

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「ケミファ」

サルポグレラート塩酸塩錠100mg「ケミファ」

Sarpogrelate Hydrochloride Tablets 50mg・100mg “Chemiphar”

剤形	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	サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」： 1錠中（日局）サルポグレラート塩酸塩 50.0mg サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」： 1錠中（日局）サルポグレラート塩酸塩 100.0mg	
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・ 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：日本ケミファ株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	日本ケミファ株式会社 くすり相談室 TEL.0120-47-9321 03-3863-1225/FAX.03-3861-9567 受付時間：8:45～17:30（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.nc-medical.com/	

本 IF は 2024 年 3 月改訂の添付文書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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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I F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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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、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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI F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I Fを作成・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利用者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、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、I F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

I F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。I F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I F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、I F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	8. トランスポーターに関する情報	15
1. 開発の経緯	1	9. 透析等による除去率	15
2. 製品の治療学的特性	1	10.特定の背景を有する患者	15
3. 製品の製剤学的特性	1	11.その他	15
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII.安全性（使用上の注意等）に関する項目	16
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	16
6. RMPの概要	1	2. 禁忌内容とその理由	16
II.名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	16
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	16
2. 一般名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	16
3. 構造式又は示性式	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	16
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	17
5. 化学名(命名法)又は本質	2	8. 副作用	17
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
III.有効成分に関する項目	3	10.過量投与	18
1. 物理化学的性質	3	11.適用上の注意	18
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	12.その他の注意	18
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	IX.非臨床試験に関する項目	19
IV.製剤に関する項目	4	1. 薬理試験	19
1. 剤形	4	2. 毒性試験	19
2. 製剤の組成	4	X.管理的事項に関する項目	20
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	1. 規制区分	20
4. 力価	5	2. 有効期間	20
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	3. 包装状態での貯法	20
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	4. 取扱い上の注意	20
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	5. 患者向け資材	20
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	6. 同一成分・同効薬	20
9. 溶出性	6	7. 国際誕生年月日	20
10.容器・包装	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	20
11.別途提供される資材類	8	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	20
12.その他	8	10.再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
V.治療に関する項目	9	11.再審査期間	20
1. 効能又は効果	9	12.投薬期間制限に関する情報	20
2. 効能又は効果に関連する注意	9	13.各種コード	21
3. 用法及び用量	9	14.保険給付上の注意	21
4. 用法及び用量に関連する注意	9	XI.文献	22
5. 臨床成績	9	1. 引用文献	22
VI.薬効薬理に関する項目	11	2. その他の参考文献	22
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	11	XII.参考資料	23
2. 薬理作用	11	1. 主な外国での発売状況	23
VII.薬物動態に関する項目	12	2. 海外における臨床支援情報	23
1. 血中濃度の推移	12	XIII.備考	24
2. 薬物速度論的パラメータ	13	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	24
3. 母集団(ポピュレーション)解析	14	2. その他の関連資料	24
4. 吸収	14		
5. 分布	14		
6. 代謝	15		
7. 排泄	15		

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製剤は 5-HT₂ ブロッカーであり、本邦では 1993 年に承認されている。

サルポグレラート塩酸塩錠「ケミファ」50mg・100mg は、後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、生物学的同等性試験、加速試験を実施し、2009 年 7 月に承認を得て、2009 年 11 月に上市した。

2. 製品の治療学的特性

- 1) 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適応を有している（「V.-1. 効能又は効果」の項参照）。
- 2) 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.-2. 薬理作用」の項参照）。
- 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.-8. 副作用」の項参照）。

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

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

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」

(2) 洋名

Sarpogrelate Hydrochloride Tablets 50mg・100mg “Chemiphar”

(3) 名称の由来

「有効成分」+「剤形」+「含量」+「屋号」より命名した。

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

血小板凝集抑制剤：-grel-
-grel

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₄H₃₁NO₆・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）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

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

1) 各種溶媒における溶解度

溶 媒	日局の溶解度表現
0.01mol/L塩酸試液	溶ける
水 エタノール(99.5)	溶けにくい

2) 各種 pH 溶媒における溶解度 (37℃)

液性	溶解度 (37℃)	
pH1.2	3.48	mg/mL
pH4.0	51.1	mg/mL
pH6.8	60.7	mg/mL
水	50.8	mg/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

解離定数 (20℃)

pKa₁ : 3.89 (カルボキシル基、滴定法)

pKa₂ : 8.42 (第3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

旋光性 : 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

水 : 1mg/mL 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不安定である。
1mg/mL のとき、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 : 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「サルボグレラート塩酸塩」確認試験による。

定量法 : 日局「サルボグレラート塩酸塩」定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	表面	裏面	側面	性状
サルポグレラート 塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」				白色
直径:6.6mm, 厚さ:3.2mm, 重量:99mg				
サルポグレラート 塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」				白色
直径:8.6mm, 厚さ:4.5mm, 重量:260mg				

(3) 識別コード

	サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」	サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」
識別コード	NCP 33D	NCP 33E
記載場所	錠剤	

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加物

	サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」	サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」
有効成分 (1錠中)	(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
添加剤	D-マンニトール、結晶セルロース、クエン酸水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、タルク、マクロゴール 6000、酸化チタン、カルナウバロウ	D-マンニトール、バレイショデンプン、無水クエン酸、カルメロース、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、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ

(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

製剤の分解物として類縁物質が混入する可能性があるが、「IV. -6. 製剤の各種条件下における安定性」の項に示したように、いずれも通常の市場流通下において品質に影響を与えない程度であった。

6. 製剤の各種条件下における安定性^{1)~3)}

(1) サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃、60%RH	36ヵ月	最終包装製品 (PTP包装)	規格内
加速試験	40±1℃、75±5%RH	6ヵ月	最終包装製品 (PTP包装)	規格内
無包装 安定性試験	40±2℃	3ヵ月	遮光・気密	規格内
	25±1℃、75±5%RH	3ヵ月	遮光・開放	規格内
	総照度60万lx・hr (温度湿度：なりゆき)	-	気密	規格内

測定項目：性状、確認試験、純度試験、含量均一性、溶出性、定量法、質量試験〈長期保存試験〉
性状、確認試験、純度試験、含量均一性、溶出性、定量法〈加速試験〉
性状、溶出性、定量法、硬度〈無包装安定性試験〉

(2) サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃、60%RH	36ヵ月	最終包装製品 (PTP包装/バラ包装)	規格内
加速試験	40±1℃、75±5%RH	6ヵ月	最終包装製品 (PTP包装/バラ包装)	規格内
無包装 安定性試験	40℃	3ヵ月	遮光・気密	規格内
	25℃、75%RH	3ヵ月	遮光・開放	規格内
	総照度60万lx・hr (20℃)	25日	気密	規格内

測定項目：性状、純度試験、溶出性、定量法、質量試験、硬度〈長期保存試験〉
性状、確認試験、純度試験、含量均一性、溶出性、定量法〈加速試験〉
性状、溶出性、定量法、硬度〈無包装安定性試験〉

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

溶出挙動における類似性⁴⁾

本製剤は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02291）サルボグレラート塩酸塩錠50mg「ケミファ」

（方法） 日局溶出試験法 パドル法

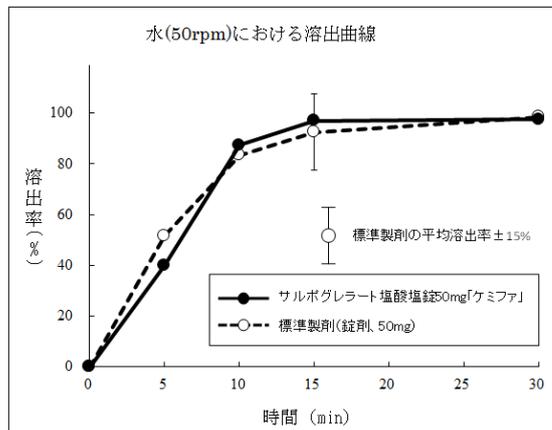
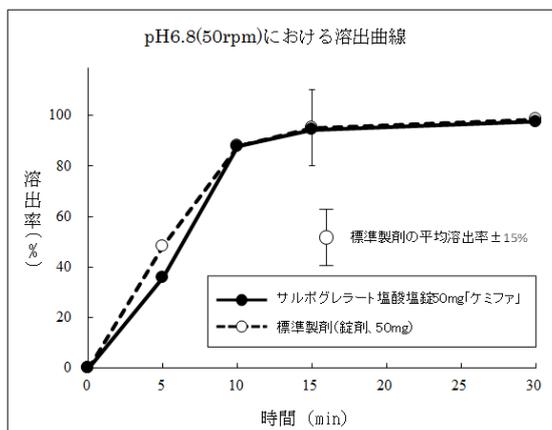
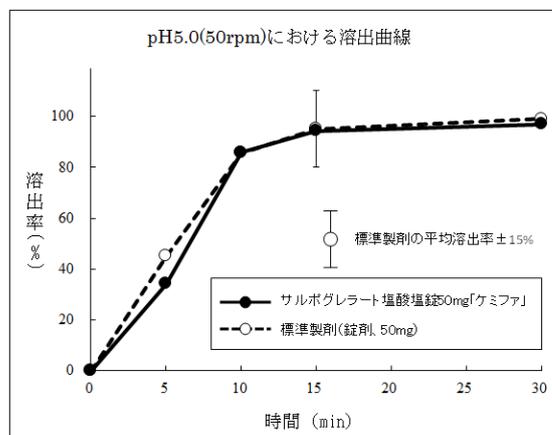
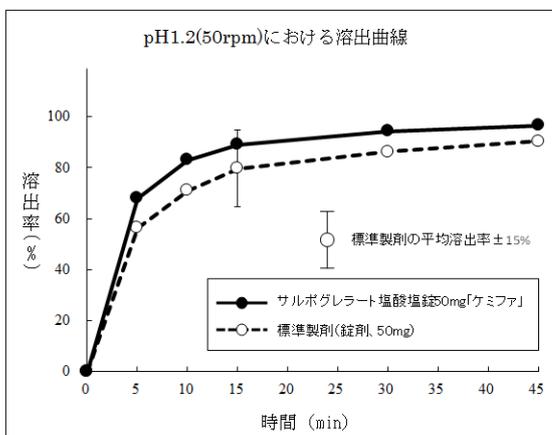
試験条件： 回転数50rpm、100rpm

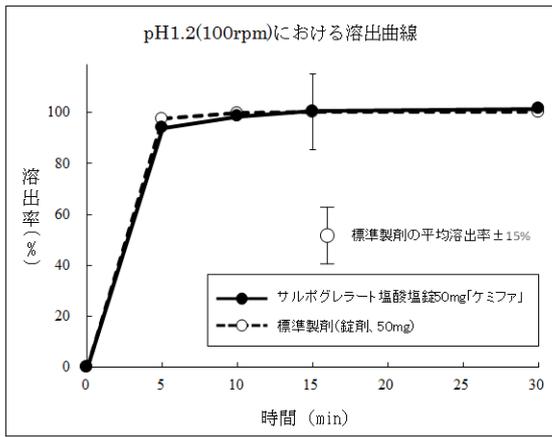
試験液： pH1.2、pH5.0、pH6.8、水

判定基準：

回転数	試験液	判定時間	判定基準
50rpm	pH1.2	15分	試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出するか、あるいは試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH5.0	15分	
	pH6.8	15分	
	水	15分	
100rpm	pH1.2	15分	

（結果） すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と類似性を有することが確認された。





2) サルボグレラート塩酸塩錠100mg「ケミファ」

(方法) 日局溶出試験法 パドル法

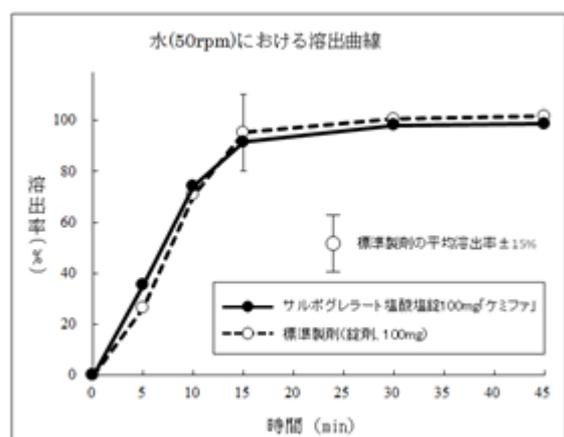
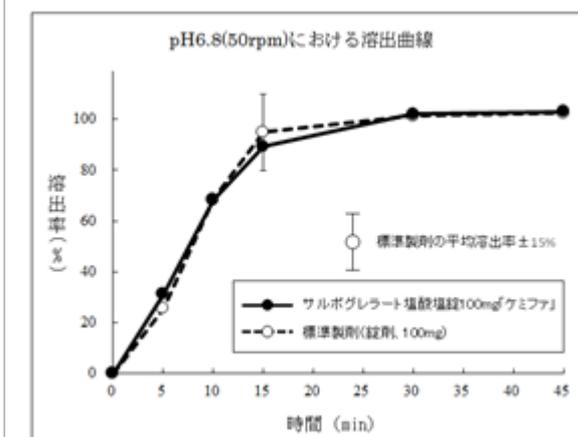
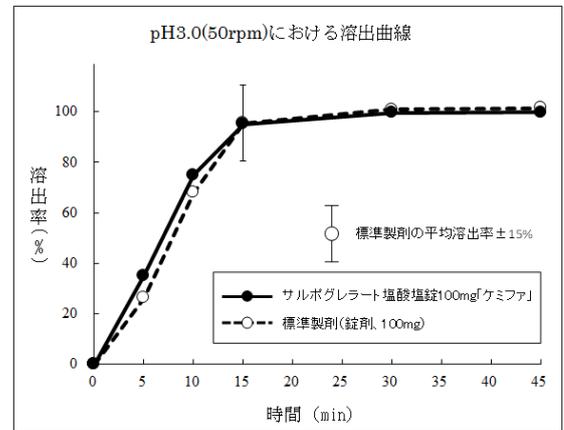
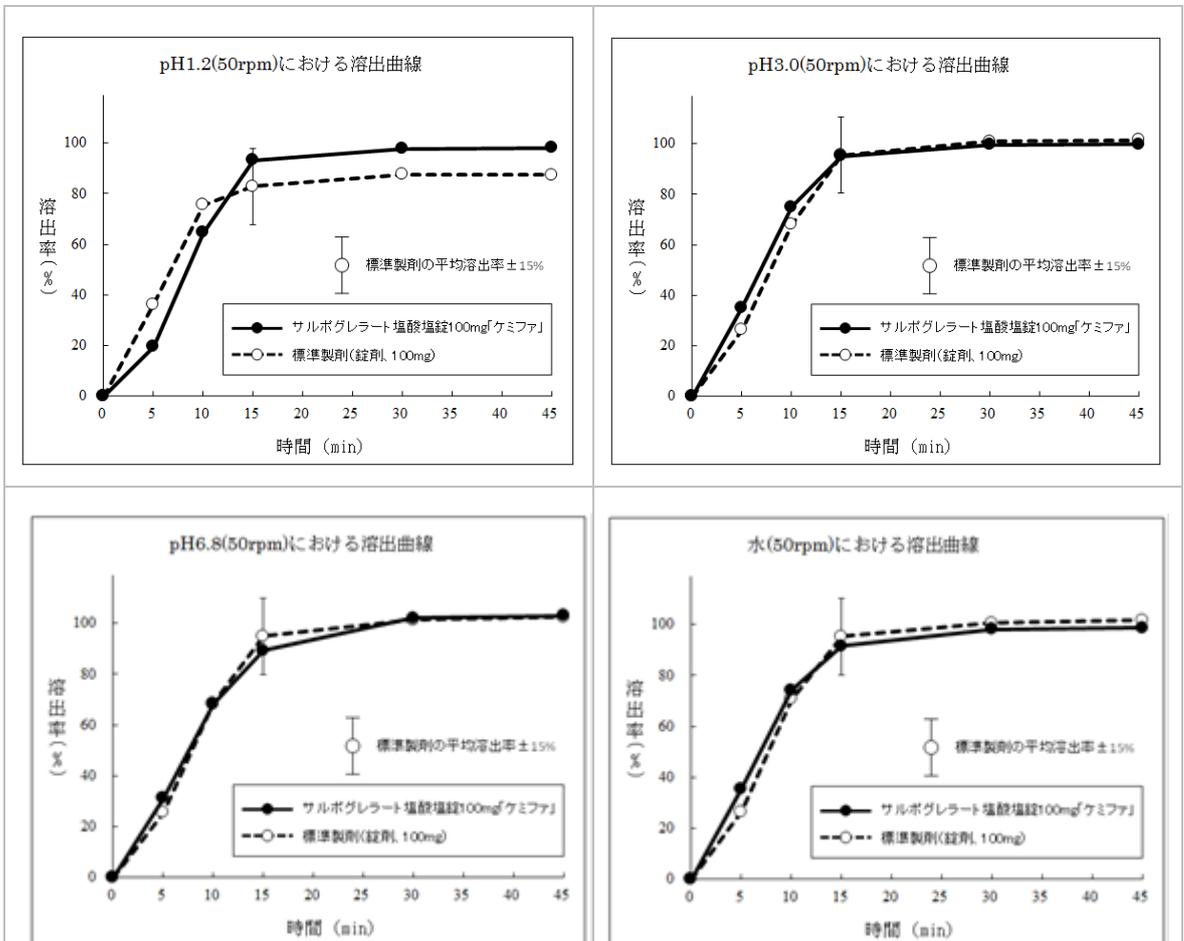
試験条件： 回転数50rpm、100rpm

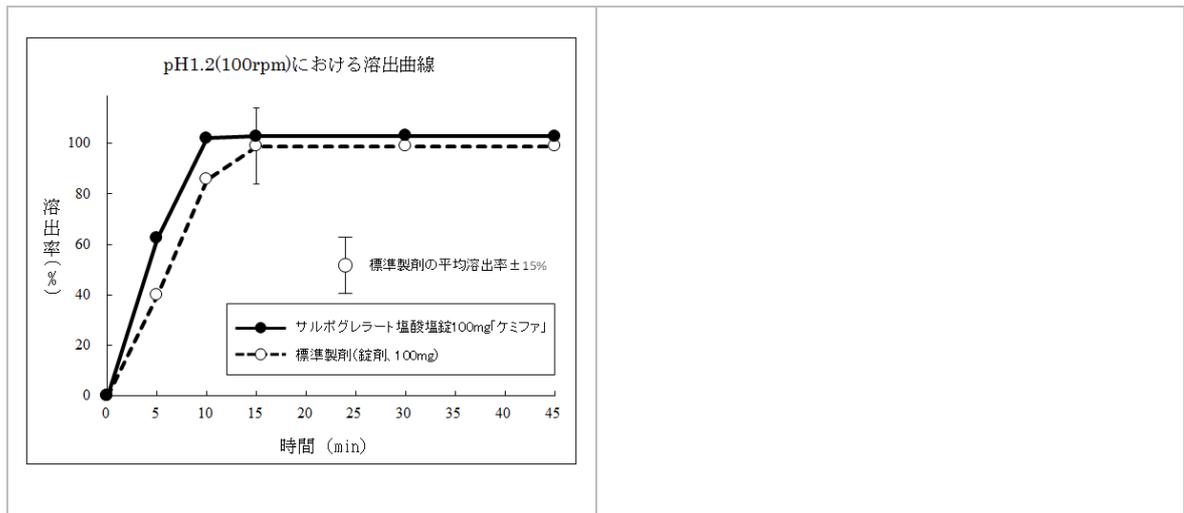
試験液： pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

判定基準：

回転数	試験液	判定時間	判定基準
50rpm	pH1.2	15分	試験剤は15分以内に平均85%以上溶出するか、あるいは試験剤の平均溶出率が標準剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	pH3.0	15分	
	pH6.8	15分	
	水	15分	
100rpm	pH1.2	15分	

(結果) すべての試験液において判定基準を満たし、標準剤と類似性を有することが確認された。





(2) 公的溶出規格への適合

サルボグレラート塩酸塩錠 50mg「ケミファ」及びサルボグレラート塩酸塩錠 100mg「ケミファ」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。

(方法) 日本薬局方 溶出試験法 パドル法

条件 : 回転数 50rpm

試験液 水 (900mL)

(結果) 30 分間の溶出率は 80%以上であった。

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

サルボグレラート塩酸塩錠 50mg「ケミファ」: 100 錠 [10 錠 (PTP) ×10、乾燥剤入り]

サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「ケミファ」: 100 錠 [10 錠 (PTP) ×10、乾燥剤入り]

(3) 予備容量

該当資料なし

(4) 容器の材質

PTP : ポリ塩化ビニル、アルミニウム箔

外袋(ピロー) : アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

ボトル(バラ) : ポリエチレン容器、ポリプロピレンキャップ

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

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
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⁵⁾。
 - 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

5 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

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

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-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^{6)~9)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

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^{10),11)} (*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⁶⁾。
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⁶⁾。

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¹²⁾
- 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¹³⁾。

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⁶⁾。

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⁷⁾。

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¹⁴⁾。

(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

1) 単回投与

該当資料なし

2) 反復投与

該当資料なし

3) 生物学的同等性試験

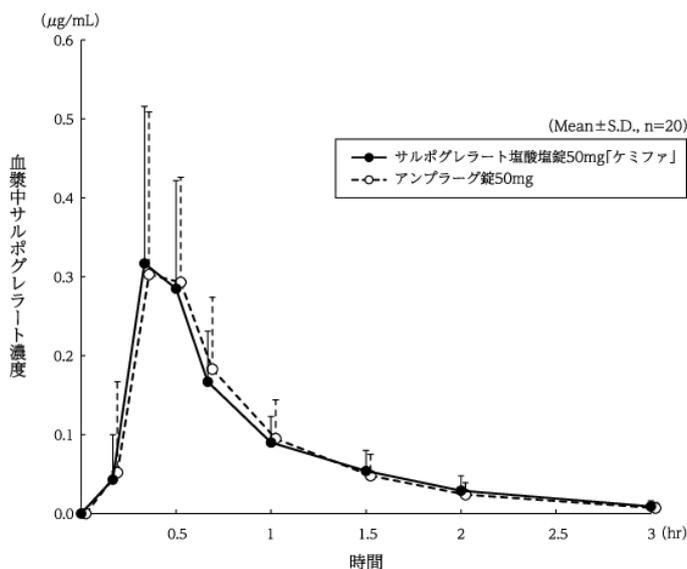
本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（令和 2 年 3 月 19 日薬生薬審発 0319 第 1 号）に準拠。

〈サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」〉

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」とアンプラーグ錠 50mg 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 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、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁵⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→3} ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」	0.240 ± 0.066	0.391 ± 0.172	0.43 ± 0.10	0.76 ± 0.33
アンプラーグ錠 50mg	0.239 ± 0.087	0.399 ± 0.158	0.41 ± 0.11	0.65 ± 0.18

(Mean ± S.D., n=20)



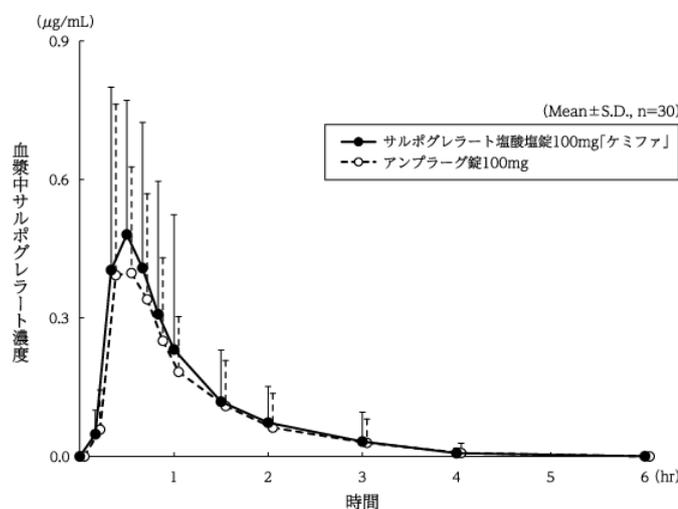
〈サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「ケミファ」〉

サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「ケミファ」とアンブラーグ錠 100mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（サルボグレラート塩酸塩として 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、Cmax）について AUC は対数値の平均値の差の 90%信頼区間において生物学的同等性の判定基準に適合し、さらに Cmax も対数値の平均値の差が $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ の範囲内であり、且つ、溶出試験で溶出挙動が類似していると判定されたことから、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁵⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→3} ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} [※] (hr)
サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「ケミファ」	0.510±0.312	0.652±0.415	0.67±0.57	0.65±0.36
アンブラーグ錠 100mg	0.443±0.155	0.583±0.333	0.68±0.59	0.62±0.22

(Mean±S.D., n=30)

(※ : n=29)



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。

(3) 中毒域
該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響
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) 消失速度定数¹⁵⁾
1.0455±0.3450/hr
(健康成人男子、サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」 1 錠を絶食単回投与)
1.2742±0.4307/hr
(健康成人男子、サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」 1 錠を絶食単回投与)

(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¹⁶⁾。

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. 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
「Ⅷ-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¹⁴C-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¹⁷⁾。

(6) 血漿蛋白結合率
ヒト血清:95%以上¹⁸⁾ (*in vitro*、限外ろ過法)。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

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¹⁹⁾。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

「VI-6. 代謝 (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照

(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化、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¹⁶⁾。

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

該当しない

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 参照、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 参照、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	出血傾向を増強するおそれがある。	

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。

注) 発現頻度は、製造販売後調査の結果を含む。

(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 参照、9.1.2 参照]

11.1.2 血小板減少（頻度不明）

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。

11.1.4 無顆粒球症（頻度不明）

(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

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

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

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
該当資料なし
- (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
該当しない
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：有り
くすりのしおり：有り
6. 同一成分・同効薬
同一成分薬：アンプラグ錠 50mg・100mg、アンプラグ細粒 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
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

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 「ケミファ」	2009年 7月13日	22100AMX02163000	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 「ケミファ」	2009年 7月13日	22100AMX01855000	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
該当しない

13. 各種コード

販売名	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 (9桁) 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 「ケミファ」	3399006F1174	3399006F1174	119419702	621941901
サルボグレラート 塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」	3399006F2170	3399006F2170	119420302	621942001

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) 日本ケミファ株式会社：安定性（長期保存試験）に関する資料（社内資料）
- 2) 日本ケミファ株式会社：安定性（加速試験）に関する資料（社内資料）
- 3) 日本ケミファ株式会社：無包装状態での安定性に関する資料（社内資料）
- 4) 日本ケミファ株式会社：溶出に関する資料（社内資料）
- 5) 古川欽一, 他: 臨床医薬. 1991; 7 (8) : 1747-1770
- 6) 原 啓人, 他: Thromb Haemost. 1991; 65 (4) : 415-420
- 7) 原 啓人, 他: 薬理と治療. 1991; 19: S611-618
- 8) 土橋洋史, 他: J Pharmacobiodyn. 1991; 14 (8) : 461-466
- 9) 丸山恵子, 他: J Pharmacobiodyn. 1991; 14 (4) : 177-181
- 10) 山口 寛, 他: 臨床医薬. 1991; 7 (6) : 1235-1241
- 11) 磯貝行秀, 他: 臨床医薬. 1991; 7 (6) : 1227-1233
- 12) 原 啓人, 他: Arzneimittelforschung. 1991; 41 (6) : 616-620
- 13) 原 啓人, 他: Thromb Haemost. 1991; 66 (4) : 484-488
- 14) 伊藤勝朗, 他: 臨床医薬. 1991; 7 (6) : 1243-1251
- 15) 日本ケミファ株式会社：生物学的同等性に関する資料（社内資料）
- 16) 小松貞子, 他: 薬物動態. 1991; 6 (3) : 353-375
- 17) 小松貞子, 他: 薬物動態. 1991; 6 (3) : 377-398
- 18) 丹羽卓朗, 他: 薬理と治療. 1991; 19: S749-756
- 19) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021: C2091-2095
- 20) 日本ケミファ株式会社：粉碎状態における安定性に関する資料（社内資料）

2. その他の参考文献

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
該当資料なし
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。

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 事務連絡）

(1) 粉砕²⁰⁾

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
サルポグレラート 塩酸塩錠 50mg 「ケミファ」	25℃、75%RH	4週	遮光・開放	規格内
	総照度60万lx・hr (20℃)	25日	気密	規格内
サルポグレラート 塩酸塩錠 100mg 「ケミファ」	25℃、75%RH	4週	遮光・開放	規格内
	総照度60万lx・hr (20℃)	25日	気密	規格内

試験項目：性状、定量法、純度試験

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること

照会先：日本ケミファ株式会社 くすり相談室

TEL. 0120-47-9321 03-3863-1225/FAX.03-3861-9567

受付時間：8:45～17:30（土日祝祭日を除く）

2. その他の関連資料

該当しない

