

2024年4月改訂（第7版）

日本標準商品分類番号

873399

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 2018(2019年更新版)に準拠して作成

5-HT₂ 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「オーハラ」

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 50mg, 100mg 「OHARA」

| | |
|--------------------------|--|
| 剤形 | 錠剤(フィルムコーティング錠) |
| 製剤の規制区分 | 該当しない |
| 規格・含量 | 錠 50mg:1 錠中日局サルポグレラート塩酸塩 50mg を含有する。 錠 100mg:1 錠中日局サルポグレラート塩酸塩 100mg を含有する。 |
| 一般名 | 和名：サルポグレラート塩酸塩 [JAN] 洋名：Sarpogrelate Hydrochloride [JAN] |
| 製造販売承認年月日 | 製造販売承認年月日:2009年7月13日 |
| 薬価基準収載 ・発売年月日 | 薬価基準収載年月日:2009年11月13日 発売年月日: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：大原薬品工業株式会社 |
| 医薬情報担当者の 連絡先 | |
| 問い合わせ窓口 | 大原薬品工業株式会社 お客様相談室 フリーダイヤル 0120-419-363 URL https://www.ohara-ch.co.jp |

本 IF は 2023 年 12 月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。

最新の情報は、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。

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)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り、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IF と略す)が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第 2 小委員会が IF の位置付け、IF 記載様式、IF 記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会が IF 記載要領の改訂を行ってきた。

IF 記載要領 2008 以降、IF は PDF 等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加した IF が速やかに提供されることとなった。最新版の IF は、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品の IF の情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF 記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IF に記載する項目配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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 の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IF の利用にあたって

電子媒体の IF は、PMDA の医療用医薬品情報検索の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 IF を作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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 PMDA の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、
「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IF は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らが IF の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IF を活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

| | |
|--|----|
| I 概要に関する項目 | |
| 1. 開発の経緯 | 1 |
| 2. 製品の治療学的特性 | 1 |
| 3. 製品の製剤学的特性 | 1 |
| 4. 適正使用に関して周知すべき特性 | 1 |
| 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 | 2 |
| 6. RMP の概要 | 2 |
| II 名称に関する項目 | |
| 1. 販売名 | 3 |
| 2. 一般名 | 3 |
| 3. 構造式又は示性式 | 3 |
| 4. 分子式及び分子量 | 3 |
| 5. 化学名（命名法）又は本質 | 3 |
| 6. 慣用名，別名，略号，記号番号 | 4 |
| III 有効成分に関する項目 | |
| 1. 物理化学的性質 | 5 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 | 5 |
| 3. 有効成分の確認試験法、定量法 | 6 |
| IV 製剤に関する項目 | |
| 1. 剤形 | 7 |
| 2. 製剤の組成 | 7 |
| 3. 添付溶解液の組成及び容量 | 8 |
| 4. 力価 | 8 |
| 5. 混入する可能性のある夾雑物 | 8 |
| 6. 製剤の各種条件下における安定性 | 8 |
| 7. 調製法及び溶解後の安定性 | 10 |
| 8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） | 10 |
| 9. 溶出性 | 10 |
| 10. 容器・包装 | 12 |
| 11. 別途提供される資材類 | 13 |
| 12. その他 | 13 |
| V 治療に関する項目 | |
| 1. 効能又は効果 | 14 |
| 2. 効能又は効果に関連する注意 | 14 |
| 3. 用法及び用量 | 14 |
| 4. 用法及び用量に関連する注意 | 14 |
| 5. 臨床成績 | 14 |
| 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 | 16 |
| 2. 薬理作用 | 16 |
| VII 薬物動態に関する項目 | |
| 1. 血中濃度の推移 | 17 |
| 2. 薬物速度論的パラメータ | 19 |
| 3. 母集団（ポピュレーション）解析 | 19 |
| 4. 吸収 | 19 |
| 5. 分布 | 19 |
| 6. 代謝 | 20 |
| 7. 排泄 | 20 |
| 8. トランスポーターに関する情報 | 20 |
| 9. 透析等による除去率 | 20 |
| 10. 特定の背景を有する患者 | 21 |
| 11. その他 | 21 |
| 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 | 22 |
| 2. 禁忌内容とその理由 | 22 |
| 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 | 22 |
| 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 | 22 |
| 5. 重要な基本的注意とその理由 | 22 |
| 6. 特定の背景を有する患者に関する注意 | 22 |
| 7. 相互作用 | 23 |
| 8. 副作用 | 23 |
| 9. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 24 |
| 10. 過量投与 | 24 |
| 11. 適用上の注意 | 25 |
| 12. その他の注意 | 25 |
| IX 非臨床試験に関する項目 | |
| 1. 薬理試験 | 26 |
| 2. 毒性試験 | 26 |
| X 管理的事項に関する項目 | |
| 1. 規制区分 | 27 |
| 2. 有効期間 | 27 |
| 3. 包装状態での貯法 | 27 |
| 4. 取扱い上の注意 | 27 |
| 5. 患者向け資材 | 27 |
| 6. 同一成分・同効薬 | 27 |
| 7. 国際誕生年月日 | 27 |
| 8. 製造販売承認年月日及び承認番号， 薬価基準収載年月日，販売開始年月日 | 27 |
| 9. 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 | 27 |
| 10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 | 28 |
| 11. 再審査期間 | 28 |
| 12. 投薬期間制限に関する情報 | 28 |
| 13. 各種コード | 28 |
| 14. 保険給付上の注意 | 28 |

X I 文献

- 1. 引用文献 29
- 2. その他の参考文献 29

X II 参考資料

- 1. 主な外国での発売状況 30
- 2. 海外における臨床支援情報 30

X III 備考

- 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての
参考情報 31
- 2. その他の関連資料 31

付表 32

略語表

| 略語 | 略語内容(英語) | 略語内容(日本語) |
|------------------|--|---------------------|
| ADP | adenosine diphosphate | アデノシン二リン酸 |
| ALP | alkaline phosphatase | アルカリフォスファターゼ |
| ALT | alanine aminotransferase | アラニンアミノトランスフェラーゼ |
| AST | aspartate aminotransferase | アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ |
| AUC | area under the plasma concentration-time curve | 血漿中濃度-時間曲線下面積 |
| BUN | blood urea nitrogen | 血液尿素窒素 |
| C _{max} | maximum plasma concentration | 最高血漿中濃度 |
| CYP | cytochrome P450 | チトクローム P450 |
| γ-GTP | gamma-glutamyl transpeptidase | γ-グルタミントランスペプチダーゼ |
| LDH | lactate dehydrogenase | 乳酸脱水素酵素 |
| RMP | risk management plan | 医薬品リスク管理計画 |
| t _{1/2} | elimination half-life | 半減期 |
| t _{max} | time of maximum plasma concentration | 最高血漿中濃度到達時間 |

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

サルポグレラート塩酸塩(一般名)は、抗血小板作用及び血管収縮抑制作用を示す製剤であり、本邦では1993年に上市されている。

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 及び 100mg 「オーハラ」は、大原薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)(付表参照)に基づき、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、2009 年 7 月に製造販売承認を取得し、2009 年 11 月に上市した。

なお、本剤は後発医薬品として、大原薬品工業株式会社、キョーリンリメディオ株式会社、沢井製薬株式会社と他 1 社の 4 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

その後 2012 年 8 月(錠 100mg)及び 2013 年 3 月(錠 50mg)に処方変更を行った。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は慢性動脈閉塞症の潰瘍、疼痛、冷感等の虚血性諸症状の改善に有用である。
(「V. 治療に関する項目」参照)
- (2) サルポグレラートは血小板及び血管平滑筋における 5-HT₂(セロトニン)レセプターに対する特異的な拮抗作用を示す。その結果、抗血小板作用及び血管収縮抑制作用を示す。(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)
- (3) 重大な副作用として、**脳出血、消化管出血、血小板減少、肝機能障害、黄疸、無顆粒球症**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」参照)

3. 製品の製剤学的特性

- (1) 成分名、含量、屋号が両面印字された錠剤である。
- (2) 成分名、含量、屋号、GS1 コードが表示された PTP シートである。
- (3) 個装箱には、製品名カード、剤形イメージ、GS1 コードの 3 つの製品情報が盛り込まれている。また、解体用ミシン目を設けることによって廃棄時の負担軽減に配慮している。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

| 適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等 | 有無 |
|------------------------------|----|
| RMP | 無 |
| 追加のリスク最小化活動として作成されている資材 | 無 |
| 最適使用推進ガイドライン | 無 |
| 保険適用上の留意事項通知 | 無 |

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

サルポグレレート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」

サルポグレレート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」

(2) 洋名

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 50mg 「OHARA」

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 100mg 「OHARA」

(3) 名称の由来

通知「薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

サルポグレレート塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

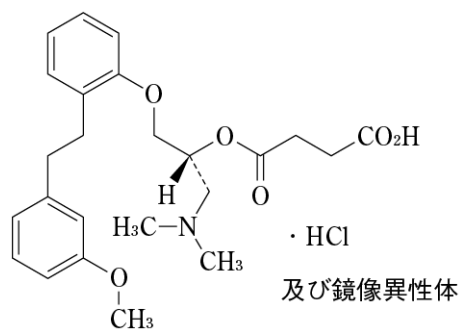
Sarpogrelate Hydrochloride (JAN)

Sarpogrelate (INN)

(3) ステム

-grel- : platelet aggregation inhibitors (血小板凝集阻害薬)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

(1) 分子式 : $C_{24}H_{31}NO_6 \cdot HCl$

(2) 分子量 : 465.97

5. 化学名 (命名法) 又は本質

(2*RS*)-1-Dimethylamino-3-[2-[2-(3-methoxyphenyl)ethyl]phenoxy]propan-2-yl hydrogen succinate monohydrochloride (IUPAC 命名法)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

開発番号 : OHK7411 (サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」)

OHK7412 (サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末である。

本品は結晶多形が認められる。

(2) 溶解性

溶解性

| 溶媒 | 日本薬局方の溶解度表記 |
|-------------|-------------|
| 水 | 溶けにくい |
| 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。

溶解度(37℃)¹⁾

| | |
|-------|-----------|
| pH1.2 | 3.48mg/mL |
| pH4.0 | 51.1mg/mL |
| pH6.8 | 60.7mg/mL |
| 水 | 50.8mg/mL |

(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¹⁾

pK_{a1} (20℃) : 3.89(カルボキシル基、滴定法)

pK_{a2} (20℃) : 8.42(第三アミノ基、滴定法)

(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¹⁾

溶解後の安定性

| | |
|--------|---|
| 水 | 1mg/mL 濃度のとき、40℃、24 時間で約 7%分解する。 |
| 液性(pH) | 酸性領域では安定で、アルカリ性になるにつれて不安定である。 1mg/mL 濃度： pH2.0、37℃で 2 時間は安定である。 pH4.0、37℃、2 時間で約 0.5%分解する。 pH6.0、37℃、2 時間で約 4%分解する。 pH8.0、37℃、2 時間で 70%以上分解する。 |

光安定性：固体状態で安定である。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日局「サルポグレラート塩酸塩」による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法(塩化カリウム錠剤法)
- (3) 塩化物の定性反応

定量法

日局「サルポグレラート塩酸塩」による。

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

錠剤(フィルムコーティング錠)

(2) 製剤の外観及び性状

| 販売名 | 剤形 | 性状 | 外形・サイズ | | |
|--------------------------|---------------------|----|-------------------------------|----|----|
| | | | 表面 | 裏面 | 側面 |
| サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」 | 円形のフィルムコーティング錠 | 白色 | | | |
| | | | 直径：7.6mm 厚さ：3.6mm 質量：145.0 mg | | |
| サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」 | 割線入りの円形のフィルムコーティング錠 | 白色 | | | |
| | | | 直径：8.6mm 厚さ：4.2mm 質量：227.0 mg | | |

(3) 識別コード

表示部位：錠剤

表示内容：

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」：サルポグレラート 50 オーハラ

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」：サルポグレラート 100 オーハラ

(4) 製剤の物性^{2,3)}

| 販売名 | 硬度(kp, n=5) |
|--|-------------|
| サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」 ²⁾ | 9.9 |
| サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」 ³⁾ | 13.7 |

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

| 販売名 | サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」 | サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」 |
|------|--|----------------------------|
| 有効成分 | 1錠中日局サルポグレラート塩酸塩 50mg を含有 | 1錠中日局サルポグレラート塩酸塩 100mg を含有 |
| 添加剤 | D-マンニトール、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、クエン酸水和物、ステアリン酸カルシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ | |

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

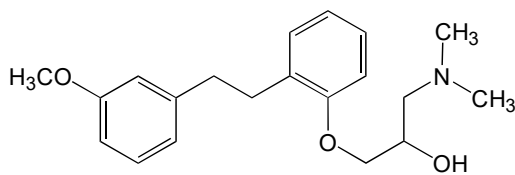
3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

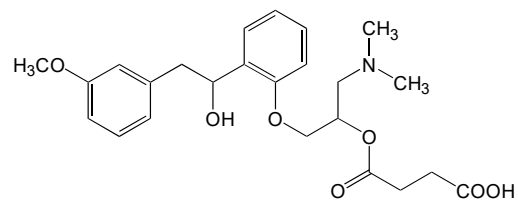
4. 力価

該当しない

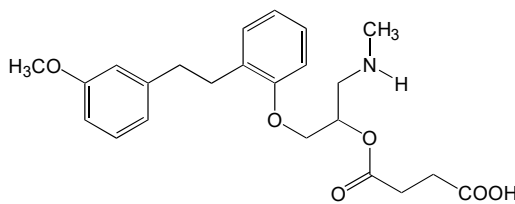
5. 混入する可能性のある夾雑物



脱エステル体



水酸化体



モノメチル体

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 長期保存条件下での安定性試験^{4,5)}

・ 保存形態：

PTP 包装：PTP(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)包装し、アルミ多層ラミネート製袋(ポリエチレン、アルミ箔及びポリエチレンテレフタレート)に入れ加熱シールした。

バラ包装：ポリエチレン製容器に入れ、ポリプロピレンキャップで封をした。(錠 100mg のみ)

- ・ 保存条件：25°C(±2°C)、60%RH(±5%RH)
- ・ 保存期間：36 ヶ月
- ・ 試験項目：性状、確認試験、純度試験(類縁物質)、含量均一性試験、溶出試験、定量
- ・ 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

1) サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」⁴⁾

| 保存条件 | 期間 | 保存形態 | 結果 |
|-----------------------------|-------|--------|-----------------------|
| 25°C(±2°C)、 60%RH(±5%RH) | 36 ヶ月 | PTP 包装 | 類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。 |

2) サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」⁵⁾

| 保存条件 | 期間 | 保存形態 | 結果 |
|-----------------------------|-------|--------|-----------------------|
| 25°C(±2°C)、 60%RH(±5%RH) | 36 ヶ月 | PTP 包装 | 類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。 |
| | | バラ包装 | |

(2) 加速条件下での安定性試験^{6,7)}

・ 保存形態：

PTP 包装：PTP(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)包装し、アルミ多層ラミネート製袋(ポリエチレン、アルミ箔及びポリエチレンテレフタレート)に入れ加熱シールした。

バラ包装：ポリエチレン製容器に入れ、ポリプロピレンキャップで封をした。(錠 100mg のみ)

・ 保存条件：40°C(±1°C)、75%RH(±5%RH)

・ 保存期間：6 ヶ月

・ 試験項目：性状、確認試験、純度試験(類縁物質)、含量均一性試験、溶出試験、定量

・ 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

1) サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」⁶⁾

| 保存条件 | 期間 | 保存形態 | 結果 |
|-----------------------------|------|--------|-----------------------|
| 40°C(±1°C)、 75%RH(±5%RH) | 6 ヶ月 | PTP 包装 | 類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。 |

2) サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」⁷⁾

| 保存条件 | 期間 | 保存形態 | 結果 |
|-----------------------------|------|--------|-----------------------|
| 40°C(±1°C)、 75%RH(±5%RH) | 6 ヶ月 | PTP 包装 | 類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。 |
| | | バラ包装 | |

(3) 無包装状態での安定性試験^{1,2)}

無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験(性状、純度試験(類縁物質)、溶出試験、定量、硬度)を行った。

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg、100mg 「オーハラ」

| | 試験条件 | 結果 |
|----|---------------------------------|---------|
| 温度 | 40°C、3 ヶ月(遮光・気密容器) | 全て変化なし。 |
| 湿度 | 25°C、75%RH、6 ヶ月(遮光・開放) | 全て変化なし。 |
| 光 | 総照射量 120 万 lx・hr(開放/25°C、60%RH) | 全て変化なし。 |

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

9. 溶出性

(1) 日局溶出試験^{6,7)}

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」により、試験を行う。

条件：回転数 50rpm

試験液 水

試験結果：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(30 分間の溶出率が 80%以上)に適合した。

| | 時間 | 溶出率* (最小値～最大値) |
|--|------|-------------------------|
| サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」 ⁶⁾ | 30 分 | 100.6% (98.6～103.2%) |
| サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」 ⁷⁾ | 30 分 | 100.0% (98.2～101.7%) |

※:3Lot 平均値

(2) 経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験^{8,9)}

1) サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」⁸⁾

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に準じ試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

試験液量：900mL

温度：37℃±0.5℃

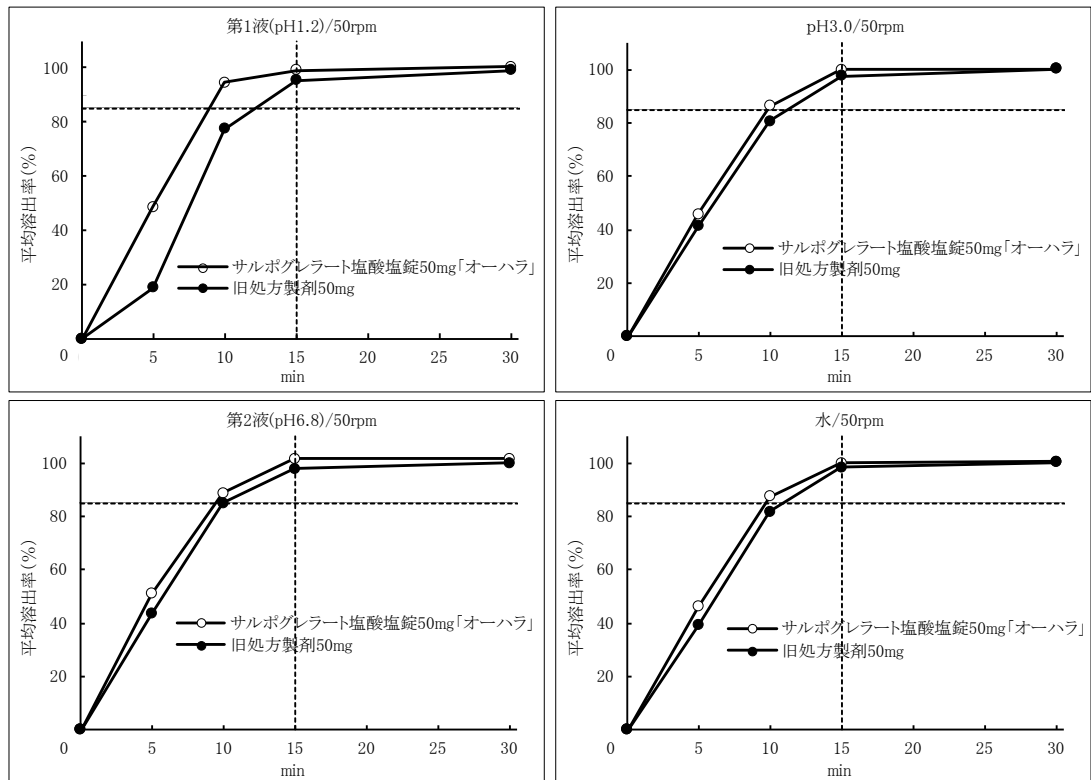
試験結果：「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」に適合した。

表 溶出挙動における類似性

| 試験条件 | 判定 時点 (分) | 平均溶出率(%) | | 類似性の判定基準 | 判定 | |
|-------|-----------------|----------|---------------|----------|---------------------|----|
| | | 試験製剤 | 旧処方製剤 50mg | | | |
| 50rpm | pH1.2 | 15 | 99.0 | 95.3 | 15分間に試験製剤が平均85%以上溶出 | 類似 |
| | pH3.0 | 15 | 99.8 | 97.5 | | 類似 |
| | pH6.8 | 15 | 101.5 | 97.7 | | 類似 |
| | 水 | 15 | 99.9 | 98.3 | | 類似 |

(n=12)

(溶出曲線)



試験液: pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液
pH6.8=日本薬局方溶出試験液の第2液

pH3.0=薄めたMcIlvaineの緩衝液
水=日本薬局方精製水

2) サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」⁹⁾

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号、平成19年5月30日 審査管理課事務連絡)に準じ試験を実施した。

試験方法: 日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

試験液量: 900mL

温度: 37°C ± 0.5°C

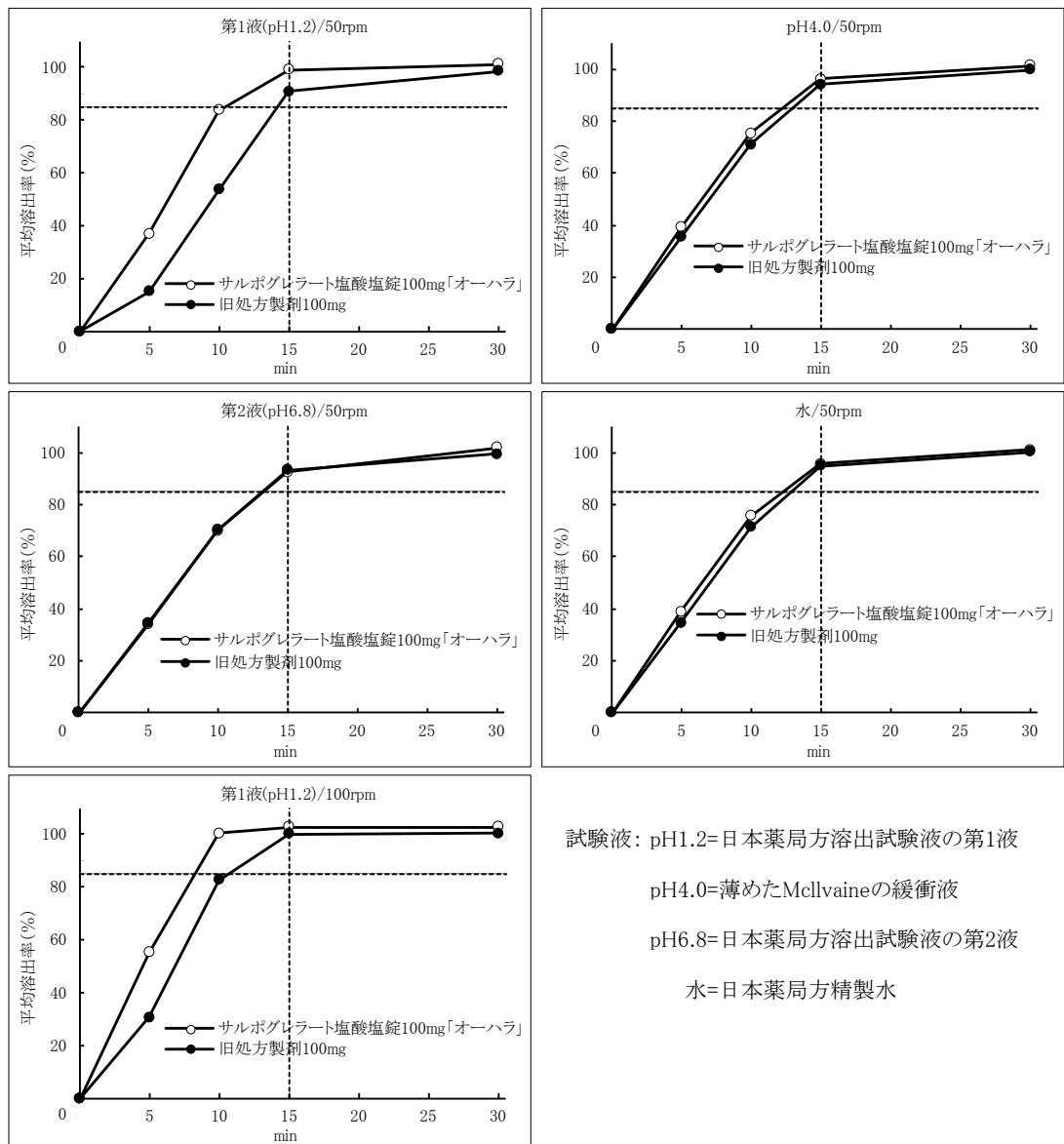
試験結果: 「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」に適合した。

表 溶出挙動における類似性

| 試験条件 | 判定 時点 (分) | 平均溶出率(%) | | 類似性の判定基準 | 判定 | |
|--------|-----------------|----------|----------------|----------|---------------------|----|
| | | 試験製剤 | 旧処方製剤 100mg | | | |
| 50rpm | pH1.2 | 15 | 99.0 | 91.0 | 15分間に試験製剤が平均85%以上溶出 | 類似 |
| | pH4.0 | 15 | 96.2 | 93.9 | | 類似 |
| | pH6.8 | 15 | 92.4 | 93.3 | | 類似 |
| | 水 | 15 | 95.5 | 94.7 | | 類似 |
| 100rpm | pH1.2 | 15 | 102.7 | 100.1 | 15分間に試験製剤が平均85%以上溶出 | 類似 |

(n=12)

(溶出曲線)



10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」：(PTP) 100錠(10錠×10)

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」：(PTP) 100錠(10錠×10)

(バラ) 500錠(乾燥剤入り)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP包装

PTP: ポリ塩化ビニル、アルミ箔

アルミ多層フィルム袋：ポリエチレン、アルミ箔、ポリエチレンテレフタレート

バラ包装

ボトル：ポリエチレン、キャップ：ポリプロピレン、乾燥剤：シリカゲル

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

特になし

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. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

国内第Ⅲ相比較試験

慢性動脈閉塞症を対象に100mg錠を1回1錠1日3回6週間毎食後に経口投与した二重盲検比較試験において、有用度は64.3%(45/70例)(有用以上)、90.0%(63/70例)(やや有用以上)であった。副作用発現頻度は2.6%(2/76例)であった。副作用の内訳は腹痛、嘔気、消化管出血いずれも1.3%(1/76例)であった¹⁰⁾。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

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

チクロピジン塩酸塩、クロピドグレル硫酸塩、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

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

サルポグレラートは血小板及び血管平滑筋における 5-HT₂(セロトニン)レセプターに対する特異的な拮抗作用を示す。その結果、抗血小板作用及び血管収縮抑制作用を示す^{11~14)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 血小板凝集抑制作用

① 健康成人及び慢性動脈閉塞症患者において、セロトニンとコラーゲン同時添加による血小板凝集を抑制する^{15,16)} (*ex vivo* 試験)。

② *In vitro* の試験(ヒト、ウサギ、ラット)においてコラーゲンによる血小板凝集及びADP 又はアドレナリンによる血小板の二次凝集を抑制する¹¹⁾。

また、コラーゲンによる血小板凝集はセロトニンにより増強されるが、この増強された血小板凝集を抑制する¹¹⁾。

2) 抗血栓作用

① 末梢動脈閉塞症モデル(ラウリン酸注入によるラット末梢動脈閉塞)における病変の進展を抑制する¹⁷⁾。

② 動脈血栓モデル(血管内皮損傷によるマウス動脈血栓、ポリエチレンチューブ置換ラット動脈血栓)における血栓の形成を抑制する¹⁸⁾。

3) 血管収縮抑制作用

ラットの血管平滑筋を用いた *in vitro* の試験において、セロトニンによる血管平滑筋の収縮を抑制する¹¹⁾。

また、血小板凝集に伴い血管平滑筋が収縮するが、この収縮を抑制する¹²⁾。

4) 微小循環改善作用

慢性動脈閉塞症患者の経皮的組織酸素分圧及び皮膚表面温度を上昇させる¹⁹⁾。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験^{20~22)}

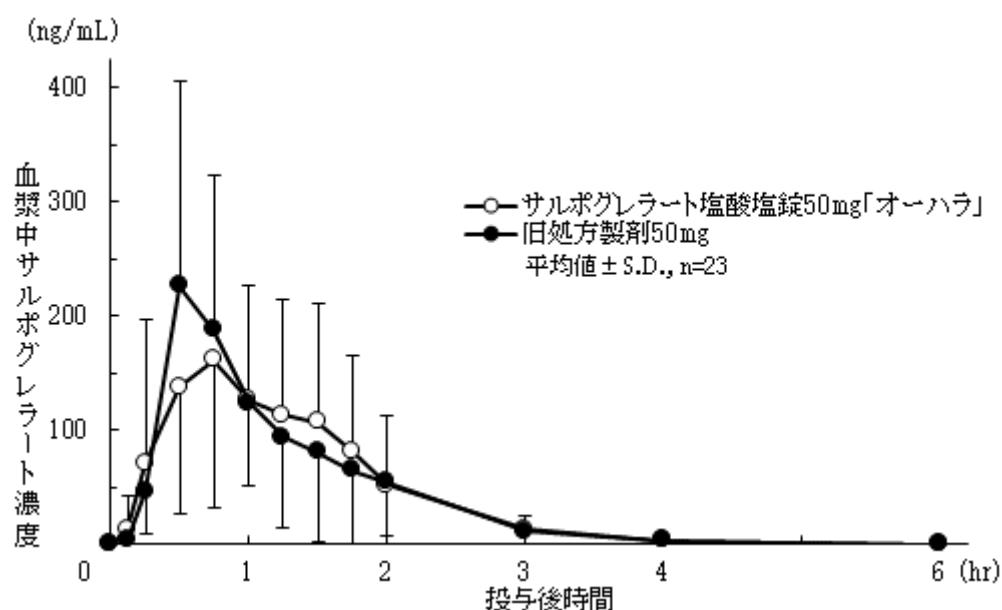
<サルポグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」>^{20,21)}

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に基づき、新処方製剤のサルポグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」と、ヒトを対象とした生物学的同等性試験によりアンプラーグ錠50mgとの同等性が確認された旧処方製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(サルポグレラート塩酸塩としてそれぞれ50mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、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。

薬物動態パラメータ

| | n | AUC _{0→6} (ng・hr/mL) | C _{max} (ng/mL) | t _{max} (hr) | t _{1/2} (hr) |
|-------------------------|----|----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
| サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」 | 23 | 247.58± 115.53 | 269.96± 141.06 | 0.9±0.5 | 0.6±0.2 |
| 旧処方製剤 50mg | 23 | 253.59± 115.52 | 286.69± 170.73 | 0.9±0.5 | 0.6±0.2 |

(平均値±S.D.)



血漿中サルポグレラート濃度の推移

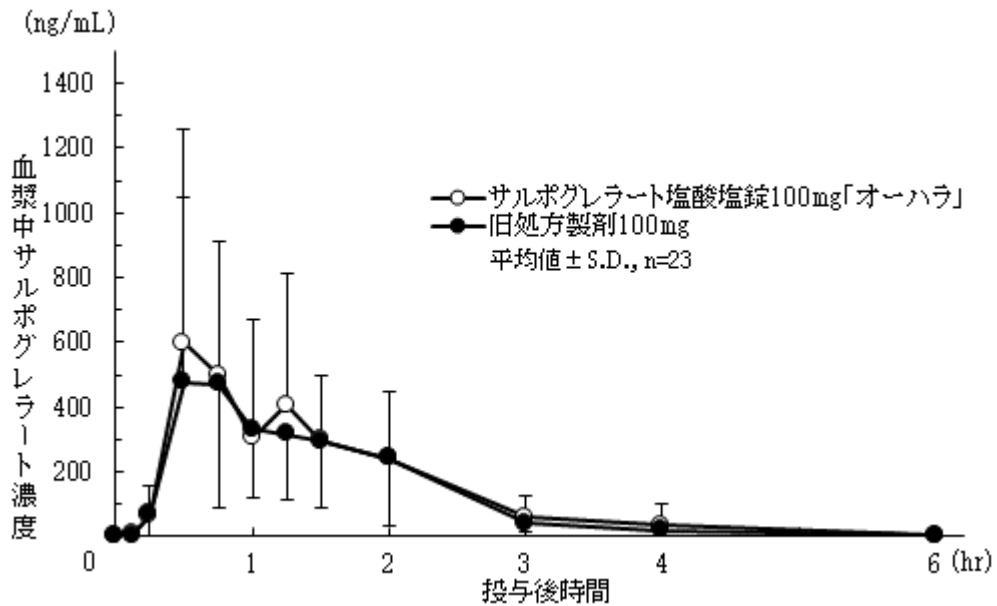
<サルポグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」>^{20, 22)}

「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に基づき、新処方製剤のサルポグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」と、ヒトを対象とした生物学的同等性試験によりアンブラーグ錠100mgとの同等性が確認された旧処方製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(サルポグレラート塩酸塩としてそれぞれ100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、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。

薬物動態パラメータ

| | n | AUC ₀₋₆ (ng・hr/mL) | C_{max} (ng/mL) | t_{max} (hr) | $t_{1/2}$ (hr) |
|--------------------------|----|----------------------------------|----------------------|-------------------|-------------------|
| サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「オーハラ」 | 23 | 869.56 ± 307.24 | 961.62 ± 591.42 | 1.2 ± 0.7 | 0.8 ± 0.2 |
| 旧処方製剤 100mg | 23 | 771.82 ± 232.49 | 851.83 ± 488.99 | 1.2 ± 0.6 | 0.8 ± 0.2 |

(平均値 ± S.D.)



血漿中サルポグレラート濃度の推移

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、血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

該当資料なし

2) 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

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) 消失速度定数^{21,22)}

健康成人男子単回投与

| 投与量 | 50mg (n=23) ²¹⁾ | 100mg (n=23) ²²⁾ |
|-----------|----------------------------|-----------------------------|
| Ke1 (/hr) | 1.323±0.348 | 0.985±0.367 |

(平均値±S. D.)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

健康成人における経口吸収率は尿、糞中への未変化体及び代謝物の排泄率より50%以上と推定される²³⁾。

5. 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

<参考>

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。
(「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 6. 特定の背景を有する患者に関する注意 (5) 妊婦」の項参照)

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>

動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。(「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)」に関する項目 6. 特定の背景を有する患者に関する注意 (6) 授乳婦」の項参照)

(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

雄性ラットに ^{14}C -サルポグレラート塩酸塩を 20mg/kg 経口投与したとき、大部分の組織中放射能濃度は 15~30 分で最高値に達し、肝臓、腎臓及び肺に血漿中より高い放射能の分布が認められたが、他の組織中濃度は血漿中濃度と同等かもしくは低値であった²⁴⁾。

(6) 血漿蛋白結合率

ヒト血清：95%以上²⁵⁾ (*in vitro*、限外ろ過法)。

6. 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 (CYP 等) の分子種, 寄与率

サルポグレラート塩酸塩錠は脱エステル化された後、代謝物は複数のチトクローム P450 分子種 (CYP1A2、CYP2B6、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6、CYP3A4) で代謝される²⁶⁾。

(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活性比, 存在比率

該当資料なし

7. 排泄

健康成人 6 例にサルポグレラート塩酸塩錠を 100mg 単回経口投与したとき、投与後 24 時間までに未変化体は尿及び糞中に認められなかったが、大部分が抱合型代謝物として尿中に排泄された。また、尿中及び糞中への合計排泄率はそれぞれ 44.5%及び 4.2%であった²³⁾。

注) 本剤の承認用法は 1 日 3 回食後経口投与である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 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。] [9.1.2、11.1.1 参照]

2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性[9.5 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 月経期間中の患者

出血を増強するおそれがある。

9.1.2 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。[2.1、11.1.1 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重篤な腎障害のある患者

排泄に影響するおそれがある。

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。動物実験(ラット)で胚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。[2.2 参照]

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

| |
|---|
| <p>11.1 重大な副作用</p> <p>11.1.1 脳出血、消化管出血(いずれも0.1%未満) 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[2.1、9.1.2参照]</p> <p>11.1.2 血小板減少(頻度不明)</p> <p>11.1.3 肝機能障害、黄疸(いずれも頻度不明) AST、ALT、ALP、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。</p> <p>11.1.4 無顆粒球症(頻度不明)</p> |
|---|

(2) その他の副作用

| | | | |
|--------------|---|-------------------------|-------------------------|
| 11.2 その他の副作用 | | | |
| | 0.1～5%未満 | 0.1%未満 | 頻度不明 |
| 過敏症 | 発疹、発赤 | 丘疹、そう痒 | 紅斑、蕁麻疹 |
| 肝臓 | 肝機能障害(ビリルビン、AST、ALT、ALP、 γ -GTP、LDHの上昇等) | | |
| 出血傾向 | 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) 発現頻度は、製造販売後調査の結果を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

10. 過量投与

該当資料なし

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

該当資料なし

(2) 非臨床試験に基づく情報

該当資料なし

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) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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：サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」 該当しない
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」 該当しない
有効成分：サルポグレラート塩酸塩 劇薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

- ・ 患者向医薬品ガイド：無し
- ・ くすりのしおり：有り
- ・ 患者用指導箋：無し

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アンプラーグ錠 50mg、100mg、アンプラーグ細粒 10%

同 効 薬：チクロピジン塩酸塩、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

7. 国際誕生年月日

1993年7月2日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

| 販売名 | 製造販売承認年月日 | 承認番号 | 薬価基準収載年月日 | 販売開始年月日 |
|---------------------------|------------|------------------|-------------|-------------|
| サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」 | 2009年7月13日 | 22100AMX02117000 | 2009年11月13日 | 2009年11月13日 |
| サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」 | 2009年7月13日 | 22100AMX02118000 | 2009年11月13日 | 2009年11月13日 |

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は厚生労働大臣の定める「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

13. 各種コード

| 販売名 | HOT9 | 厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード | レセプト電算処理 システムコード |
|------------------------------|-----------|-----------------------|---------------------|
| サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「オーハラ」 | 119271101 | 3399006F1018 | 621927101 |
| サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「オーハラ」 | 119272801 | 3399006F2014 | 621927201 |

14. 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) (財)日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集 No. 28(薬事日報社) p175 (2007)
- 2) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 苛酷試験(錠 50mg) (2012年)
- 3) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 苛酷試験(錠 100mg) (2012年)
- 4) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 長期保存試験(錠 50mg) (2020年)
- 5) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 長期保存試験(錠 100mg) (2021年)
- 6) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 加速試験(錠 50mg) (2013年)
- 7) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 加速試験(錠 100mg) (2012年)
- 8) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 溶出試験(錠 50mg) (2012年)
- 9) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 溶出試験(錠 100mg) (2012年)
- 10) 古川欽一他: 臨床医薬. 1991 ; 7(8). 1747-1770
- 11) Hara H, et al. : Thromb Haemost. 1991 ; 65(4). 415-420
- 12) 原啓人他: 薬理と治療. 1991 ; 19. 611-618
- 13) Tsuchihashi H, et al. : J Pharmacobiodyn. 1991 ; 14(8). 461-466
- 14) Maruyama K, et al. : J Pharmacobiodyn. 1991 ; 14(4). 177-181
- 15) 山口寛他: 臨床医薬. 1991 ; 7(6). 1235-1241
- 16) 磯貝行秀他: 臨床医薬. 1991 ; 7(6). 1227-1233
- 17) Hara H, et al. : Arzneimittelforschung. 1991 ; 41(6). 616-620
- 18) Hara H, et al. : Thromb Haemost. 1991 ; 66(4). 484-488
- 19) 伊藤勝朗他: 臨床医薬. 1991 ; 7(6). 1243-1251
- 20) 陶易王他: 新薬と臨床. 2009 ; 58(9). 1674-1690
- 21) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 生物学的同等性試験(錠 50mg) (2012年)
- 22) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 生物学的同等性試験(錠 100mg) (2012年)
- 23) 小松貞子他: 薬物動態. 1991 ; 6(3). 353-375
- 24) 小松貞子他: 薬物動態. 1991 ; 6(3). 377-398
- 25) 丹羽卓朗他: 薬理と治療. 1991 ; 19. 749-756
- 26) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店. 2021 ; C-2091-2095
- 27) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 粉碎後の安定性試験(錠 50mg) (2012年)
- 28) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 粉碎後の安定性試験(錠 100mg) (2012年)
- 29) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 経管通過性試験(錠 50mg) (2012年)
- 30) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 経管通過性試験(錠 100mg) (2012年)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

本剤は海外では発売されていない。

尚、サルポグレラート塩酸塩製剤としては海外で販売されている。

(2024年4月時点)

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について(その3)」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課)

(1) 粉碎^{27, 28)}

粉碎品について保存し、安定性試験(性状、純度試験、定量)を行った。
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg、100mg 「オーハラ」

| 試験条件 | 結果 |
|------------------------|-----------------------|
| 25°C、60%RH、1 ヶ月(遮光・開放) | 類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。 |

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性^{29, 30)}

試験方法

[崩壊懸濁試験]

ディスペンサー内に試料1錠を入れ、約55°Cの温湯20mLをディスペンサーに吸い取り、筒先の蓋をしてディスペンサーを5分間放置した後、90度横転(15往復)し、崩壊・懸濁の状態を観察する。5分後に崩壊しない場合、さらに5分間放置後、同様の操作を行う。

[通過性試験]

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を、経管チューブの注入端より2~3mL/秒の速度で注入する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30cmの高さにセットし、チューブ(サイズ;8フレンチ)の通過性を観察する。

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg、100mg 「オーハラ」

| 試験方法 | 崩壊懸濁試験 | 通過性試験 | 判定 |
|------|---|-------------------|----|
| 試験結果 | 10分間では完全に崩壊・懸濁しなかった。(約15分で崩壊・懸濁)錠剤をコーティング破壊すれば、10分以内に崩壊・懸濁した。 | チューブ(8フレンチ)を通過した。 | 適2 |

2. その他の関連資料

特になし

付表

薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく承認申請時に添付する資料*

別表 1 及び別表 2-(1)医療用医薬品より改変

※注 平成 17 年 4 月 1 日から平成 26 年 11 月 24 日の間に申請した医薬品に適用された。

| 添付資料の内容 | | 新有効成分含有 製剤 (先発医薬品) | その他の医薬品 (後発医薬品) | 剤形追加に係る 医薬品 (後発医薬品) |
|------------------------------------|--------------------|--------------------------|--------------------|---------------------------|
| イ 起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料 | 1 起原又は発見の経緯 | ○ | × | ○ |
| | 2 外国における使用状況 | ○ | × | ○ |
| | 3 特性及び他の医薬品との比較検討等 | ○ | × | ○ |
| ロ 製造方法並びに規格及び試験方法等に関する資料 | 1 構造決定及び物理化学的性質等 | ○ | × | × |
| | 2 製造方法 | ○ | △ | ○ |
| | 3 規格及び試験方法 | ○ | ○ | ○ |
| ハ 安定性に関する資料 | 1 長期保存試験 | ○ | × | △ |
| | 2 苛酷試験 | ○ | × | △ |
| | 3 加速試験 | ○ | ○ | ○ |
| ニ 薬理作用に関する資料 | 1 効力を裏付ける試験 | ○ | × | × |
| | 2 副次的薬理・安全性薬理 | ○ | × | × |
| | 3 その他の薬理 | △ | × | × |
| ホ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料 | 1 吸収 | ○ | × | × |
| | 2 分布 | ○ | × | × |
| | 3 代謝 | ○ | × | × |
| | 4 排泄 | ○ | × | × |
| | 5 生物学的同等性 | × | ○ | ○ |
| | 6 その他の薬物動態 | △ | × | × |
| ヘ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料 | 1 単回投与毒性 | ○ | × | × |
| | 2 反復投与毒性 | ○ | × | × |
| | 3 遺伝毒性 | ○ | × | × |
| | 4 がん原性 | △ | × | × |
| | 5 生殖発生毒性 | ○ | × | × |
| | 6 局所刺激性 | △ | × | × |
| | 7 その他の毒性 | △ | × | × |
| ト 臨床試験の成績に関する資料 | 臨床試験成績 | ○ | × | × |

○添付 ×添付不要 △個々の医薬品により判断される。

※本通知は平成 26 年 11 月 21 日薬食発 1121 第 2 号により改正された。