

# 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 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「NP」**  
EPALRESTAT TABLETS

剤形	錠剤（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 日本薬局方 エパルレスタット 50mg
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：2014年 2月 12日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2014年 6月 20日（販売名変更による） 発売年月日：2005年 7月 8日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL:0120-226-898 FAX:06-6375-0177 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.nipro.co.jp/">http://www.nipro.co.jp/</a>

本 I F は 2019 年 4 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。

## 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、I Fと略す）の位置付け並びにI F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I F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I F記載要領2008が策定された。

I F記載要領2008では、I F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-I F）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-I Fが提供されることとなった。

最新版のe-I F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-I F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-I Fの情報を検討する組織を設置して、個々のI F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、I F記載要領の一部改訂を行いI F記載要領2013として公表する運びとなった。

### 2. I Fとは

I F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I F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I F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。

#### 【I F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。
- ②I F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「I F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。

#### [I Fの作成]

- ①I F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。
- ②I Fに記載する項目及び配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのI F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，「I F記載要領2013」と略す）により作成されたI F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。

#### [I Fの発行]

- ①「I F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，「I F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I Fが改訂される。

### 3. I Fの利用にあたって

「I F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である。

電子媒体のI F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，I Fの原点を踏まえ，医療現場に不足している情報やI F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，I F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，I F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，I F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

I F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。I F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，I Fがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり，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。

(2013年4月改訂)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b>		<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	
1. 開発の経緯	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	10
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬理作用	10
<b>II. 名称に関する項目</b>		<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	
1. 販売名	2	1. 血中濃度の推移・測定法	11
2. 一般名	2	2. 薬物速度論的パラメータ	12
3. 構造式又は示性式	2	3. 吸収	12
4. 分子式及び分子量	2	4. 分布	13
5. 化学名（命名法）	2	5. 代謝	13
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	2	6. 排泄	13
7. CAS 登録番号	2	7. トランスポーターに関する情報	13
		8. 透析等による除去率	14
<b>III. 有効成分に関する項目</b>		<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	
1. 物理化学的性質	3	1. 警告内容とその理由	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15
3. 有効成分の確認試験法	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	15
4. 有効成分の定量法	3	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	15
<b>IV. 製剤に関する項目</b>		5. 慎重投与内容とその理由	15
1. 剤形	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び 処置方法	15
2. 製剤の組成	4	7. 相互作用	15
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	4	8. 副作用	16
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	9. 高齢者への投与	16
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	17
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	11. 小児等への投与	17
7. 溶出性	5	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
8. 生物学的試験法	8	13. 過量投与	17
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	14. 適用上の注意	17
10. 製剤中の有効成分の定量法	8	15. その他の注意	17
11. 力価	8	16. その他	17
12. 混入する可能性のある夾雑物	8		
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に 関する情報	8	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	
14. その他	8	1. 薬理試験	18
<b>V. 治療に関する項目</b>		2. 毒性試験	18
1. 効能又は効果	9		
2. 用法及び用量	9		
3. 臨床成績	9		

<b>X. 管理的事項に関する項目</b>			
1. 規制区分	19	14. 再審査期間	20
2. 有効期間又は使用期限	19	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	20
3. 貯法・保存条件	19	16. 各種コード	21
4. 薬剤取扱い上の注意点	19	17. 保険給付上の注意	21
5. 承認条件等	19	<b>XI. 文献</b>	
6. 包装	19	1. 引用文献	22
7. 容器の材質	19	2. その他の参考文献	22
8. 同一成分・同効薬	19	<b>XII. 参考資料</b>	
9. 国際誕生年月日	20	1. 主な外国での発売状況	23
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	20	2. 海外における臨床支援情報	23
11. 薬価基準収載年月日	20	<b>XIII. 備考</b>	
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	20	その他の関連資料	24
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	20		

---

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

エパルレスタットは、アルドース還元酵素を阻害するアルドース還元酵素阻害剤であり、本邦では1992年に上市されている。

エパルレスタットを50mg含有するキネスタット錠は、竹島製薬㈱が後発医薬品として開発を企画し、薬発第698号及び薬審第718号（昭和55年5月30日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2005年3月に承認を取得、2005年7月に販売を開始した。

2006年12月には、医療事故防止対策\*として販売名をキネスタット錠50mgに変更した。その後、2014年2月には、販売名をエパルレスタット錠50mg「NP」と、ブランド名から一般名\*\*に変更し、製造販売承認をニプロ㈱が承継した。

\*「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」

（平成12年9月19日付医薬発第935号厚生省医薬安全局長通知）に基づく

\*\*「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成17年9月22日付薬食審査発第0922001号）に基づく

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

○本剤は、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<sup>1)</sup>。

○臨床的には、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）に有用性が認められている。

○重大な副作用としては、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）。

---

## Ⅱ. 名称に関する項目

---

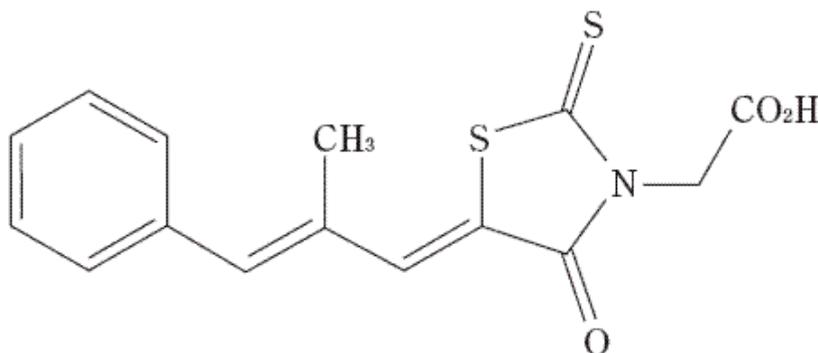
### 1. 販売名

- (1) 和 名 : エパルレスタット錠 50mg 「NP」  
(2) 洋 名 : EPALRESTAT TABLETS  
(3) 名称の由来 : 有効成分であるエパルレスタットに剤形及び含量を記載し、NIPRO から「NP」を付した。

### 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)  
(3) ステム : アルドース還元酵素阻害剤 : -restat

### 3. 構造式又は示性式



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

### 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

黄色～橙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<sup>2)</sup>

pKa=4.3 (カルボキシル基、中和滴定法)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値<sup>1)</sup>

乾燥減量: 0.2%以下 (1g、減圧、シリカゲル、60℃、3時間)

強熱残分: 0.1%以下 (1g)

#### 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<sup>1)</sup>

日本薬局方の医薬品各条の「エパルレスタット」確認試験法による。

#### 4. 有効成分の定量法<sup>1)</sup>

日本薬局方の医薬品各条の「エパルレスタット」定量法による。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

1) 区別：錠剤（フィルムコート錠）

2) 外観及び性状：下記表に記載

販売名	エパルレスタット錠 50mg 「NP」	
外形		
形状	白色のフィルムコート錠	
大きさ	直径 (mm)	6.7
	厚さ (mm)	3.5
	重量 (mg)	120
識別コード	TP-225	

(2) 製剤の物性：該当資料なし

(3) 識別コード：上記表に記載

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等：該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1 錠中 日本薬局方 エパルレスタット 50mg

#### (2) 添加物

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

#### (3) その他

該当しない

### 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<sup>3)</sup>

試験条件：40±1℃、75±5%RH

包装形態（ポリ塩化ビニル・アルミ箔）

項目及び規格	試験開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状（白色のフィルムコート錠である）	適 合	適 合	適 合	適 合
確認試験	適 合	適 合	適 合	適 合
純度試験	適 合	—	—	適 合
溶出試験（45 分間の溶出率：75%以上）	適 合	—	—	適 合
微生物限度試験	適 合	—	—	適 合
含量（95～105%）	99.7～100.7	99.9～100.8	99.9～100.2	99.4～99.8

長期保存試験<sup>4)</sup>

試験条件：室温

包装形態（ポリ塩化ビニル・アルミ箔）

項目及び規格	試験開始時	3 年 3 カ月後
性状（白色のフィルムコート錠である）	適 合	適 合
純度試験	適 合	適 合
溶出試験（45 分間の溶出率：75%以上）	適 合	適 合
含量（95～105%）	99.3～100.2	99.2～100.4

(n=3)

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、3 年間）の結果、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（物理化学的変化）

該当しない

#### 7. 溶出性

溶出挙動における類似性<sup>5)</sup>

（「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号」）

試験方法：日本薬局方一般試験法溶出試験法（パドル法）

### 試験条件

試験液の温度 :  $37 \pm 0.5^{\circ}\text{C}$

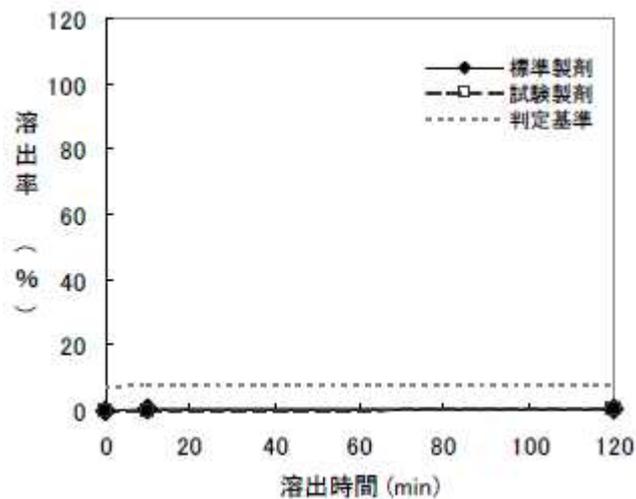
試験液の量 : 900mL

試験液 : pH1.2 = 日本薬局方崩壊試験第1液  
pH5.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液  
pH6.8 = 日本薬局方崩壊試験第2液  
水

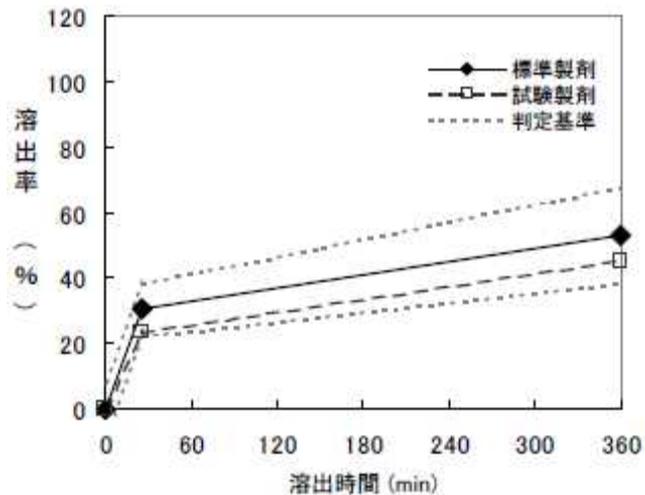
回転数 : 回転数 50rpm の場合 pH1.2、5.0、6.8 及び水  
回転数 100rpm の場合 pH6.8

試験結果 : 各試験条件においてエパルレスタット錠 50mg 「NP」と標準製剤の溶出試験を実施した結果、全ての条件において溶出挙動の類似性の判定基準を満たしていたため、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

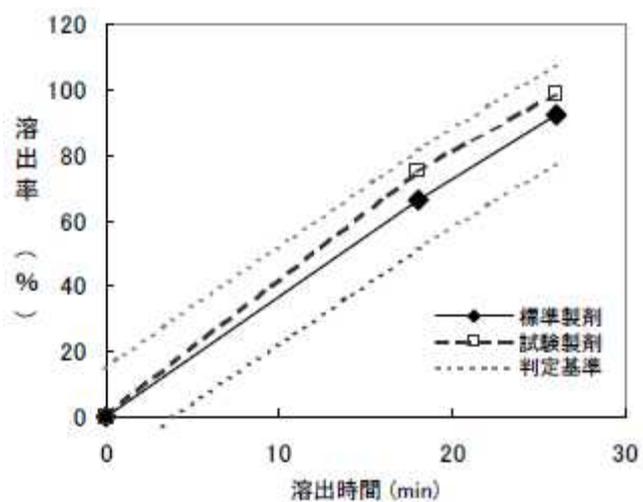
試験液 pH1.2 における平均溶出曲線 (mean  $\pm$  S. D.、n=12)



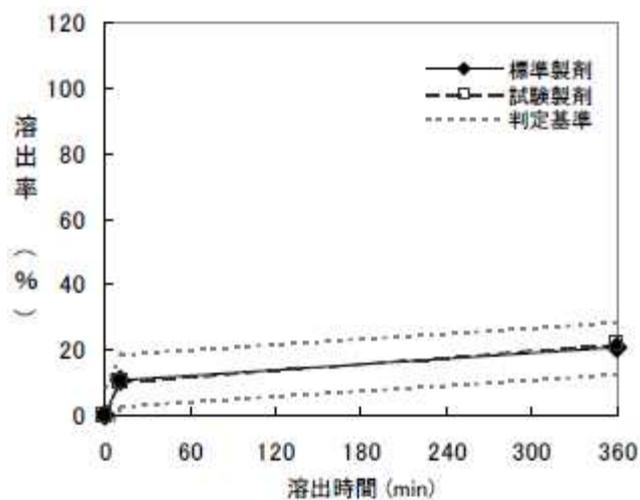
試験液 pH5.0 における平均溶出曲線 (mean  $\pm$  S. D.、n=12)



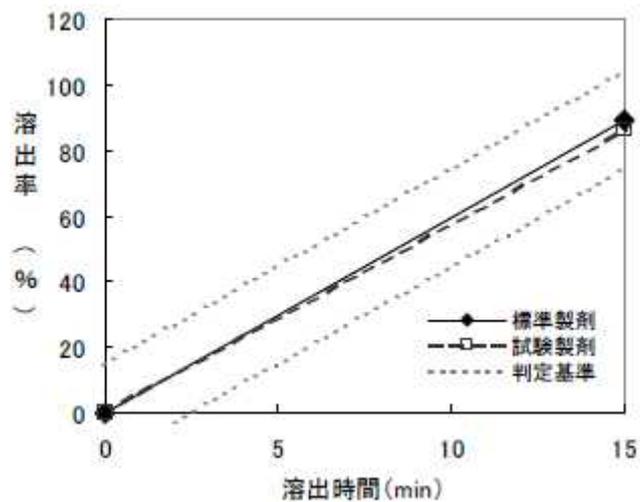
試験液 pH6.8 における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



試験液 水における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



試験液 pH6.8 (100rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



〈公的溶出規格への適合〉

エパルレスタット錠 50mg 「NP」

方法 : 日本薬局方 溶出試験法 (パドル法)

試験液 : 日本薬局方 溶出試験第 2 液 900mL

回転数 : 50rpm

試験結果 : 45 分間以内に 70%以上溶出した。

エパルレスタット錠 50mg 「NP」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<sup>6)</sup>

日本薬局方の医薬品各条の「エパルレスタット錠」確認試験法による。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法<sup>6)</sup>

日本薬局方の医薬品各条の「エパルレスタット錠」定量法による。

## 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. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

## 14. その他

該当しない

---

## 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

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

該当しない

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>1)</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<sup>7)</sup>

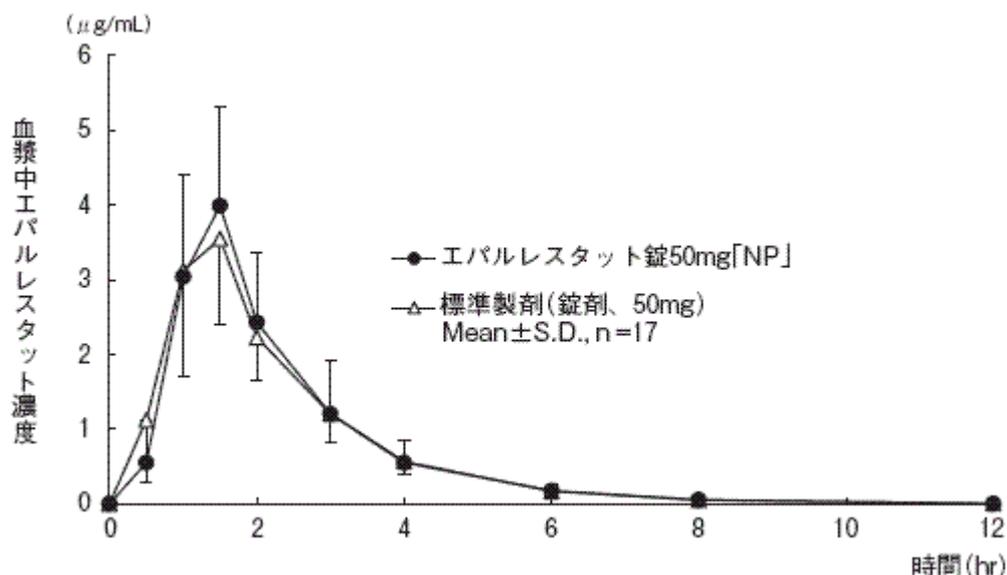
健康成人男子に、エパルレスタット錠50mg「NP」を1錠（エパルレスタットとして50mg、n=17）食前に経口投与した時のTmaxは約1.35時間であった。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>7)</sup>

生物学的同等性試験ガイドライン

（「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号」、「医薬品の臨床試験の実施の基準に関する省令：平成9年3月27日 厚生省令第28号」）

エパルレスタット錠50mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1錠（エパルレスタットとして50mg）を、2剤2期のクロスオーバー法により健康成人男子に食前に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た。得られた薬物動態パラメータ（ $AUC_{0-12hr}$ 、 $C_{max}$ ）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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→12hr</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
エパルレスタット 錠 50mg 「NP」	8.138± 2.233	4.3155± 1.2388	1.35± 0.23	1.2182± 0.3846
標準製剤 (錠剤、50mg)	8.103± 1.546	4.0736± 1.0418	1.29± 0.25	1.2268± 0.4629

(Mean±S. D., n=17)

生物学的同等性試験によって得られた血漿中濃度並びに 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

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

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〉

動物試験（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

#### 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、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

種類\頻度	頻度不明
過敏症 <sup>注1)</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1)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

「8. 副作用」の項 を参照。

## 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。[動物試験（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

該当しない

---

## Ⅹ. 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

製 剤：エパルレスタット錠 50mg 「NP」 処方箋医薬品<sup>注2)</sup>

有効成分：日本薬局方 エパルレスタット 処方箋医薬品<sup>注2)</sup>

注2) 注意－医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後3年（安定性試験結果に基づく）

（「IV. 製剤に関する項目」の「4. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照。）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱い上の留意点について

該当しない

（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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「14. 適用上の注意」及び  
「15. その他の注意」の項を参照。

（3）調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

100錠（PTP）

### 7. 容器の材質

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（小野薬品工業） 他

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

製造販売承認年月日：2014年2月12日（販売名変更による）

承認番号：22600AMX00165000

[注1]旧販売名：キネスタット錠 承認年月日：2005年3月14日

[注2]旧販売名：キネスタット錠 50mg 承認年月日：2006年9月11日

[注3]2012年10月1日に製造販売承認をニプロファーマ(株)に承継

[注4]2014年2月28日に製造販売承認をニプロ(株)に承継

11. 薬価基準収載年月日

2014年6月20日

[注1]キネスタット錠（旧販売名）：2005年7月8日

経過措置期間満了：2007年8月31日

[注2]キネスタット錠 50mg（旧販売名）：2006年12月8日

経過措置期間満了：2015年3月31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、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

〈参考〉

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項を参照。

#### 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 (YJコード)	レセプト 電算コード
エパルレスタット錠 50mg「NP」	116824202	3999013F1010 (3999013F1355)	621682402

#### 17. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 第十七改正 日本薬局方 解説書 (廣川書店) C-948 (2016)
- 2) 日本薬剤師研修センター編: 日本薬局方 医薬品情報 2016 (じほう) 134 (2016)
- 3) ニプロ(株)社内資料: 安定性 (加速) 試験
- 4) ニプロ(株)社内資料: 安定性 (長期保存) 試験
- 5) ニプロ(株)社内資料: 生物学的同等性 (溶出) 試験
- 6) 第十七改正 日本薬局方 解説書 (廣川書店) C-952 (2016)
- 7) ニプロ(株)社内資料: 生物学的同等性 (血漿中濃度測定) 試験

### 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

【MEMO】

【MEMO】

**ニフ.〇 株式会社**  
大阪市北区本庄西3丁目9番3号