

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 2013 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/100mg 「トローワ」

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 50mg “TOWA” / TABLETS 100mg “TOWA”

製 品 名	サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トローワ」	サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トローワ」
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	1錠中 日局 サルポグレラート塩酸塩 50mg 含有	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	2009年 7月 13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：東和薬品株式会社	
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	電話番号： FAX：	
問 い 合 わ せ 窓 口	東和薬品株式会社 学術部 DI センター  0120-108-932 FAX 06-7177-7379 https://med.towayakuhin.co.jp/medical/	

本 IF は 2021 年 5 月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。

最新の電子添文情報は医薬品医療機器情報提供ホームページ

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

IF 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、添付文書と略す)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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IF と略す)の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を保管する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」(以下、「IF記載要領 2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領 2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領 2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月)

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	24
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	24
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	24
II. 名称に関する項目	2	3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	24
1. 販売名	2	4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	24
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	24
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	24
4. 分子式及び分子量	3	7. 相互作用	24
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	25
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	26
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	27
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	27
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	27
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	13. 過量投与	27
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	27
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	27
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	27
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	28
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	28
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	2. 毒性試験	28
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	29
5. 調製法及び溶解後の安定性	10	1. 規制区分	29
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	10	2. 有効期間又は使用期限	29
7. 溶出性	11	3. 貯法・保存条件	29
8. 生物学的試験法	15	4. 薬剤取扱い上の注意点	29
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	15	5. 承認条件等	29
10. 製剤中の有効成分の定量法	15	6. 包装	29
11. 力価	15	7. 容器の材質	30
12. 混入する可能性のある夾雑物	15	8. 同一成分・同効薬	30
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	15	9. 国際誕生年月日	30
14. その他	15	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	30
V. 治療に関する項目	16	11. 薬価基準収載年月日	30
1. 効能・効果	16	12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	30
2. 用法・用量	16	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	30
3. 臨床成績	16	14. 再審査期間	30
VI. 薬効薬理に関する項目	18	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	31
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18	16. 各種コード	31
2. 薬理作用	18	17. 保険給付上の注意	31
VII. 薬物動態に関する項目	19	XI. 文 献	32
1. 血中濃度の推移・測定法	19	1. 引用文献	32
2. 薬物速度論的パラメータ	21	2. その他の参考文献	32
3. 吸収	22	XII. 参考資料	32
4. 分布	22	1. 主な外国での発売状況	32
5. 代謝	22	2. 海外における臨床支援情報	32
6. 排泄	23	XIII. 備 考	33
7. トランスポーターに関する情報	23	その他の関連資料	33
8. 透析等による除去率	23		

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は 5-HT₂ ブロッカーであり、本邦では 1993 年に上市されている。東和薬品株式会社が後発医薬品として、サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」及びサルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」の開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2009 年 7 月にそれぞれ承認を取得、2009 年 11 月に発売した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

臨床的特性

有用性：サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」及びサルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」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に対して、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ことにより、有用性が認められている。

安全性：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。

副作用として、発疹、発赤、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(鼻出血、皮下出血等)、嘔気、胸やけ、腹痛、便秘、心悸亢進、頭痛、蛋白尿、尿潜血、BUN 上昇、クレアチニン上昇、貧血、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、尿沈渣等が報告されている。〔Ⅷ. 8. (3) その他の副作用の項を参照〕

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、無顆粒球症があらわれることがある。〔Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状の項を参照〕

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 「トーフ」
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「トーフ」

(2) 洋名

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 50mg “TOWA”
SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE TABLETS 100mg “TOWA”

(3) 名称の由来

一般名+剤形+規格(含量)+「トーフ」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

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)

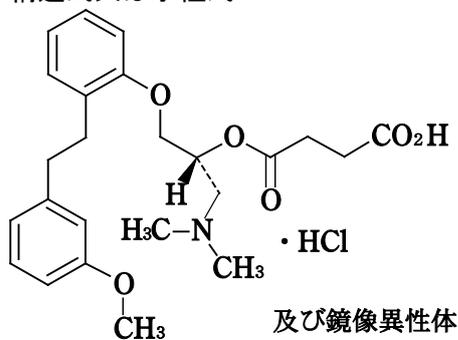
Sarpogrelate Hydrochloride (JAN)

Sarpogrelate(INN)

(3) ステム

血小板凝集阻害薬：-grel-

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)

(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

該当資料なし

7. CAS登録番号

125926-17-2(free base)

135159-51-2(Sarpogrelate Hydrochloride)

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

溶 媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	溶 解 性
水	100mL 以上 1000mL 未満	溶けにくい
エタノール(99.5)	100mL 以上 1000mL 未満	溶けにくい

本品は 0.01mol/L 塩酸試液に溶ける。

(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

pK_{a1} : 3.89(カルボキシ基、滴定法)

pK_{a2} : 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

旋光度：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 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不安定である。

1mg/mL 濃度のとき、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

日局「サルポグレラート塩酸塩」の確認試験による

4. 有効成分の定量法

日局「サルポグレラート塩酸塩」の定量法による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

製品名	サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」			サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」			
剤形の区別	フィルムコーティング錠						
性状	白色のフィルムコーティング錠			白色の割線入りの フィルムコーティング錠			
識別 コード	本体	Tw741			Tw742		
	包装						
外形	表 	裏 	側面 	表 	裏 	側面 	
錠径(mm)	6.6			8.1			
厚さ(mm)	3.2			4.2			
質量(mg)	105			208			

(2) 製剤の物性

製品名	サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」	サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」
硬度	148N (15.1kg 重)	145N (14.8kg 重)

(3) 識別コード

(1) 剤形の区別、外観及び性状の項を参照

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」

1錠中 日局 サルポグレラート塩酸塩 50mg を含有する。

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」

1錠中 日局 サルポグレラート塩酸塩 100mg を含有する。

(2) 添加物

D-マンニトール、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、クエン酸水和物、低置換度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、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク、酸化チタン

(3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

サルボグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」¹⁾

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	98.2~102.8	99.3~104.9
含量(%)	98.7~100.2	98.5~99.9

サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」²⁾

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	99.6~102.6	99.1~102.7
含量(%)	99.0~101.2	98.0~99.0

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品(乾燥剤入り)

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率(%)	99.6~102.6	98.6~103.4
含量(%)	99.0~101.2	98.0~99.2

(2) 長期保存試験

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」³⁾

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、3ロット(n=1)

試験項目	開始時	5 年 6 箇月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
溶出率(%)	100~105	102~104
含量(%)	99.9~101.2	98.9~99.9

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」⁴⁾

包装形態：PTP 包装し貼り合わせアルミ箔包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、3ロット*(n=1)

試験項目	開始時	5 年 6 箇月
性状	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験	規格内	同左
溶出率(%)	100~104	101~104
含量(%)	99.0~100.6	98.7~99.7

*：確認試験のみ 1 ロットで実施したデータ

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品(乾燥剤入り)

試験条件：25℃、60%RH、1ロット(n=1)

試験項目	開始時	5年6箇月
性状	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	同左
純度試験	規格内	同左
溶出率(%)	100~101	101~102
含量(%)	99.0	99.1

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度 60%、5年6箇月)の結果、サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」及びサルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」は通常の市場流通下においてそれぞれ5年間安定であることが確認された。

(3) 無包装状態における安定性

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」⁵⁾

試験項目	外観	含量	硬度	溶出性
温度 (40℃、3箇月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 (25℃、75%RH、3箇月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
光 (60万lx・hr)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

注) 評価は「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成11年8月20日」の評価基準による。

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」⁶⁾

試験項目	外観	含量	硬度	溶出性
温度 (40℃、3箇月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 (25℃、75%RH、3箇月)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
光 (60万lx・hr)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

注) 評価は「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成11年8月20日」の評価基準による。

(4) 分割後の安定性

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」⁷⁾

包装形態：開放シャーレ

試験条件：25℃、60%RH、遮光保存、1ロット(n=3*)

試験項目		開始時	分割直後	1 箇月	3 箇月
性状	表面	白色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)		100.8~102.6	100.4~101.6	102.0~103.5	101.3~104.4
含量(%)		100.5	99.5	100.1	99.5

*：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

包装形態：開放シャーレ

試験条件：25℃、75%RH、遮光保存、1ロット(n=3*)

試験項目		開始時	分割直後	1 箇月
性状	表面	白色	同左	同左
	分割面	—	白色	同左
溶出率(%)		100.8~102.6	100.4~101.6	101.8~103.4
含量(%)		100.5	99.5	100.1

*：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

包装形態：ラップで蓋をした開放シャーレ

試験条件：25℃、60%RH、3000lx 散光下、1ロット(n=3*)

試験項目		開始時	分割直後	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性状	表面	白色	同左	同左	同左
	分割面	—	白色	同左	同左
溶出率(%)		100.8~102.6	100.4~101.6	99.8~102.2	101.0~102.6
含量(%)		100.5	99.5	99.3	100.1

*：溶出率のみ n=1 で実施したデータ

分割後の安定性試験(25℃・相対湿度 60%・遮光保存(3 箇月)、25℃・相対湿度 75%・遮光保存(1 箇月)及び 25℃・相対湿度 60%(120 万 lx・hr))の結果、サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」はそれぞれの試験項目で、ほとんど変化を認めなかった。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

7. 溶出性

(1) 規格及び試験方法 ⁸⁾⁹⁾

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」及びサルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」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それぞれ適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：水 900mL

回転数：50rpm

測定法：紫外可視吸光度測定法

規 格：30 分間の溶出率が 80%以上のときは適合とする。

〔出典：日本薬局方医薬品各条〕

(2) 生物学的同等性試験

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」¹⁰⁾

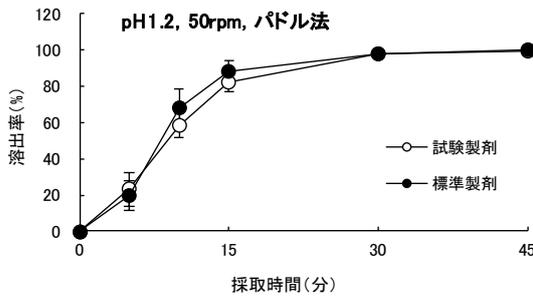
処方変更後のサルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」(以下、新製法製剤)について、処方変更前のサルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」(以下、旧製法製剤)を標準製剤として、「経口固形剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」及び「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発第 0229 号第 10 号)(以下、ガイドライン)に従い溶出試験を行った。

なお、旧製法製剤は、ヒトでの生物学的同等性が確認された処方変更前のサルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」と同等性が確認されている。

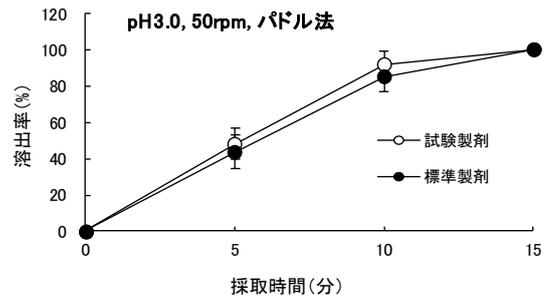
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH3.0、pH6.8、水
 回転数 : 50rpm、100rpm
 試験製剤 : サルポグレラート塩酸塩錠50mg「トーワ」
 (新製法製剤)

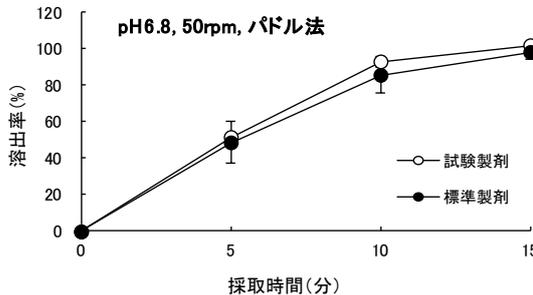
検体数 : n=12
 試験法 : パドル法
 標準製剤 : サルポグレラート塩酸塩錠50mg「トーワ」
 (旧製法製剤)



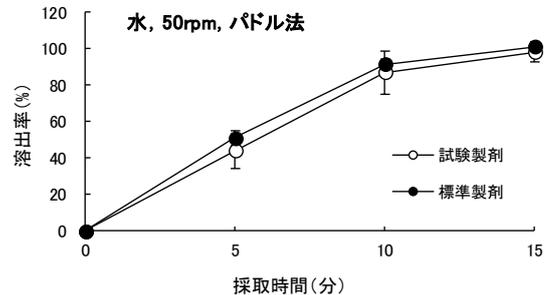
時間(分)	0	5	10	15	30	45
試験製剤	0	23.2	58.5	82.3	98.2	99.2
標準偏差	0	9.5	6.5	4.9	2.0	1.7
標準製剤	0	20.1	67.9	88.5	98.1	100.5
標準偏差	0	8.2	10.8	5.9	2.4	0.7



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	48.3	92.1	100.5
標準偏差	0	8.4	7.1	1.6
標準製剤	0	43.8	85.0	100.4
標準偏差	0	9.4	7.5	1.9



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	51.2	92.9	101.5
標準偏差	0	1.6	2.6	1.0
標準製剤	0	48.8	85.8	98.3
標準偏差	0	11.3	10.2	3.6



時間(分)	0	5	10	15
試験製剤	0	44.1	86.8	98.5
標準偏差	0	9.5	11.9	5.5
標準製剤	0	51.1	91.3	101.1
標準偏差	0	4.1	3.3	1.8

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		平均 溶出率 の差(%)	類似性の判定基準	判定
回転数 (rpm)	試験液	採取時間 (分)	試験 製剤	標準 製剤			
50	pH1.2	15	82.3	88.5	-6.2	15分以内に平均85%以上 溶出又は、標準製剤の平 均溶出率の±15%以内	適
	pH3.0		100.5	100.4	0.1		適
	pH6.8		101.5	98.3	3.2		適
	水		98.5	101.1	-2.6		適

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

従って、試験製剤(新製法製剤)と標準製剤(旧製法製剤)の溶出挙動は類似していると判断した。

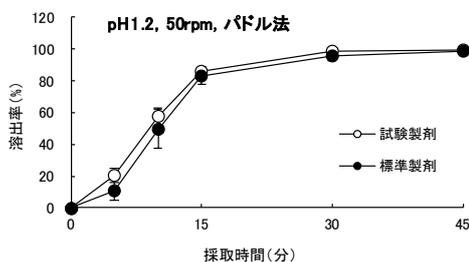
サルボグレレート塩酸塩錠 100mg「トーフ」¹⁾

処方変更後のサルボグレレート塩酸塩錠 100mg「トーフ」(以下、新製法製剤)について、ヒトでの生物学的同等性が確認された処方変更前のサルボグレレート塩酸塩錠 100mg「トーフ」(以下、旧製法製剤)を標準製剤として、「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」及び「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 薬食審査発第 0229 号第 10 号)(以下、ガイドライン)に従い溶出試験を行った。

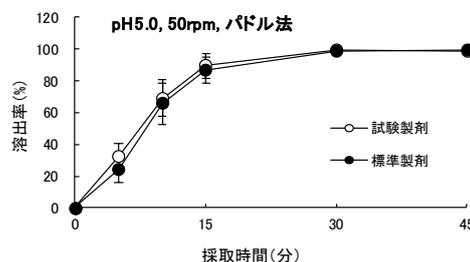
<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
 回転数 : 50rpm、100rpm
 試験製剤 : サルボグレレート塩酸塩錠100mg「トーフ」
 (新製法製剤)

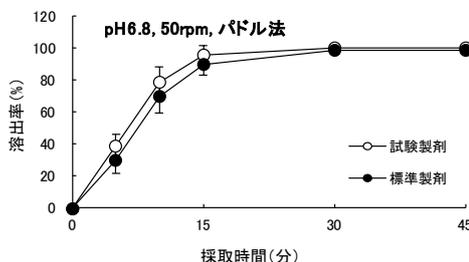
検体数 : n=12
 試験法 : バドル法
 標準製剤 : サルボグレレート塩酸塩錠100mg「トーフ」
 (旧製法製剤)



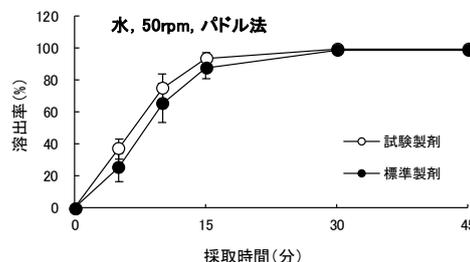
時間(分)	0	5	10	15	30	45
試験製剤	0	20.4	57.4	86.1	98.9	99.6
標準偏差	0	4.7	5.3	3.1	0.6	0.6
標準製剤	0	10.9	49.7	83.3	95.5	98.4
標準偏差	0	6.4	12.3	5.2	2.4	1.1



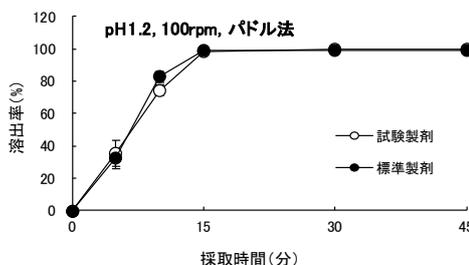
時間(分)	0	5	10	15	30	45
試験製剤	0	32.6	69.2	89.7	99.3	99.1
標準偏差	0	8.3	11.4	7.8	0.6	0.6
標準製剤	0	24.5	65.6	86.6	98.6	99.2
標準偏差	0	8.2	13.3	8.1	0.8	0.7



時間(分)	0	5	10	15	30	45
試験製剤	0	38.9	79.0	96.1	100.5	100.4
標準偏差	0	7.5	9.7	5.5	0.3	0.3
標準製剤	0	30.2	69.7	90.3	98.9	99.2
標準偏差	0	8.1	9.9	6.8	0.8	0.5



時間(分)	0	5	10	15	30	45
試験製剤	0	37.1	75.5	93.6	99.4	99.4
標準偏差	0	6.1	8.6	3.7	0.7	0.6
標準製剤	0	25.8	65.9	88.0	98.8	99.0
標準偏差	0	8.8	12.1	6.7	1.0	0.9



時間(分)	0	5	10	15	30	45
試験製剤	0	35.5	74.5	98.5	100.2	100.0
標準偏差	0	7.9	3.5	0.9	0.8	0.8
標準製剤	0	32.3	82.8	99.2	99.0	98.9
標準偏差	0	6.3	3.4	0.5	0.3	0.4

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較(パドル法)

試験条件			平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤			
50	pH1.2	10	57.4	49.7	7.7	標準製剤の平均溶出率の±15%以内	適
		15	86.1	83.3	2.8		
	pH5.0	15	89.7	86.6	3.1	15分以内に平均85%以上溶出又は、標準製剤の平均溶出率の±15%以内	適
	pH6.8	15	96.1	90.3	5.8		適
	水	15	93.6	88.0	5.6		適
100	pH1.2	15	98.5	99.2	-0.7	適	

(n=12)

上記の結果より、試験条件それぞれについて、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

従って、試験製剤(新製法製剤)と標準製剤(旧製法製剤)の溶出挙動は類似していると判断した。

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「サルポグレラート塩酸塩錠」の確認試験による

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「サルポグレラート塩酸塩錠」の定量法による

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

脱エステル体

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 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

2. 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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

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試験の概要

該当しない

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

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

血小板及び血管平滑筋に存在する 5-HT₂ 受容体と強い親和性を有し、セロトニンの 5-HT₂ 受容体への結合を特異的に阻害し、セロトニンによる血小板凝集増強作用及び血管収縮作用の抑制を示すと考えられる。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

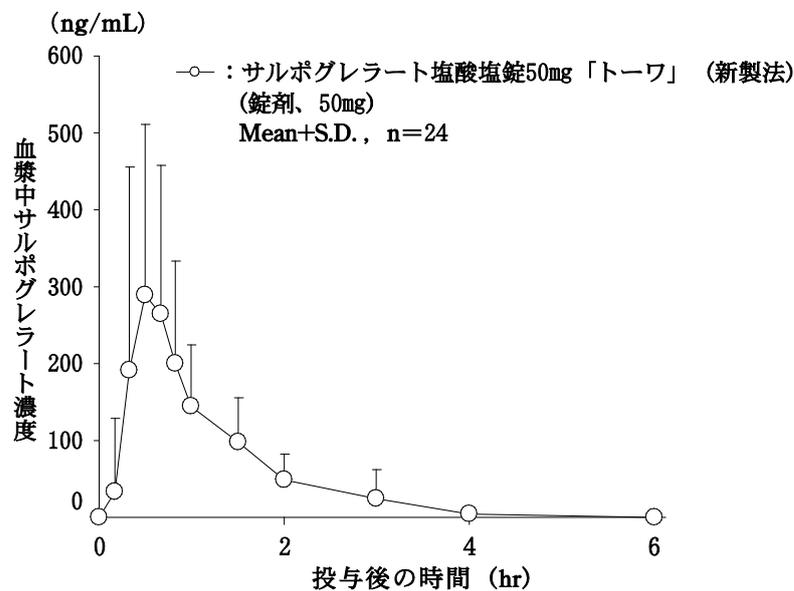
(3) 臨床試験で確認された血中濃度の項を参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」¹²⁾

試験製剤（サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」（新製法））と標準製剤（サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」（旧製法））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（n=24）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）について統計解析を行った結果、AUC については対数値の平均値の差の 90%信頼区間が $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、Cmax については対数値の平均値の差が $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ で、かつ、溶出試験で規定するすべての条件で溶出挙動が類似していたことから、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

	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50mg「トーワ」 (新製法) (錠剤、50mg)	331.2±127.3	383.674±261.029	0.882±0.642	0.672±0.225

(Mean±S.D., n=24)

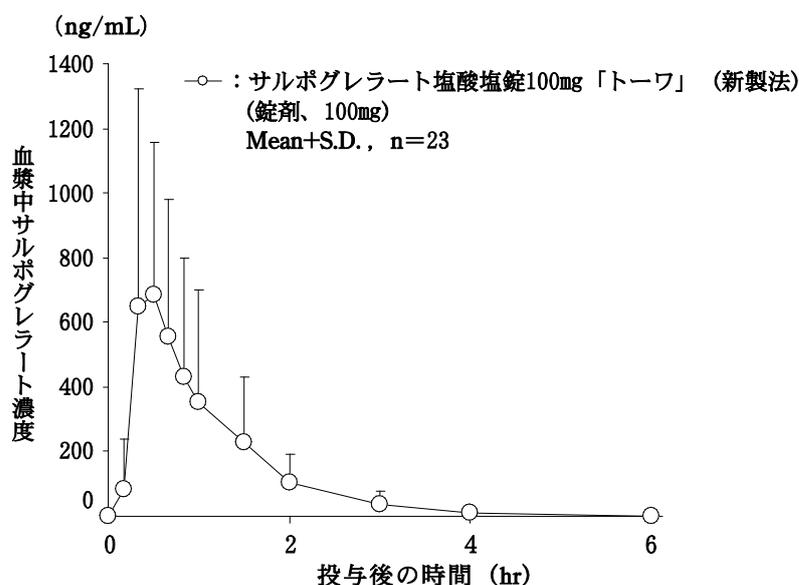
両剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

パラメータ	AUC ₀₋₆	C _{max}
平均値の差	log(0.9872)	log(0.9774)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.8995)~log(1.0835)	log(0.7746)~log(1.2333)

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。

サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」¹³⁾

試験製剤（サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」(新製法)）と標準製剤（サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」(旧製法)）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（n=23）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、AUC については対数値の平均値の差の 90%信頼区間が log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、C_{max} については対数値の平均値の差が log(0.90)~log(1.11)で、かつ、溶出試験で規定するすべての条件で溶出挙動が類似していたことから、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

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC 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「トーフ」 (新製法) (錠剤、100mg)	769±431	952.87±613.64	0.804±0.638	0.6510±0.1235

(Mean±S.D., n=23)

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

パラメータ	AUC ₆	C _{max}
平均値の差	log(1.0014)	log(1.0583)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.8737)~log(1.1479)	log(0.7904)~log(1.4171)

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」¹²⁾

kel : $1.124 \pm 0.306 \text{ hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食単回経口投与)

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」¹³⁾

kel : $1.101 \pm 0.207 \text{ hr}^{-1}$ (健康成人男子、絶食単回経口投与)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸 収

該当資料なし

4. 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

(3) 乳汁への移行性

VIII. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 2)を参照

(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

該当資料なし

5. 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(CYP450 等)の分子種

該当資料なし

(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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排 泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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(原則禁忌を含む)

【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女性(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

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。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

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

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

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)、A1-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。

(3) その他の副作用

その他の副作用	
	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、発赤、丘疹、そう痒、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、けん怠感、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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

電子添文より抜粋

その他の副作用	
	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、発赤、丘疹、そう痒、紅斑、蕁麻疹

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。

9. 高齢者への投与

高齢者への投与
高齢者では低用量（例えば 150 mg/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。]

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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) 授乳中の女性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。]

11. 小児等への投与

小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。（使用経験がない）

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

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。]

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

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) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

Ⅷ. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与の項 1)を参照

(4) 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：該当しない

有効成分：劇薬

劇薬：1個中サルボグレラートとして92.18mg以下を含有する内用剤は除かれる。

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：5年(外箱、ラベルに記載)

3. 貯法・保存条件

貯法：室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて

患者向け医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

VIII. 14. 適用上の注意の項を参照

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

製品名	包装形態	内容量(重量、容量又は個数等)
サルボグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」	PTP包装	100錠
サルボグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」	PTP包装	100錠、500錠
	バラ包装	500錠

7. 容器の材質

製品名	包装形態	材質
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリ塩化ビニル、アルミ箔
		ピロー : アルミニウム・ポリエチレンラミネート
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」	PTP 包装	PTP : ポリ塩化ビニル、アルミ箔
		ピロー : アルミニウム・ポリエチレンラミネート
	バラ包装	瓶、蓋(乾燥剤入り) : ポリエチレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アンプラーグ錠 50mg、アンプラーグ錠 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

9. 国際誕生年月日

1993 年 7 月 2 日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号	備考
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」	2009 年 7 月 13 日	22100AMX01954000	
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」	2009 年 7 月 13 日	22100AMX01953000	

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日	備考
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg「トーワ」	2009 年 11 月 13 日	
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg「トーワ」	2009 年 11 月 13 日	

12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

16. 各種コード

製品名	HOT 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
サルポグレラート塩酸塩 錠 50mg「トーワ」	119461601	3399006F1018 (統一名) 3399006F1220 (個別)	622897100 (統一名) 621946101 (個別)
サルポグレラート塩酸塩 錠 100mg「トーワ」	119462301	3399006F2014 (統一名) 3399006F2227 (個別)	622897200 (統一名) 621946201 (個別)

17. 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) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(錠 50mg)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：加速試験(錠 100mg)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：長期保存試験(錠 50mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：長期保存試験(錠 100mg)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(錠 50mg)
- 6) 東和薬品株式会社 社内資料：無包装状態における安定性試験(錠 100mg)
- 7) 東和薬品株式会社 社内資料：分割後の安定性試験(錠 100mg)
- 8) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(錠 50mg)
- 9) 東和薬品株式会社 社内資料：製品試験；溶出試験(錠 100mg)
- 10) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(錠 50mg)
- 11) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験(錠 100mg)
- 12) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；血漿中未変化体濃度(錠 50mg)
- 13) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験；血漿中未変化体濃度(錠 100mg)
- 14) 東和薬品株式会社 社内資料：粉碎後の安定性試験
- 15) 東和薬品株式会社 社内資料：崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験

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

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) 粉碎¹⁴⁾

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「トーフ」

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「トーフ」は、サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「トーフ」と素錠部の有効成分及び添加物の組成比が等しいことから、粉碎後の安定性につきましてはサルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「トーフ」の結果をご参照ください。

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「トーフ」

■ 試験製剤

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「トーフ」

■ 方法

◇ 検体作製方法

試験製剤 70 錠をとり、錠剤粉碎机（ラボミルサープラス LM-PLUS）で 15 秒間粉碎する。（n=1）

◇ 保存条件

・ 散光

条件：成り行き温度及び湿度，照度は約 600 lx 付近に調整（3 箇月後の時点で累計 120 万 lx・hr 以上），検体の層の厚さは 3 mm 以下とする。

保存容器：開放したプラスチックシャーレをラップで覆う。

◇ 試験項目及び試験方法

- ・ 試験項目：外観(n=3)，含量(n=3)（残存率 [粉碎直後の含量を 100%として算出]）
- ・ 試験方法：各検体の試験方法は医薬品製造販売承認書の製剤の規格及び試験方法に準じる。

■ 結果

保存条件	試験項目	粉碎直後	1 箇月後	3 箇月後
散光	外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末 (一部固化) *
	含量(%) (残存率(%))	98.6 (100)	97.5 (98.3)	96.7 (98.1)

* : 直径 1~4mm 程度のダマ状の粉末集合体の一部生成

保存期間 : 2010 年 6 月 17 日~2010 年 9 月 20 日

温度 : 18.0~27.8 °C

湿度 : 47~91 %RH

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性¹⁵⁾

■ 試験製剤

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「トーワ」

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「トーワ」

■ 方法

- ①ディスペンサー (Exacta-Med オーラルディスペンサー) のピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に製剤 1 個を入れてピストンを戻す。
- ②水浴を用いて 55±1 °C に設定したお湯をディスペンサー口から約 20mL 吸い取り、キャップ (Exacta-Med オーラルディスペンサーとセットで同封) で閉じ、ディスペンサーを横にした状態で 5 分間放置する。
- ③ディスペンサーを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。
- ④崩壊していることが確認されれば⑥の手順へ進む。崩壊不良の場合は再度 5 分間放置し③の手順を行い、崩壊が確認されれば⑥の手順へ進む。さらに崩壊しない場合は⑤の操作へ進む。
- ⑤錠剤はペンチで軽くつぶしたもの、カプセル剤は脱カプセルしたものについて①~③の作業を行う。崩壊不良の場合は再度 5 分間放置し③の手順を行う。この時点にて崩壊・懸濁しない場合、試験を中止する。
- ⑥ディスペンサーからキャップを取り外し、チューブ (予め挿入口から 2/3 を水平にし、ディスペンサー装着部を高さ 30cm の位置にセットしておく) に取り付け、流速約 2~3mL/秒で懸濁液を押しこむ。
- ⑦チューブを通過した懸濁液を回収し、室温まで冷ました後、pH を測定する。
- ⑧懸濁液をチューブ内に全て押し込んだ後、さらに水道水 20mL をディスペンサーで注入し、洗いこむ。
- ⑨洗いこみ後のチューブ注入口、内部及び先端部について、詰まりや残留物の有無を目視にて確認する。
- ⑩通過性にて通過抵抗を感じた、あるいはチューブ閉塞が起きた場合、チューブ径を 12Fr に変更し、懸濁液を調製後、⑧~⑩の操作を行う。

■ 試験器具・機器

日本コヴィディエン（株） ニューエンテラルフィーディングチューブ（8 フレンチ長さ：120cm）

Baxa 社製 Exacta-Med オーラルディスペンサー（透明）60mL サイズ

Baxa 社製 経口用ストップコック付三方活栓

テルモ製 サフィードコネクター100

堀場製作所製 pH メーター D-52

■ 結果

製品名	試験項目	結果
		水(約 55℃)
サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「トーワ」	崩壊性	10 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過する (全量を押し出せる)
	残存	ほとんどなし
	崩壊後 pH	pH 3.611
サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「トーワ」	崩壊性	水 (約 55℃) では崩壊不良であり、 製剤破壊後、水 (約 55℃) ・10 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過する (全量を押し出せる)
	残存	ほとんどなし

2. その他の関連資料

東和薬品株式会社 製品情報ホームページ

<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/product/index.php>



製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号