

# 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

日本標準商品分類番号

873399

貯法：室温保存  
使用期限：外箱に表示

	錠50mg	錠100mg
承認番号	22100AMX02132000	22100AMX02133000
薬価収載	2009年11月	2009年11月
販売開始	2009年11月	2009年11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】

##### ・組成

- \*\*サルポグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」：1錠中に日局サルポグレラート塩酸塩50mgを含有する。  
添加物として、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-マンニトールを含有する。
- \*\*サルポグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」：1錠中に日局サルポグレラート塩酸塩100mgを含有する。  
添加物として、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-マンニトールを含有する。

##### ・製剤の性状

品名	剤形	外形			性状
		直径(mm)	重量(mg)	厚さ(mm)	
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		50		白色
		7.6	約145	3.6	
[識別コード：SW SPT 50]					
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		100		白色
		8.6	約227	4.2	
[識別コード：SW SPT 100]					

#### 【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。]

##### 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		

##### 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、 $\gamma$ -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 <sup>(注1)</sup>	発疹、発赤、丘疹、痒疹、紅斑、蕁麻疹
肝臓 <sup>(注2)</sup>	肝機能障害(ビリルビン、AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、 $\gamma$ -GTP、LDHの上昇等)
出血傾向 <sup>(注2)</sup>	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

	頻度不明
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、授乳婦等への投与

- 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)。

## 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、更には穿孔をお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】

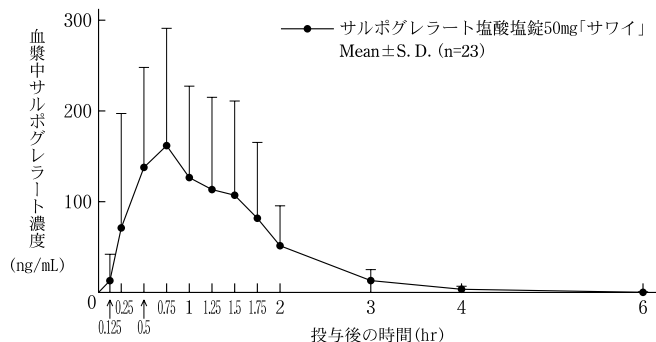
#### 1. 生物学的同等性試験

○サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」  
 サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(サルボグレラート塩酸塩として50mg)空腹時単回経口投与したときの薬物動態は以下のとおりであった。<sup>1)</sup>  
 (〔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〕に従い、ヒトを対象とした生物学的同等性試験により標準製剤(錠剤、50mg)との同等性が確認された旧処方製剤と、現処方製剤について実施した生物学的同等性試験におけるデータ)

本剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T1/2 (hr)	AUC0-6hr (ng·hr/mL)
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「サワイ」	270±141	0.9±0.5	0.6±0.2	248±116

(Mean±S. D.)

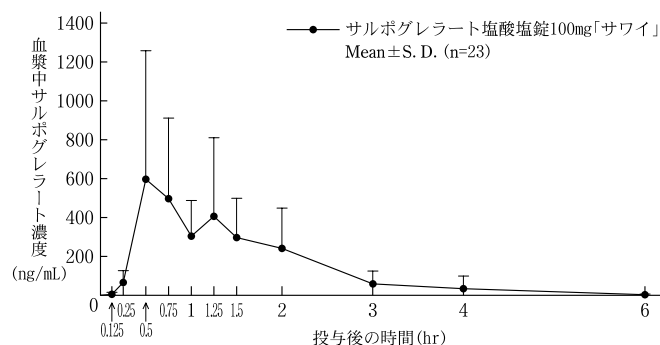


○サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」  
 サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(サルボグレラート塩酸塩として100mg)空腹時単回経口投与したときの薬物動態は以下のとおりであった。<sup>2)</sup>  
 (〔経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン〕に従い、ヒトを対象とした生物学的同等性試験により標準製剤(錠剤、100mg)との同等性が確認された旧処方製剤と、現処方製剤について実施した生物学的同等性試験におけるデータ)

本剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T1/2 (hr)	AUC0-6hr (ng·hr/mL)
サルボグレラート塩酸塩錠100mg「サワイ」	962±591	1.2±0.7	0.8±0.2	870±307

(Mean±S. D.)



血漿中濃度ならびに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。

#### 2. 溶出挙動

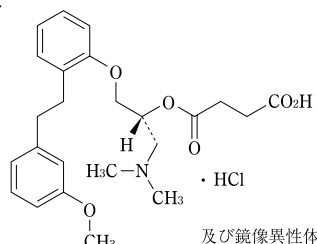
本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

### 【薬効薬理】

サルボグレラートは、血小板及び血管平滑筋の5-HT<sub>2</sub>受容体に対する特異的な拮抗作用により、血小板凝集抑制作用及び血管収縮抑制作用を示して末梢循環障害を改善する。

### 【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: (2RS)-1-Dimethylamino-3-[2-[2-(3-methoxyphenyl) ethyl] phenoxy] propan-2-yl hydrogen succinate monohydrochloride  
 分子式: C<sub>24</sub>H<sub>31</sub>NO<sub>6</sub> · HCl  
 分子量: 465.97  
 構造式:



性状: サルボグレラート塩酸塩は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

PTP包装(PTPシートをアルミビロー包装)したものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、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。<sup>3),4)</sup>

### 【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)、500錠(10錠×50)

### 【主要文献及び文献請求先】

#### \*\* \* 主要文献

1)、2) 沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]

3)、4) 沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

#### ・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

TEL:0120-381-999 FAX:06-6394-7355

製造販売元

**沢井製薬株式会社**

大阪市淀川区宮原5丁目2-30

D04 A121204

A

