

貯法：室温保存  
使用期限：外箱等に表示(3年)

	顆粒	錠
承認番号	22100AMX01970	22200AMX00070
薬価収載	2009年11月	2010年5月
販売開始	2009年11月	2010年5月

胃炎・胃潰瘍治療剤

# レバミピド顆粒20%「タカタ」

レバミピド顆粒

# \* レバミピド錠100mg「タカタ」

日本薬局方 レバミピド錠

REBAMIPIDE



前回改訂  
⇒

**【禁忌(次の患者には投与しないこと)】**

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

**【組成・性状】\***

1. 組成

品名	レバミピド顆粒20%「タカタ」
成分・分量	1g中 レバミピド 200mg
添加物	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、デンプングリコール酸ナトリウム、モノステアリン酸グリセリン、タルク、ステアリン酸マグネシウム、含水二酸化ケイ素




前回改訂  
⇒

品名	レバミピド錠100mg「タカタ」
成分・分量	1錠中 レバミピド 100mg
添加物	低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール6000、カルナウバロウ

2. 製剤の性状

品名	レバミピド顆粒20%「タカタ」
性状	白色のフィルムコーティング顆粒で、においはないか又はわずかに特異なおいがある。

前回改訂  
⇒

品名	レバミピド錠100mg「タカタ」		
性状	白色のフィルムコーティング錠		
外形	表面直径	裏面重さ	側面厚さ
	 約7.6mm	 約0.14g	 約3.3mm
識別コード	TTS-325		

**【効能・効果】【用法・用量】\***

効能・効果	用法・用量
胃潰瘍	通常、成人には1回レバミピドとして100mg(顆粒：0.5g、錠：1錠)を1日3回、朝、夕及び就寝前に経口投与する。
下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善 急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期	通常、成人には1回レバミピドとして100mg(顆粒：0.5g、錠：1錠)を1日3回経口投与する。

前回改訂  
⇒

前回改訂  
⇒

**【使用上の注意】\***

1. 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)

- 1) ショック、アナフィラキシー様症状 ショック、アナフィラキシー様症状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。
- 2) 白血球減少、血小板減少 白血球減少、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。
- 3) 肝機能障害、黄疸 AST(GOT)、ALT(GPT)、γ-GTP、AI-Pの上昇等を伴う肝機能障害、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。

(2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注1)</sup>	発疹、痒痒感、薬疹様湿疹等の過敏症状、蕁麻疹
精神神経系	しびれ、めまい、眠気
消化器	便秘、腹部膨満感、下痢、嘔気・嘔吐、胸やけ、腹痛、げっぷ、味覚異常、口渇等

	頻度不明
肝臓 <sup>注2)</sup>	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、 $\gamma$ -GTP上昇、AI-P上昇等
血液	白血球減少、顆粒球減少、血小板減少等
その他	月経異常、BUN上昇、浮腫、咽頭部異物感、乳腺腫脹、乳房痛、女性化乳房、乳汁分泌誘発、動悸、発熱、顔面潮紅、舌のしびれ、咳、息苦しい、脱毛

注1) 症状があらわれた場合には、投与を中止すること。(太字)

注2) トランスアミナーゼが著しく上昇した場合や発熱、発疹等が同時にあらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。(太字)

## 2. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、消化器症状等の副作用に注意すること。

## 3. 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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。[動物試験(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。(使用経験が少ない。)

## 5. 適用上の注意

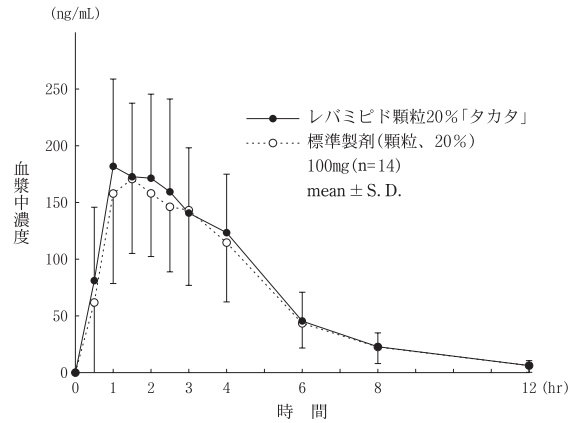
薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

## 【薬物動態】\*

### 1. 生物学的同等性試験

#### (1) レバミピド顆粒20%「タカタ」<sup>1)</sup>

本剤と標準製剤(顆粒、20%)をクロスオーバー法により、健康成人男子14名にそれぞれ0.5g(レバミピドとして100mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8及び12時間に前腕静脈から採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したレバミピドの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの平均値の差は $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
レバミピド顆粒 20%「タカタ」	845.76 ± 270.02	222.74 ± 75.22	1.8 ± 0.9	2.9 ± 3.4
標準製剤 (顆粒、20%)	793.74 ± 268.67	216.07 ± 74.62	1.5 ± 0.7	2.0 ± 0.7

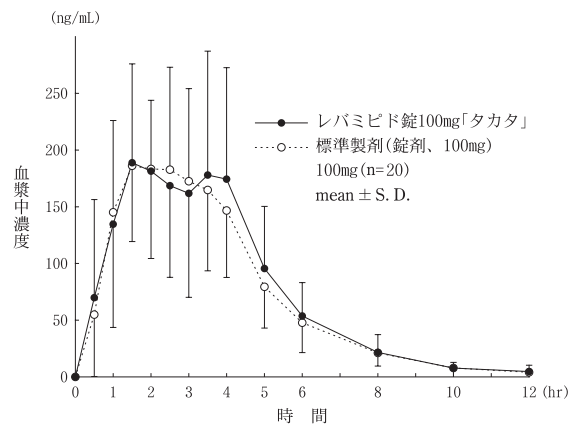
(mean ± S. D.)

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。

前  
回  
改  
訂  
⇒

#### (2) レバミピド錠100mg「タカタ」<sup>2)</sup>

本剤と標準製剤(錠剤、100mg)をクロスオーバー法により、健康成人男子20名にそれぞれ1錠(レバミピドとして100mg)を空腹時に単回経口投与し、投与前、投与後0.5、1、1.5、2、2.5、3、3.5、4、5、6、8、10及び12時間に前腕静脈から採血した。液体クロマトグラフィーにより測定したレバミピドの血漿中濃度の推移及びパラメータは次のとおりであり、統計解析にて90%信頼区間を求めた結果、判定パラメータの平均値の差は $\log 0.8 \sim \log 1.25$ の範囲にあり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
レバミピド錠 100mg「タカタ」	912.22 ± 299.31	263.15 ± 82.50	2.2 ± 1.2	2.0 ± 1.4
標準製剤 (錠剤、100mg)	868.03 ± 265.97	240.34 ± 86.02	2.0 ± 0.8	2.2 ± 0.9

(mean ± S. D.)

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。

前回改訂  
⇒

## 2. 溶出挙動<sup>3)</sup>

レバミピド錠100mg「タカタ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたレバミピド錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

### 【薬効薬理】

レバミピドは、胃粘膜防御因子増強薬に分類される抗潰瘍薬であるが、機序として内因性PG増加作用、胃粘膜血流増加作用、胃粘膜粘液量増加作用、胃アルカリ分泌亢進などが示唆されている。<sup>4)</sup>

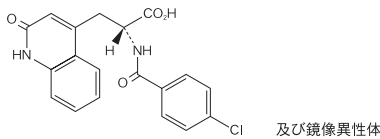
### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：レバミピド〔日局〕

Rebamipide

化学名：(2*RS*)-2-(4-Chlorobenzoylamino)-3-(2-oxo-1,2-dihydroquinolin-4-yl)propanoic acid

構造式：



分子式：C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>

分子量：370.79

性状：白色の結晶性の粉末であり、味は苦い。

*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)に極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

*N,N*-ジメチルホルムアミド溶液(1→20)は旋光性を示さない。

融点 約291℃(分解)

### 【取扱い上の注意】\*

前回改訂  
⇒

#### 安定性試験<sup>5,6)</sup>

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、75%RH、6ヵ月)の結果、3年間安定であることが推測された。

### 【包装】\*

レバミピド顆粒20%「タカタ」

分 包：0.5g×210包

バラ包装：100g(プラスチック瓶)

前回改訂  
⇒

レバミピド錠100mg「タカタ」

PTP包装：100錠(10錠×10)

500錠(10錠×50)

バラ包装：500錠(プラスチック瓶)

### 【主要文献】\*

- 1) 高田製薬(株)社内資料(顆粒：生物学的同等性、2009)
- 2) 高田製薬(株)社内資料(錠：生物学的同等性、2010)
- 3) 高田製薬(株)社内資料(錠：溶出性)
- 4) 日本薬局方解説書編集委員会編：第十七改正日本薬局方解説書(廣川書店)C-5934、2016.
- 5) 高田製薬(株)社内資料(顆粒：安定性、2009)
- 6) 高田製薬(株)社内資料(錠：安定性、2010)

前回改訂  
⇒

### 【文献請求先】\*\*

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

今回改訂  
→

高田製薬株式会社 学術部

〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号

電話 0120-989-813

FAX 048-816-4183

製造販売

**高田製薬株式会社**

さいたま市西区宮前町203番地1

