

※※印：2019年 1月改訂(第14版)
※印：2016年10月改訂

日本標準商品分類番号
872329

貯 法：室温・気密容器保存
使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。

日本薬局方

イルソグラジンマレイン酸塩錠

粘膜防御性胃炎・胃潰瘍治療剤

※※ **イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「武田テバ」**

※※ **イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「武田テバ」**

Irsogladine Maleate Tab. 2mg・4mg “TAKEDA TEVA”

	2mg	4mg
承認番号	23100AMX00064000	23100AMX00065000
薬価収載	2019年 6月	2019年 6月
販売開始	1996年 7月	1996年 7月
再評価結果 (品質再評価)	2000年12月	2000年12月

【組成・性状】

	イルソグラジンマレイン酸塩錠2mg「武田テバ」	イルソグラジンマレイン酸塩錠4mg「武田テバ」	
組成	1錠中： イルソグラジンマレイン酸塩 ……………2mg <添加物> クロスポビドン、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、デンプングリコール酸ナトリウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース	1錠中： イルソグラジンマレイン酸塩 ……………4mg	
性状	白色の素錠	白色の片面1/2割線入り素錠	
識別コード (PTP)	t IM 2	t IM 4mg	
外形 (サイズ)	表 (直径mm)	 7.0	 8.0
	裏 (重量mg)	 125	 200
	側面 (厚さmm)	 2.5	 3.2

【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】

通常、成人イルソグラジンマレイン酸塩として1日4mgを1～2回に分割経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

【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。

	頻度不明
消化器	便秘、下痢、嘔気・嘔吐
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、LDHの上昇、 γ-GTP、ビリルビン等の上昇
皮膚 ^{注)}	発疹、そう痒感、発赤、湿疹、多形滲出性紅斑、 浮腫性紅斑
その他	胸部圧迫感、発熱

注) 投与を中止すること。

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、低用量(例えば2mg/日)から投与を開始するなど、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

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]

4. 小児等への投与

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)

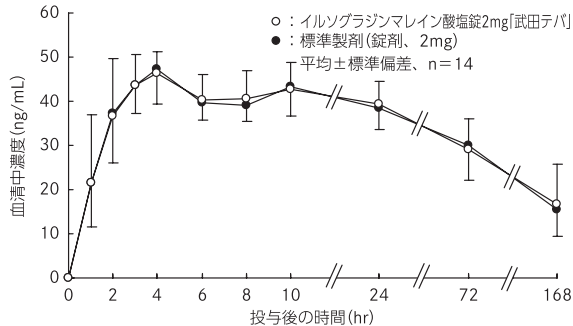
6. その他の注意

健康人における本薬の血漿中からの消失半減期は約150時間である。

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験¹⁾

- イルソグラジンマレイン酸塩錠2mg〔武田テバ〕
イルソグラジンマレイン酸塩錠2mg〔武田テバ〕と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（イルソグラジンマレイン酸塩として2mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

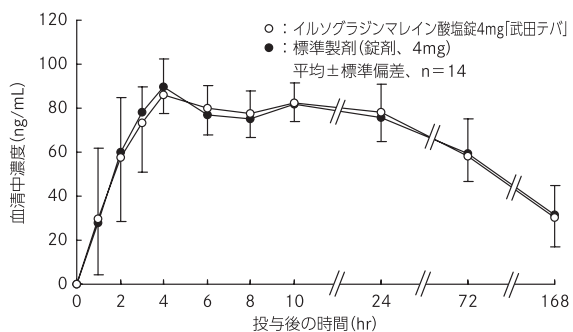


薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₁₆₈ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
イルソグラジンマレイン酸塩錠2mg〔武田テバ〕	2	4797.1 ± 1104.5	48.5 ± 6.3	3.8 ± 1.4	157.9 ± 152.4
標準製剤 (錠剤, 2mg)	2	4769.4 ± 876.6	48.6 ± 4.3	4.5 ± 2.4	113.8 ± 42.8

血清中濃度並びに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。

- イルソグラジンマレイン酸塩錠4mg〔武田テバ〕
イルソグラジンマレイン酸塩錠4mg〔武田テバ〕と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（イルソグラジンマレイン酸塩として4mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₁₆₈ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
イルソグラジンマレイン酸塩錠4mg〔武田テバ〕	4	9331.5 ± 1795.8	91.1 ± 8.7	7.5 ± 7.4	111.8 ± 36.8
標準製剤 (錠剤, 4mg)	4	9385.6 ± 2129.6	91.0 ± 11.7	6.6 ± 5.6	121.2 ± 61.3

血清中濃度並びに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。

2. 溶出性²⁾

イルソグラジンマレイン酸塩錠2mg〔武田テバ〕及びイルソグラジンマレイン酸塩錠4mg〔武田テバ〕の溶出性は、日本薬局方に定められた規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】³⁾

胃粘膜防御因子増強薬に分類される抗潰瘍剤。胃粘膜内cAMP含量を増加させて細胞間コミュニケーションを活性化することにより胃粘膜細胞の統合性を高め、細胞防御機能を亢進すると考えられる。

【有効成分に関する理化学的知見】

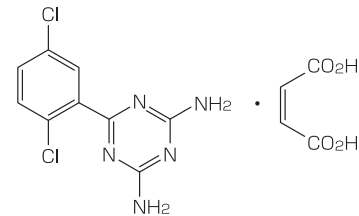
一般名：イルソグラジンマレイン酸塩 (Irsogladine Maleate)
化学名：6-(2,5-Dichlorophenyl)-1,3,5-triazine-2,4-diamine monomaleate

分子式：C₉H₇Cl₂N₅ · C₄H₄O₄

分子量：372.16

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、味はやや苦い。酢酸(100)又はエチレングリコールにやや溶けにくく、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けにくく、水にはほとんど溶けない。

構造式：



【取扱い上の注意】⁴⁾

安定性試験結果の概要

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、イルソグラジンマレイン酸塩錠2mg〔武田テバ〕及びイルソグラジンマレイン酸塩錠4mg〔武田テバ〕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】

- イルソグラジンマレイン酸塩錠2mg〔武田テバ〕
※PTP包装：100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)
- イルソグラジンマレイン酸塩錠4mg〔武田テバ〕
※※PTP包装：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

【主要文献】

- 1) 武田テバファーマ(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 武田テバファーマ(株)社内資料(溶出試験)
- ※※3) 第十七改正日本薬局方解説書
- 4) 武田テバファーマ(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文献・社内資料は下記にご請求下さい。
武田テバファーマ株式会社 武田テバDIセンター
〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
TEL 0120-923-093
受付時間 9:00～17:30(土日祝日・弊社休業日を除く)

※販売

武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号

※製造販売元

武田テバファーマ株式会社
名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

PQ017501
PQ017601
01