

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「ファイザー」

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」

SARPOGRELATE Hydrochloride Tablets 50mg・100mg [Pfizer]

貯法：室温保存、気密容器
使用期限：最終年月を外箱等に記載
(取扱い上の注意参照)

	50mg	100mg
承認番号	22300AMX00898	22300AMX00899
薬価収載	2011年11月	
販売開始	2012年2月	

【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〕







【組成・性状】

1. 組成

1錠中：

販売名	サルポグレラート塩酸塩錠50mg 「ファイザー」	サルポグレラート塩酸塩錠100mg 「ファイザー」
成分	日局 サルポグレラート塩酸塩 50.0mg	日局 サルポグレラート塩酸塩 100.0mg
有効成分	日局 サルポグレラート塩酸塩 50.0mg	日局 サルポグレラート塩酸塩 100.0mg
添加物	クエン酸水和物、パレイシヨデンブ、D-マンニトール、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	

2. 性状

販売名	外形			識別コード	色調等
	上面	下面	側面		
サルポグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」				SH 50 PF	白色 フィルム コーティング錠
	直径 6.6mm	厚さ 2.8mm	重量 79.9mg		
サルポグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」				SH 100 PF	白色 フィルム コーティング錠
	直径 7.6mm	厚さ 4.0mm	重量 157.0mg		

【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) 抗凝血剤（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、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
抗凝血剤 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 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) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、丘疹、蕁麻疹、紅斑、発赤、そう痒
肝臓 ^{注2)}	肝機能障害（ビリルビン・AST (GOT)・ALT (GPT)・Al-P・ γ -GTP・LDHの上昇等）
出血傾向 ^{注2)}	出血（鼻出血、皮下出血等）
消化器	嘔気、嘔吐、胸やけ、異物感（食道）、食欲不振、腹部膨満感、腹痛、便秘、下痢、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・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。

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。[動物試験（ラット）で胎児死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。[動物試験（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。]

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

(1)サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」¹⁾

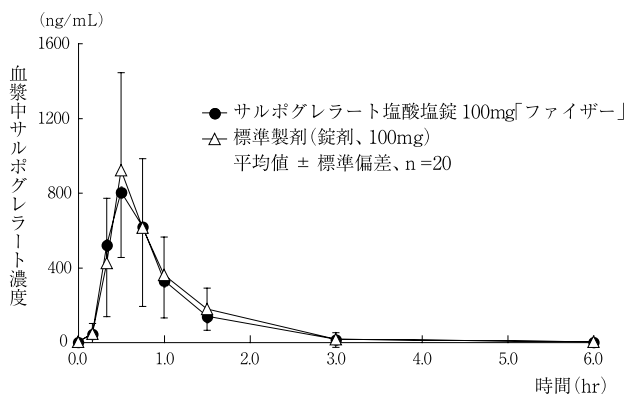
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成12年2月14日医薬審第64号、平成18年11月24日一部改正）」に基づき、サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

(2)サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」²⁾

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」と標準製剤それぞれ1錠（サルボグレラート塩酸塩錠として100mg）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に経口投与して血漿中サルボグレラート濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC₀₋₆、C_{max}）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、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 ₀₋₆ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」	708.6±260.2	983.4±393.3	0.5±0.1	0.5±0.3
標準製剤 (錠剤、100mg)	768.0±400.1	973.8±493.2	0.5±0.1	0.5±0.2

(平均値±標準偏差、n=20)



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。

2. 溶出挙動^{1,3)}

サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」及びサルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」は、日本薬局方医薬品各条に定められたサルボ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。

【薬効薬理】

サルボグレラートは、選択的5-HT₂受容体拮抗薬。血小板及び血管平滑筋に作用して、活性化血小板から遊離した5-HTによる血小板凝集と血管収縮を抑制する。この作用を利用して、臨床的には末梢循環障害の治療に用いられる⁴⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

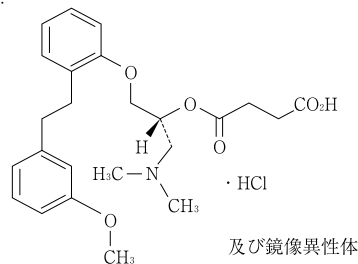
一般名：サルボグレラート塩酸塩 (Sarpogrelate Hydrochloride)

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

分子式：C₂₄H₃₁NO₆・HCl

分子量：465.97

構造式：



性状：白色の結晶性の粉末である。

水又はエタノール（99.5）に溶けにくい。

0.01mol/L 塩酸試液に溶ける。

水溶液（1→100）は旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

安定性試験

(1)サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」⁵⁾

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」は通常の市場流通下において、3年間安定であることが推測された。

(2)サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」⁶⁾

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」は通常の市場流通下において、3年間安定であることが推測された。

【包装】

サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」：100錠（PTP）

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」：100錠、500錠（PTP）

【主要文献】

- 社内資料：溶出試験(サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」)
[L20110310009]
- 社内資料：生物学的同等性試験(サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」)
[L20110310013]
- 社内資料：溶出試験(サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」)
[L20110310012]
- 第十六改正 日本薬局方解説書 廣川書店：C-1748, 2011 [L20110706016]
- 社内資料：安定性試験(サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ファイザー」)
[L20110310011]
- 社内資料：安定性試験(サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ファイザー」)
[L20110310014]

【文献請求先】

「主要文献」に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ファイザー株式会社 製品情報センター

〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7

学術情報ダイヤル 0120-664-467

FAX 03-3379-3053



【製造販売】

ファイザー株式会社

東京都渋谷区代々木3-22-7

※【提携】

マイラン製薬株式会社

大阪市中央区本町2丁目6番8号



Mylan