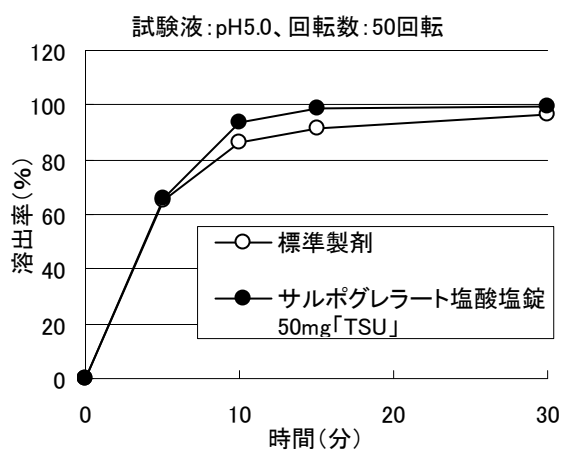
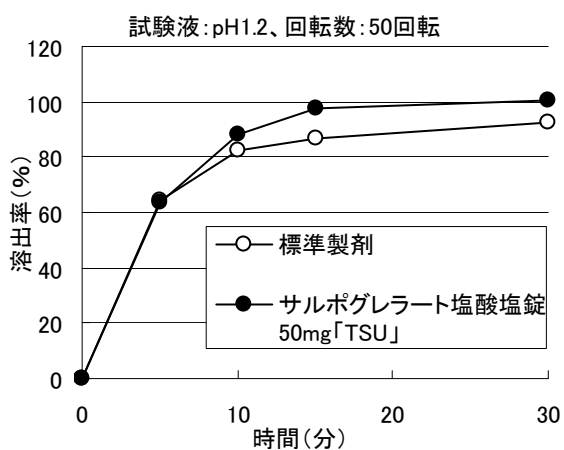
溶出規格：30分 80%以上

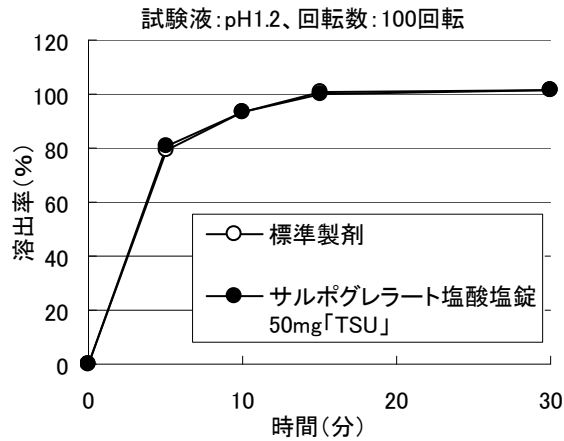
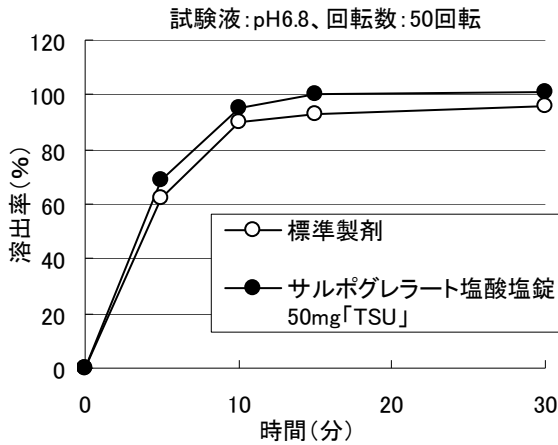


サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」につき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

### 試験結果

標準製剤を対照としたサルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。

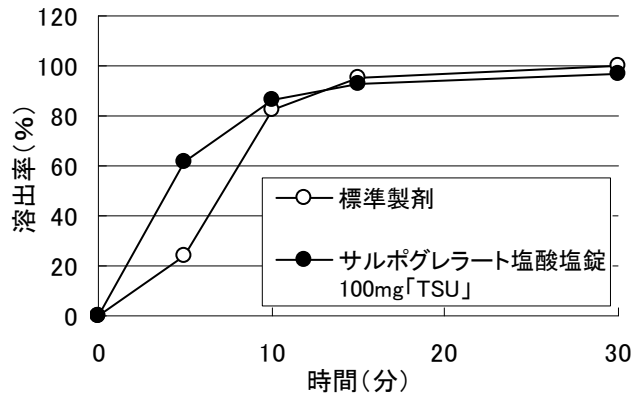




### サルポグレレート塩酸塩錠 100mg 「TSU」

サルポグレレート塩酸塩錠 100mg 「TSU」の溶出は、日本薬局方医薬品各条に定められたサルポグレレート塩酸塩錠の溶出規格に適合した。

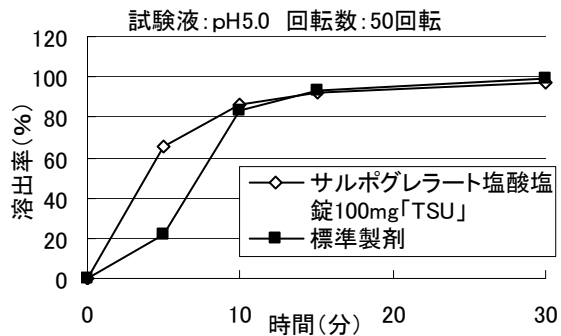
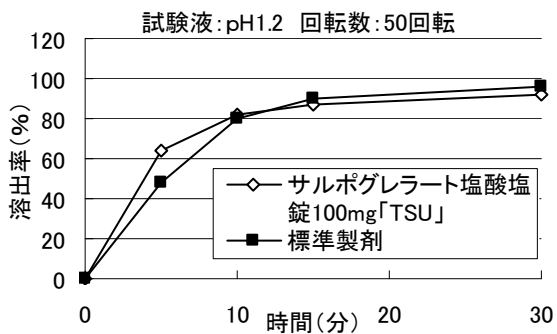
試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）  
 回転数：毎分50回転  
 試験液：水  
 溶出規格：30分 80%以上

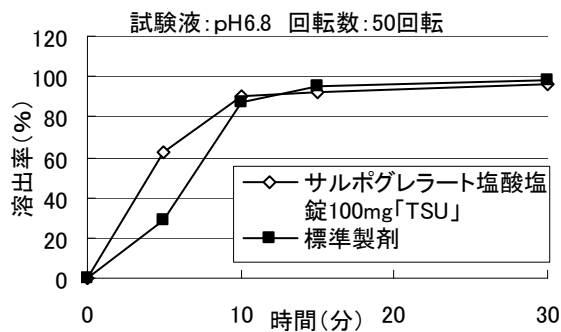
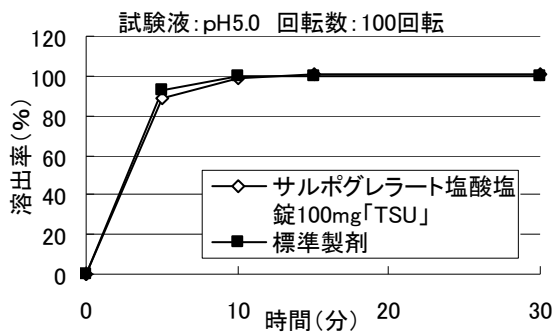


サルポグレレート塩酸塩錠 100mg 「TSU」につき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

### 試験結果

標準製剤を対照としたサルポグレレート塩酸塩錠 100mg 「TSU」の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。サルポグレレート塩酸塩錠 100mg 「TSU」の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。





## 8. 生物学的試験法

該当資料なし

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法

## 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

該当資料なし

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

## 13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

## 14. その他

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

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

### 2. 用法及び用量

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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化平行用量反応試験

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

該当しない



## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

チクロピジン塩酸塩, 硫酸クロピドグレル, シロスタゾール, リマプロストアル  
ファデクス, イコサペント酸エチル, ベラプロストナトリウム

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

サルボグレラートは血小板と血管平滑筋の 5-HT<sub>2</sub> 型受容体において、セロトニンの作用に拮抗する。  
そのため、血小板の凝集、血管収縮の増強及び血栓の形成が抑制される。

#### (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

(「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<sup>3)</sup>

#### 生物学的同等性

#### サルボグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」:

サルボグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性ガイドライン」により当社サルボグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」(ヒトを対象とした生物学的同等性試験により、標準製剤との同等性が証明されている。)を標準製剤とした溶出試験において両製剤は生物学的に同等であることが示されている。

標準製剤：サルボグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」

試験製剤：サルボグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」

#### 結果

試験液：pH1.2においては、標準製剤が15分以内に平均85%溶出した。試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した

試験液：pH5.0においては、標準製剤が15分以内に平均85%溶出した。試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した

試験液：pH6.8においては、標準製剤が15分以内に平均85%溶出した。試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した

試験液：水においては、標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出した。試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した

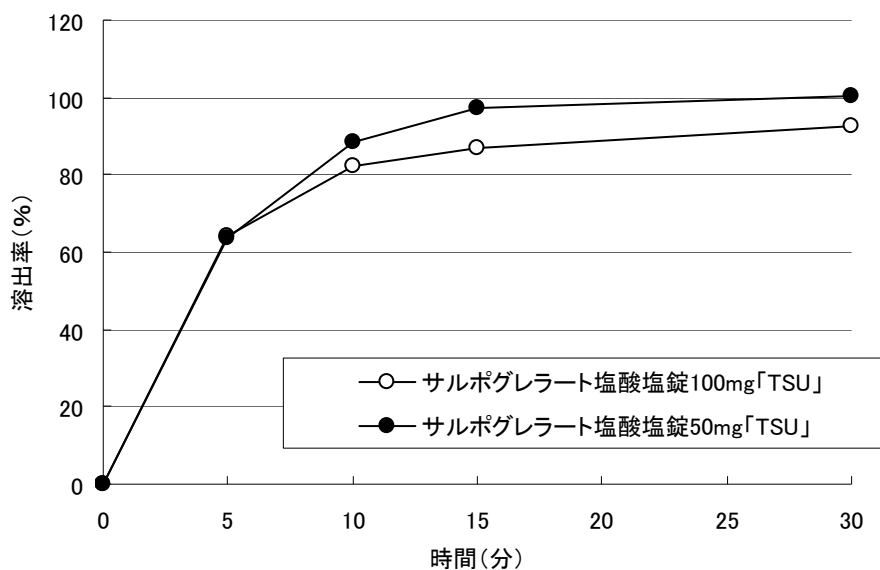
試験液：pH1.2回転数：100回転においては標準製剤が15分以内に平均溶出率85%以上溶出した。試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した

以上の結果から、全ての液性において、標準製剤と試験製剤は溶出挙動が同等であると判断できた。

《試験液：pH1.2、回転数：50回転》について  
標準製剤及び試験製剤の平均溶出率を次表に示した。

測定時間(分)	平均溶出率 (%)				
	0分	5分	10分	15分	30分
サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「TSU」	0.0	64.2	82.4	87.1	92.4
サルボグレラート塩酸塩錠 50mg「TSU」	0.0	63.8	88.3	97.3	100.3

試験液：pH1.2、回転数：50回転



以上の結果、標準製剤が15分以内に平均溶出率85%以上を示し、試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した為、判定基準「標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。」に適合していると判断した。

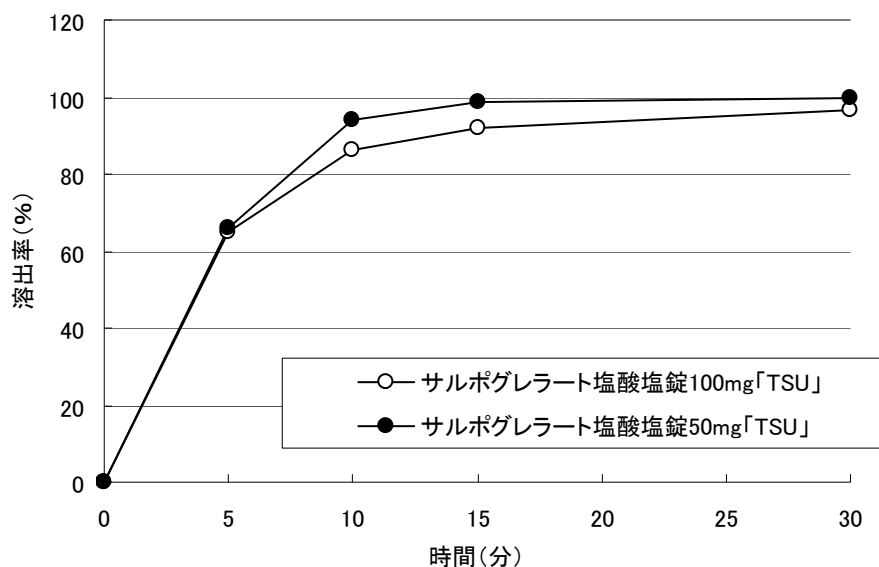
また個々の溶出率において、試験製剤の平均溶出率の±15%及び±25%の範囲を超えるものはなく、判定基準「a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない」に適合していると判断した。

従って、試験液：pH1.2（回転数：50回転）において標準製剤と試験製剤は溶出挙動が同等であると判断した。

《試験液：pH5.0、回転数：50回転》について  
標準製剤及び試験製剤の平均溶出率を次表に示した。

測定時間(分)	平均溶出率 (%)				
	0分	5分	10分	15分	30分
サルボグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」	0.0	65.0	86.4	91.8	96.8
サルボグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」	0.0	66.0	93.8	98.6	99.7

試験液:pH5.0、回転数:50回転



以上の結果、標準製剤が15分以内に平均溶出率85%以上を示し、試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した為、判定基準「標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。」に適合していると判断した。

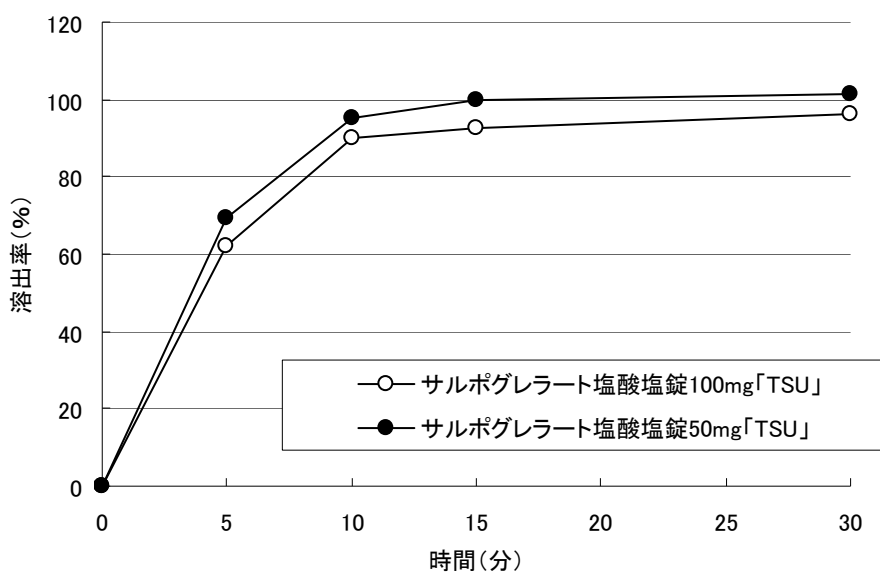
また個々の溶出率において、試験製剤の平均溶出率の±15%及び±25%の範囲を超えるものはなく、判定基準「a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない」に適合していると判断した。

従って、試験液：pH5.0（回転数：50回転）において標準製剤と試験製剤は溶出挙動が同等であると判断した。

《試験液：pH6.8、回転数：50回転》について  
標準製剤及び試験製剤の平均溶出率を次表に示した。

測定時間(分)	平均溶出率 (%)				
	0分	5分	10分	15分	30分
サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「TSU」	0.0	62.2	90.0	92.6	96.0
サルボグレラート塩酸塩錠 50mg「TSU」	0.0	69.1	95.0	100.0	101.2

試験液:pH6.8、回転数:50回転



以上の結果、標準製剤が15分以内に平均溶出率85%以上を示し、試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した為、判定基準「標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm$ 10%の範囲にある。」に適合していると判断した。

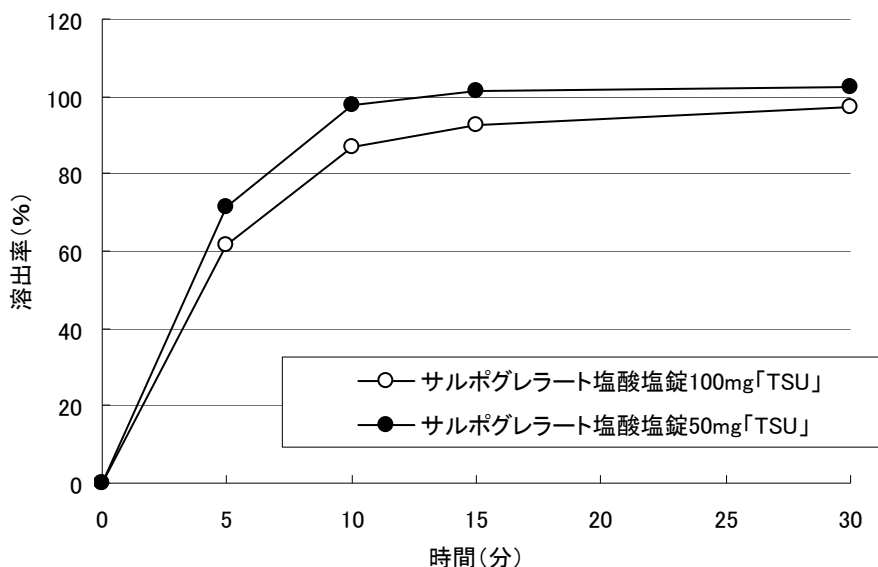
また個々の溶出率において、試験製剤の平均溶出率の $\pm$ 15%及び $\pm$ 25%の範囲を超えるものはなく、判定基準「a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm$ 15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm$ 25%の範囲を超えるものがない」に適合していると判断した。

従って、試験液：pH6.8（回転数：50回転）において標準製剤と試験製剤は溶出挙動が同等であると判断した。

《試験液：水、回転数：50回転》について  
標準製剤及び試験製剤の平均溶出率を次表に示した。

測定時間(分)	平均溶出率 (%)				
	0分	5分	10分	15分	30分
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」	0.0	61.7	86.7	92.5	97.2
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」	0.0	71.4	98.0	101.6	102.6

試験液：水、回転数：50回転



以上の結果、標準製剤が15分以内に平均溶出率85%以上を示し、試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した為、判定基準「標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。」に適合していると判断した。

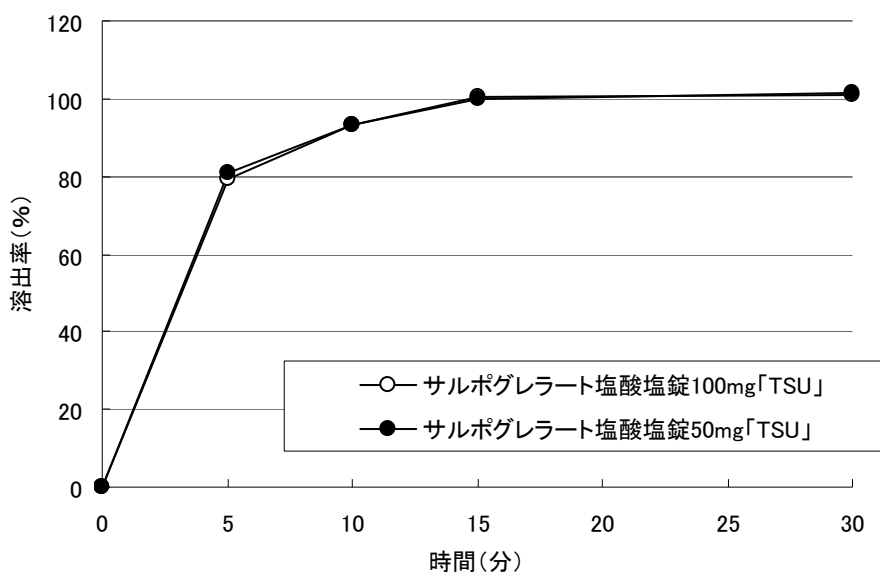
また個々の溶出率において、試験製剤の平均溶出率の±15%及び±25%の範囲を超えるものはなく、判定基準「a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない」に適合していると判断した。

従って、試験液：水（回転数：50回転）において標準製剤と試験製剤は溶出挙動が同等であると判断した。

《試験液：pH1.2、回転数：100回転》について  
標準製剤及び試験製剤の平均溶出率を次表に示した。

測定時間(分)	平均溶出率 (%)				
	0分	5分	10分	15分	30分
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」	0.0	79.2	93.4	100.6	101.2
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TSU」	0.0	81.0	93.0	100.1	101.3

試験液：pH1.2、回転数：100回転



以上の結果、標準製剤が15分以内に平均溶出率85%以上を示し、試験製剤も15分以内に平均溶出率85%以上を示した為、判定基準「標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。」に適合していると判断した。

また個々の溶出率において、試験製剤の平均溶出率の±15%及び±25%の範囲を超えるものはなく、判定基準「a. 標準製剤の平均溶出率が85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない」に適合していると判断した。

従って、試験液：pH1.2(回転数：100回転)において標準製剤と試験製剤は溶出挙動が同等であると判断した。

以上より標準製剤と試験製剤は生物学的に同等であると判断できた。

## サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」:

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」と標準製剤との血中濃度比較による検討

### 1. 緒言

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、両製剤投与後の血漿中サルポグレラート塩酸塩濃度推移を比較した。

### 2. 実験方法

#### ① 使用薬剤

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」  
標準製剤

#### ② 対象

あらかじめ健康診断を実施し、異常の認められなかった成人男子 10名

#### ③ 投与量

製剤試験により同等と認められた両製剤 1錠 (サルポグレラート塩酸塩として 100mg) ずつを経口投与した。

#### ④ 投与方法

健康成人男子志願者で事前に文書による同意を得られた 10名を 2群に分け、医師の問診の後、1群にはサルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」、他群には標準製剤を空腹時経口投与した。

#### ⑤ 採血時間

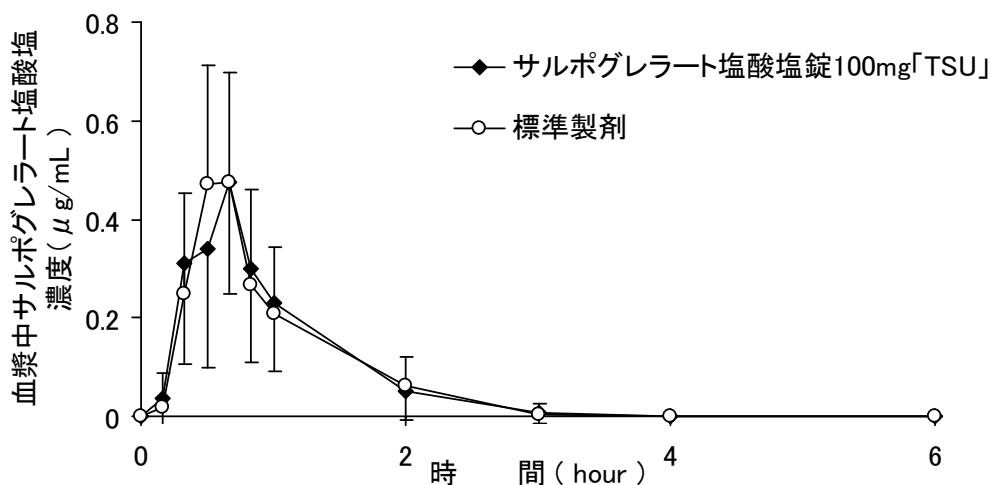
投与前、0.5時間、1時間、1.5時間、2時間、3時間、4時間、6時間、  
8時間、10時間、24時間

### 3. 結果

両製剤の  $AUC_0^6$ 、 $C_{max}$  の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は  $AUC_0^6$  では  $\log(0.8401) \sim \log(1.2133)$ 、 $C_{max}$  では  $\log(0.8566) \sim \log(1.1586)$  となり、いずれも  $\log(0.8) \sim \log(1.25)$  の範囲内であった。

以上の結果よりサルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TSU」及び標準製剤は生物学的同等性を有する製剤であると推測される。





	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-6</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
サルポグレレート塩酸塩錠 100mg 「TSU」	0.44 ± 0.17	0.59 ± 0.19	0.57 ± 0.18	約 0.8
標準製剤 (100mg、錠剤)	0.44 ± 0.17	0.60 ± 0.22	0.55 ± 0.14	約 0.9

(mean ± S.D., n=20)

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

(「Ⅷ. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 7.相互作用」の項を参照のこと)

(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ー

(1) コンパートメントモデル

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

該当資料なし

(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

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) 乳汁中への移行性

該当資料なし

(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. 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

【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）

### 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

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。〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

記載事項なし

#### (2) 併用注意とその理由

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）		

## 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

#### 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、 $\gamma$ -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。

### (3) その他の副作用

	頻 度 不 明
過敏症 <sup>注1)</sup>	発疹、発赤、丘疹、掻痒、紅斑、蕁麻疹
肝臓 <sup>注2)</sup>	肝機能障害（ビリルビン上昇、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、LDH 上昇)
出血傾向 <sup>注2)</sup>	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) 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。

### (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

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。〕

## 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。〕

## 11. 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。）

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 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

該当資料なし

## 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

(「Ⅵ. 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

- 1) 製剤：該当しない
- 2) 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（安定性試験に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### （1）薬局での取り扱いについて

（「規制区分」及び「貯法・保存条件」の項を参照のこと）

#### （2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14.適用上の注意」の項を参照のこと）

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

50mg錠：(PTP) 100錠、500錠

100mg錠：(PTP) 100錠、500錠

### 7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル，アルミニウム箔

### 8. 同一成分・同効薬

アンブラーグ錠 50mg／アンブラーグ錠 100mg（田辺三菱）

### 9. 国際誕生年月日

1993年7月2日

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「TSU」	2009年7月13日	22100AMX02210000
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「TSU」	2009年7月13日	22100AMX02209000

11. 薬価基準収載年月日

2009年11月13日

12. 効能・効果追加，用法・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

該当しない

16. 各種コード

製品名	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
サルポグレラート塩酸塩 錠 50mg「TSU」	119612201	3399006F 1123	621961201
サルポグレラート塩酸塩 錠 100mg「TSU」	119619101	3399006F 2120	621961901

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。



## **X I . 文 献**

### 1. 引用文献

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) 鶴原製薬株式会社 社内資料

### 2. その他の参考文献

なし

## **X II . 参 考 資 料**

### 1. 主な外国での発売状況

なし

### 2. 海外における臨床支援情報

なし

## **X III . 備 考**

### 1. その他の関連資料

なし



製造販売元

**鶴原製薬株式会社**

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

文献請求先：鶴原製薬（株）医薬情報部