5-HT$_2$ブロッカー

OHARA

日本標準商品分類番号 873399

薬価基準収載

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,100mg「オーハラ」

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 50mg,100mg「OHARA」

識別性・視認性を考慮した錠剤及び PTPシートを提供 ―個装箱:iPackage仕様―

POINT 1

両面印字錠

成分名、含量、屋号を両面印字。

POINT 2

PTPシート

成分名、含量、屋号、GS1-コードをピッチコントロール(文字間隔調整)表示。

100mg錠

POINT 3

個装箱(*i Package*仕様)

製品名カード
切り離して薬剤棚の製品名カードとして使用することができます。

剤形イメージ
開封前に剤形の概要を確認することができます。

GS1コード
①専用のアプリ「添文ナビ®」より最新の添付文章情報を確認することができます。
②変動情報(製造番号、使用期限)及び販売包装単位などを確認することができます。

【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(「6.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

※効能・効果、用法・用量、禁忌を含む使用上の注意等は、Drug Informationをご参照下さい。

大原薬品工業株式会社

〈お問い合わせ先〉〒104-6591 東京都中央区明石町8-1 聖路加タワー36階 TEL.03-6740-7701(代表) FAX.03-6740-7703

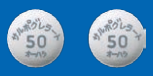
お客様相談室 フリーダイヤル 0120-419-363 9:00~18:00 月~金曜日(祝祭日を除く)

当社の製品情報などはホームページで https://www.ohara-ch.co.jp

2023年3月作成

サルポグレラート塩酸塩錠50mg,100mg「オーハラ」

組成・性状

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」		
剤形写真						
成分・含量	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		
色調・剤形	白色・円形のフィルムコーティング錠			白色・割線入りの円形のフィルムコーティング錠		
外形	表面	裏面	側面	表面	裏面	側面
	直径：7.6mm　厚さ：3.6mm			直径：8.6mm　厚さ：4.2mm		
重量	145.0mg			227.0mg		
識別コード	サルポグレラート50オーハラ			サルポグレラート100オーハラ		
添加物	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					

加速試験

規格	保存条件	期間	試験項目	保存形態	結果
錠 50mg	PTPシート+アルミピロー+個装箱	6ヵ月	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	PTP包装	類縁物質増加（規格内）。その他は全て変化なし
錠 100mg	PTPシート+アルミピロー+個装箱			PTP包装	類縁物質増加（規格内）。その他は全て変化なし
	ポリエチレン容器+個装箱			バラ包装	類縁物質増加（規格内）。その他は全て変化なし

試験条件：40℃±1℃,75%RH±5%　　（一部変更承認時資料）

生物学的同等性試験

薬物動態試験

「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9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及び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標準製剤(錠剤、50mg及び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50mg及び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た。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(一部変更承認時資料)。

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」

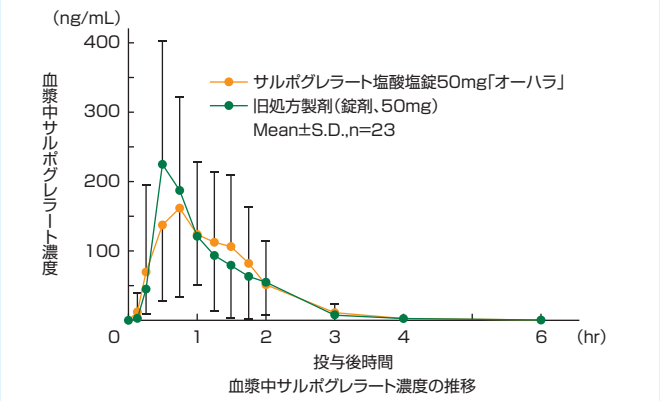
	n	$AUC_{0\to6}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
サルポグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」	23	247.58±115.53	269.96±141.06	0.9±0.5	0.6±0.2
旧処方製剤(錠剤、50mg)	23	253.59±115.52	286.69±170.73	0.9±0.5	0.6±0.2

(Mean±S.D.)

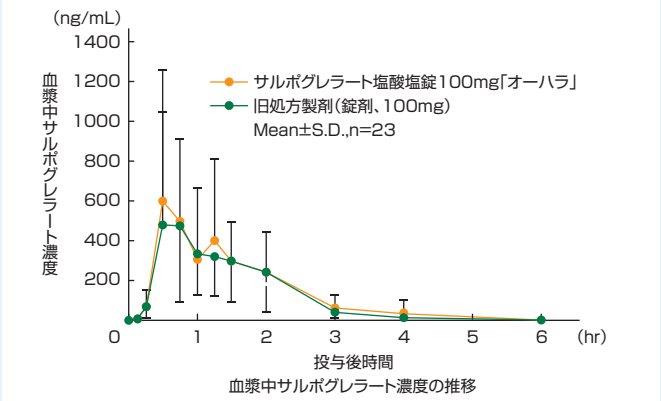
サルポグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」

	n	$AUC_{0\to6}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (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(錠剤、100mg)	23	771.82±232.49	851.83±488.99	1.2±0.6	0.8±0.2

(Mean±S.D.)



血漿中サルポグレラート濃度の推移



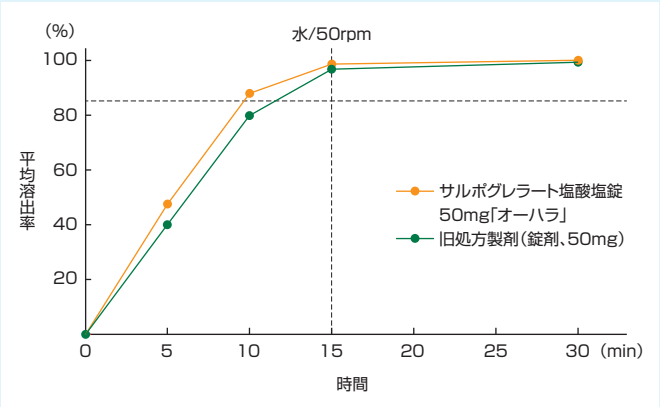
血漿中サルポグレラート濃度の推移

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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。

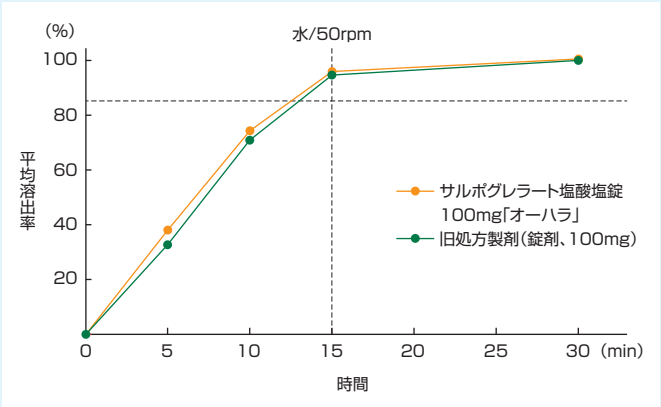
溶 出 挙 動

「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」に従って試験を行った結果、サルポグレラート塩酸塩錠50mg及び100mg「オーハラ」は規定されたすべての溶出試験条件において判定基準に適合し、サルポグレラート塩酸塩錠50mg及び100mg「オーハラ」の溶出挙動は旧処方製剤(錠剤、50mg及び100mg)と類似していると判定された(承認時資料)。

溶出曲線(承認規格)※サルポグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」



溶出曲線(承認規格)※サルポグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」



※その他の条件〈50mg錠:第1液(pH1.2)・pH4.0・第2液(pH6.8)/50rpm、第1液(pH1.2)/100rpm〉〈100mg錠:第1液(pH1.2)・pH3.0・第2液(pH6.8)/50rpm、第1液(pH1.2)/100rpm〉についても溶出挙動の類似性が確認されている。

・サルポグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」及びサルポグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」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ていることが確認されている(一部変更承認時資料)。

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「OHARA」
SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 100mg「OHARA」

日本標準商品分類番号		
873399		
	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」
承認番号	22100AMX02117000	22100AMX02118000
承認年月	2009年7月	2009年7月
薬価収載	2009年11月	2009年11月
販売開始	2009年11月	2009年11月

※詳細は添付文書をご参照ください。

【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(「6.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

【組成・性状】

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」		
成分・含量	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		
添加物	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					
色調・剤形	白色 円形のフィルムコーティング錠			白色 割線入りの円形のフィルムコーティング錠		
外形	表面	裏面	側面	表面	裏面	側面
	直径:7.6mm　厚さ:3.6mm			直径:8.6mm　厚さ:4.2mm		
重量	145.0mg			227.0mg		
識別コード	サルポグレラート50オーハラ			サルポグレラート100オーハラ		

【効能・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

【用法・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。

【使用上の注意】

1.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。〕

2.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。

3.相互作用

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		

4.副作用

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。

(1)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、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)その他の副作用

	副作用の頻度 頻度不明
過敏症 注1)	発疹、発赤、丘疹、瘙痒、紅斑、蕁麻疹
肝臓 注2)	肝機能障害(ビリルビン上昇、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、γ-GTP上昇、LDH上昇等)
出血傾向 注2)	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	血清中性脂肪上昇、血清コレステロール上昇、血清アルブミン減少、尿糖、尿沈渣、体重増加、浮腫、倦怠感、血清カルシウム減少、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。

5.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。〕

6.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)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。〕

7.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。(使用経験がない。)

8.適用上の注意

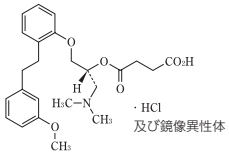
薬剤交付時:PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名:サルポグレラート塩酸塩(Sarpogrelate Hydrochloride)

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

構造式:



分子式:$C_{24}H_{31}NO_6 \cdot HCl$

分子量:465.97

性　状:本品は白色の結晶性の粉末である。
本品は水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。
本品は0.01mol/L塩酸試液に溶ける。
本品の水溶液(1→100)は旋光性を示さない。
本品は結晶多形が認められる。

【取扱い上の注意】

貯　法:室温保存、気密容器

使用期限:外箱に表示の使用期限内に使用すること。

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験(なりゆき温度及び湿度、3年間)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、サルポグレラート塩酸塩錠50mg「オーハラ」及びサルポグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」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。

【包　装】

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「オーハラ」:(PTP)100錠(10錠×10×1袋)

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「オーハラ」:(PTP)100錠(10錠×10×1袋)
500錠(10錠×10×5袋)
(バラ)500錠

【資料請求先・製品情報お問い合わせ先】

大原薬品工業株式会社 お客様相談室

〒104-6591 東京都中央区明石町8-1 聖路加タワー36階

0120-419-363　FAX 03-6740-7703

URL https://www.ohara-ch.co.jp

製造販売元 大原薬品工業株式会社

滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121−15

202303③AH