

胃炎・胃潰瘍治療剤

**日本薬局方 テプレノンカプセル

***テプレノンカプセル50mg「サワイ」**

***テプレノン細粒10%「サワイ」**

TEPRENONE

テプレノン製剤

日本標準商品分類番号
8 7 2 3 2 9

	カプセル50mg	細粒10%
* 承認番号	22400AMX00936000	22400AMX00937000
薬価収載	2013年6月	2013年6月
販売開始	1997年7月	1997年7月
効能追加	2007年2月	2007年2月

** 貯 法：室温保存
 細粒バラ包装は、開封後は光を避けて保存すること(光により含量が低下することがある)
 使用期限：外箱等に表示
 調剤上の留意事項：細粒剤は、合成ケイ酸アルミニウムとの配合により、次第に黄変し含量が低下するので、配合剤とせず組み合わせ剤とすること

【組成・性状】

・組成

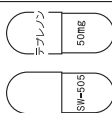
テプレノンカプセル50mg「サワイ」：1カプセル中に日局テプレノン50mgを含有する。

添加物として、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、トコフェロール、ヒドロキシプロピルセルロース、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Na、青色1号、黄色5号を含有する。

テプレノン細粒10%「サワイ」：1g中に日局テプレノン100mgを含有する。

添加物として、タルク、トコフェロール、二酸化ケイ素、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトールを含有する。

・製剤の性状

品名	剤形	外形 全長(mm)・重量(mg)・カプセル号数	性状
テプレノンカプセル50mg「サワイ」	硬カプセル剤	 14.2 約160 4 [識別コード：SW-505]	頭部：灰青緑色不透明 胴部：淡橙色不透明 内容物：白色～帯黄白色の粒及び粉末
テプレノン細粒10%「サワイ」	細粒剤	—	白色～帯黄白色

【効能・効果】

・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

・胃潰瘍

【用法・用量】

○テプレノンカプセル50mg「サワイ」

通常成人、3カプセル(テプレノンとして150mg)を1日3回に分けて食後に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

○テプレノン細粒10%「サワイ」

通常成人、細粒1.5g(テプレノンとして150mg)を1日3回に分けて食後に経口投与する。

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。

1) 重大な副作用(頻度不明)

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、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
消化器	便秘、下痢、嘔気、口渇、腹痛、腹部膨満感
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇
精神神経系	頭痛
過敏症 ^{注)}	発疹、痒痒感
その他	総コレステロールの上昇、眼瞼の発赤・熱感、血小板減少

注)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。

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減量するなど注意すること。

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)

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

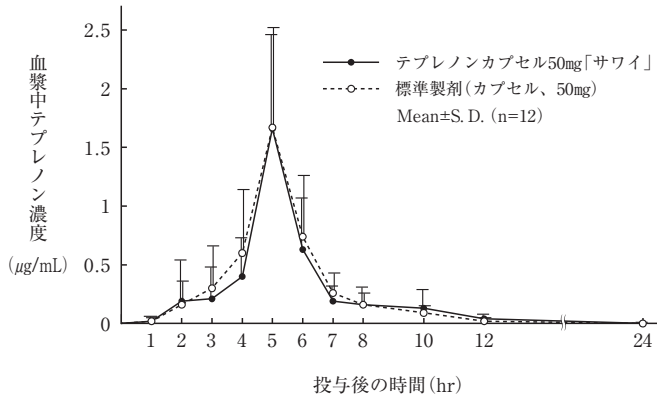
○テプレノンカプセル50mg「サワイ」

テプレノンカプセル50mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ3カプセル(テプレノンとして150mg)食後単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中テプレノン濃度を測定した。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。¹⁾

各製剤3カプセル投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (μ g/mL)	T _{max} (hr)	AUC _{0-24hr} (μ g·hr/mL)
テプレノンカプセル50mg「サワイ」	1.69±0.76	4.7±0.9	4.09±1.46
標準製剤(カプセル、50mg)	1.74±0.81	4.8±0.4	4.30±1.64

(Mean±S.D.)



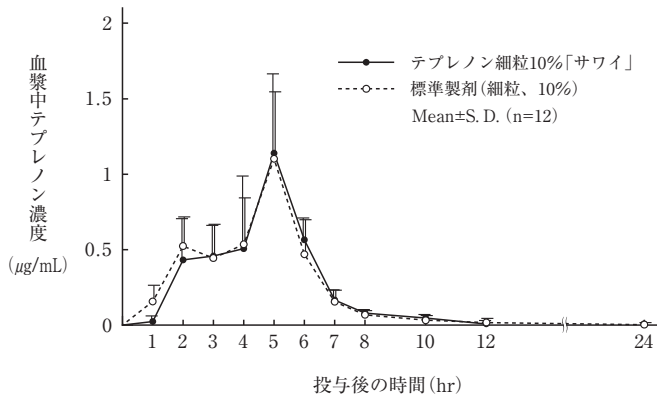
○テブレノン細粒10%「サワイ」

テブレノン細粒10%「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1.5g(テブレノンとして150mg)食後単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中テブレノン濃度を測定した。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。²⁾

各製剤1.5g投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (μg/mL)	T _{max} (hr)	AUC _{0-24hr} (μg·hr/mL)
テブレノン細粒10%「サワイ」	1.14 ± 0.53	4.9 ± 0.3	3.57 ± 1.19
標準製剤(細粒、10%)	1.15 ± 0.39	4.9 ± 0.3	3.71 ± 1.05

(Mean ± S. D.)



(注)テブレノン150mg単回投与は、承認外用量である。

血漿中濃度ならびに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

カプセル50mgは日本薬局方に、細粒10%は日本薬局方外医薬品規格第3部に、それぞれ定められた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】

防御因子増強型抗潰瘍薬。胃粘液の合成及び分泌を促進することにより、胃粘膜を保護し、胃粘膜組織を修復する。プロスタグランジンE₂、I₂の産生増加など様々な作用が示されており、これらが総合して奏功すると考えられている。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：テブレノン(Teprenone)

化学名：(5*E*, 9*E*, 13*E*)-6, 10, 14, 18-Tetramethylnonadeca-

5, 9, 13, 17-tetraen-2-one

(5*Z*, 9*E*, 13*E*)-6, 10, 14, 18-Tetramethylnonadeca-

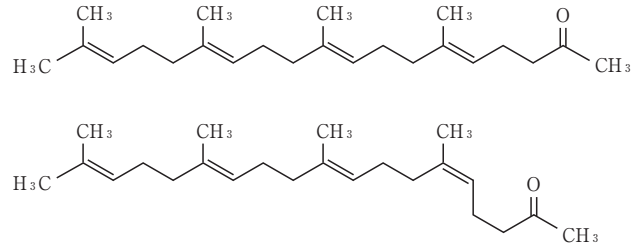
5, 9, 13, 17-tetraen-2-one

本品はモノシス体及びオールトランス体からなり、その比は約2：3である。

分子式：C₂₃H₃₈O

分子量：330.55

構造式：



性状：テブレノンは無色～微黄色澄明の油状の液で、わずかに特異なおいがある。エタノール(99.5)、酢酸エチル又はヘキサンと混和する。水にほとんど溶けない。空気によって酸化され、徐々に黄色となる。

屈折率：n_D²⁰：1.485～1.491

比重：d₂₀²⁰：0.882～0.890

【取扱い上の注意】

・安定性試験

カプセル50mg：PTP包装及びバラ包装したものをを用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。⁴⁾

細粒10%：分包包装及びバラ包装したものをを用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。⁵⁾

【包装】

テブレノンカプセル50mg「サワイ」：

PTP：100カプセル(10カプセル×10)、

1,000カプセル(10カプセル×100)

バラ：1,000カプセル

テブレノン細粒10%「サワイ」：

180包(1包0.5g)、1,200包(1包0.5g)、1kg(バラ)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

1)、2) 沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]

3)“第16改正日本薬局方 解説書,” 廣川書店, 東京, 2011, C-2932～C-2936.

4)、5) 沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元

沢井製薬株式会社

大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K13 A160622