

2025年12月改訂(第2版)

2023年11月改訂(第1版)

貯法: 室温保存

有効期間: 3年

日本標準商品分類番号

873399

| | | |
|------|------------------|------------------|
| | 錠 50mg | 錠 100mg |
| 承認番号 | 22100AMX02176000 | 22100AMX02177000 |
| 販売開始 | 2009年11月 | 2009年11月 |

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「TCK」

サルポグレラート 塩酸塩錠100mg「TCK」

SARPOGRELATE HYDROCHLORIDE Tablets 「TCK」

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. 組成・性状

3.1 組成

| 販売名 | 有効成分(1錠中) | 添加剤 |
|------------------------|-----------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------|
| サルポグレラート塩酸塩錠50mg「TCK」 | サルポグレラート塩酸塩(日局) 50mg | 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 |
| サルポグレラート塩酸塩錠100mg「TCK」 | サルポグレラート塩酸塩(日局) 100mg | |

3.2 製剤の性状

| 販売名 | 外 形 | | | 色調 剤形 | 識別 コード |
|------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|-----------|
| | 直径(mm) | 厚さ(mm) | 重量(mg) | | |
| サルポグレラート塩酸塩錠50mg「TCK」 |  |  |  | 白色 フィルム コーティング錠 | TU 311 |
| サルポグレラート塩酸塩錠100mg「TCK」 |  |  |  | 白色 フィルム コーティング錠 | TU 312 |

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

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。

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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]

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。

9.5 妊婦

妊娠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]

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。

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。

9.8 高齢者

低用量(例えは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。

10. 相互作用

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。 | |

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。

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)

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)

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 |

| | 0.1～5% 未満 | 0.1% 未満 | 頻度不明 |
|-------|-------------------------------------------------|-------------------------|-------------------------|
| 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 | しづれ感、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。

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

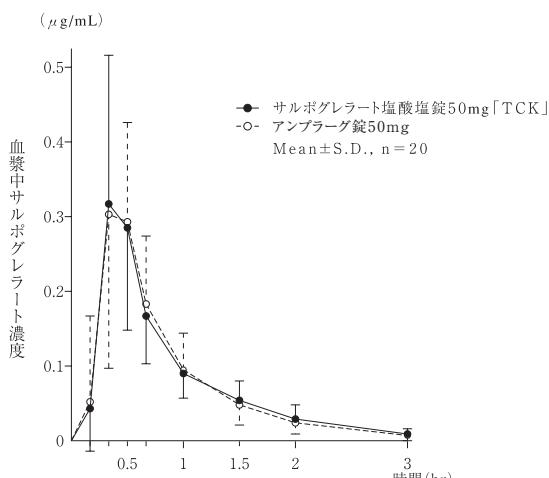
16.1.1 生物学的同等性試験

〈サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TCK」〉

サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TCK」 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 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、 $\log (0.8) \sim \log (1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|-------------------------|---------------------------------|--------------|-----------|-----------------------|
| | AUC _{0-3hr} (μg·hr/mL) | Cmax (μg/mL) | Tmax (hr) | T _{1/2} (hr) |
| サルポグレラート塩酸塩錠 50mg 「TCK」 | 0.24±0.07 | 0.39±0.17 | 0.43±0.10 | 0.76±0.33 |
| アンプラーグ錠 50mg | 0.24±0.09 | 0.40±0.16 | 0.41±0.11 | 0.65±0.18 |

(Mean±S.D., n=20)

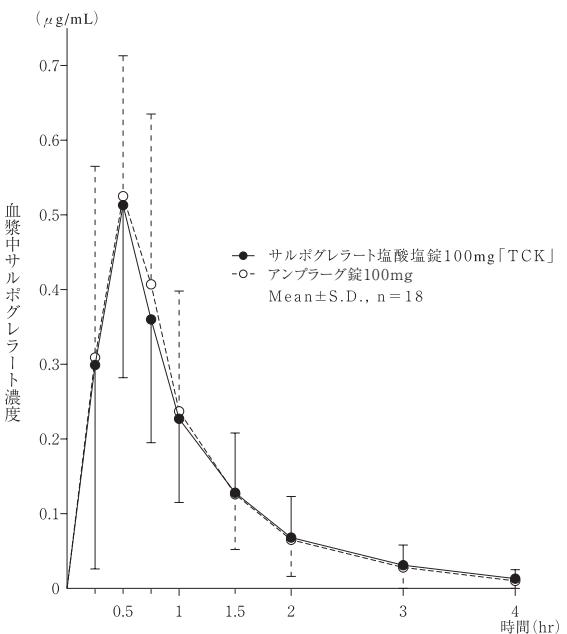


〈サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TCK」〉

サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TCK」とアンプラーグ錠 100mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (サルポグレラート塩酸塩 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 90% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log (0.8) \sim \log (1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|--------------------------|---------------------------------|--------------|-----------|-----------------------|
| | AUC _{0-4hr} (μg·hr/mL) | Cmax (μg/mL) | Tmax (hr) | T _{1/2} (hr) |
| サルポグレラート塩酸塩錠 100mg 「TCK」 | 0.53±0.16 | 0.62±0.18 | 0.53±0.15 | 0.95±0.25 |
| アンプラーグ錠 100mg | 0.54±0.17 | 0.64±0.20 | 0.51±0.13 | 0.97±0.28 |

(Mean±S.D., n=18)



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。

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³⁾。

16.3 分布

16.3.1 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しくは低値であった⁴⁾。

16.3.2 蛋白結合率

ヒト血清: 95% 以上⁵⁾ (in vitro、限外ろ過法)。

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⁶⁾。

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³⁾。

注) 本剤の承認用法は 1 日 3 回食後経口投与である。

