

アルドース還元酵素阻害剤

エパルレスタット錠50「EK」

Epalrestat tab.50「EK」

〈エパルレスタット錠〉

承認番号	21700AMZ00505000
薬価収載	2005年7月
販売開始	2005年7月

〔貯法〕 室温保存

〔使用期限〕 外箱又はラベルに表示の使用期限内に使用すること。

〔注〕 注意—医師等の処方せんにより使用すること

【組成・性状】

販売名	エパルレスタット錠50「EK」		
有効成分 (1錠中)	エパルレスタット50mg		
添加物	含水二酸化ケイ素、クロスカルメロースナトリウム、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、プロピレングリコール、マクロゴール4000、D-マンニトール		
性状・剤形	白色のフィルムコーティング錠		
外形	表	裏	側面
	直径(mm)・質量(mg)・厚さ(mm) 約6.7 約120 約3.7		
識別コード	EK03		

2) 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全 劇症肝炎、著しいAST (GOT)・ALT (GPT)の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸、肝不全があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような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 [※]	発疹、痒疹、紅斑、水疱等
肝臓	AST (GOT)・ALT (GPT)・ γ -GTPの上昇等、ビリルビン上昇
消化器	胸やけ、腹痛、嘔気、嘔吐、下痢、食欲不振、腹部膨満感、便秘
腎臓	尿量減少、頻尿、BUN上昇、クレアチニン上昇
血液	貧血、白血球減少
その他	しびれ、脱毛、紫斑、CK (CPK)上昇、発熱、倦怠感、めまい、頭痛、こわばり、脱力感、四肢疼痛、胸部不快感、動悸、浮腫、ほてり

〔注〕 発現した場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

【効能・効果】

糖尿病性末梢神経障害に伴う自覚症状（しびれ感、疼痛）、振動覚異常、心拍変動異常の改善
(糖化ヘモグロビンが高値を示す場合)

【用法・用量】

通常、成人にはエパルレスタットとして1回50mgを1日3回毎食前に経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- 糖尿病治療の基本である食事療法、運動療法、経口血糖降下剤、インスリン等の治療を行った上でなお、糖化ヘモグロビンが高値を示す患者に対して適用を考慮する。
- 本剤の投与の対象となる患者の糖化ヘモグロビンは、HbA_{1c}値7.5%以上（安定型HbA_{1c}値では6.6%に相当する）を目安とする。
- 不可逆的な器質の変化を伴う糖尿病性末梢神経障害の患者では効果が確立されていない。
- 投与中は経過を十分に観察し、12週間投与して効果が認められない場合には他の適切な治療に切り換えること。

2. 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）

- 血小板減少 血小板減少があらわれることがあるので、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。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。
〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- 本剤投与中は授乳を避けさせること。
〔動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

5. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与により尿は黄褐色又は赤色を呈するため、ビリルビン及びケトン体の尿定性試験に影響することがある。

6. 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）

7. その他の注意

本剤の投与により、黄褐色又は赤色の着色尿があらわれることがある。
〔本剤及び代謝物の影響による。〕

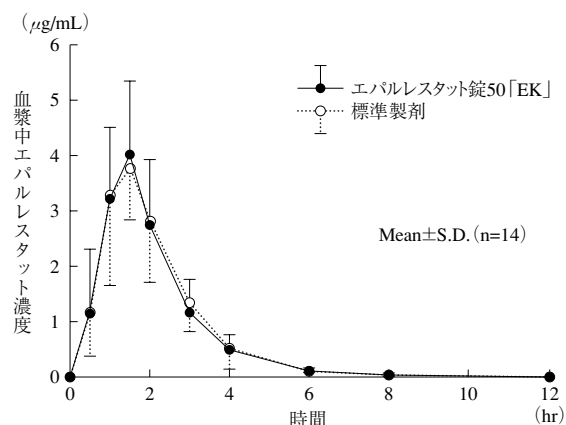
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

エパルレスタット錠50「EK」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エパルレスタットとして50mg）を健康成人男性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、両剤の生物学的同等性が確認された。(①) 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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-12hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
エパルレスタット錠50「EK」	8.44±2.54	4.36±1.17	1.3±0.3	0.9±0.2
標準製剤	8.63±1.99	4.31±1.08	1.3±0.3	0.9±0.2

(Mean±S.D., n=14)



1 錠投与時の平均血漿中濃度推移

2. 溶出挙動

エパルレスタット錠50「EK」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたエパルレスタットの溶出規格に適合していることが確認されている。(②)

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エパルレスタット (Epalrestat)

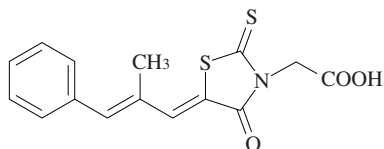
化学名：5-[(1Z,2E)-2-Methyl-3-phenylpropenylidene]-4-oxo-2-thioxo-3-thiazolidineacetic acid

分子式： $C_{15}H_{13}NO_3S_2$

分子量：319.40

融点：222～227℃

構造式：



物理化学的性状：

エパルレスタットは、黄色～だいたい色の結晶又は結晶性の粉末である。

本品は、テトラヒドロフランに溶けやすく、*N,N*-ジメチルホルムアミドにやや溶けやすく、メタノール、エタノール (95) 又は酢酸エチルに溶けにくく、水にはほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

加速試験

加速試験 (40℃、相対湿度75%、6ヵ月) の結果、エパルレスタット錠50「EK」(最終包装) は、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。(③)

【包装】

エパルレスタット錠50「EK」……………500錠(バラ)
100錠(PTP)・500錠(PTP)

※【主要文献】

- ① 生物学的同等性に関する資料 (小林化工株式会社 社内資料)
- ② 溶出性に関する資料 (小林化工株式会社 社内資料)
- ③ 安定性に関する資料 (小林化工株式会社 社内資料)

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。

エルメッド エーザイ株式会社 FAX 03-3980-6634
〒170-0013 東京都豊島区東池袋3-23-5

※【商品情報お問い合わせ先】

エルメッド エーザイ株式会社 商品情報センター ☎0120-223-698

エーザイ株式会社 お客様ホットライン ☎0120-419-497

製造販売元



小林化工株式会社

福井県あわら市矢地5-15

販売元



エルメッド エーザイ株式会社

東京都豊島区東池袋3-23-5

※販売提携



エーザイ株式会社

東京都文京区小石川4-6-10