

貯 法：室温保存
有効期間：3年

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「アメル」
サルポグレラート 塩酸塩錠 100mg「アメル」

Sarpogrelate Hydrochloride Tablets [AMEL]

	錠50mg	錠100mg
承認番号	22100AMX02170	22100AMX02171
販売開始	2009年11月	2009年11月

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、咯血、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	サルポグレラート塩酸塩錠50mg「アメル」	サルポグレラート塩酸塩錠100mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局サルポグレラート塩酸塩50mgを含有する。	1錠中、日局サルポグレラート塩酸塩100mgを含有する。
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、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

3.2 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
サルポグレラート塩酸塩錠50mg「アメル」	フィルムコーティング錠		KW SA50
	白色	直径：約 6.6mm 厚さ：約 3.2mm 質量：約 99mg	
サルポグレラート塩酸塩錠100mg「アメル」	フィルムコーティング錠		KW SA100
	白色	直径：約 8.1mm 厚さ：約 4.2mm 質量：約 198mg	

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。

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
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

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

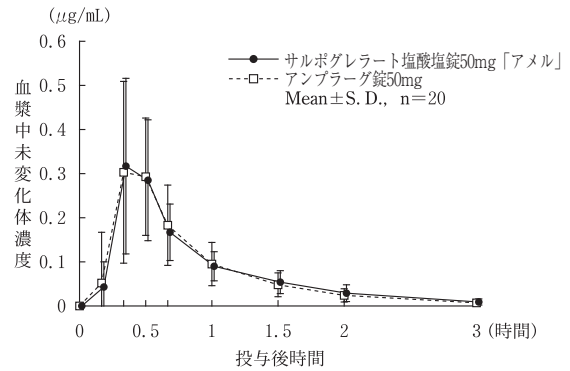
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「アメル」及びサルボグレラート塩酸塩錠100mg「アメル」と各標準製剤について、下記のとおりクロスオーバー法により健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。
(注) 本剤の承認された用法は、食後投与である。

	標準製剤	試験投与量
サルボグレラート塩酸塩錠50mg「アメル」	アンブラーグ錠50mg	それぞれ1錠（サルボグレラート塩酸塩として50mg）
サルボグレラート塩酸塩錠100mg「アメル」	アンブラーグ錠100mg	それぞれ1錠（サルボグレラート塩酸塩として100mg）

薬物動態パラメータ（生物学的同等性）

	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50mg「アメル」	0.24 ± 0.07	0.39 ± 0.17	0.43 ± 0.10	0.76 ± 0.33
アンブラーグ錠50mg	0.24 ± 0.09	0.40 ± 0.16	0.41 ± 0.11	0.65 ± 0.18

(Mean \pm S. D., n=20)

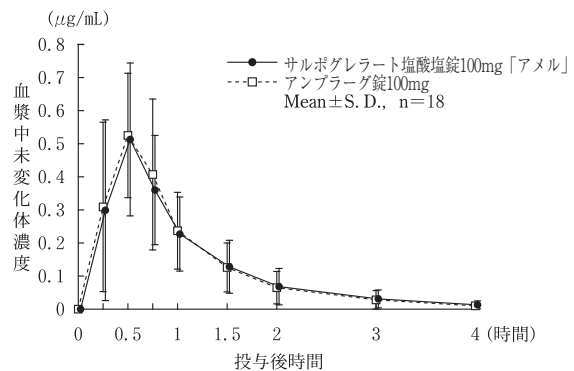


血漿中未変化体濃度（生物学的同等性）

薬物動態パラメータ（生物学的同等性）

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₄₎ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	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「アメル」	0.53 ± 0.16	0.62 ± 0.18	0.53 ± 0.15	0.95 ± 0.25
アンブラーグ錠100mg	0.54 ± 0.17	0.64 ± 0.20	0.51 ± 0.13	0.97 ± 0.28

(Mean \pm S. D., n=18)



血漿中未変化体濃度（生物学的同等性）

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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

本剤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²⁾⁻⁵⁾。

19. 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

(2*R*,5*S*)-1-Dimethylamino-3-[2-[2-(3-methoxyphenyl)ethyl]phenoxy]propan-2-yl hydrogen succinate monohydrochloride
分子式

C₂₄H₃₁NO₆ · HCl

分子量

465.97

性状

白色の結晶性の粉末である。

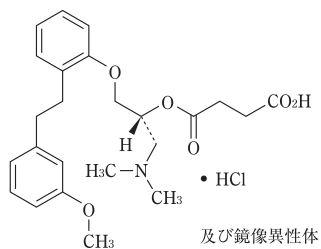
水又はエタノール（99.5）に溶けにくい。

0.01mol/L塩酸試液に溶ける。

本品の水溶液（1→100）は旋光性を示さない。

結晶多形が認められる。

構造式



22. 包装

〈サルボグレラート塩酸塩錠50mg「アメル」〉

100錠[10錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]

〈サルボグレラート塩酸塩錠100mg「アメル」〉

100錠[10錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]

23. 主要文献

- 1) 社内資料：生物学的同等性試験[錠50mg、錠100mg]
- 2) 原啓人, 他：Thromb Haemost. 1991；65 (4)：415-420
- 3) 原啓人, 他：薬理と治療. 1991；19：611-618
- 4) 土橋洋史, 他：J Pharmacobiodyn. 1991；14 (8)：461-466
- 5) 丸山恵子, 他：J Pharmacobiodyn. 1991；14 (4)：177-181

24. 文献請求先及び問い合わせ先

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口

〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

共和薬品工業株式会社

大阪市北区中之島3-2-4