

日本薬局方 レバミピド錠

レバミピド錠100mg「ファイザー」

REBAMIPIDE Tablets 100mg [Pfizer]

貯法：室温保存、密閉容器
使用期限：最終年月を外箱等に記載
(取扱い上の注意参照)

承認番号	22300AMX01075
薬価収載	2011年11月
販売開始	2012年1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

1錠中：

販売名	レバミピド錠100mg「ファイザー」
成分	レバミピド 100.0mg
有効成分	日局 レバミピド 100.0mg
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、軽質無水ケイ酸、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6000、酸化チタン、カルナウバロウ

2. 性状

販売名	外形			識別コード	色調等
	上面	下面	側面		
レバミピド錠100mg 「ファイザー」				RB 100 PF	白色フィルム コーティング錠
	直径 8.1mm	厚さ 3.4mm	重量 175mg		

【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、A1-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 ^{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
肝臓 ^{注2)}	AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTP、A1-Pの上昇
血液	白血球減少、顆粒球減少、血小板減少
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

- 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. 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、更には穿孔をお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。〕

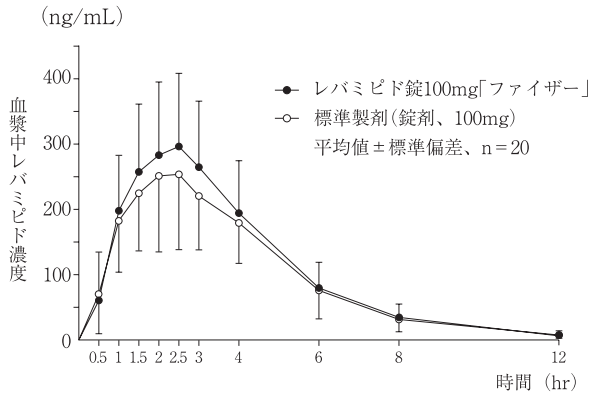
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験¹⁾

レバミピド錠100mg「ファイザー」と標準製剤を、クロスオーバー法により1錠（レバミピド100mg）を健康成人男子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_{0-12} 、 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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-12} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
レバミピド錠100mg 「ファイザー」	1284.98 ± 413.07	330.57 ± 113.19	2.40 ± 0.80	1.69 ± 0.38
標準製剤 (錠剤、100mg)	1161.02 ± 389.23	284.03 ± 99.29	2.08 ± 0.78	1.85 ± 0.46

(平均値 ± 標準偏差、n = 20)



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²⁾

レバミピド錠100mg「ファイザー」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】

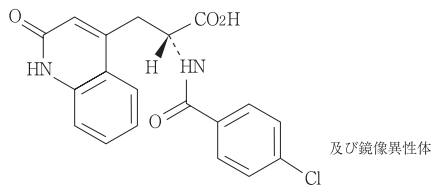
一般名：レバミピド (Rebamipide)

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

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。

融点：約291℃ (分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験⁴⁾

加速試験 (40℃、相対湿度75%、6ヵ月) の結果、レバミピド錠100mg「ファイザー」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。

【包装】

レバミピド錠100mg「ファイザー」：100錠、630錠 (PTP)
500錠 (バラ)

【主要文献】

- 社内資料：生物学的同等性試験(レバミピド錠100mg「ファイザー」) [L20110310025]
- 社内資料：溶出試験(レバミピド錠100mg「ファイザー」) [L20110310024]
- 第十七改正 日本薬局方解説書 廣川書店：C-5930, 2016
- 社内資料：安定性試験(レバミピド錠100mg「ファイザー」) [L20110310026]

【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ください。

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

【製造販売】

ファイザー株式会社

東京都渋谷区代々木3-22-7

【提携】

マイラン製薬株式会社

大阪市中央区本町2丁目6番8号

