

2024年10月改訂（第8版）

日本標準商品分類番号  
873999

## 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2008に準拠して作成（一部2018に準拠）

アルドース還元酵素阻害剤  
処方箋医薬品<sup>注</sup>

日本薬局方 エパルレスタット錠  
**エパルレスタット錠50mg「VTRS」**  
EPALRESTAT Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1錠中 日局 エパルレスタット50.0mg
一般名	和名：エパルレスタット(JAN) 洋名：Epalrestat(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2011年 7月15日 薬価基準収載年月日：2022年 6月 1日 販売開始年月日：2011年12月 6日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販売元：ヴィアトリス製薬合同会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 <a href="https://www.viatris-e-channel.com/">https://www.viatris-e-channel.com/</a>

本IFは2024年7月改訂の電子化された添付文書の記載に基づき改訂した。最新の添付文書情報は、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」<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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

### 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 判、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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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。

(2008 年 9 月)

# 目次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>
1. 開発の経緯 .....	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>
1. 販売名 .....	2
2. 一般名 .....	2
3. 構造式又は示性式 .....	2
4. 分子式及び分子量 .....	2
5. 化学名（命名法） .....	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3
7. CAS登録番号 .....	3
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>
1. 物理化学的性質 .....	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4
3. 有効成分の確認試験法 .....	4
4. 有効成分の定量法 .....	4
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>
1. 剤形 .....	5
2. 製剤の組成 .....	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	5
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	6
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	9
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	9
7. 溶出性 .....	10
8. 生物学的試験法 .....	11
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	11
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	12
11. 力価 .....	12
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	12
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 .....	12
14. その他 .....	12
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>13</b>
1. 効能又は効果 .....	13
2. 効能又は効果に関連する注意 .....	13
3. 用法及び用量 .....	13
4. 用法及び用量に関連する注意 .....	13
5. 臨床成績 .....	13
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>15</b>
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 .....	15
2. 薬理作用 .....	15
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>17</b>
1. 血中濃度の推移・測定法 .....	17
2. 薬物速度論的パラメータ .....	19
3. 吸収 .....	19
4. 分布 .....	19
5. 代謝 .....	20

6. 排泄 .....	20
7. 透析等による除去率 .....	20
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 .....</b>	<b>21</b>
1. 警告内容とその理由 .....	21
2. 禁忌内容とその理由 .....	21
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 .....	21
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 .....	21
5. 重要な基本的注意とその理由 .....	21
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....	21
7. 相互作用 .....	22
8. 副作用 .....	22
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	23
10. 過量投与 .....	23
11. 適用上の注意 .....	23
12. その他の注意 .....	24
<b>IX. 非臨床試験に関する項目 .....</b>	<b>25</b>
1. 薬理試験 .....	25
2. 毒性試験 .....	25
<b>X. 管理的事項に関する項目 .....</b>	<b>26</b>
1. 規制区分 .....	26
2. 有効期間又は使用期限 .....	26
3. 貯法・保存条件 .....	26
4. 薬剤取扱い上の注意点 .....	26
5. 承認条件等 .....	26
6. 包装 .....	26
7. 容器の材質 .....	26
8. 同一成分・同効薬 .....	26
9. 国際誕生年月日 .....	27
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 .....	27
11. 薬価基準収載年月日 .....	27
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 .....	27
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 .....	27
14. 再審査期間 .....	27
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 .....	27
16. 各種コード .....	27
17. 保険給付上の注意 .....	27
<b>XI. 文献 .....</b>	<b>28</b>
1. 引用文献 .....	28
2. その他の参考文献 .....	28
<b>XII. 参考資料 .....</b>	<b>29</b>
1. 主な外国での発売状況 .....	29
2. 海外における臨床支援情報 .....	29
<b>XIII. 備考 .....</b>	<b>30</b>
その他の関連資料 .....	30

---

# I. 概要に関する項目

---

## 1. 開発の経緯

エパルレスタットは、糖尿病神経障害の発症にソルビトールの増加とアルドース還元酵素が関与することに着目し、開発された化合物である。本剤は、アルドース還元酵素を特異的に阻害し、高血糖の持続により引き起こされた神経内ソルビトールの蓄積を抑制することにより、糖尿病性末梢神経障害における自覚症状及び神経機能異常を改善する。

エパルレスタット錠 50mg「ファイザー」は、ファイザー株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2011 年 7 月に承認を得た製剤である。

2022 年 6 月、マイラン製薬株式会社からマイラン EPD 合同会社（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同株式会社）へ製造販売移管したため、販売名をエパルレスタット錠 50mg「V T R S」に変更した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

### 1. 糖尿病性末梢神経障害を改善するアルドース還元酵素阻害剤

エパルレスタットはアルドース還元酵素を特異的に阻害し、神経内ソルビトールの蓄積を抑制することにより、糖尿病性末梢神経障害における自覚症状及び神経機能異常を改善する。

（「VI-2. (1) 作用部位・作用機序」の項参照）

### 2. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み

1) 包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント\*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている<sup>1)~3)</sup>。

2) 規格取り違えを防ぐための試みとして複数規格ある含量表示に上下の記号（▲▼）をラベル・小函に表記した。エパルレスタットは単一規格であるため、記載含量(50mg)を▲▼で囲んだ。

### 3. 重大な副作用として、血小板減少、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全が報告されている。

（「VIII-8. 副作用」の項参照）

\*「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

---

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

(1) 和名

エパルレストアット錠 50mg 「V T R S」

(2) 洋名

EPALRESTAT Tablets

(3) 名称の由来

有効成分であるエパルレストアットに剤形、含量及び「V T R S」を付した。

### 2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

エパルレストアット (JAN)

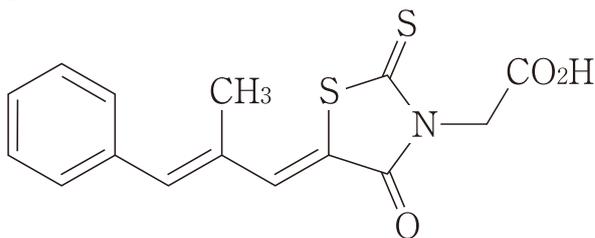
(2) 洋名 (命名法)

Epalrestat (JAN, INN)

(3) ステム

アルドース還元酵素阻害薬: -restat

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式: C<sub>15</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>3</sub>S<sub>2</sub>

分子量: 319.40

### 5. 化学名 (命名法)

2-[(5Z)-5-[(2E)-2-Methyl-3-phenylprop-2-en-1-ylidene]-4-oxo-2-thioxothiazolidin-3-yl]acetic acid

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

7. CAS 登録番号

82159-09-9

---

### III. 有効成分に関する項目

---

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状<sup>4)</sup>

黄色～橙色の結晶又は結晶性の粉末である。  
結晶多形が認められる。

##### (2) 溶解性

*N,N*-ジメチルホルムアミドにやや溶けやすく、メタノール又はエタノール（99.5）に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：222～227℃

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

光により徐々に退色し、分解する。  
結晶多形が認められる。

#### 3. 有効成分の確認試験法<sup>4)</sup>

日本薬局方「エパルレスタット」の確認試験法による。

#### 4. 有効成分の定量法<sup>4)</sup>

日本薬局方「エパルレスタット」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、規格及び性状

販売名	外形			色調等
	上面	下面	側面	
エパルレスタット錠 50mg「V T R S」				白色 フィルムコーティング錠
	直径 7mm	厚さ 2.9mm	重量 120mg	

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

EP 50

#### (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

1錠中 日局 エパルレスタット 50.0mg

#### (2) 添加物

D-マンニトール、ポビドン、軽質無水ケイ酸、硬化油、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、ポリソルベート 80、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、プロピレングリコール、カルナウバロウ

#### (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

加速試験<sup>5)</sup>

試験条件：40±1℃、75±5%RH

包装形態（PTP 充てん）

項目及び規格		試験開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験	呈色反応	適合	適合	適合	適合
	紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合
	薄層クロマトグラフィー	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験		適合	—	—	適合
溶出試験		適合	適合	適合	適合
定量試験（95.0～105.0%）		99.5～101.4	98.0～101.3	98.9～102.7	98.7～101.1
純度試験		適合	—	—	適合
水分試験（%）		1.1～1.2	1.1～1.2	1.1～1.2	1.1～1.2
微生物 限度試験	細菌	適合	—	—	適合
	真菌	適合	—	—	適合
	大腸菌	適合	—	—	適合
	サルモネラ菌	適合	—	—	適合
	緑膿菌	適合	—	—	適合
	黄色ブドウ球菌	適合	—	—	適合

ロット数：3

長期保存試験<sup>6)</sup>

試験条件：25±1°C、60±5%RH

包装形態（PTP 充てん）

項目及び規格		試験開始時	6ヵ月後	1年後	2年後	3年後
性状（白色のフィルムコーティング錠）		適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	呈色反応	適合	—	—	—	適合
	紫外可視吸光度測定法	適合	—	—	—	適合
	薄層クロマトグラフィー	適合	—	—	—	適合
製剤均一性試験		適合		—	—	適合
溶出試験		適合	適合	適合	適合	適合
定量試験（95.0～105.0%）		99.2～99.9	99.1～99.9	98.1～99.5	96.3～97.2	95.1～96.6
純度試験		適合	適合	適合	適合	適合
水分試験（%）		0.9～1.0	1.1～1.4	1.0～1.1	0.8～1.1	1.1～1.3
微生物 限度試験	細菌	適合	適合	—	—	—
	真菌	適合	適合	—	—	—
	大腸菌	適合	適合	—	—	—
	サルモネラ菌	適合	適合	—	—	—
	緑膿菌	適合	適合	—	—	—
	黄色ブドウ球菌	適合	適合	—	—	—
硬度（kg）		11.02～11.61	10.02～11.39	9.91～10.13	10.43～10.99	11.07～11.98

ロット数：3

長期保存試験（室温、3年間）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、エパルレスタット錠 50mg「V T R S」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

無包装状態の安定性<sup>7)</sup>

【試験方法】

保存条件：

- ①40℃/75%RH (シヤール開放)
- ②25℃/60%RH (シヤール開放)
- ③25℃/60%RH、約 120 万 Lux・hr (シヤール開放)

測定時期：①、②開始時、1、3 ヶ月後

③開始時、1 ヶ月後試験項目：性状、含量、溶出性

試験回数：性状 1 回、含量 3 回、溶出性 1 回 (6 ベッセル)

【試験結果】

製品名：エパルレスタット錠 50mg 「V T R S」

① [40℃/75%RH]

試験項目	測定時期		
	開始時	1ヵ月	3ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠 <sup>※1</sup>
含量 (%) [残存率 (%) ]	100.7 [100.0]	94.3 [93.6]	96.3 [95.6]
溶出性 [最小-最大 (%) ]	79.4-84.2	79.9-84.9	74.8-83.1

※1 フィルム表面に変色 (黄色) あり

② [25℃/60%RH]

試験項目	測定時期		
	開始時	1ヵ月	3ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量 (%) [残存率 (%) ]	100.7 [100.0]	96.2 [95.5]	96.8 [96.1]
溶出性 [最小-最大 (%) ]	79.4-84.2	82.1-86.9	78.7-87.9

③ [約 120 万 Lux・hr]

試験項目	測定時期	
	開始時	1ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠 <sup>※2</sup>
含量 (%) [残存率 (%) ]	100.7 [100.0]	96.1 [95.4]
溶出性 [最小-最大 (%) ]	79.4-84.2	82.2-84.9

※2 フィルム表面に変色 (極うすい黄色) あり

注：本剤の無包装状態での保存は弊社としては推奨していない。

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

溶出挙動<sup>8)</sup>

エパールスタット錠 50mg「V T R S」と標準品\*の溶出試験を実施した結果、エパールスタット錠 50mg「V T R S」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「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」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

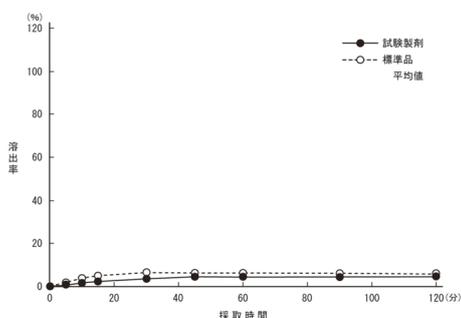
\*：エパールスタット錠 50mg「V T R S」の処方変更前製剤

試験条件

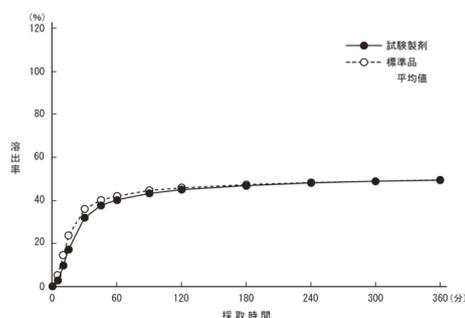
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液) pH5.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液) pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液) 水	900mL	50rpm
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)	900mL	100rpm

n=12

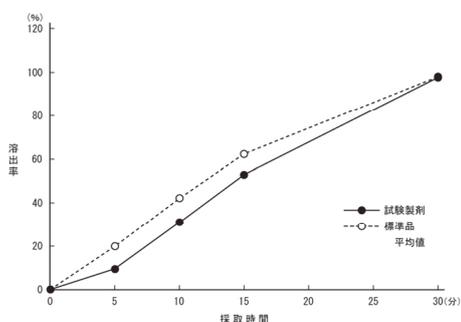
pH1.2 (50rpm)



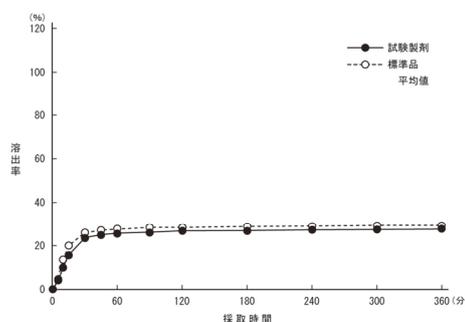
pH5.0 (50rpm)



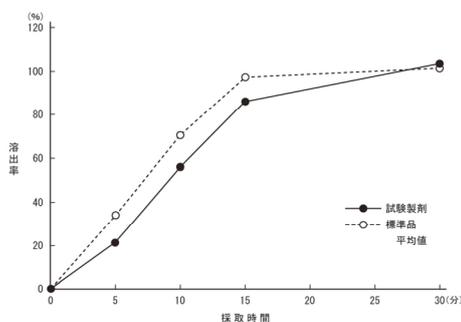
pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)



pH6.8 (100rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)								
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	90分	120分	360分
pH1.2 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	0.5± 0.131	1.4± 0.358	2.0± 0.361	3.4± 0.762	4.4± 0.520	4.3± 0.355	4.3± 0.299	4.2± 0.307	—
	標準品	1.6± 0.469	3.6± 0.488	4.9± 0.394	6.3± 0.304	6.1± 0.259	6.0± 0.345	5.8± 0.332	5.7± 0.270	—
pH5.0 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	3.4± 1.005	10.2± 1.804	17.4± 2.057	32.6± 1.544	38.1± 1.783	40.9± 2.124	43.9± 2.467	45.6± 2.673	50.0± 3.245
	標準品	5.7± 1.330	15.1± 2.075	24.1± 1.796	36.7± 0.719	40.6± 0.532	42.6± 0.656	45.1± 0.692	46.3± 0.680	50.0± 0.824
pH6.8 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	9.3± 3.188	31.0± 4.841	52.7± 7.076	97.5± 1.861	—	—	—	—	—
	標準品	19.8± 1.595	42.0± 6.109	62.4± 10.729	97.7± 1.859	—	—	—	—	—
水 50rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	3.6± 0.735	10.0± 1.152	15.4± 1.224	23.3± 0.728	24.9± 0.686	25.6± 0.676	26.2± 0.691	26.6± 0.700	27.6± 0.724
	標準品	4.7± 1.714	13.3± 2.734	19.8± 1.891	25.8± 0.915	26.9± 0.877	27.4± 0.794	28.1± 0.787	28.3± 0.786	29.4± 0.817
pH6.8 100rpm	エパールスタット錠 50mg「VTRS」	21.0± 4.118	55.8± 4.010	86.0± 3.884	103.5± 1.458	—	—	—	—	—
	標準品	33.6± 2.579	70.8± 3.655	97.3± 1.791	101.3± 1.058	—	—	—	—	—

平均±SD n=12

#### 公的溶出試験

エパールスタット錠 50mg「VTRS」は、日本薬局方 医薬品各条に定められたエパールスタット錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

(規格：45分で70%以上)

試験液	判定時点	溶出率 (%)		
		ロットA	ロットB	ロットC
日本薬局方溶出試験 第2液	45分	83.4~91.8	83.0~91.2	83.6~89.1
判定		適合	適合	適合

各ロット n=6

#### 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<sup>4)</sup>

日本薬局方 医薬品各条「エパールスタット錠」の確認試験法による。

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法<sup>4)</sup>

日本薬局方 医薬品各条「エパルレスタット錠」の定量法による。  
液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当資料なし

---

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 効能又は効果

#### 4. 効能又は効果

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）

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

- 5.1 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。
- 5.2 本剤の投与の対象となる患者の糖化ヘモグロビンは、HbA1c (NGSP 値) 7.0%以上 (JDS 値 6.6%以上) を目安とする。
- 5.3 不可逆的な器質的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。

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

#### 6. 用法及び用量

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。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

「V-5. (3) 用量反応探索試験」の項参照

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### 7. 用法及び用量に関連する注意

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。

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

忍容性試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

二重盲検比較試験においてエパルレストアット錠の有用性が認められている。

また、糖尿病性末梢神経障害に伴う自覚症状及び神経機能の改善度について対照群との間に有意な差が認められている<sup>9)</sup>。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

---

## 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

該当しない

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

エパルレスタット錠はアルドース還元酵素を特異的に阻害し、神経内ソルビトールの蓄積を抑制することにより、糖尿病性末梢神経障害における自覚症状及び神経機能異常を改善する<sup>4)、10)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) アルドース還元酵素阻害作用 (*in vitro*)

- ①ラットの坐骨神経、水晶体、網膜、ウサギ水晶体及びヒト胎盤より抽出したアルドース還元酵素に対して強い阻害作用が認められている。50%阻害濃度は $1.0\sim 3.9\times 10^{-8}\text{M}$ である<sup>10~12)</sup>。
- ②アルドース還元酵素以外の糖代謝系酵素に対しては $10^{-5}\text{M}$ でほとんど阻害作用を示さない<sup>10)</sup> (*in vitro*)。
- ③エパルレスタット錠の酵素阻害様式は偏拮抗阻害であり、また、その作用は可逆的である<sup>10)、11)</sup>。

##### 2) ソルビトール蓄積抑制作用

- ①糖尿病性神経障害患者にエパルレスタット 150mg/日を4週間経口投与すると、赤血球内ソルビトール値の有意な低下が認められている<sup>13)、14)</sup>。
- ②高濃度グルコース存在下で、ラットの坐骨神経、赤血球、水晶体及びヒト赤血球内ソルビトールの蓄積を抑制する。50%抑制濃度は $1.5\sim 5\times 10^{-6}\text{M}$ である<sup>10)、11)</sup> (*in vitro*)。ストレプトゾトシン糖尿病ラットの坐骨神経内ソルビトールの蓄積を抑制する<sup>15)、16)</sup>。また、高フルクトース食を負荷したストレプトゾトシン糖尿病ラットの坐骨神経、網膜及び赤血球内ソルビトール蓄積を抑制する<sup>17)</sup>。

##### 3) 運動神経伝導速度改善作用

- ①ストレプトゾトシン糖尿病ラットの尾部神経の運動神経伝導速度の低下を抑制<sup>15)</sup>あるいは改善<sup>16)</sup>する。また、高フルクトース食を負荷したストレプトゾトシン糖尿病ラットの尾部神経の運動神経伝導速度を改善する<sup>18)</sup>。
- ②自然発症糖尿病ラットの尾部神経の運動神経伝導速度を改善する<sup>19)</sup>。

##### 4) 自律神経機能に対する作用

- ①ストレプトゾトシン糖尿病ラットの副交感神経機能の指標である心電図 R-R 間隔変動の異常を抑制する<sup>20)</sup>。
- ②ストレプトゾトシン糖尿病ラットの交感神経機能の指標である心臓のノルエピネフリンの turn-over の低下を改善する<sup>21)</sup>。

##### 5) 神経の形態学的変化に対する作用

- ①ストレプトゾトシン糖尿病ラットの坐骨神経の総有髄神経線維密度の低下を抑制する<sup>20)</sup>。また、腓腹神経の髄鞘の厚さ、軸索面積及び軸索真円率の低下を抑制する<sup>22)</sup>。
- ②ストレプトゾトシン糖尿病ラットの軸索流の異常を改善する<sup>23)</sup>。

6) 神経血流に対する作用

ストレプトゾトシン糖尿病ラットの坐骨神経血管の血流を有意に改善し、虚血状態をあらわす坐骨神経内の乳酸含量の上昇を有意に抑制する<sup>24)</sup>。

7) 神経ミオイノシトール含量に対する作用

高フルクトース食を負荷したストレプトゾトシン糖尿病ラットの坐骨神経ミオイノシトール含量の低下を抑制する<sup>22)、24)</sup>。

(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

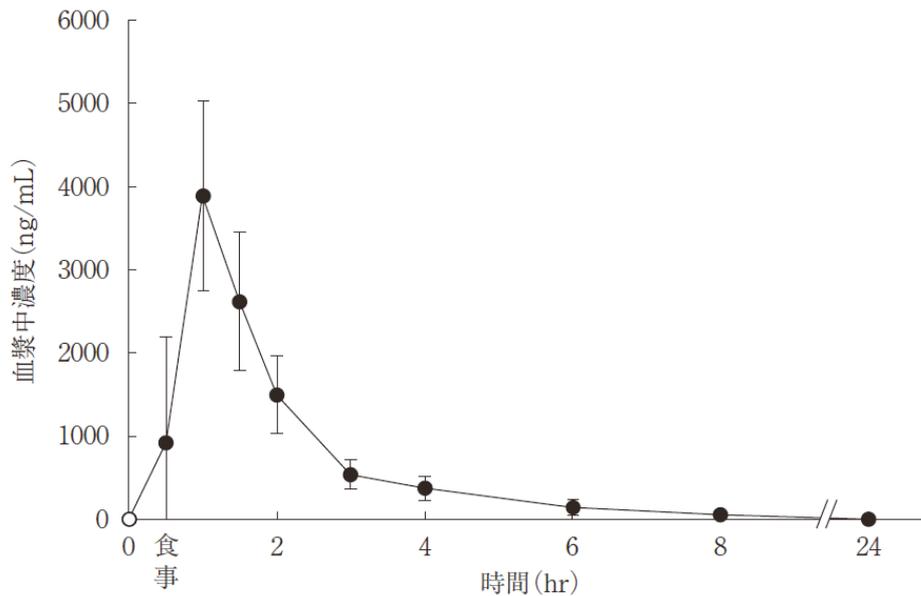
#### (2) 最高血中濃度到達時間<sup>25)</sup>

1.708±0.624 (hr)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 1) 単回投与

健康成人 10 例に 50mg を食前 30 分に単回経口投与すると、血漿中濃度は 1 時間後に最高に達し、その濃度は 3.9 μg/mL である。血漿中半減期は 1.8 時間で、血漿中濃度は 4 時間後に 0.37 μg/mL となる<sup>26)</sup>。



T <sub>max</sub> (hr)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	AUC <sub>0-∞</sub> (ng · hr/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)
1.05 ± 0.16	3896 ± 1132	6435 ± 1018	1.844 ± 0.387

平均値±標準偏差

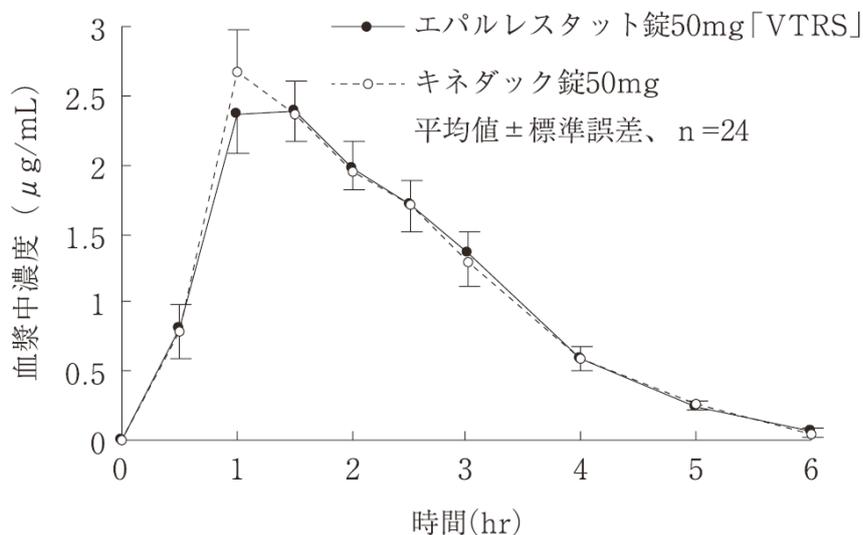
2) 生物学的同等性試験<sup>25)</sup>

エパルレスタット錠 50mg「VTRS」とキネダック錠 50mg 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）、健康成人男子 24 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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。

投与薬剤	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC <sub>0-6</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	$C_{max}$ ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	AUC <sub><math>\infty</math></sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	MRT (hr)	kel
エパルレスタット錠 50mg「VTRS」	1 錠 (50mg)	6.52 ±1.85	3.22 ±0.96	6.72 ±1.79	1.708 ±0.624	約 0.9	2.194 ±0.423	0.850 ±0.256
キネダック錠 50mg	1 錠 (50mg)	6.56 ±1.58	3.44 ±0.96	6.75 ±1.54	1.542 ±0.690	約 0.9	2.139 ±0.413	0.822 ±0.189

平均値±標準偏差 (n=24)

血漿中エパルレスタットの濃度推移



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) コンパートメントモデル

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<sup>25)</sup>

0.850±0.256

### (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

ヒト血清に対する蛋白結合率は90.1%である<sup>27)</sup> (*in vitro*、平衡透析法)。

## 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

該当資料なし

<参考>

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) 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

尿中主要代謝物はベンゼン環が水酸化を受けた一水酸化体及び二水酸化体の硫酸抱合体である<sup>27)</sup>。

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

設定されていない

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V-2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V-4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

## (6) 授乳婦

### 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）で乳汁中へ移行することが報告されている<sup>17)</sup>。

## (7) 小児等

### 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。

## (8) 高齢者

設定されていない

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

### (2) 併用注意とその理由

設定されていない

## 8. 副作用

### 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。

### (1) 重大な副作用と初期症状

#### 11.1 重大な副作用

##### 11.1.1 血小板減少（頻度不明）

##### 11.1.2 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全

劇症肝炎（頻度不明）、著しいAST・ALTの上昇等を伴う肝機能障害（0.1%未満）、黄疸（頻度不明）、肝不全（頻度不明）があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～0.5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	—	発疹、そう痒、紅斑、水疱等	—
肝臓	AST・ALT・ $\gamma$ -GTPの上昇等	ビリルビン上昇	—
消化器	腹痛、嘔気	嘔吐、下痢、食欲不振、腹部膨満感、便秘	胸やけ
腎臓	—	BUN上昇、クレアチニン上昇	尿量減少、頻尿
血液	—	貧血、白血球減少	—
その他	—	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	しびれ、脱毛、紫斑、CK上昇、発熱

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 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。 [15.1 参照]

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

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。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

#### 15.1 臨床使用に基づく情報

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。 [12. 参照]

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」参照

#### (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

該当資料なし

#### (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：エパルレスタット錠 50mg 「V T R S」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：日局 エパルレスタット 該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

有効期間：3年

(「IV-4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱いについて

該当しない

#### (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII-11. 適用上の注意」の項参照

患者向医薬品ガイド：無し、くすりのしおり：有り

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [10錠 (PTP) ×50]

### 7. 容器の材質

PTPシート：アルミ、塩化ビニル

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：キネダック錠 50mg (アルフレッサ ファーマ株式会社) 等

同効薬：なし

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造承認年月日：2011年7月15日

承認番号：22300AMX00902

11. 薬価基準収載年月日

2022年6月1日

12. 効能又は効果追加、用法及び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、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT（9桁）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
エパルレスタット錠 50mg 「VTRS」	120880103	統一名：3999013F1010 個別：3999013F1410	統一名：622311100 個別：622088003

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (1) - 明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較 -」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：2009；25
- 2) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (2) - 低視力状態での可視性の比較 -」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：2009；29
- 3) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (3) - 低コントラスト状態での可視性の比較 -」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：2009；33
- 4) 第十八改正 日本薬局方解説書. 廣川書店. 2021：C-1003-1009
- 5) 社内資料：安定性試験（加速試験）（エパルレスタット錠 50mg「VTR S」）
- 6) 社内資料：長期保存試験（エパルレスタット錠 50mg「VTR S」）
- 7) 社内資料：無包装状態の安定性（エパルレスタット錠 50mg「VTR S」）
- 8) 社内資料：溶出試験（エパルレスタット錠 50mg「VTR S」）
- 9) 後藤由夫ほか：医学のあゆみ. 1990；152：405-416
- 10) 寺島宏ほか：現代医療. 1986；18（増Ⅲ）：1-10
- 11) 寺島宏ほか：J Pharmacol Exp Ther. 1984；229：226-230
- 12) 川村雅範ほか：有機合成化学協会誌. 1997；55（7）：651-657
- 13) 中埜幸治ほか：医学のあゆみ. 1990；152：137-142
- 14) 堀田饒ほか：現代医療. 1987；19（8）：2587-2593
- 15) 吉川隆一ほか：Metabolism. 1984；33：212-214
- 16) 吉川隆一ほか：Diabetologia. 1983；24：290-292
- 17) 宮本茂敏ほか：現代医療. 1986；18（増Ⅲ）：40-50
- 18) 堀田饒ほか：Diabetologia. 1985；28：176-180
- 19) 柿崎正栄ほか：現代医療. 1984；16：1274-1276
- 20) 浅野次義ほか：糖尿病. 1983；26：1105-1111
- 21) 吉田俊秀ほか：Diabetes. 1987；36：6-13
- 22) 堀田饒ほか：糖尿病. 1986；29（Suppl. 1）：22-25
- 23) 鬼頭昭三ほか：Hiroshima J Med Sci. 1986；35：109-115
- 24) 安田斎ほか：Diabetes. 1989；38：832-838
- 25) 社内資料：生物学的同等性試験（エパルレスタット錠 50mg「VTR S」）
- 26) 町井浩司ほか：現代医療. 1996；28：1273-1279
- 27) 宮本茂敏ほか：現代医療. 1986；18（増Ⅲ）：82-97

### 2. その他の参考文献

参考文献) 藤島 一郎 監修：内服薬経管投与ハンドブック第 2 版：2006；37，東京，じほう

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XIII. 備考

### その他の関連資料

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)

本剤の粉砕後の安定性並びに簡易懸濁法試験（崩壊懸濁試験及び通過性試験）の報告を以下に示す。なお、本剤を粉砕あるいは簡易懸濁しての投与は、承認された剤形での投与ではなく、適正使用の観点から、弊社としては推奨していない。

本剤を粉砕あるいは簡易懸濁しての投与については、各医療担当者の裁量と判断により行うこと。

#### (1) 粉砕

##### 【試験方法】

試料の調整方法：乳鉢を用いて粉砕する。

保存条件：

- ①30℃、75%RH、室内散光（遮光開栓ガラス瓶）
- ②30℃、75%RH、室内散光（透明開栓ガラス瓶）
- ③30℃、75%RH、室内散光（遮光密栓ガラス瓶）
- ④30℃、75%RH、室内散光（透明密栓ガラス瓶）

測定時期：開始時、7日、14日、30日

試験項目：外観、含量、水分

試験回数：外観 1回、含量・水分 3回

##### 【試験結果】

製品名：エパルレスタット錠 50mg「VTRS」

①30℃、75%RH、室内散光（遮光開栓ガラス瓶）

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	101.1 [100.0]	100.7 [99.6]	98.5 [97.4]	101.9 [100.8]
水分 (%)	1.03	2.31	2.22	2.19

②30℃、75%RH、室内散光（透明開栓ガラス瓶）

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	101.1 [100.0]	100.6 [99.5]	98.5 [97.4]	102.5 [101.4]
水分 (%)	1.03	2.48	2.38	2.32

③30℃、75%RH、室内散光（遮光密栓ガラス瓶）

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	101.1 [100.0]	99.2 [98.1]	100.6 [99.5]	102.3 [101.2]
水分 (%)	1.03	1.05	1.09	1.20

④30℃、75%RH、室内散光（透明密栓ガラス瓶）

測定項目	測定時期			
	開始時	7日	14日	30日
外観	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末	橙色の粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	101.1 [100.0]	99.9 [98.8]	100.7 [99.6]	103.1 [102.0]
水分 (%)	1.03	0.91	1.13	1.23

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

【崩壊懸濁試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」<sup>参考文献</sup>に準じて実施。

1錠又は1カプセルをカテーテル用ディスペンサーに入れ、これに55℃の温湯20mLを吸い取り、ディスペンサーの先端に蓋をし、横向きに5分間放置する。5分後、ディスペンサーを手で90度の角度で15回往復横転し、「崩壊・懸濁」を観察する。

5分後に崩壊・懸濁しないものは更に5分間放置し、同様の操作を行う。それでも「崩壊・懸濁」しないものは、この方法による試料調製を中止する。

中止した薬剤は、粉碎可能な錠剤は、シート（PTP、SP）の上から乳棒で数回叩いてコーティング破壊をするか、開封可能なカプセル剤は開封してカテーテル用ディスペンサーに入れ、以下、上記と同様に操作を行う。

【通過性試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」<sup>参考文献</sup>に準じて実施。

ディスペンサー内で、崩壊懸濁試験で得られた試料溶液を経管栄養カテーテルの注入先端より約2～3mL/秒の速度で注入する。カテーテルはベッド上の患者を想定して、体内挿入端から2/3を水平にする。他端（ディスペンサー注入先）は30cmの高さにセットする。経管栄養カテーテルのサイズは「8Fr」を用いる。

薬剤注入後、適量の水（約10mL）で洗浄するとき、薬剤の残存を確認する。

【試験結果】

剤型	簡易懸濁法				通過性試験
	水(約55℃)		破壊→水		通過サイズ
	5分	10分	5分	10分	
エパルレスタット錠50mg 「VTRS」	×	×	○		8Fr.

×：投与困難な崩壊状況 ○：完全崩壊

### 文献請求先・製品情報お問い合わせ先

---

ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号  
フリーダイヤル 0120-419-043

### 製造販売元

---

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号

### 販売元

---

ヴィアトリス製薬合同会社  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号

