

胃炎・胃潰瘍治療剤

日本薬局方 レバミピド錠

レバミピド錠100mg「NP」

REBAMIPIDE TABLETS

貯 法：室温保存
使用期限：容器等に記載
注 意：「取扱い上の注意」参照

承認番号	22100AMX00051
薬価収載	2009年5月
販売開始	2009年5月

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

販売名	レバミピド錠100mg「NP」
有効成分 (1錠中)	日本薬局方 レバミピド 100mg
添加物	結晶セルロース、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、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール、酸化チタン、カルナウバロウ

2. 製剤の性状

※ 外形		
形状	白色のフィルムコーティング錠	
大きさ	直径 (mm)	8.1
	厚さ (mm)	3.4
	重量 (mg)	175
本体表示	レバミピド NP100	

【効能・効果】

- 胃潰瘍
- 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

【用法・用量】

- 胃潰瘍
通常、成人には1回1錠（レバミピドとして100mg）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1錠（レバミピドとして100mg）を1日3回経口投与する。

【使用上の注意】

1. 副作用

本剤は、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、Al-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

種類\頻度	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹、そう痒感、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
肝臓 ^{注2)}	AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTP、Al-Pの上昇等
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) 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。

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。

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ので、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

- 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。]
- 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。]

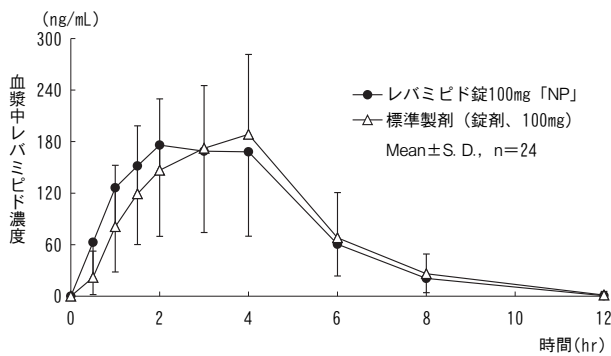
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

レバミピド錠100mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1錠（レバミピドとして100mg）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に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（ $AUC_{0\rightarrow 12hr}$ 、 C_{max} ）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。¹⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\rightarrow 12hr}$ (ng·hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
レバミピド錠 100mg「NP」	907.46±379.96	245.10±102.47	2.46±1.12	1.59±0.60
標準製剤 (錠剤、100mg)	892.74±366.09	224.86±84.28	2.96±0.90	1.51±0.58

(Mean±S. D., n=24)



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。

2. 溶出挙動

レバミピド錠100mg「NP」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。²⁾

【薬効薬理】

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等が示唆されている。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：レバミピド (Rebamipide)

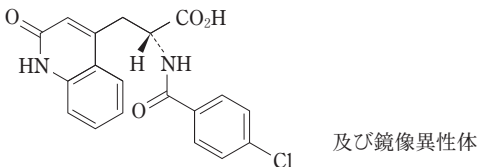
化学名：(2*RS*)-2-(4-Chlorobenzoylamino)-3-(2-oxo-1, 2-dihydroquinolin-4-yl)propanoic acid

分子式： $C_{19}H_{15}ClN_2O_4$

分子量：370.79

融点：約291℃ (分解)

構造式：



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。

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験 (40℃、相対湿度75%、6カ月)の結果、レバミピド錠100mg「NP」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。⁴⁾

【包装】

100錠 (PTP)
210錠 (PTP)
500錠 (PTP、バラ)
1,050錠 (PTP)

【主要文献】

- 1)ニプロ (株)：社内資料 (生物学的同等性試験)
- 2)ニプロ (株)：社内資料 (溶出試験)
- 3)第十六改正日本薬局方解説書
- 4)ニプロ (株)：社内資料 (安定性試験)

※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ニプロ株式会社 医薬品情報室
〒531-8510 大阪市北区本庄西3丁目9番3号
☎ 0120-226-898
FAX 06-6375-0177



製造販売 ニプロ株式会社
大阪市北区本庄西3丁目9番3号