

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「アメル」
レバミピド顆粒 20%「アメル」



貯 法:

「取扱い上の注意」の項参照

使用期限:

包装箱、ラベルに表示。

使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。

〈レバミピド製剤〉

REBAMIPIDE

	錠100mg	顆粒20%
承認番号	22100AMX02003	22100AMX01906
薬価収載	2009年11月	2009年11月
販売開始	2009年11月	2009年11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「アメル」	レバミピド顆粒20%「アメル」
有効成分	1錠中、日局レバミピド100mgを含有する。	1g中、日局レバミピド200mgを含有する。
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	乳糖水和物、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、ポリソルベート80、ヒプロメロース、エチルセルロース、マクロゴール6000、軽質無水ケイ酸

2. 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
レバミピド錠 100mg「アメル」	フィルムコーティング錠		レバミピド 100 アメル
	白色	直径：約8.1mm 厚さ：約3.6mm 質量：約175mg	

販売名	剤形・色	識別コード
レバミピド顆粒 20%「アメル」	フィルムコート顆粒	KW833
	白色～帯黄白色	

【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回レバミピドとして100mg(レバミピド錠100mg「アメル」：1錠、レバミピド顆粒20%「アメル」：0.5g)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(レバミピド錠100mg「アメル」：1錠、レバミピド顆粒20%「アメル」：0.5g)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、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 ^{注1)}	発疹、掻痒感、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、口渴等
肝臓 ^{注2)}	AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、AI-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】

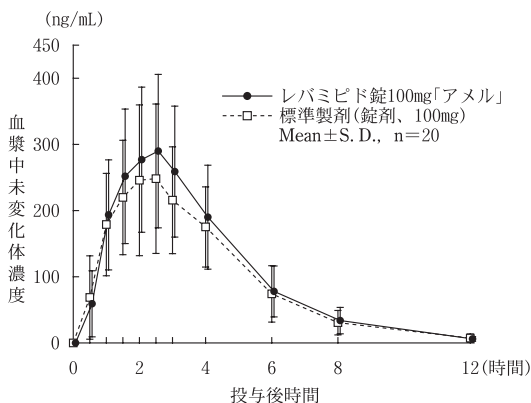
(生物学的同等性試験)¹⁾

レバミピド錠100mg「アメル」及びレバミピド顆粒20%「アメル」と各標準製剤について、下記の通りクロスオーバー法により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、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)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)～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。

	標準製剤	試験投与量
レバミピド錠100mg「アメル」	錠剤、100mg	それぞれ1錠(レバミピドとして100mg)
レバミピド顆粒20%「アメル」	顆粒剤、20%	それぞれ0.5g(レバミピドとして100mg)

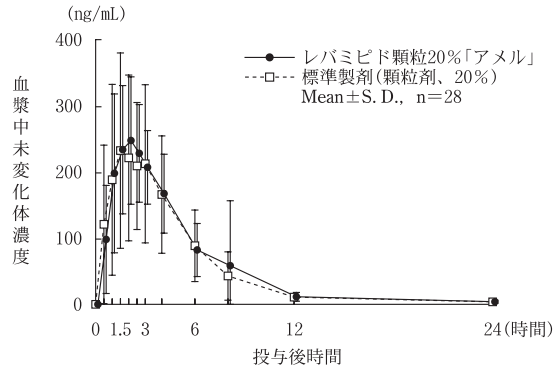
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₁₂₎ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
レバミピド錠100mg「アメル」	1284.98±413.07	330.57±113.19	2.40±0.80	1.69±0.38
標準製剤 (錠剤、100mg)	1161.02±389.23	284.03±99.29	2.08±0.78	1.85±0.46

(Mean ± S. D., n = 20)



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₂₄₎ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
レバミピド顆粒20%「アメル」	1364.66±452.25	325.87±95.20	2.16±1.44	5.09±2.33
標準製剤 (顆粒剤、20%)	1310.09±394.83	349.43±116.36	1.84±1.01	5.67±2.36

(Mean ± S. D., n = 28)



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。

(溶出挙動)²⁾

レバミピド錠100mg「アメル」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】

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⁾

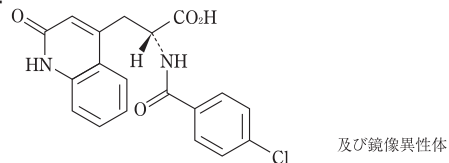
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：レバミピド(Rebamipide)

分子式：C₁₉H₁₅ClN₂O₄

分子量：370.79

構造式：



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

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。

本品の*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】

1. 貯法

錠100mg：室温保存

顆粒20%：室温保存(吸湿注意、開封後は密封すること)

2. 安定性試験⁴⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、レバミピド錠100mg「アメル」及び顆粒20%「アメル」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「アメル」：

PTP100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

バラ500錠

レバミピド顆粒20%「アメル」：

バラ500g(250g×2)

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 共和薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店, C-5930(2016)
- 4) 共和薬品工業株式会社 社内資料：安定性試験

*〈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。

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口

〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

