

貯法：室温保存  
有効期間：3年

## アルドース還元酵素阻害剤

日本薬局方エパルレスタット錠

## エパルレスタット錠50mg「アメル」

Epalrestat Tablets 「AMEL」

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋により使用すること

承認番号	21700AMZ00537
販売開始	2005年7月

## 3. 組成・性状

## 3.1 組成

販売名	エパルレスタット錠50mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局エパルレスタット50mgを含有する。
添加剤	D-マンニトール、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、ヒプロメロース、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
エパルレスタット錠50mg「アメル」	フィルムコーティング錠		KW090
	白色	直径：約6.7mm 厚さ：約3.3mm 質量：約120mg	

## 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）

## 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、HbA<sub>1c</sub>（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。

## 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。

## 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。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

## 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。

## 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>1)</sup>

## 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。

## 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 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。

## 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

注）発現頻度は使用成績調査を含む。

## 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]

## 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。

## 15. その他の注意

## 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]

## 16. 薬物動態

## 16.1 血中濃度

## 16.1.1 生物学的同等性試験

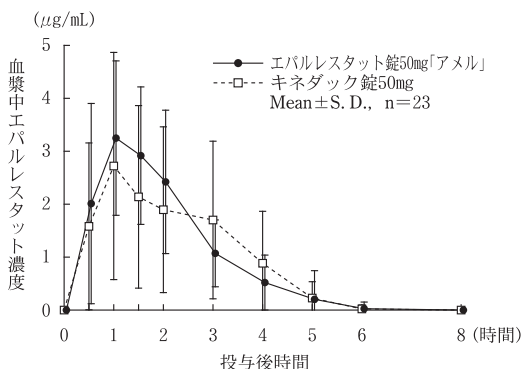
エパルレスタット錠50mg「アメル」とキネダック錠50mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（エパルレスタットとして50mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中エパルレスタット濃度を測定し、得られた薬物動態パラメ

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<sup>2)</sup>。

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 <sub>(0-8)</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
エパルレストアット錠 50mg 「アメル」	7.74±1.96	4.18±1.10	1.5±1.1	0.7±0.3
キネダック錠 50mg	7.49±2.60	4.26±1.38	1.7±1.1	0.7±0.2

(Mean±S.D., n = 23)



血漿中エパルレストアット濃度 (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

グルコースからソルビトールへの変換を司るアルドース還元酵素を阻害して、高血糖によって生ずるソルビトールの細胞内蓄積を抑制する。これにより糖尿病性末梢神経障害に伴う手足のしびれや痛みを改善する<sup>3)</sup>。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名

エパルレストアット (Epalrestat)

化学名

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

分子式

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

分子量

319.40

性状

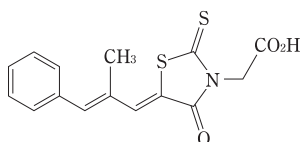
黄色～橙色の結晶又は結晶性の粉末である。

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。

光により徐々に退色し、分解する。

結晶多形が認められる。

構造式



融点

222～227℃

22. 包装

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

23. 主要文献

- 1) 宮本茂敏, 他: 現代医療. 1986; 18 (増刊): 40-50
- 2) 社内資料: 生物学的同等性試験 [錠 50mg]
- 3) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店. 2021; C-1003

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