

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2008に準拠して作成

アルドース還元酵素阻害剤
処方箋医薬品^注

日本薬局方 エパルレスタット錠

エパルレスタット錠50mg「VTRS」

EPALRESTAT Tablets

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50.0mg
一般名	和名：エパルレスタット(JAN) 洋名：Epalrestat(JAN)
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：2011年 7月15日 薬価基準収載年月日：2022年 6月 1日 発売年月日：2011年12月 6日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：マイランEPD合同会社 販売：ヴィアトリス製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 https://www.viatris-e-channel.com/

本IFは2022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、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

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 年が経過した現在、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 判、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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」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

「IF 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
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	2
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	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
4. 製剤の各種条件下における安定性	6
5. 調製法及び溶解後の安定性	7
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7
7. 溶出性	8
8. 生物学的試験法	9
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	9
10. 製剤中の有効成分の定量法	10
11. 力価	10
12. 混入する可能性のある夾雑物	10
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	10
14. その他	10

V. 治療に関する項目	11
1. 効能又は効果	11
2. 用法及び用量	11
3. 臨床成績	11
VI. 薬効薬理に関する項目	13
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	13
2. 薬理作用	13
VII. 薬物動態に関する項目	14
1. 血中濃度の推移・測定法	14
2. 薬物速度論的パラメータ	15
3. 吸収	15
4. 分布	15
5. 代謝	16
6. 排泄	16
7. 透析等による除去率	16
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
1. 警告内容とその理由	17
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由.....	17
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由.....	17
5. 慎重投与内容とその理由	17
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17
7. 相互作用	17
8. 副作用	18
9. 高齢者への投与	18
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
11. 小児等への投与	19
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
13. 過量投与	19
14. 適用上の注意	19
15. その他の注意	19
16. その他	19
IX. 非臨床試験に関する項目	20
1. 薬理試験	20
2. 毒性試験	20

X. 管理的事項に関する項目	21
1. 規制区分	21
2. 有効期間又は使用期限	21
3. 貯法・保存条件	21
4. 薬剤取扱い上の注意点	21
5. 承認条件等	21
6. 包装	21
7. 容器の材質	21
8. 同一成分・同効薬	21
9. 国際誕生年月日	22
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	22
11. 薬価基準収載年月日	22
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.....	22
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	22
14. 再審査期間	22
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	22
16. 各種コード	22
17. 保険給付上の注意	22
XI. 文献	23
1. 引用文献	23
2. その他の参考文献	23
XII. 参考資料	24
1. 主な外国での発売状況	24
2. 海外における臨床支援情報	24
XIII. 備考	25
その他の関連資料	25

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

エパルレスタットは、糖尿病神経障害の発症にソルビトールの増加とアルドース還元酵素が関与することに着目し、開発された化合物である。本剤は、アルドース還元酵素を特異的に阻害し、高血糖の持続により引き起こされた神経内ソルビトールの蓄積を抑制することにより、糖尿病性末梢神経障害における自覚症状及び神経機能異常を改善する。

エパルレスタット錠 50mg「ファイザー」は、ファイザー株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2011 年 7 月に承認を得た製剤である。

2022 年 6 月、マイラン製薬株式会社からマイラン EPD 合同会社へ製造販売移管したため、販売名をエパルレスタット錠 50mg「V T R S」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 糖尿病性末梢神経障害を改善するアルドース還元酵素阻害剤

エパルレスタットは、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¹⁾、糖尿病性神経障害に関与するソルビトールの細胞内蓄積を抑制する。糖尿病性末梢神経障害に伴う自覚症状（しびれ感、疼痛）などの治療に用いられる。

2. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み

1) 包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている^{2) ~4)}。

2) 規格取り違えを防ぐための試みとして複数規格ある含量表示に上下の記号（▲▼）をラベル・小函に表記した。エパルレスタットは単一規格であるため、記載含量(50mg)を▲▼で囲んだ。

3. 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が、エパルレスタットの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、肝不全が報告されている。
（「VIII. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 8. 副作用」の項参照）

*「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

エパルレストアット錠 50mg 「V T R S」

(2) 洋名

EPALRESTAT Tablets

(3) 名称の由来

有効成分であるエパルレストアットに剤形、含量及び「V T R S」を付した。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

エパルレストアット (JAN)

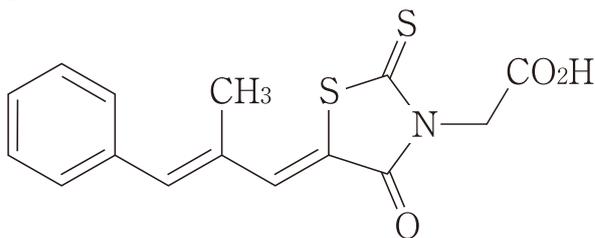
(2) 洋名 (命名法)

Epalrestat (JAN, INN)

(3) ステム

アルドース還元酵素阻害薬: -restat

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: C₁₅H₁₃NO₃S₂

分子量: 319.40

5. 化学名 (命名法)

2-[(5Z)-5-[(2E)-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

該当資料なし

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¹⁾

黄色～だいだい色の結晶又は結晶性の粉末である。
結晶多形が認められる。

(2) 溶解性

N,N-ジメチルホルムアミドにやや溶けやすく、メタノール又はエタノール（99.5）に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(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℃

(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

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

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⁾

日本薬局方「エパルレスタット」の確認試験法による。

4. 有効成分の定量法¹⁾

日本薬局方「エパルレスタット」の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	外形			色調等
	上面	下面	側面	
エパルレスタット錠 50mg「VTR S」				白色 フィルムコーティング錠
	直径 7mm	厚さ 2.9mm	重量 120mg	

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

EP 50

(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

1錠中 日局 エパルレスタット 50.0mg

(2) 添加物

D-マンニトール、ポビドン、軽質無水ケイ酸、硬化油、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、ポリソルベート 80、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、プロピレングリコール、カルナウバロウ

(3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験⁵⁾

試験条件：40±1℃、75±5%RH

包装形態（PTP 充てん）

項目及び規格		試験開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験	呈色反応	適合	適合	適合	適合
	紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合
	薄層クロマトグラフィー	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
溶出試験		適合	適合	適合	適合
定量試験（95.0～105.0%）		99.5～101.4	98.0～101.3	98.9～102.7	98.7～101.1
純度試験		適合	—	—	適合
水分試験（%）		1.1～1.2	1.1～1.2	1.1～1.2	1.1～1.2
微生物 限度試験	細菌	適合	—	—	適合
	真菌	適合	—	—	適合
	大腸菌	適合	—	—	適合
	サルモネラ菌	適合	—	—	適合
	緑膿菌	適合	—	—	適合
	黄色ブドウ球菌	適合	—	—	適合

ロット数：3

長期保存試験⁶⁾

試験条件：25±1°C、60±5%RH

包装形態（PTP 充てん）

項目及び規格		試験開始時	6ヵ月後	1年後	2年後	3年後
性状（白色のフィルムコーティング錠）		適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	呈色反応	適合	—	—	—	適合
	紫外可視吸光度測定法	適合	—	—	—	適合
	薄層クロマトグラフィー	適合	—	—	—	適合
製剤均一性試験		適合		—	—	適合
溶出試験		適合	適合	適合	適合	適合
定量試験（95.0～105.0%）		99.2～99.9	99.1～99.9	98.1～99.5	96.3～97.2	95.1～96.6
純度試験		適合	適合	適合	適合	適合
水分試験（%）		0.9～1.0	1.1～1.4	1.0～1.1	0.8～1.1	1.1～1.3
微生物 限度試験	細菌	適合	適合	—	—	—
	真菌	適合	適合	—	—	—
	大腸菌	適合	適合	—	—	—
	サルモネラ菌	適合	適合	—	—	—
	緑膿菌	適合	適合	—	—	—
	黄色ブドウ球菌	適合	適合	—	—	—
硬度（kg）		11.02～11.61	10.02～11.39	9.91～10.13	10.43～10.99	11.07～11.98

ロット数：3

長期保存試験（室温、3年間）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、エパルレスタット錠 50mg「V T R S」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。

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

溶出挙動⁷⁾

エパルレスタット錠 50mg「V T R S」と標準品*の溶出試験を実施した結果、エパルレスタット錠 50mg「V T R S」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「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」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

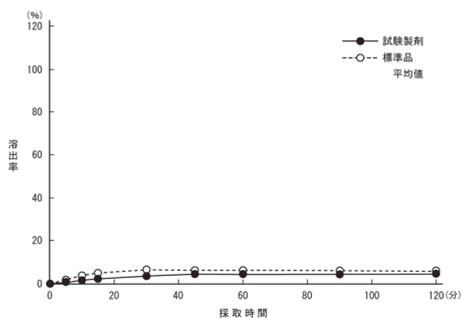
*：エパルレスタット錠 50mg「V T R S」の処方変更前製剤

試験条件

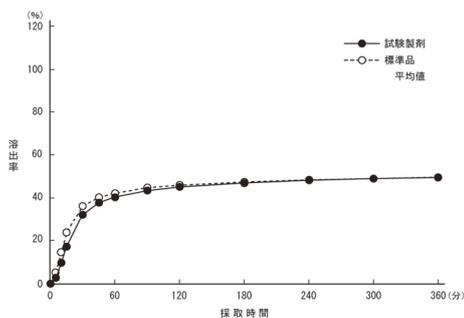
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液) pH5.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液) pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液) 水	900mL	50rpm
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)	900mL	100rpm

n=12

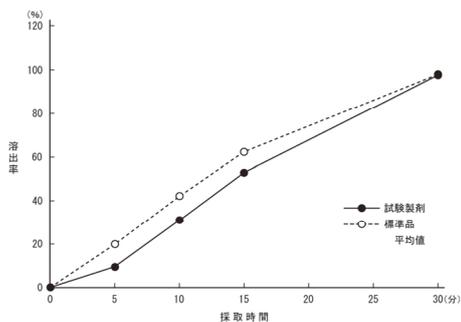
pH1.2 (50rpm)



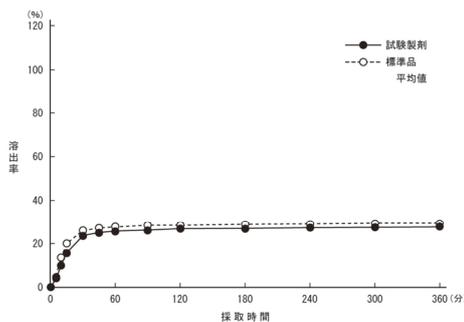
pH5.0 (50rpm)



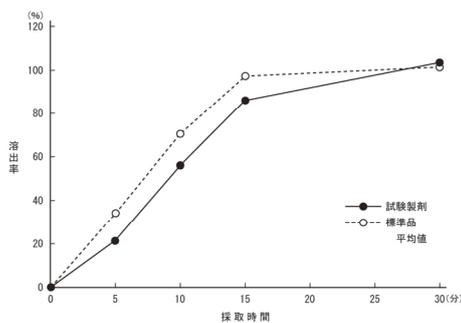
pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)



pH6.8 (100rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)								
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	90分	120分	360分
pH1.2 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	0.5± 0.131	1.4± 0.358	2.0± 0.361	3.4± 0.762	4.4± 0.520	4.3± 0.355	4.3± 0.299	4.2± 0.307	—
	標準品	1.6± 0.469	3.6± 0.488	4.9± 0.394	6.3± 0.304	6.1± 0.259	6.0± 0.345	5.8± 0.332	5.7± 0.270	—
pH5.0 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	3.4± 1.005	10.2± 1.804	17.4± 2.057	32.6± 1.544	38.1± 1.783	40.9± 2.124	43.9± 2.467	45.6± 2.673	50.0± 3.245
	標準品	5.7± 1.330	15.1± 2.075	24.1± 1.796	36.7± 0.719	40.6± 0.532	42.6± 0.656	45.1± 0.692	46.3± 0.680	50.0± 0.824
pH6.8 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	9.3± 3.188	31.0± 4.841	52.7± 7.076	97.5± 1.861	—	—	—	—	—
	標準品	19.8± 1.595	42.0± 6.109	62.4± 10.729	97.7± 1.859	—	—	—	—	—
水 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	3.6± 0.735	10.0± 1.152	15.4± 1.224	23.3± 0.728	24.9± 0.686	25.6± 0.676	26.2± 0.691	26.6± 0.700	27.6± 0.724
	標準品	4.7± 1.714	13.3± 2.734	19.8± 1.891	25.8± 0.915	26.9± 0.877	27.4± 0.794	28.1± 0.787	28.3± 0.786	29.4± 0.817
pH6.8 100rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	21.0± 4.118	55.8± 4.010	86.0± 3.884	103.5± 1.458	—	—	—	—	—
	標準品	33.6± 2.579	70.8± 3.655	97.3± 1.791	101.3± 1.058	—	—	—	—	—

平均±SD n=12

公的溶出試験

エパールスタット錠 50mg「VTRS」は、日本薬局方 医薬品各条に定められたエパール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。

(規格：45分で70%以上)

試験液	判定時点	溶出率 (%)		
		ロットA	ロットB	ロットC
日本薬局方溶出試験 第2液	45分	83.4~91.8	83.0~91.2	83.6~89.1
判定		適合	適合	適合

各ロット n=6

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⁸⁾

日本薬局方 医薬品各条「エパールスタット錠」の確認試験法による。

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法⁸⁾

日本薬局方 医薬品各条「エパルレスタット錠」の定量法による。
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

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当資料なし

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

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¹⁾。

(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⁹⁾

1.708±0.624 (hr)

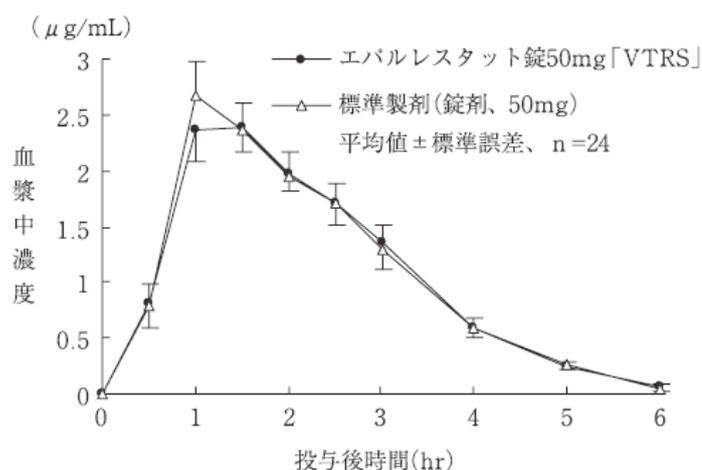
(3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験⁹⁾

エパルレスタット錠 50mg「VTRS」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24名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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。

投与薬剤	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC ₀₋₆ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	AUC _{∞} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	MRT (hr)	kel
エパルレスタット錠 50mg「VTRS」	1錠 (50mg)	6.52 ±1.85	3.22 ±0.96	6.72 ±1.79	1.708 ±0.624	約0.9	2.194 ±0.423	0.850 ±0.256
標準製剤 (錠剤、50mg)	1錠 (50mg)	6.56 ±1.58	3.44 ±0.96	6.75 ±1.54	1.542 ±0.690	約0.9	2.139 ±0.413	0.822 ±0.189

平均値±標準偏差 (n=24)



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、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) 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⁹⁾

0.850±0.256

(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

該当資料なし

<参考>

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. 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

重要な基本的注意

- (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

重大な副作用（頻度不明）

- 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 ^{注)}	発疹、そう痒、紅斑、水疱等
肝臓	AST (GOT) ・ ALT (GPT) ・ γ -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

該当しない

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

該当しない

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、更には穿孔をお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

該当しない

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）

該当資料なし

- (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：エパルレスタット錠 50mg「V T R S」 処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：日局 エパルレスタット 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：最終年月を外箱等に記載

(「IV-4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

3. 貯法・保存条件

室温保存、遮光保存、気密容器

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

【取扱い上の注意】

保管方法

光、湿気を避けて保存してください。

(2) 薬剤交付時の注意（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

患者向医薬品ガイド：無し、くすりのしおり：有り

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

エパルレスタット錠 50mg「V T R S」：100 錠、500 錠 (PTP)

7. 容器の材質

PTP シート：アルミ、塩化ビニル

8. 同一成分・同効薬

同一成分：キネダック錠 50mg（小野薬品工業株式会社）等

同 効 薬：なし

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造承認年月日：2011年7月15日

承認番号：22300AMX00902

11. 薬価基準収載年月日

2022年6月1日

(旧販売名)

エパルレスタット錠 50mg 「ファイザー」：2011年11月28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. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

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 「VTRS」	120880103	統一名：3999013F1010 個別：3999013F1410	統一名：622311100 個別：622088003

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編：“（処）エパルレスタット”第十七改正
日本薬局方第一追補解説書 廣川書店：C-948, 2016
- 2) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（1）
－明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較－」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集：25, 2009
- 3) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（2）
－低視力状態での可視性の比較－」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集：29, 2009
- 4) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（3）
－低コントラスト状態での可視性の比較－」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集：33, 2009
- 5) 社内資料：安定性試験（加速試験）（エパルレスタット錠 50mg「VTRS」）
- 6) 社内資料：長期保存試験（エパルレスタット錠 50mg「VTRS」）
- 7) 社内資料：溶出試験（エパルレスタット錠 50mg「VTRS」）
- 8) 日本薬局方解説書編集委員会編：“（処）エパルレスタット錠”第十七改正
日本薬局方第一追補解説書 廣川書店：C-952, 2016
- 9) 社内資料：生物学的同等性試験（エパルレスタット錠 50mg「VTRS」）

2. その他の参考文献

該当資料なし

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

該当資料なし

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ヴィアトリス製薬株式会社　メディカルインフォメーション部
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5-11-2
フリーダイヤル　0120-419-043

製造販売

マイラン EPD 合同会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5-11-2

販売

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5-11-2

