

医 薬 品 イ ン タ ビ ュ ー フ ォ ー ム

日本病院薬剤師会のI F 記載要領2008に準拠して作成

注射用 Ca 拮抗剤

日本薬局方 ニカルジピン塩酸塩注射液

サリペックス®注 0.1%

Salipex

剤 形	注射液
製 剤 の 規 制 区 分	劇薬 処方せん医薬品（注意-医師等の処方せんにより使用すること）
規 格 ・ 含 量	1 管(2mL)中ニカルジピン塩酸塩 2mg 含有 1 管(10mL)中ニカルジピン塩酸塩 10mg 含有
一 般 名	和 名：ニカルジピン塩酸塩 洋 名：Nicardipine Hydrochloride
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬価基準収載・発売年月日	承認年月日：2001 年 3 月 8 日 薬価収載：2001 年 7 月 6 日 販売年月日：2001 年 7 月 6 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問 い 合 わ せ 窓 口	日医工株式会社 お客様サポートセンター（月曜～金曜 9:00～17:00） TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ http://www.nichiiko.co.jp/

本 I F は 2011 年 7 月改訂（第 8 版）の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、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

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版、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等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等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

[Ⅰ] 概要に関する項目	1
[Ⅱ] 名称に関する項目	2
[Ⅲ] 有効成分に関する項目	3
[Ⅳ] 製剤に関する項目	4
[Ⅴ] 治療に関する項目	9
[Ⅵ] 薬効薬理に関する項目	11
[Ⅶ] 薬物動態に関する項目	12
[Ⅷ] 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
[Ⅸ] 非臨床試験に関する項目	19
[Ⅹ] 管理的事項に関する項目	20
[ⅩⅠ] 文 献	22
[ⅩⅡ] 参考資料	22
[ⅩⅢ] 備 考	22
[付録] 付 表	23

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

一般的に 1,4 - ジヒドロピリジン誘導体は水に不溶性でかつ容易に分解する性質を有するが、本剤は一連の誘導体の中で水溶性であり、光に対して比較的安定で、強い血管拡張作用及び血圧降下作用を有する。

ニカルジピン塩酸塩製剤のサリペックス注 0.1%は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験を実施し、2001 年 3 月 8 日に承認を取得、2001 年 7 月 6 日に上市した。（医薬発第 481 号(平成 11 年 4 月 8 日)に基づき承認申請）

サリペックス注 0.1%は、2002 年 10 月 18 月付で「急性心不全（慢性心不全の急性増悪を含む）」の効能・効果が追加された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、注射用 Ca 拮抗剤である。
- (2) 製剤規格として、1 管 2mL 及び、1 管 10mL の 2 製剤がある。
- (3) 重大な副作用（頻度不明）として、麻痺性イレウス、低酸素血症、肺水腫、呼吸困難、狭心痛、血小板減少、肝機能障害、黄疸が報告されている。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

サリペックス®注 0.1%

(2) 洋名

Salipex

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ニカルジピン塩酸塩（JAN）

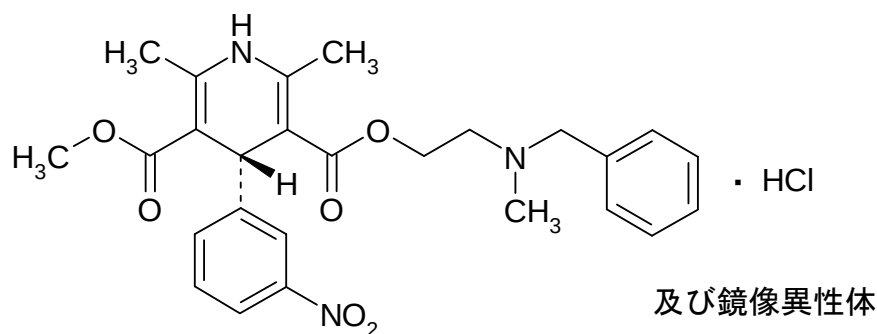
(2) 洋名（命名法）

Nicardipine Hydrochloride（JAN）

(3) ステム

ニフェジピン系カルシウム拮抗薬：-pine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₆H₂₉N₃O₆・HCl

分子量：515.99

5. 化学名（命名法）

2- [Benzyl(methyl)amino] ethyl methyl(4*RS*)-2,6-dimethyl-4-(3-nitrophenyl)-1,4-dihydropyridine-3,5-dicarboxylate monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名，別名，略号，記号番号

別名：塩酸ニカルジピン

7. CAS 登録番号

54527-84-3

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

わずかに緑みを帯びた黄色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

メタノール又は酢酸(100)に溶けやすく，エタノール(99.5)にやや溶けにくく，水，アセトニトリル又は無水酢酸に溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点），沸点，凝固点

融点：167～171℃

(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

本品のメタノール溶液(1→20)は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は光によって徐々に変化する。

3. 有効成分の確認試験法

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法
- (3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 規格及び性状

剤 形：注射液

規 格：1 管(2mL)中ニカルジピン塩酸塩 2mg 含有

1 管(10mL)中ニカルジピン塩酸塩 10mg 含有

性 状：微黄色澄明の注射液

(2) 溶液及び溶解時の pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等

pH	3.0～4.5
浸透圧比	0.8～1.2 (生理食塩液に対する比)

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

サリペックス注 0.1%(2mL)：1 管中ニカルジピン塩酸塩 2mg 含有

サリペックス注 0.1%(10mL)：1 管中ニカルジピン塩酸塩 10mg 含有

(2) 添加物

添加目的	添 加 物	
	サリペックス注 0.1%(2mL)	サリペックス注 0.1%(10mL)
安定化剤	マルトース 185mg	マルトース 925mg
pH 調節剤	pH 調節剤	pH 調節剤

(3) 電解質の濃度

該当資料なし

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

該当資料なし

3. 注射剤の調製法

＜点滴静注時の薬剤の調製法の例示＞

点滴静注する場合の本剤の 0.01～0.02%溶液は、下表の例示を参考に本剤と配合可能な輸液に本剤の必要量を加えて調製する。

配合する 輸液の量 (mL)	調製するサリペックス溶液の濃度		
	約 0.01%	約 0.015%	約 0.02%
	加えるサリペックス注の量(mL)		
100	12	18	24
250	30	45	60
500	60	90	120

＜参考＞

「手術時の異常高血圧の救急処置」において、急速に血圧を下げる必要がある場合には、本剤をそのまま体重 1kg 当たりニカルジピン塩酸塩として 10～30 μ g を静脈内投与する。

4. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

本品につき加速試験（40℃，6 ヶ月）を行った結果，サリペックス注 0.1%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。

[最終包装形態]

試験項目 [規格値]	40℃	
	開始時	6 ヶ月
性状 [微黄色澄明な液]	適合	適合
確認試験	適合	適合
pH [3.0～4.5]	適合	適合
浸透圧比 [0.8～1.2]	適合	適合
無菌試験 [日局判定基準]	適合	適合
不溶性異物検査 [日局判定基準]	適合	適合
不溶性微粒子試験 [日局判定基準]	適合	適合
定量試験 [93～107%]	適合	適合

6. 溶解後の安定性²⁾

本剤を点滴静注する場合，輸液で希釈し，ニカルジピン塩酸塩として 0.1 - 0.2mg/mL の濃度で使用するため，以下の条件で試験を実施した。

調製試料：サリペックス注(10mg/10mL×2.5 管)+輸液(100mL)

[ニカルジピン塩酸塩 0.2mg/mL 溶液に調製]

配合輸液：注射用水，5%ブドウ糖，生理食塩液

保存条件：室温散光下及び室温遮光下

保存期間：24 時間（直後，3 時間，6 時間，24 時間）

試験項目：外観，pH，含量（残存率）

① 注射用水 100mL [輸液の性状：無色澄明，pH5.83]

保存条件	試験項目	配合後の変化			
		直 後	3 時間	6 時間	24 時間
散光下	外観	僅微黄色澄明	同左	同左	同左
	pH	4.49	4.50	4.47	4.60
	残存率(%)	100	99.7	98.6	98.7
遮光下	外観	僅微黄色澄明	同左	同左	同左
	pH	4.45	4.45	4.45	4.40
	残存率(%)	100	99.1	99.6	99.5

② 5%ブドウ糖 100mL [輸液の性状：無色澄明，pH4.94]

保存条件	試験項目	配合後の変化			
		直 後	3 時間	6 時間	24 時間
散光下	外観	僅微黄色澄明	同左	同左	同左
	pH	4.26	4.24	4.23	4.29
	残存率(%)	100	100.8	100.4	99.5
遮光下	外観	僅微黄色澄明	同左	同左	同左
	pH	4.27	4.25	4.23	4.26
	残存率(%)	100	99.6	99.7	99.9

③ 生理食塩液 100mL [輸液の性状：無色澄明, pH5.77]

保存条件	試験項目	配合後の変化			
		直 後	3 時間	6 時間	24 時間
散光下	外観	僅微黄色澄明	同左	同左	同左
	pH	4.48	4.41	4.44	4.44
	残存率(%)	100	99.3	99.8	100.1
遮光下	外観	僅微黄色澄明	同左	同左	同左
	pH	4.50	4.45	4.45	4.44
	残存率(%)	100	99.9	100.5	101.0

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）³⁾

(1) pH 変動試験

◆サリペックス注 0.1% (10mg/10mL) の pH 変動スケール

pH 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14

	←①	②→	白濁
--	----	----	----

1.37 3.62 5.07

① : 0.1mol/L HCl 消費量 10.0mL ② : 0.1mol/L NaOH 消費量 0.03mL

◆最終 pH 及び変化点 pH での観察

試料	規格 pH 域	試料 pH	最終 pH 又は 変化点 pH	最終 pH 及び変化点 pH での観察		
					滴下直後	24 時間後
サリペックス 注 0.1% 10mg/10mL	3.0~4.5	3.62	1.37	外観	微黄色澄明	微黄色澄明
				pH	1.37	1.37
				残存率(%)	100	99.3
			5.07	外観	僅かに白濁	油状物浮遊
				pH	5.07	5.07
				残存率(%)	100	98.8

(2) 配合変化試験

調製試料：サリペックス注(10mg/10mL×12 管)+各種輸液(500mL)

[ニカルジピン塩酸塩約 0.2mg/mL 溶液に調製]

保存条件：室温散光下

保存期間：24 時間（直後，3 時間，6 時間，24 時間）

試験項目：外観，pH，含量（残存率）

—：外観変化なし

配合輸液		配合変化（輸液 500mL+サリペックス注 120mg/120mL）				
商品名 配合量 [会社名]<同一成分薬>	外観	観察項目	観察時間			
	pH		配合直後	3 時間後	6 時間後	24 時間後
生理食塩液 500mL[川澄]	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	6.31	pH	4.62	4.60	4.61	4.60
		残存率(%)	100	98.7	97.7	97.9
5%ブドウ糖 500mL[川澄]	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	4.76	pH	4.27	4.28	4.27	4.23
		残存率(%)	100	100.7	97.8	98.9

続き

ー：外観変化なし

配合輸液		配合変化（輸液 500mL＋サリペックス注 120mg/120mL）				
商品名 配合量 [会社名]＜同一成分薬＞	外観	観察項目	観察時間			
	pH		配合直後	3 時間後	6 時間後	24 時間後
10% デキストラン 40LOW 500mL[川澄] ＜低分子デキストランL 注＞	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	5.33	pH	5.31	5.32	5.33	5.31
		残存率(%)	100	97.9	99.2	99.2
カーミラクト 500mL[川澄] ＜ラクテック注＞	無色澄明	外観	白濁	白濁	白濁	白濁
	6.52	pH	5.90	5.88	5.87	5.86
		残存率(%)	78.5	75.3	72.6	71.4
カーミラクトS 500mL[川澄] ＜ラクテックG 注＞	無色澄明	外観	白濁	白濁	白濁	白濁
	6.45	pH	5.88	5.87	5.86	5.85
		残存率(%)	79.2	79.4	78.5	74.4
カーミキープ 3 号 4.3G 500mL[川澄] ＜ソリタ T3 号＞	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	5.49	pH	5.43	5.43	5.42	5.43
		残存率(%)	100	99.9	101.1	100.3
カーミキープ 3 号 500mL[川澄] ＜フィジオゾール 3 号＞	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	4.96	pH	4.96	4.94	4.94	4.95
		残存率(%)	100	99.6	100.1	99.3
アセテートD 500mL[川澄] ＜ヴィーンD＞	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	5.38	pH	5.38	5.38	5.38	5.38
		残存率(%)	100	98.0	99.0	99.0
グリセバック F 注 500mL[川澄] ＜グリセオール注＞	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	3.65	pH	3.67	3.67	3.68	3.67
		残存率(%)	100	101.5	99.2	100.0
20%マンニトール注 500mL[川澄] ＜20%マンニトール＞	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	5.59	pH	4.37	4.36	4.28	4.32
		残存率(%)	100	99.3	99.0	100.8
ソリタ T3 号 500mL[清水]	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	5.11	pH	5.09	5.09	5.08	5.08
		残存率(%)	100	99.9	99.0	99.2
アクチット 500mL[日研]	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	5.41	pH	5.42	5.42	5.41	5.42
		残存率(%)	100	101.1	101.3	100.3
ポタコールR 500mL[大塚工場]	無色澄明	外観	僅微黄色澄明	—	—	—
	4.91	pH	4.91	4.89	4.89	4.90
		残存率(%)	100	102.1	101.5	99.3
アミノフリード 500mL[大塚工場]	無色澄明	外観	直後白濁→混濁・ペースト状物質が壁に付着			
	6.70	pH	6.68	6.64	6.61	6.57
		残存率(%)	22.5	27.3	25.6	10.4
アミノレバン 500mL[大塚工場]	無色澄明	外観	直後白濁→混濁・ペースト状物質が壁に付着			
	5.89	pH	5.86	5.85	5.84	5.83
		残存率(%)	84.9	80.8	74.2	76.7
ネオアミュー 500mL[味の素ファルマ]	無色澄明	外観	直後白濁→混濁・ペースト状物質が壁に付着			
	7.12	pH	7.05	7.02	7.02	7.02
		残存率(%)	15.4	19.0	14.4	4.7

＜添付文書＞

適用上の注意：本剤を点滴静注する場合、配合する輸液によっては pH が高いなどの原因で本剤が析出することがあるので、十分注意すること。

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

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当資料なし

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

該当資料なし

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- 手術時の異常高血圧の救急処置
- 高血圧性緊急症
- 急性心不全（慢性心不全の急性増悪を含む）

2. 用法及び用量

○手術時の異常高血圧の救急処置

本剤は、生理食塩液又は 5%ブドウ糖注射液で希釈し、ニカルジピン塩酸塩として 0.01～0.02%(1mL 当たり 0.1～0.2mg)溶液を点滴静注する。この場合 1 分間に、体重 1kg 当たり 2～10 μ g の点滴速度で投与を開始し、目的値まで血圧を下げ、以後血圧をモニターしながら点滴速度を調節する。なお、急速に血圧を下げる必要がある場合には、本剤をそのまま体重 1kg 当たりニカルジピン塩酸塩として 10～30 μ g を静脈内投与する。

○高血圧性緊急症

本剤は、生理食塩液又は 5%ブドウ糖注射液で希釈し、ニカルジピン塩酸塩として 0.01～0.02%(1mL 当たり 0.1～0.2mg)溶液を点滴静注する。この場合 1 分間に、体重 1kg 当たり 0.5～6 μ g の点滴速度で投与する。なお、投与に際しては 1 分間に、体重 1kg 当たり 0.5 μ g より開始し、目的値まで血圧を下げ、以後血圧をモニターしながら点滴速度を調節する。

○急性心不全（慢性心不全の急性増悪を含む）

本剤は、生理食塩液又は 5%ブドウ糖注射液で希釈し、ニカルジピン塩酸塩として 0.01～0.02% (1mL 当たり 0.1～0.2mg) 溶液を点滴静注する。この場合 1 分間に、体重 1kg 当たり 1 μ g の点滴速度で投与する。なお、患者の病態に応じて 1 分間に、体重 1kg 当たり 0.5～2 μ g の範囲で点滴速度を調節する。

<用法及び用量に関連する使用上の注意>

- (1) 高血圧性緊急症においては、本剤投与により目的の血圧が得られた後、引き続き降圧治療が必要で経口投与が可能な場合には経口投与に切り替えること。
- (2) 高血圧性緊急症において、本剤投与終了後に血圧が再上昇することがあるので、本剤の投与を終了する際には徐々に減量し、投与終了後も血圧を十分に管理すること。なお、経口投与に切り替えた後にも血圧の再上昇等に留意すること。
- (3) 急性心不全において、本剤の投与によっても、期待された改善がみられない場合には投与を中止し、他の治療法（利尿薬、陽性変力作用をもついわゆる強心薬、血管拡張薬等の静脈内投与又は機械的補助循環等）に切り替えるなど必要な措置を講じること。
- (4) 点滴静注時の薬剤の調製法の例示

点滴静注する場合の本剤の0.01～0.02%溶液は、下表の例示を参考に本剤と配合可能な輸液に本剤の必要量を加えて調製する。

配合する 輸液の量 (mL)	調製するサリペックス溶液の濃度		
	約0.01%	約 0.015%	約 0.02%
	加えるサリペックス注の量(mL)		
100	12	18	24
250	30	45	60
500	60	90	120

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連のある化合物又は化合物群

Ca 拮抗剤

ジヒドロピリジン系：ニフェジピン，ニトレンジピン，アムロジピンベシル酸塩 等

ベンゾチアゼピン系：ジルチアゼム塩酸塩

フェニルアルキルアミン系：ベラパミル塩酸塩

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁴⁾

電位依存性 L 型 Ca^{2+} チャネルを介する血管平滑筋細胞内への Ca^{2+} の流入を抑制することにより，強力な血管拡張作用を発揮する。血管に対する選択性が高く，血管平滑筋に対する作用は，心筋に対する作用よりも約 3 万倍低い濃度で現れる。安定した降圧効果と共に，脳・冠・腎血流量の増加が得られる。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

(「VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 7. 相互作用」の項参照)

(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

該当資料なし

(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⁴⁾

98～99.5%

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

(VIII-10. 「妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

(3) 乳汁への移行性

(VIII-10. 「妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

(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

主として CYP3A4 で代謝される。

(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

（「排泄率」の項参照）

(2) 排泄率⁴⁾

投与経路にかかわらず、48 時間以内に 66～72%がふん便中に、23～29%が尿中に排泄される。

(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

【警告】

本剤を脳出血急性期の患者及び脳卒中急性期で頭蓋内圧が亢進している患者に投与する場合には、緊急対応が可能な医療施設において、最新の関連ガイドラインを参照しつつ、血圧等の患者の状態を十分にモニタリングしながら投与すること。

2. 禁忌内容とその理由

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 急性心不全において、高度な大動脈弁狭窄・僧帽弁狭窄、肥大型閉塞性心筋症、低血圧（収縮期血圧 90mmHg 未満）、心原性ショックのある患者〔心拍出量及び血圧が更に低下する可能性がある。〕
- (3) 急性心不全において、発症直後で病態が安定していない重篤な急性心筋梗塞患者〔広範囲、3 枝病変による梗塞等の重篤な急性心筋梗塞患者では血行動態の急激な変化を生じることがあり、更に病態が悪化するおそれがある。〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

（「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照）

5. 慎重投与内容とその理由

【慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）】

- (1) 脳出血急性期の患者〔出血を促進させる可能性があるので、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。〕
- (2) 脳卒中急性期で頭蓋内圧が亢進している患者〔頭蓋内圧を高めるおそれがあるので、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。〕
- (3) 肝・腎機能障害のある患者〔本剤は肝臓で代謝される。また、一般に重篤な腎機能障害のある患者では、急激な降圧に伴い腎機能低下を来す可能性がある。〕
- (4) 大動脈弁狭窄症の患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕
- (5) 急性心不全において、重篤な不整脈のある患者〔一般にこのような患者では、不整脈を慎重に管理しながら治療する必要がある。〕
- (6) 急性心不全において、血圧が低い患者〔更なる血圧低下を来す可能性がある。（「重要な基本的注意」の項参照）〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 本剤の作用には個人差があるので、血圧、心拍数等を十分に管理しながら慎重に投与すること。
- (2) 本剤の過剰投与により著明な低血圧を来した場合には投与を中止すること。また、速やかに血圧を回復させたい場合には昇圧剤(ノルアドレナリン)を投与すること。
- (3) 本剤を長時間投与し、注入部位に痛みや発赤等がみられた場合には注入部位を変更すること。
- (4) 急性心不全において、血圧、心拍数、尿量、体液及び電解質、また可能な限り肺動脈楔入圧、心拍出量及び血液ガス等患者の全身状態を十分管理しながら投与すること。
- (5) 急性心不全において、本剤の血管拡張作用による過度の血圧低下、動脈血酸素分圧の低下が発現することがあるので注意すること。特に本剤には血圧低下作用があることから、血圧がやや低く(収縮期血圧が 100mmHg 未満を目安)、循環血液量が相対的に減少しているような場合、厳重な血圧モニターを行い、更なる血圧低下が認められた場合には、投与を中止するなど必要な措置を講じること。
- (6) 急性心不全において、本剤の投与により臨床症状が改善し、患者の状態が安定した場合(急性期の状態を脱した場合)には、漫然と投与することなく他の治療法に変更すること。投与期間は患者の反応性に応じて異なるが、急性心不全に対する 24 時間を超える使用経験が少ないので、これを超えて投与する必要性が生じた場合には、血行動態及び全身状態等を十分に管理しながら慎重に投与すること。
- (7) 急性心不全において、他の血管拡張薬との併用に際しては過度の血圧低下に注意すること。
- (8) 急性心不全において、急性心筋梗塞による急性心不全に対して本剤を使用する場合は、血行動態及び全身状態等を十分に管理しながら慎重に投与すること。

7. 相互作用

本剤は主として CYP3A4 で代謝される。

(1) 併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

(2) 併用注意とその理由

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
他の血圧降下剤	血圧降下作用が増強されることがある。	両剤の薬理学的な相加作用等による。
β遮断剤 プロプラノロール等	うつ血性心不全患者では、過度の血圧低下、心機能の低下があらわれることがある。 必要に応じどちらかを減量又は投与を中止する。	両剤の薬理学的な相加作用による。 1) 血圧降下作用の増強 2) 陰性変力作用の増強
フェンタニール	フェンタニール麻酔時、β遮断剤と本剤の併用で血圧低下がみられることがある。 必要に応じどちらかを減量又は投与を中止する。	機序不明

続き

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジゴキシン	ジゴキシンの作用を増強し、中毒症状(嘔気、嘔吐、めまい、徐脈、不整脈等)があらわれることがある。 必要に応じジゴキシンを減量する。	本剤が、主に腎でのクリアランスを減少させ、ジゴキシンの血中濃度が上昇する。
ダントロレンナトリウム水和物	他のカルシウム拮抗剤(ベラパミル等)の動物実験で心室細動、循環虚脱がみられたとの報告がある。	高カルシウム血症を来すと考えられる。
タンドスピロンクエン酸塩	動物実験で血圧降下作用が増強されたとの報告がある。	タンドスピロンクエン酸塩は中枢性の血圧降下作用を有し、相加的な降圧作用を示す。
ニトログリセリン	動物実験で房室ブロックを起こしたとの報告がある。	機序不明
筋弛緩剤 パンクロニウム臭化物、 ベクロニウム臭化物等	筋弛緩剤の作用が増強することがある。 筋弛緩作用に注意し、異常が認められた場合には両剤の減量もしくは投与を中止する。	本剤が神経筋接合部位において、シナプス前あるいは後にアセチルコリン放出を抑制させること、及び骨格筋の筋小胞体での Ca 遊離抑制による筋自体の収縮力の低下等が考えられている。
免疫抑制剤 シクロスポリン、 タクロリムス水和物等	免疫抑制剤の作用を増強し、中毒症状(特に腎機能異常)があらわれることがある。また、本剤の作用を増強し、血圧低下、頻脈等があらわれることがある。 必要に応じ免疫抑制剤及び本剤を減量する。	本剤あるいは免疫抑制剤により CYP3A4 が阻害され、免疫抑制剤あるいは本剤の血中濃度が上昇する
フェニトイン	1) フェニトインの作用を増強し、中毒症状(神経的)があらわれることがある。 必要に応じフェニトインを減量する。 2) 本剤の作用が減弱されることがある。 必要に応じ本剤を増量する。	1) 本剤の蛋白結合率が高いため、血漿蛋白結合競合により、遊離型フェニトインが上昇する。 2) CYP3A4 が誘導され、本剤の代謝が促進される。
リファンピシン	本剤の作用が減弱されることがある。 必要に応じ本剤を増量する。	CYP3A4 が誘導され、本剤の代謝が促進される。
シメチジン	本剤の作用が増強され、血圧低下、頻脈等があらわれることがある。 必要に応じ本剤を減量する。	これらの薬剤により CYP3A4 が阻害され、本剤の血中濃度が上昇する。
HIV プロテアーゼ阻害剤 サキナビル、 リトナビル等	本剤の血中濃度が上昇し、本剤の作用が増強されるおそれがある。	
アゾール系抗真菌薬 イトラコナゾール等		

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状（頻度不明）

- 1) **麻痺性イレウス**：麻痺性イレウスがあらわれることがあるので、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) **低酸素血症**：低酸素血症があらわれることがあるので、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) **肺水腫，呼吸困難**：肺水腫，呼吸困難があらわれることがあるので、これらの症状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) **狭心痛**：外国においてニカルジピン塩酸塩注射剤で治療した冠動脈疾患患者の1%未満に狭心痛の発現あるいは悪化が認められたとの報告がある。このような症状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。
- 5) **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。
- 6) **肝機能障害，黄疸**：AST(GOT)・ALT(GPT)・ γ -GTP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。

(3) その他の副作用

	頻度不明
循環器	頻脈，心電図変化，血圧低下，肺動脈圧の上昇（急性心不全時），心係数の低下（急性心不全時），心室頻拍（急性心不全時），チアノーゼ（急性心不全時），動悸，顔面潮紅，全身倦怠感，心室性期外収縮，房室ブロック
肝臓	肝機能異常(AST(GOT)・ALT(GPT)等の上昇)
腎臓	BUN・クレアチニンの上昇
消化器	嘔気，嘔吐，むかつき
過敏症	皮疹
その他	頭痛，体温の上昇，尿量減少，血中総コレステロールの低下，悪寒，背部痛，血清カリウムの上昇，静脈炎

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) **禁忌**：本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) **その他の副作用**：皮疹の過敏症が発現することがある。

9. 高齢者への投与

高齢者に使用する場合は低用量(例えば $0.5 \mu\text{g/kg/分}$ で点滴静注)から投与を開始し、経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。

[高齢者では生理機能(肝機能、腎機能等)が低下していることが多い。]

10. 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、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。[動物実験で、妊娠末期に投与すると高用量では胎児死亡の増加、分娩障害、出生児の体重減少及びその後の体重増加の抑制が報告されている。]

(2)授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。[動物試験で、乳汁中へ移行することが報告されている。]

11. 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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当記載事項なし

14. 適用上の注意

(1) **調剤時**：本剤を点滴静注する場合、配合する輸液によっては pH が高いなどの原因で本剤が析出することがあるので、十分注意すること。

(2) **アンプルカット時**：本剤はワンポイントカットアンプルを使用しているので、アンプル枝部のマークを上にして反対方向に折ること。

なお、アンプルカット時の異物の混入を避けるため、カット部をエタノール綿等で清拭し、カットすること。

15. その他の注意

開心術後の回復管理期においては、症例によっては循環不全を生じ、心不全状態になることが知られているが、それらにおける本剤の使用経験が少なく、有効性は確立していない。

16. その他

該当記載事項なし

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

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤	サリペックス注 0.1%	劇薬 ^{注1)} ， 処方せん医薬品 ^{注2)}
有効成分	ニカルジピン塩酸塩	劇薬 ^{注1)} ， 処方せん医薬品 ^{注2)}

注1) 1 個中ニカルジピンとして 40mg 以下を含有する内用剤及びニカルジピンとして 10%以下を含有する散剤は除かれる。

注2) 注意-医師等の処方せんにより使用すること。

2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示の使用期限内に使用すること。（3 年：安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存，遮光保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

（「規制区分」及び「貯法・保存」の項参照）

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の項参照）

5. 承認条件等

なし

6. 包装

2mL×10 アンプル

10mL×10 アンプル

7. 容器の材質

褐色のガラスアンプル

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ペルジピン注射液 2mg，ペルジピン注射液 10mg（アステラス）

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日	承認番号
2001 年 3 月 8 日	21300AMZ00164000

11. 薬価基準収載年月日

2001 年 7 月 6 日

12. 効能・効果追加，用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

効能追加年月日：2002 年 10 月 18 日

<効能・効果>

急性心不全（慢性心不全の急性増悪を含む）

<用法・用量>

○急性心不全（慢性心不全の急性増悪を含む）

本剤は，生理食塩液又は 5%ブドウ糖注射液で希釈し，ニカルジピン塩酸塩として 0.01～0.02%（1mL 当たり 0.1～0.2mg）溶液を点滴静注する。この場合 1 分間に，体重 1kg 当たり 1 μ g の点滴速度で投与する。なお，患者の病態に応じて 1 分間に，体重 1kg 当たり 0.5～2 μ g の範囲で点滴速度を調節する。

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. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は，投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

（V-2.「用法及び用量に関連する使用上の注意」の項参照）

16. 各種コード

	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	HOT(9 桁) コード
サリペックス注 0.1%(2mL)	2149400A1051	640453076	114028601
サリペックス注 0.1%(10mL)	2149400A2066	640453077	114029301

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 日医工株式会社 社内資料（安定性試験）
- 2) 日医工株式会社 社内資料（溶解後安定性試験）
- 3) 日医工株式会社 社内資料（配合変化試験）
- 4) 第十五改正日本薬局方解説書 廣川書店(2006)

2. その他の参考文献

なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

なし

2. 海外における臨床支援情報

なし

X III. 備考

その他の関連資料

なし

付表 1 — 1

薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく承認申請時に添付する資料

別表 1 及び別表 2－（１）医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有製剤（先発医薬品）	その他の医薬品（後発医薬品）	剤形追加に係る医薬品（後発医薬品）
イ 起源又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起源又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 製造方法並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定及び物理化学的性質等	○	×	×
	2 製造方法	○	△	○
	3 規格及び試験方法	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	△
	2 苛酷試験	○	×	△
	3 加速試験	○	○	○
ニ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 副次的薬理・安全性薬理	○	×	×
	3 その他の薬理	△	×	×
ホ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 生物学的同等性	×	○	○
	6 その他の薬物動態	△	×	×
ヘ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 単回投与毒性	○	×	×
	2 反復投与毒性	○	×	×
	3 遺伝毒性	○	×	×
	4 がん原性	△	×	×
	5 生殖発生毒性	○	×	×
	6 局所刺激性	△	×	×
	7 その他の毒性	△	×	×
ト 臨床試験の成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	×

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される

付表 1—2

医薬発第 481 号（平成 11 年 4 月 8 日）に基づく承認申請時に添付する資料

別表 1 及び別表 2－（１）医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有製剤（先発医薬品）	その他の医薬品（後発医薬品）	剤形追加に係る医薬品（後発医薬品）
イ 起源又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起源又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定	○	×	×
	2 物理的・科学的性質等	○	×	×
	3 規格及び試験方法	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	△
	2 苛酷試験	○	×	△
	3 加速試験	○	○	○
ニ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 単回投与毒性	○	×	×
	2 反復投与毒性	○	×	×
	3 生殖発生毒性	○	×	×
	4 変異原性	○	×	×
	5 がん原性	△	×	×
	6 局所刺激性	△	×	×
	7 その他の毒性	△	×	×
ホ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 一般薬理	○	×	×
ヘ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 生物学的同等性	×	○	○
ト 臨床試験の成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	×

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される

付表 1—3

薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づく承認申請時に添付する資料

別表 1 及び別表 2－（１）医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有製剤（先発医薬品）	その他の医薬品（後発医薬品）	剤形追加に係る医薬品（後発医薬品）
イ 起源又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起源又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定	○	×	×
	2 物理的・化学的性質等	○	×	×
	3 規格及び試験方法	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	×
	2 苛酷試験	○	×	×
	3 加速試験	×	○	○
ニ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 急性毒性	○	×	×
	2 亜急性毒性	○	×	×
	3 慢性毒性	○	×	×
	4 生殖に及ぼす影響	○	×	×
	5 依存性	△	×	×
	6 抗原性	△	×	×
	7 変異原性	△	×	×
	8 がん原性	△	×	×
	9 局所刺激	△	×	×
ホ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 一般薬理	○	×	×
ヘ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 生物学的同等性	×	○	○
ト 臨床試験の試験成績に関する資料	臨床試験の試験成績	○	×	○

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される