

2022年4月改訂（第2版）

日本標準商品分類番号

872329

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2013 に準拠して作成[一部 2018(2019年更新版に準拠)]

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 「EMEC」**

REBAMIPIDE TABLETS 100mg「EMEC」

剤形	錠剤（フィルムコーティング錠）
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中レバミピド 100mg を含有する。
一般名	和名：レバミピド [JAN] 洋名：Rebamipide [JAN, INN]
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日：2009年1月14日
薬価基準収載 ・発売年月日	薬価基準収載年月日：2009年5月15日 発売年月日：2009年5月15日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：大原薬品工業株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	大原薬品工業株式会社 お客様相談室 フリーダイヤル 0120-419-363 URL <a href="https://www.ohara-ch.co.jp">https://www.ohara-ch.co.jp</a>

本 IF は 2021 年 3 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

## IF 利用の手引きの概要－日本病院薬剤師会－

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

#### [IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとす。ただし、添付文書で赤字・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

#### [IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤，注射剤，外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの，製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下，「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は，電子媒体での提供を基本とし，必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は，平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については，「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂，再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ，記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては，PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は，電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については，医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが，IF の原点を踏まえ，医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ，IF の利用性を高める必要がある。また，随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては，IF が改訂されるまでの間は，当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等，あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに，IF の使用にあたっては，最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり，その取扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし，薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により，製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて，当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから，記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は，IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり，インターネットでの公開等も踏まえ，薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

# 目 次

I 概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II 名称に関する項目	
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）	2
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV 製剤に関する項目	
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	4
4. 製剤の各種条件下における安定性	5
5. 調製法及び溶解後の安定性	5
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	6
7. 溶出性	6
8. 生物学的試験法	7
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8
10. 製剤中の有効成分の定量法	8
11. 力価	8
12. 混入する可能性のある夾雑物	8
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器 に関する情報	8
14. その他	8
V 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9
3. 臨床成績	9
VI 薬効薬理に関する項目	
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10
2. 薬理作用	10
VII 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	11
2. 薬物速度論的パラメータ	12
3. 吸収	12
4. 分布	12
5. 代謝	13
6. 排泄	13
7. トランスポーターに関する情報	13
8. 透析等による除去率	13
VIII 安全性(使用上の注意等)に関する項目	
1. 警告内容とその理由	14
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	14
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由	14
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由	14
5. 慎重投与と内容とその理由	14
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14
7. 相互作用	14
8. 副作用	14
9. 高齢者への投与	16
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	16
11. 小児等への投与	16
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
13. 過量投与	16
14. 適用上の注意	16
15. その他の注意	16
16. その他	16
IX 非臨床試験に関する項目	
1. 薬理試験	17
2. 毒性試験	17
X 管理的事項に関する項目	
1. 規制区分	18
2. 有効期間又は使用期限	18
3. 貯法・保存条件	18
4. 薬剤取扱い上の注意点	18
5. 承認条件等	18
6. 包装	18
7. 容器の材質	18
8. 同一成分・同効薬	19
9. 国際誕生年月日	19
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
11. 薬価基準収載年月日	19
12. 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の 年月日及びその内容	19
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	19

14. 再審査期間	19
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
16. 各種コード	19
17. 保険給付上の注意	19

## X I 文献

1. 引用文献	20
2. その他の参考文献	20

## X II 参考資料

1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21

## X III 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての 参考情報	22
2. その他の関連資料	22

付表	23
----	----

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

レバミピド（一般名）は胃炎・胃潰瘍治療剤であり、本邦では1990年12月に上市されている。レバミピド錠100mg「オーハラ」は、大原薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、医薬発第481号（平成11年4月8日）（付録参照）に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2009年1月に承認を取得した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、胃潰瘍及び急性胃炎・慢性胃炎の急性増悪期の胃粘膜病変の治療薬である。（「V. 治療に関する項目」参照）
- (2) 本剤は、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。（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）
- (3) 成分名、屋号が印字された錠剤である。（「IV. 製剤に関する項目」参照）
- (4) 成分名、含量、屋号、薬効、GS1コードが表示されたPTPシートである。
- (5) 個装箱には、錠剤イメージ図、製品情報カード、新バーコードの3つの製品情報が盛り込まれている。
- (6) 重大な副作用として、**ショック、アナフィラキシー様症状、白血球減少、血小板減少、肝機能障害、黄疸**（いずれも頻度不明）が報告されている。（「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」参照）

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

レバミピド錠 100mg 「EMEC」

#### (2) 洋名

REBAMIPIDE TABLETS 100mg 「EMEC」

#### (3) 名称の由来

通知「薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

### 2. 一般名

#### (1) 和名(命名法)

レバミピド(JAN)

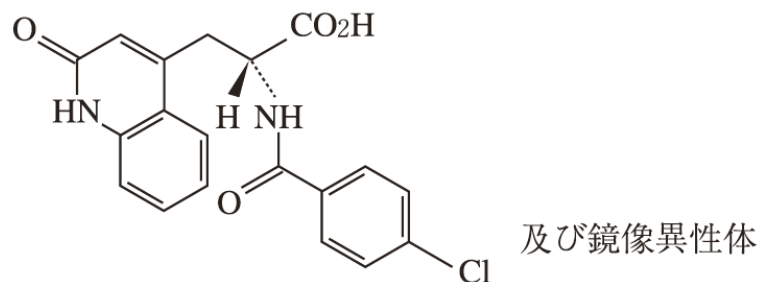
#### (2) 洋名(命名法)

Rebamipide(JAN, INN)

#### (3) ステム

不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

(1) 分子式:  $C_{19}H_{15}ClN_2O_4$

(2) 分子量: 370.79

### 5. 化学名(命名法)

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

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

なし

### 7. CAS 登録番号

111911-87-6

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末であり、味は苦い。

##### (2) 溶解性

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
<i>N,N</i> -ジメチルホルムアミド	やや溶けやすい
メタノール	極めて溶けにくい
エタノール(95)	極めて溶けにくい
水	ほとんど溶けない

溶解度<sup>1)</sup>

pH1.2	0.001mg/mL 以下
pH6.0	0.35mg/mL
pH6.8	1.7mg/mL
水	0.008mg/mL

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点: 約 291°C (分解)

##### (5) 酸塩基解離定数<sup>1)</sup>

$pK_a$ : 3.3 (25°C)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

*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。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「レバミピド」による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)
- (3) 炎色反応試験(2)

#### 4. 有効成分の定量法

日局「レバミピド」による。

滴定終点検出法(指示薬法)






## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

区別：錠剤(フィルムコーティング錠)

剤形	色調	外形・サイズ			識別コード※
		表面	裏面	側面	
錠剤 (フィルムコーティング錠)	白色				レバミピド EMEC
		直径: 8.1mm 厚さ: 3.4mm 質量: 175mg			

※錠剤表面に印刷表示

#### (2) 製剤の物性<sup>2)</sup>

硬度 (mean, n=5) : 8.1kg

#### (3) 識別コード

レバミピド EMEC

#### (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分(活性成分)の含量

1錠中 レバミピド 100mg を含有

#### (2) 添加物

カルナウバロウ、カルメロースカルシウム、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、タルク、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール 6000

#### (3) その他

該当資料なし

### 3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

##### (1) 加速条件下での安定性試験<sup>3)</sup>

- 保存形態
  - PTP包装：PTP(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)包装したものを、紙箱に入れ封を施した。
  - バラ包装：ポリエチレン製容器に入れ、封を施した。
- 保存条件：40℃(±2℃)、75%RH(±5%RH)
- 保存期間：6ヵ月
- 試験項目：性状、確認試験、溶出試験、定量
- 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

保存条件	期間	保存形態	結果
40℃(±2℃)、 75%RH(±5%RH)	6ヵ月	PTP包装	全て変化なし
		バラ包装	全て変化なし

##### (2) 長期保存条件下での安定性試験<sup>4)</sup>

- 保存形態
  - PTP包装：PTP(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)包装したものを、紙箱に入れ封を施した。
  - バラ包装：ポリエチレン製容器に入れ、封を施した。
- 保存条件：25℃、60%RH
- 保存期間：36ヵ月
- 試験項目：性状、溶出試験、定量
- 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

保存条件	期間	保存形態	結果
25℃、60%RH	36ヵ月	PTP包装	全て変化なし
		バラ包装	全て変化なし

##### (3) 無包装状態の安定性<sup>2)</sup>

レバミピド錠 100mg「EMEC」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験(性状、純度試験、溶出試験、定量、硬度)を行った。

	保存条件	結果
温度	40℃、3ヵ月(遮光・気密容器)	全て変化なし
湿度	25℃、75%RH、3ヵ月(遮光・開放)	硬度低下*。その他は変化なし。
光	総照射量 120 万 lx・hr(開放)	全て変化なし

\*錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)の評価基準での判定は「変化なし」に該当

#### 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

## 7. 溶出性

### (1) 日局溶出試験<sup>5)</sup>

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

条件：回転数 50rpm

試験液 薄めた pH6.0 のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸塩緩衝液(1→4)

試験結果：レバミピド錠 100mg「EMEC」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(60 分間の溶出率が 75%以上)に適合する。

時間	溶出率※(最小値～最大値)
60 分	87.5%(79.7～98.5%)

※:3Lot 平均値

### (2) 後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験<sup>6)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 13 年 5 月 31 日 医薬審発第 786 号)」の溶出試験の項に従って試験を行った。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

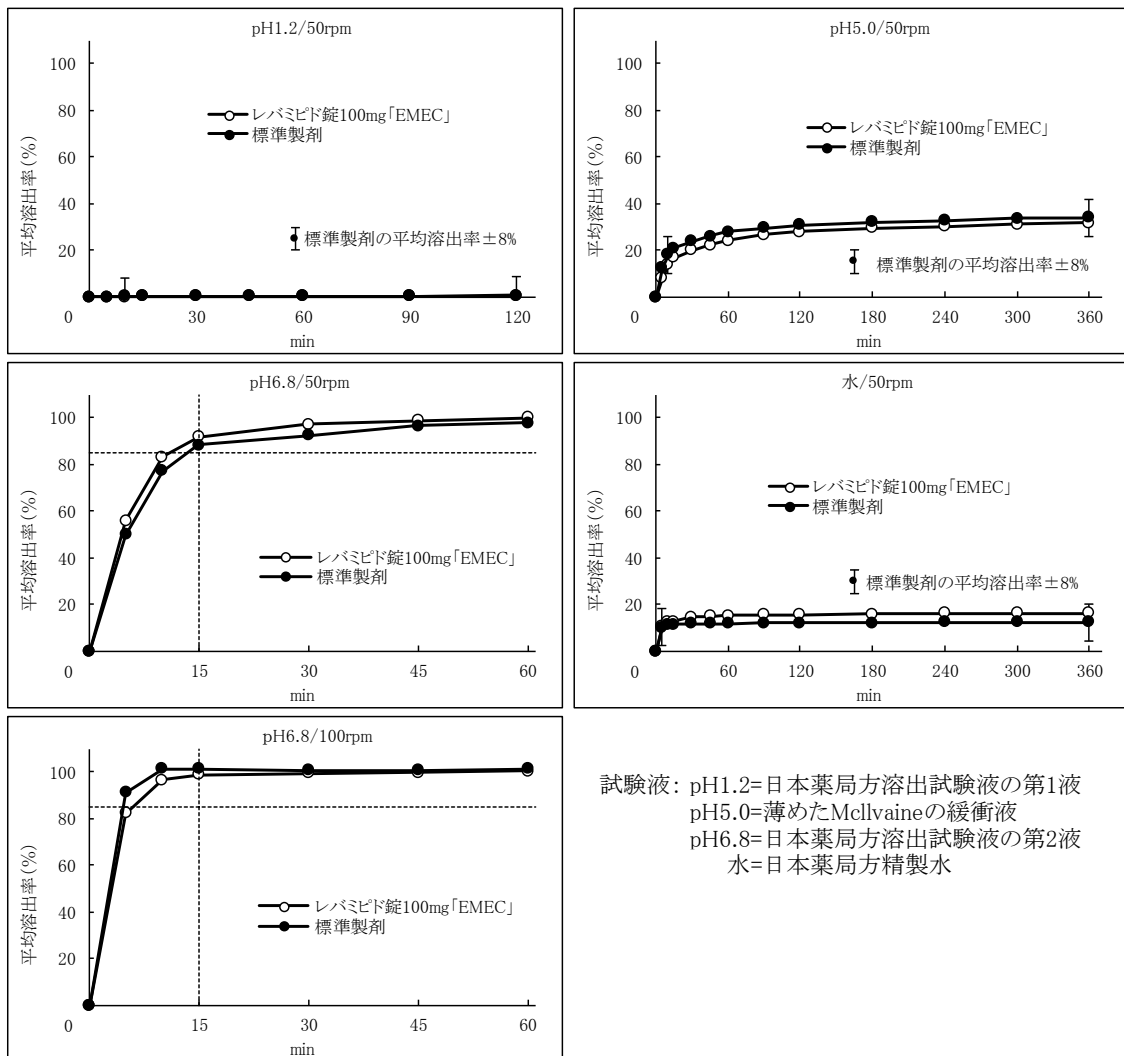
試験結果：「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に適合した。これによりレバミピド錠 100mg「EMEC」の溶出挙動は、全ての試験条件において標準製剤と同等と判定された。

表 溶出挙動における同等性(レバミピド錠 100mg「EMEC」及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件		溶出時間(分)	平均溶出率(%)		同等性の判定基準 (レバミピド錠 100mg「EMEC」の 溶出条件)	判定
			レバミピド錠 100mg「EMEC」	標準製剤 (錠剤、100mg)		
50rpm	pH1.2	5	0.1	0.2	5及び120分間の平均溶出率が標準製剤の±8%の範囲	適
		120	0.5	0.6		
	pH5.0	10	13.6	18.1	10及び360分間の平均溶出率が標準製剤の±8%の範囲	適
		360	31.8	34.1		
	pH6.8	15	91.7	88.2	15分以内に平均85%以上溶出	適
	水	5	10.8	10.4	5及び360分間の平均溶出率が標準製剤の±8%の範囲	適
360		16.4	12.4			
100rpm	pH6.8	15	98.8	101.3	15分以内に平均85%以上溶出	適

(n=6)

(溶出曲線)



## 8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「レバミピド錠」による。  
薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「レバミピド錠」による。  
液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

特になし

14. その他

特になし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

- ・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

### 2. 用法及び用量

- ・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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6) 治療的使用

##### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

##### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

セラキサート塩酸塩、テプレノン、ゲファルナート、ソファルコン

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

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>7)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間<sup>8)</sup>

レバミピド錠 100mg 「EMEC」を1錠：2.0時間

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>8)</sup>

##### 生物学的同等性試験

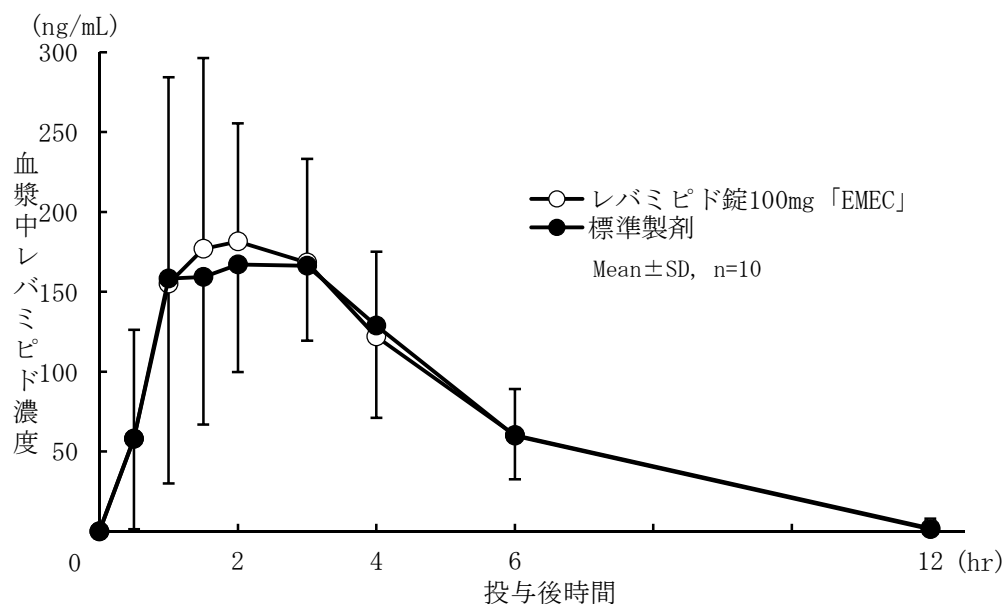
レバミピド錠 100mg 「EMEC」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠 (レバミピドとして 100mg)健康成人男性に絶食下单回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、 $C_{max}$ )について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

##### 薬物動態パラメータ

	n	AUC <sub>0→12</sub> (ng·hr/mL)	$C_{max}$ (ng/mL)	$t_{max}$ (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
レバミピド錠 100mg 「EMEC」	10	928.9±243.1	241.1±87.4	2.0±0.8	1.85±0.74 (n=9)*
標準製剤	10	916.8±193.9	239.0±75.5	2.1±1.0	2.27±1.48

(Mean±S. D.)

\*1例の被験者の血漿中薬物濃度が2相性の推移を示したため、その $T_{1/2}$ は算出不能であった。



1錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移

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。



(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移・測定法 (3)臨床試験で確認された血中濃度」の項を参照のこと。

(4) 消失速度定数<sup>8)</sup>

健康成人単回投与

	100mg (n=9)
Kel (/hr)	0.377 ± 0.242

(Mean ± SD)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率<sup>7)</sup>

*in vitro*での血漿タンパク結合率は0.05~5 μg/mLの濃度において98.4~98.6%であった。

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>

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。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦への投与(2)」の項を参照）

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路<sup>7)</sup>

尿中

(2) 排泄率<sup>7)</sup>

健康成人男子にレバミピド 100mg を投与した場合、尿中に投与量の約 10%が排泄された。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

## Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)

**【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

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

#### (2) 併用注意とその理由

該当しない

### 8. 副作用

#### (1) 副作用の概要

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。以下のよ  
うな副作用があらわれた場合には、症状に応じて使用を中止するなど適切な処置を行う  
こと。

(2) 重大な副作用と初期症状

(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)、 $\gamma$ -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。

(3) その他の副作用

	副作用の頻度	
	頻度不明	
過 敏 症 <sup>注1)</sup>	蕁麻疹、発疹、痒感、薬疹様湿疹等の過敏症状	
精神神経系	しびれ、めまい、眠気	
消 化 器	口渇、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	
肝 臓 <sup>注2)</sup>	AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP、A1-Pの上昇等	
血 液	血小板減少、白血球減少、顆粒球減少等	
そ の 他	乳腺腫脹、乳房痛、女性化乳房、乳汁分泌誘発、動悸、発熱、顔面紅潮、舌のしびれ、咳、息苦しい、脱毛、月経異常、BUN上昇、浮腫、咽頭部異物感	

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、発疹等が同時に表れた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

**【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

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。

その他の副作用	
	副作用の頻度
	頻度不明
過 敏 症 <sup>注1)</sup>	蕁麻疹、発疹、痒痒感、薬疹様湿疹等の過敏症状

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。

## 9. 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。

## 10. 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まわると判断される場合のみ投与すること。（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。〕

## 11. 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）。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 13. 過量投与

該当資料なし

## 14. 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。）

## 15. その他の注意

該当資料なし

## 16. その他

該当資料なし

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：レバミピド錠 100mg「EMEC」 該当しない

有効成分：レバミピド 該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(安定性試験結果に基づく)※

※ 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 ヶ月)の結果、レバミピド錠 100mg「EMEC」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<sup>3)</sup>。

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

- ・ 「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 14. 適用上の注意」の項を参照すること。
- ・ くすりのしおり：有り
- ・ 患者向医薬品ガイド：無し

#### (3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

(PTP) 100 錠

500 錠

(バラ) 500 錠

### 7. 容器の材質

PTP 包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

バラ包装：ポリエチレン(容器)、ポリエチレン(キャップ)

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ムコスタ錠 100mg、ムコスタ顆粒 20%

同効薬：セトラキサート塩酸塩、テプレノン、ゲファルナート、ソルファコン等)

9. 国際誕生年月日

1990年 9月 28日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2009年 1月 14日

承認番号：22100AMZ00002000

11. 薬価基準収載年月日

2009年 5月 15日

12. 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は厚生労働大臣の定める「投与期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

16. 各種コード

	HOT9	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算処理 システムコード
レバミピド錠 100mg 「EMEC」	119000703	2329021F1013	620009461

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。



## X I . 文献

### 1. 引用文献

- 1) (財)日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集 No.7 (薬事日報社) p120 (2001)
- 2) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 無包装状態の安定性試験(2005年)
- 3) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 加速試験(1995年)
- 4) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 長期保存試験
- 5) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 溶出試験(2014年)
- 6) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験(1999年)
- 7) 第十六改正日本薬局方解説書(廣川書店) C-5302(2011)
- 8) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 生物学的同等性試験(1995年)
- 9) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 粉碎後の安定性試験(2016年)
- 10) 大原薬品工業株式会社 社内資料: 経管通過性試験(2009年)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

本剤は海外では発売されていない。  
尚、レバミピド製剤としては海外で販売されている。

(2022年4月時点)

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XIII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について (その3)」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡)

#### (1) 粉砕<sup>9)</sup>

レバミピド錠 100mg「EMEC」の粉砕品を保存し、安定性試験(性状、純度試験、定量)を行った。

試験条件	結果
40℃、1 ヶ月(遮光・気密容器)	全て変化なし
25℃、75%RH、1 ヶ月(遮光・開放)	全て変化なし
総照射量 120 万 lx・hr(開放)	全て変化なし

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性<sup>10)</sup>

試験方法

[崩壊懸濁試験]

ディスペンサー内に試料 1 錠を入れ、約 55℃の温湯 20mL をディスペンサーに吸い取り、筒先の蓋をしてディスペンサーを 5 分間放置した後、90 度横転 (15 往復) し、崩壊・懸濁の状態を観察する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後、同様の操作を行う。

[通過性試験]

懸濁性試験で得られた懸濁液を、経管栄養チューブの注入端より 2~3mL/秒の速度で注入する。チューブはベッドの上を想定し、体内挿入端から 3 分 2 を水平にし、他端 (注入端) を 30cm の高さにセットし、チューブ (サイズ ; 8 フレンチ) の通過性を確認した。

試験方法	崩壊懸濁試験	通過性試験	判定
試験結果	5 分以内に崩壊・懸濁した。	チューブ (8 フレンチ) を通過した。	適 1

### 2. その他の関連資料

特になし

## 付表

平成 11 年 4 月 8 日医薬発第 481 号「医薬品の承認申請について」\*

別表 1 及び別表 2-(1) 医療用医薬品より改変

※注 平成 12 年 4 月 1 日から平成 17 年 3 月 31 日の間に申請した医薬品に適用された。

添付資料の内容		新有効成分含有製剤 (先発医薬品)	その他の医薬品 (後発医薬品)	剤形追加に係る 医薬品 (後発医薬品)
イ 起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起原又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定	○	×	×
	2 物理的・化学的性質等	○	×	×
	3 規格及び試験方法	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	×
	2 苛酷試験	○	×	×
	3 加速試験	×	○	○
ニ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 単回投与毒性	○	×	×
	2 反復投与毒性	○	×	×
	3 生殖発生毒性	○	×	×
	4 変異原性	○	×	×
	5 がん原性	△	×	×
	6 局所刺激性	△	×	×
	7 その他の毒性	△	×	×
ホ 薬理試験に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 一般薬理	○	×	×
ヘ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 生物学的同等性	×	○	○
ト 臨床試験の試験成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	○

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される

\* 本通知は平成 17 年 3 月 31 日 薬食発 0331015 号により改正された。