

## 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-HT<sub>2</sub>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「サワイ」**  
**サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「サワイ」**

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE Tablets [SAWAI]

剤形	錠50mg：フィルムコーティング錠 錠100mg：割線入り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含有 錠100mg：1錠中日局サルポグレラート塩酸塩100mg含有
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 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2009年7月13日 薬価基準収載年月日：2009年11月13日 販売開始年月日：2009年11月13日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2024年2月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。  
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 医薬品インタビューフォーム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)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(<http://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。

(2020年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	25
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	25
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	25
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	25
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	25
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	25
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	25
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	26
1. 販売名	3	8. 副作用	26
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	27
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	27
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	27
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	27
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	28
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	28
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	28
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	29
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6	1. 規制区分	29
IV. 製剤に関する項目	7	2. 有効期間	29
1. 剤形	7	3. 包装状態での貯法	29
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	29
3. 添付溶解液の組成及び容量	8	5. 患者向け資材	29
4. 力価	8	6. 同一成分・同効薬	29
5. 混入する可能性のある夾雑物	8	7. 国際誕生年月日	29
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	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	29
7. 調製法及び溶解後の安定性	9	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	29
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	9	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	29
9. 溶出性	10	11. 再審査期間	30
10. 容器・包装	14	12. 投薬期間制限に関する情報	30
11. 別途提供される資材類	15	13. 各種コード	30
12. その他	15	14. 保険給付上の注意	30
V. 治療に関する項目	16	XI. 文献	31
1. 効能又は効果	16	1. 引用文献	31
2. 効能又は効果に関連する注意	16	2. その他の参考文献	31
3. 用法及び用量	16	XII. 参考資料	32
4. 用法及び用量に関連する注意	16	1. 主な外国での発売状況	32
5. 臨床成績	16	2. 海外における臨床支援情報	32
VI. 薬効薬理に関する項目	18	XIII. 備考	33
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18	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	33
2. 薬理作用	18	2. その他の関連資料	34
VII. 薬物動態に関する項目	19		
1. 血中濃度の推移	19		
2. 薬物速度論的パラメータ	22		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	23		
4. 吸収	23		
5. 分布	23		
6. 代謝	24		
7. 排泄	24		
8. トランスポーターに関する情報	24		
9. 透析等による除去率	24		
10. 特定の背景を有する患者	24		
11. その他	24		

## 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錠50mg/錠100mg「サワイ」は、日局サルポグレラート塩酸塩を含有する5-HT<sub>2</sub>ブロッカーである。

本剤は、後発医薬品として、沢井製薬株式会社、大原薬品工業株式会社、キョーリンリメディオ株式会社と他1社の計4社が共同開発を実施した。下記通知に基づき、製造方法並びに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のうえ、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号
承認	2009年7月
上市	2009年11月

### 2. 製品の治療学的特性

1) 本剤は、「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」の効能又は効果を有する。(V. -1. 参照)

2) 本剤の用法は、「1日3回投与」である。(V. -3. 参照)

3) サルポグレラート塩酸塩は血小板及び血管平滑筋における5-HT<sub>2</sub>(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. -2. 参照)<sup>1~4)</sup>

4) 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. -8. 参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

特になし

### 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

(2025年2月3日時点)

### 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

I. 概要に関する項目

- 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

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」

## 2) 洋名

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE Tablets [SAWAI]

## 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

## 2. 一般名 .....

## 1) 和名(命名法)

サルポグレラート塩酸塩(JAN)

## 2) 洋名(命名法)

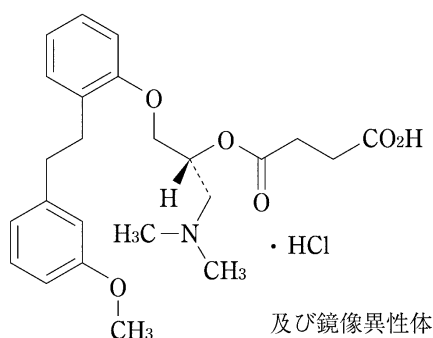
Sarpogrelate Hydrochloride(JAN)

Sarpogrelate(INN)

## 3) ステム(stem)

-grel- : platelet aggregation inhibitors

## 3. 構造式又は示性式 .....



## 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 :  $C_{24}H_{31}NO_6 \cdot HCl$ 

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)

II. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....  
特になし



### Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

結晶多形が認められる。

2) 溶解性

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。

溶解度(37°C)<sup>5)</sup> : pH1.2 : 3.48mg/mL、pH4.0 : 51.1mg/mL、pH6.8 : 60.7mg/mL、水 : 50.8mg/mL

3) 吸湿性

水分 : 0.5%以下(0.1g、電量滴定法)

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

pKa<sub>1</sub>=3.89(20°C、カルボキシル基、滴定法)<sup>5)</sup>

pKa<sub>2</sub>=8.42(20°C、第三アミノ基、滴定法)<sup>5)</sup>

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

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

原薬の安定性<sup>5)</sup>

水 : 1 mg/mL濃度のとき、40°C、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不安定である。

1 mg/mL濃度のとき、pH2.0、37°Cで2時間は安定である。

pH4.0、37°C、2時間で約0.5%分解する。

pH6.0、37°C、2時間で約4%分解する。

pH8.0、37°C、2時間で70%以上分解する。

光 : 固体状態で安定である。

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 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」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 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」の定量法に準ずる。(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

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」：フィルムコーティング錠

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」：割線入りフィルムコーティング錠

## 2) 製剤の外観及び性状

品名	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「サワイ」	 7.6	 約145	 3.6	白色
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「サワイ」	 8.6	 約227	 4.2	白色

## 3) 識別コード

## ●サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：SW サルポグレラート 50

## ●サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：SW サルポグレラート 100

## 4) 製剤の物性

製剤均一性：日局サルポグレラート塩酸塩錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局サルポグレラート塩酸塩錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。  
(水、30分：80%以上)

## 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

品名	サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「サワイ」	サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局サルポグレラート塩酸塩	
	50mg	100mg
添加剤	カルナウバロウ、クエン酸、酸化チタン、ステアリン酸Ca、タルク、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、D-マンニトール	

IV. 製剤に関する項目

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

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

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

●サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>6)</sup>

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。  
その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.1	98.4

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>7)</sup>

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。  
その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 6ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)
性状	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	9.9	10.4	9.3	9.3
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.1	99.2	100.1

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。  
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## ●サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>8)</sup>

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 <sup>※</sup>	100.0	99.3

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>9)</sup>

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 6ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	13.7	13.6	11.2	13.7
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 <sup>※</sup>	100.0	100.9	101.1	101.0

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 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)……………

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

9. 溶出性

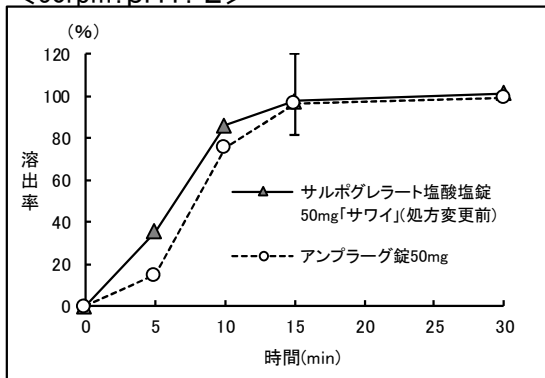
<溶出挙動における同等性及び類似性>

●サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」<sup>10)</sup>

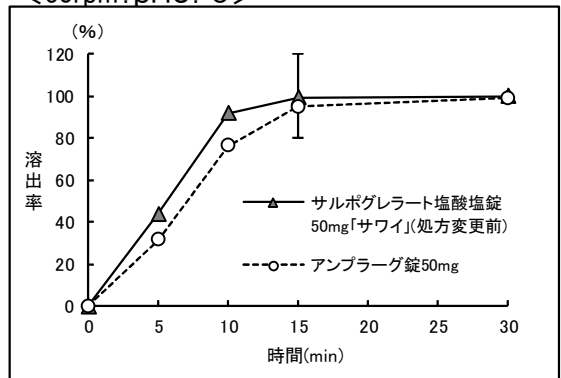
【先発医薬品との比較】

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm (pH1.2)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更前)	
標準製剤	アンブラーグ錠50mg	
結果及び考察	<p>&lt;50rpm : pH1.2&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : pH5.0&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : 水&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;100rpm : pH1.2&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p>	

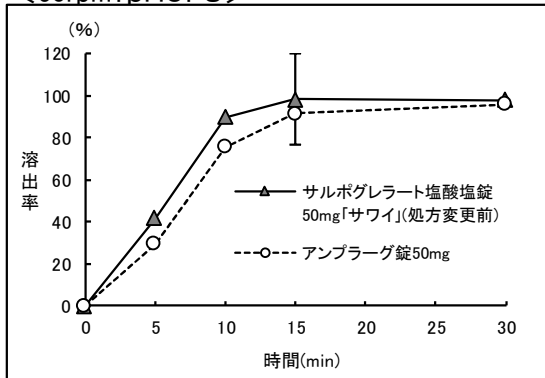
<50rpm : pH1.2>



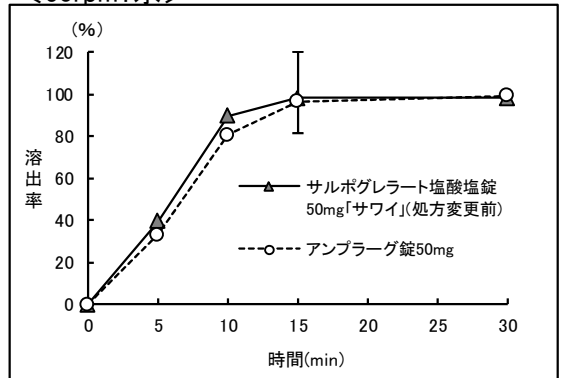
<50rpm : pH5.0>



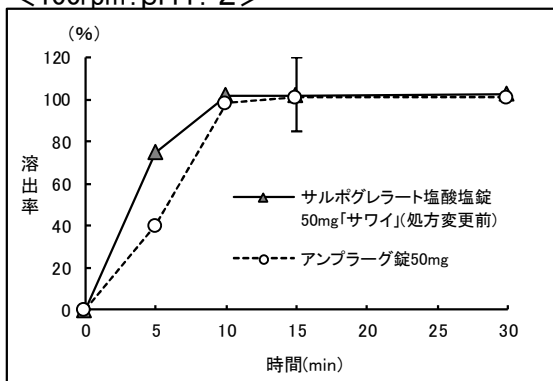
<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



<100rpm:pH1.2>

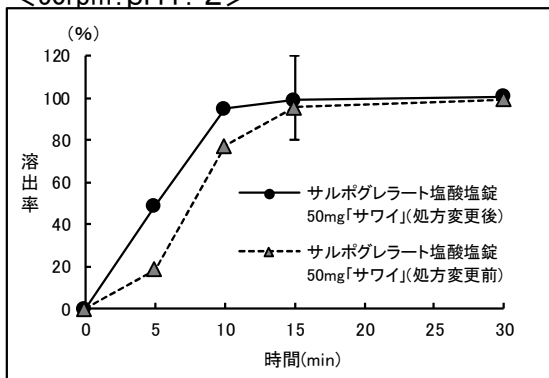


( I : 判定基準の適合範囲)

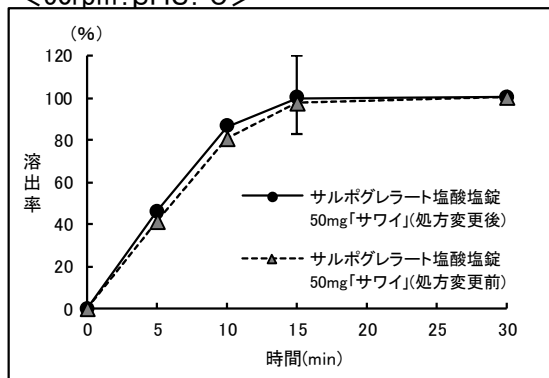
【製剤変更前後の比較】

通知等	「後発医薬品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 「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ついて」：平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、3.0、6.8、水)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更後)	
標準製剤	サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更前)	
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH3.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。  以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	

<50rpm:pH1.2>

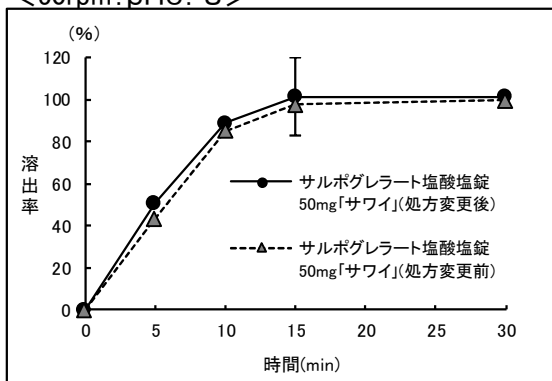


<50rpm:pH3.0>

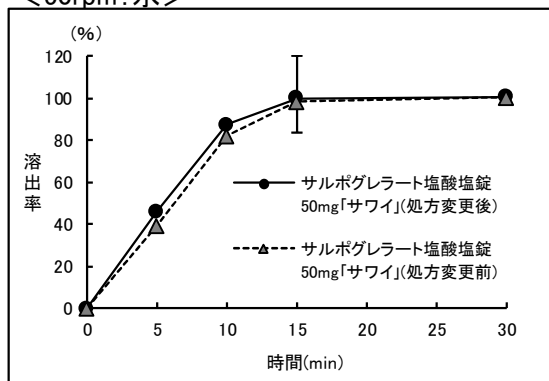


IV. 製剤に関する項目

<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>



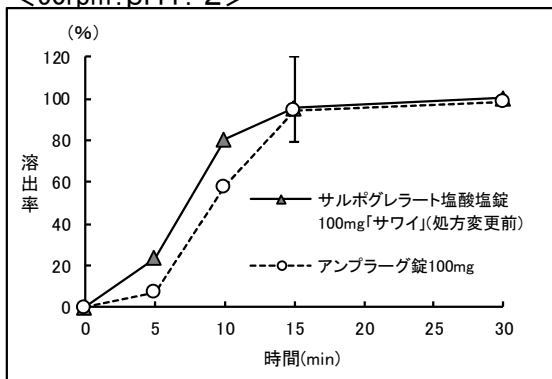
( [ ] : 判定基準の適合範囲)

●サルボグレレート塩酸塩錠100mg「サワイ」<sup>11)</sup>

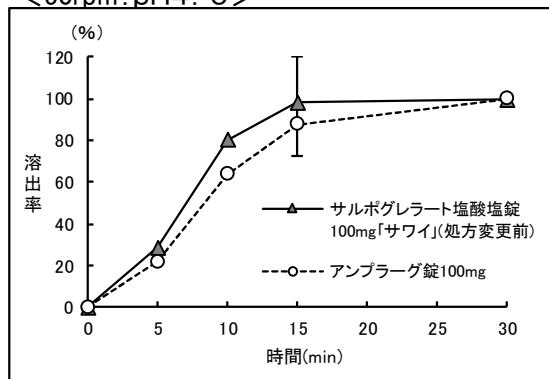
【先発医薬品との比較】

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成13年5月31日 医薬審発第786号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm (pH1.2)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	サルボグレレート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更前)	
標準製剤	アンプラーグ錠100mg	
結果及び考察	<p>&lt;50rpm : pH1.2&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : pH4.0&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : 水&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;100rpm : pH1.2&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p>	

<50rpm:pH1.2>

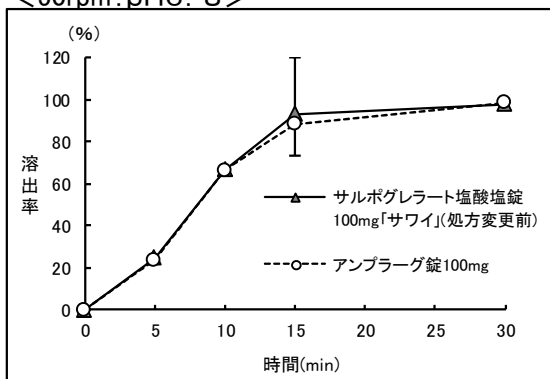


<50rpm:pH4.0>

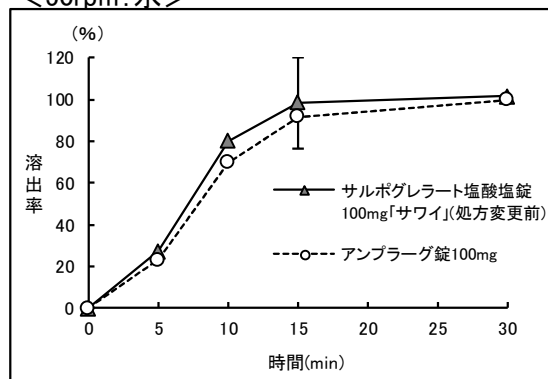




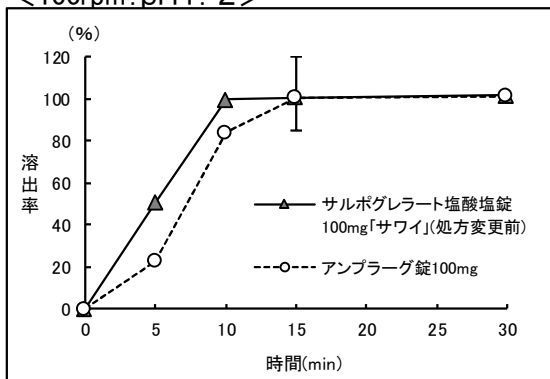
<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>



<100rpm:pH1.2>



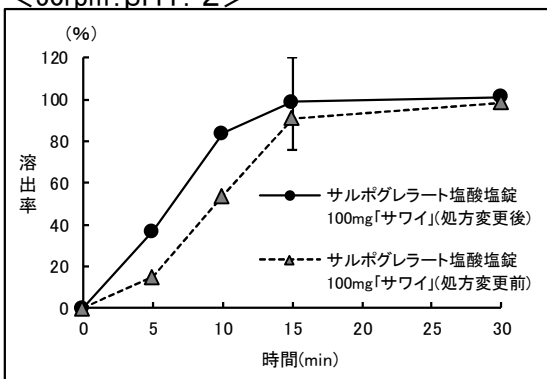
( [ ] : 判定基準の適合範囲)

【処方変更前後の比較】

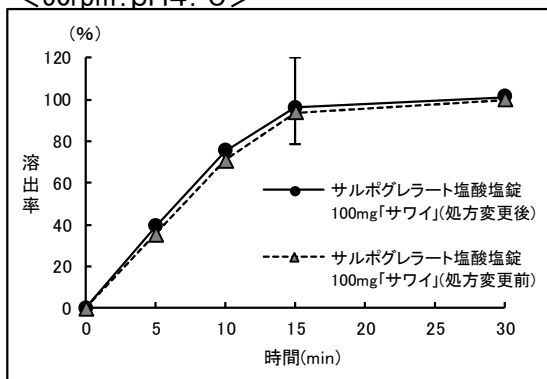
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号 「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドラインについて」：平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm (pH1.2)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	サルボグレレート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更後)	
標準製剤	サルボグレレート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更前)	
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH4.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <100rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。  以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。	

IV. 製剤に関する項目

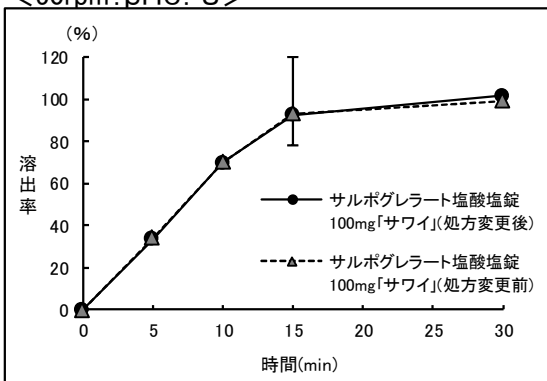
<50rpm:pH1.2>



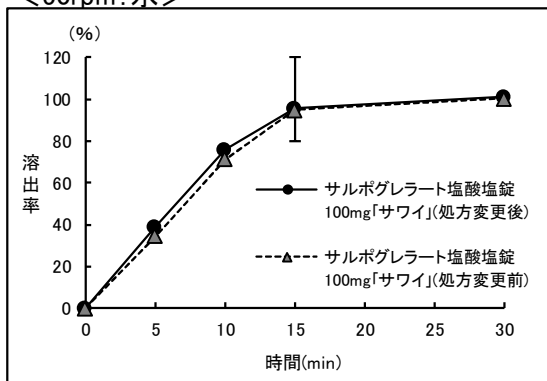
<50rpm:pH4.0>



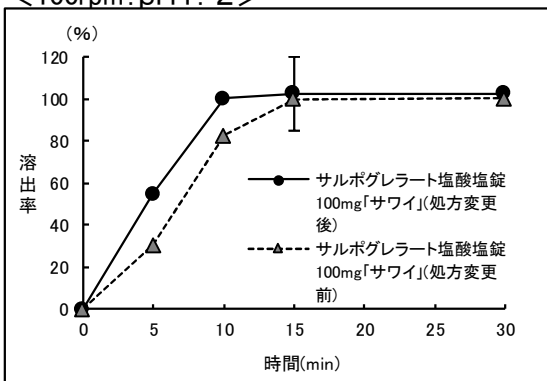
<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>



<100rpm:pH1.2>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

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

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

<サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」>

PTP : 100錠 (10錠×10)

<サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」>

PTP : 100錠 (10錠×10)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔  
[ピロー]アルミ袋

11. 別途提供される資材類 .....

該当しない

12. 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

4. 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

6. 用法及び用量

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。

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

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 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<sup>12)</sup>。

(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

該当しない

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……………

5-HT<sub>2</sub>受容体拮抗作用：サルボグレラート塩酸塩以外の化合物はない<sup>13)</sup>

2. 薬理作用……………

1) 作用部位・作用機序

**18.1 作用機序**

サルボグレラート塩酸塩は血小板及び血管平滑筋における5-HT<sub>2</sub>(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<sup>1~4)</sup>。

2) 薬効を裏付ける試験成績

**18.2 血小板凝集抑制作用**

18.2.1 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<sup>14,15)</sup>(ex vivo試験)。

18.2.2 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<sup>1)</sup>。

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<sup>1)</sup>。

**18.3 抗血栓作用**

18.3.1 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<sup>16)</sup>。

18.3.2 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<sup>17)</sup>。

**18.4 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<sup>1)</sup>。

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<sup>2)</sup>。

**18.5 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<sup>18)</sup>。

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

&lt;生物学的同等性試験&gt;

●サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」<sup>19)</sup>

【先発医薬品との比較】

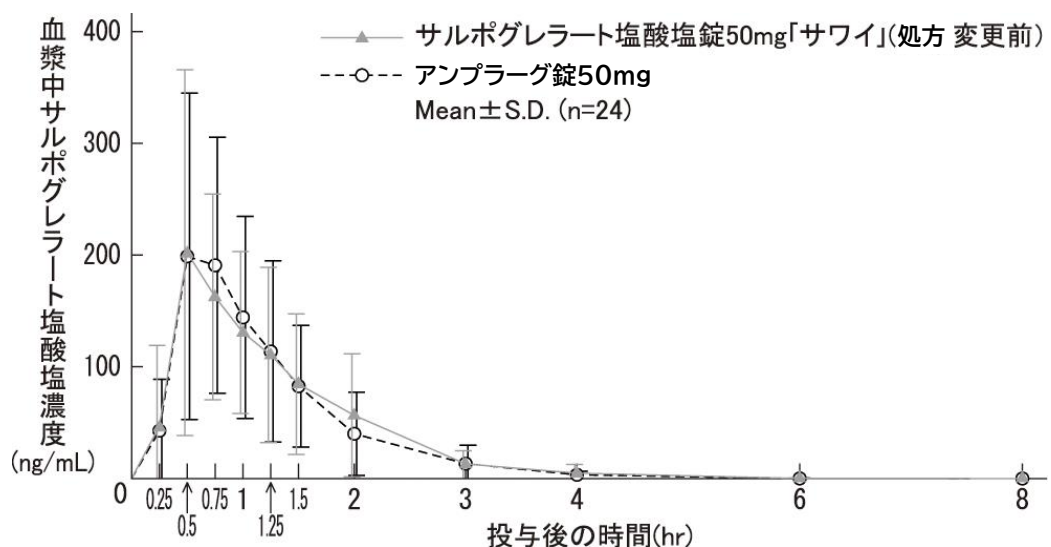
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、8 hr
休薬期間	1週間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更前)
標準製剤	アンプラーグ錠50mg

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更前)とアンプラーグ錠50mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(サルポグレラート塩酸塩として50mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中サルポグレラート塩酸塩濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-8hr</sub> (ng・hr/mL)
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「サワイ」 (処方変更前)	253±151	0.8±0.5	0.6±0.2	258±109
アンプラーグ錠50mg	273±136	0.8±0.4	0.6±0.2	252±95

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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。

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

【処方変更前後の比較】

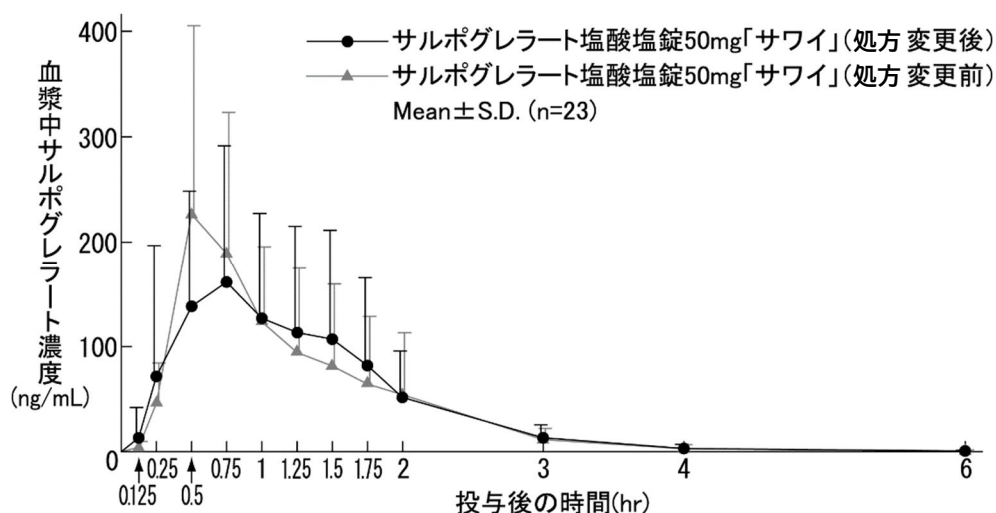
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号等 「経口固形剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドラインについて」： 平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号等
採血時点	0、0.125、0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、1.75、2、3、4、6 hr
休薬期間	1週間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更後)
標準製剤	サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更前)

サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更後)とサルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」(処方変更前)を健康成人男子にそれぞれ1錠(サルポグレラート塩酸塩として50mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中サルポ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(AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-6hr</sub> (ng・hr/mL)
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「サワイ」 (処方変更後)	270±141	0.9±0.5	0.6±0.2	248±116
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「サワイ」 (処方変更前)	287±171	0.9±0.5	0.6±0.2	254±116

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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。

●サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」<sup>20)</sup>

【先発医薬品との比較】

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6、8 hr
休薬期間	1週間



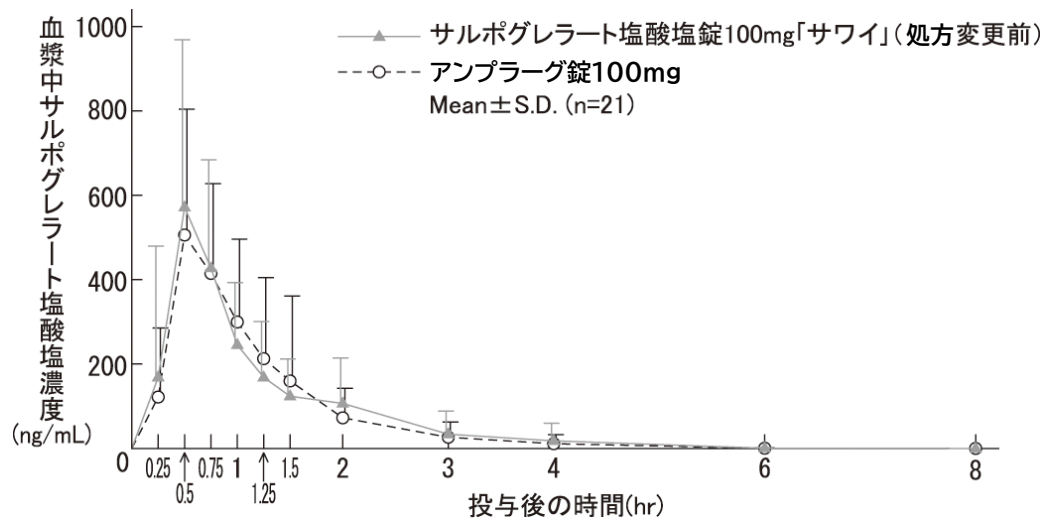
測定方法	LC/MS法
試験製剤	サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更前)
標準製剤	アンプラーグ錠100mg

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更前)とアンプラーグ錠100mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(サルポグレラート塩酸塩として100mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中サルポグレラート塩酸塩濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-8hr</sub> (ng・hr/mL)
サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更前)	682±341	0.9±0.7	0.6±0.2	584±244
アンプラーグ錠100mg	621±248	0.7±0.3	0.7±0.2	548±196

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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。

【処方変更前後の比較】

通知等	「後発医薬品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 「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ついて」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、0.125、0.25、0.5、0.75、1、1.25、1.5、2、3、4、6 hr
休薬期間	1週間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更後)
標準製剤	サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更前)

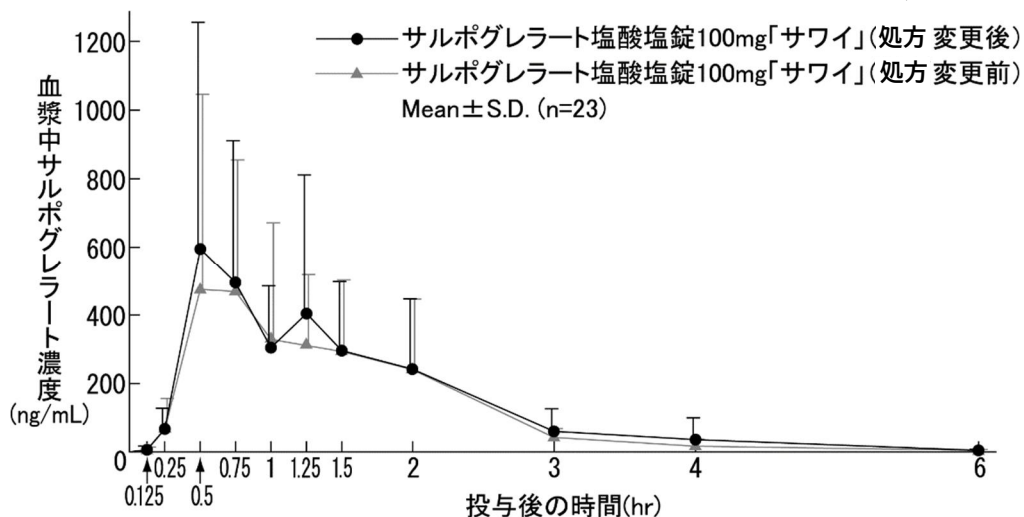
サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更後)とサルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」(処方変更前)を健康成人男子にそれぞれ1錠(サルポグレラート塩酸塩として100mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中サルポグレラート濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-6hr</sub> (ng・hr/mL)
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「サワイ」 (処方変更後)	962±591	1.2±0.7	0.8±0.2	870±307
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「サワイ」 (処方変更前)	852±489	1.2±0.6	0.8±0.2	772±232

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 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

●サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(サルポグレラート塩酸塩として50mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>19)</sup>

1.323±0.348hr<sup>-1</sup>

●サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(サルポグレラート塩酸塩として100mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>20)</sup>

0.984±0.367hr<sup>-1</sup>

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 .....

16.2 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<sup>21)</sup>。

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

VIII. -6. -5) 参照

3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 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

16.3 分布

16.3.1 組織への移行性

雄性ラットに<sup>14</sup>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<sup>22)</sup>。

VII. 薬物動態に関する項目

6) 血漿蛋白結合率

16.3.2 蛋白結合率

ヒト血清：95%以上<sup>23)</sup> (in vitro、限外ろ過法)。

6. 代謝 .....

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

サルポグレラート塩酸塩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<sup>24)</sup>。

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

VII. -6. -1) 参照

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 .....

16.5 排泄

健康成人6例にサルポグレラート塩酸塩を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<sup>21)</sup>。  
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

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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

11.1 重大な副作用

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]

11.1.2 血小板減少(頻度不明)

<p>11.1.3 肝機能障害、黄疸(いずれも頻度不明) AST、ALT、ALP、<math>\gamma</math>-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、 $\gamma$ -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 .....  
設定されていない

10. 過量投与 .....  
設定されていない

11. 適用上の注意 .....

<p>14. 適用上の注意</p> <p>14.1 薬剤交付時の注意</p> <p>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。</p>
--

12. その他の注意 .....

1) 臨床使用に基づく情報  
設定されていない

2) 非臨床試験に基づく情報  
設定されていない

---

## 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
  - 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  
VIII. -6. -5) 参照
  - 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 .....

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	劇薬

## 2. 有効期間 .....

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 .....

該当しない

## 5. 患者向け資材 .....

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

## 6. 同一成分・同効薬 .....

同一成分：アンプラーグ錠50mg/錠100mg/細粒10%

同効薬：5-HT<sub>2</sub>受容体拮抗作用サルボグレラート塩酸塩以外の化合物はない<sup>13)</sup>

## 7. 国際誕生年月日 .....

該当しない

## 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 .....

製品名	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
サルボグレラート塩酸塩 錠50mg「サワイ」	2009年7月13日	22100AMX02132000	2009年11月13日	2009年11月13日
サルボグレラート塩酸塩 錠100mg「サワイ」	2009年7月13日	22100AMX02133000	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

X. 管理的事項に関する項目

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、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。

13. 各種コード .....

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
サルボグレラート塩酸塩 錠50mg「サワイ」	3399006F1182	3399006F1182	119609201	621960901
サルボグレラート塩酸塩 錠100mg「サワイ」	3399006F2189	3399006F2189	119616001	621961601

14. 保険給付上の注意 .....  
本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

---

## X I . 文 献

---

1. 引用文献
- 1) Hara, H. et al. : *Thromb. Haemost.*, 1991 ; 65 ( 4 ) : 415-420
  - 2) 原啓人他 : *薬理と治療*, 1991 ; 19 : S611-S618
  - 3) Tsuchihashi, H. et al. : *J. Pharmacobiodyn.*, 1991 ; 14 ( 8 ) : 461-466
  - 4) Maruyama, K. et al. : *J. Pharmacobiodyn.*, 1991 ; 14 ( 4 ) : 177-181
  - 5) 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, 2007, p. 175.
  - 6) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」
  - 7) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」
  - 8) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」
  - 9) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」
  - 10) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」
  - 11) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」
  - 12) 古川欽一他 : *臨床医薬*, 1991 ; 7 ( 8 ) : 1747-1770
  - 13) 薬剤分類情報閲覧システム < <https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/> > (2025/2/3 アクセス)
  - 14) 山口寛他 : *臨床医薬*, 1991 ; 7 ( 6 ) : 1235-1241
  - 15) 磯貝行秀他 : *臨床医薬*, 1991 ; 7 ( 6 ) : 1227-1233
  - 16) Hara, H. et al. : *Arzneimittelforschung*, 1991 ; 41 ( 6 ) : 616-620
  - 17) Hara, H. et al. : *Thromb. Haemost.*, 1991 ; 66 ( 4 ) : 484-488
  - 18) 伊藤勝朗他 : *臨床医薬*, 1991 ; 7 ( 6 ) : 1243-1251
  - 19) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」
  - 20) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」
  - 21) 小松貞子他 : *薬物動態*, 1991 ; 6 ( 3 ) : 353-375
  - 22) 小松貞子他 : *薬物動態*, 1991 ; 6 ( 3 ) : 377-398
  - 23) 丹羽卓朗他 : *薬理と治療*, 1991 ; 19 : S749-S756
  - 24) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021 ; C-2091-2095
  - 25) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」
  - 26) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」
  - 27) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」
  - 28) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」
2. その他の参考文献

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
  
2. 海外における臨床支援情報.....  
    該当資料なし

### 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。

##### 1) 粉砕

###### <粉砕後の安定性試験>

###### ●サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」<sup>25)</sup>

サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で1ヵ月間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	褐色瓶開放 (25°C60%RH、1ヵ月)
性状	白色の粉末	変化なし
純度試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.7

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

###### ●サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」<sup>26)</sup>

サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で1ヵ月間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	褐色瓶開放 (25°C60%RH、1ヵ月)
性状	白色の粉末	変化なし
純度試験	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### <崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>

#### ●サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」<sup>27)</sup>

##### 試験方法

1. サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr. (外径 2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

##### 備考

- ・更に5分間(合計15分間)放置したところ、錠剤は崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。
- ・コーティングを破壊して試験を行った結果、錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr. チューブを通過した。

#### ●サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」<sup>28)</sup>

##### 試験方法

1. サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr. (外径 2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

##### 備考

- ・更に5分間(合計15分間)放置したところ、錠剤は崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。
- ・コーティングを破壊して試験を行った結果、錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr. チューブを通過した。

## 2. その他の関連資料

### 患者向け資料

- ・知っておきたい!!足の動脈硬化

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照



