

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 2018(2019年更新版)に準拠して作成

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「YD」 テプレノン細粒 10%「YD」 TEPRENONE CAPSULES TEPRENONE FINE GRANULES
--

剤形	カプセル 50 mg:硬カプセル剤 細粒 10%:細粒剤		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	カプセル 50 mg:1カプセル中、テプレノン 50mg 含有 細粒 10%:1g中、テプレノン 100mg 含有		
一般名	和名:テプレノン(JAN) 洋名:Teprenone(JAN)		
製造販売承認年月日 薬価基準収載 発売年月日		カプセル 50 mg	細粒 10%
	製造販売承認年月日	2017年6月26日	2017年6月26日
	薬価基準収載年月日	2017年12月8日	2017年12月8日
	発売年月日	1998年8月	1997年7月
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元:陽進堂ホールディングス株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	陽進堂ホールディングス株式会社 お客様相談室 0120-647-734 医療関係者向けホームページ https://yoshindoholdings.co.jp/		

本IFは2023年10月作成(第1版)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、医薬品医療機器情報提供ホームページ <https://www.pmda.go.jp/> にてご確認下さい。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 — 日本病院薬剤師会 —

(2020年4月改訂)

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「IF記載要領2018」が公表され、今般「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」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬

企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等，あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」，「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり，その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて，当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する，医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが，記載・表現には医薬品，医療機器等の品質，有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン，製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは，未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について，製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており，MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより，利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し，その客観性を見抜き，医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり，IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	V III. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	19
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	19
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	19
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	19
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	19
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	19
6. RMP の概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	19
II. 名称に関する項目	2	7. 相互作用	20
1. 販売名	2	8. 副作用	20
2. 一般名	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	20
3. 構造式又は示性式	2	10. 過量投与	21
4. 分子式及び分子量	2	11. 適用上の注意	21
5. 化学名（命名法）	2	12. その他の注意	21
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	I X. 非臨床試験に関する項目	22
III. 有効成分に関する項目	3	1. 薬理試験	22
1. 物理化学的性質	3	2. 毒性試験	22
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	X. 管理的事項に関する項目	23
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 規制区分	23
I V. 製剤に関する項目	4	2. 有効期間	23
1. 剤形	4	3. 包装状態での貯法	23
2. 製剤の組成	4	4. 取扱い上の注意	23
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	5. 患者向け資材	23
4. 力価	5	6. 同一成分・同効薬	23
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	7. 国際誕生年月日	23
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	8. 製造販売承認年月及び承認番号、薬価収載年月日、販売開始年月日	23
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	9. 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容用	24
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	24
9. 溶出性	6	11. 再審査期間	24
10. 容器・包装	8	12. 投薬期間制限に関する情報	24
11. 別途提供される資材類	9	13. 各種コード	24
12. その他	9	14. 保険給付上の注意	24
V. 治療に関する項目	10	X I. 文献	25
1. 効能又は効果	10	1. 引用文献	25
2. 効能又は効果に関連する使用上の注意	10	2. その他の参考文献	25
3. 用法及び用量	10	X II. 参考資料	26
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意	10	1. 主な外国での発売状況	26
5. 臨床試験	10	2. 海外における臨床支援情報	26
V I. 薬効薬理に関する項目	12	X III. 備考	27
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12	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	27
2. 薬理作用	12	2. その他の資料	27
V II. 薬物動態に関する項目	14		
1. 血中濃度の推移	14		
2. 薬物速度論的パラメータ	15		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	16		
4. 吸収	16		
5. 分布	17		
6. 代謝	17		
7. 排泄	18		
8. トランスポーターに関する情報	18		
9. 透析等による除去率	18		
10. 特定の背景を有する患者	18		
11. その他	18		

略語集

なし（個別に各項目において解説する）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

テプレノン[®]は、胃粘膜液の合成・分泌促進、胃粘膜の血流促進、胃粘膜を保護するプロスタグランジンの増加作用を有する、胃炎・胃潰瘍治療剤である。

アンタゴスチンカプセルは株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬発第698号（昭和55年5月30日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、平成6年3月に承認を得て、平成10年8月発売に至った。

平成19年9月に医療事故防止のための販売名変更品「アンタゴスチンカプセル50mg」の承認取得後、平成19年12月の発売に至った。

平成29年6月に一般的名称を基本とした販売名変更品「テプレノンカプセル50mg「YD」」の承認取得後、平成29年12月の発売を経て現在に至っている。

アンタゴスチン細粒10%は株式会社陽進堂が後発医薬品として開発を企画し、薬発第698号（昭和55年5月30日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、平成7年2月に承認を得て、平成9年7月発売に至った。

平成29年6月に一般的名称を基本とした販売名変更品「テプレノン細粒10%「YD」」の承認取得後、平成29年12月の発売を経て現在に至っている。

2. 製品の治療学的特性

重大な副作用として、肝機能障害、黄疸が報告されている。（「VIII. 安全性（使用上の注意）」に関する項目」参照）

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動としている作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2023年10月時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

テプレノンカプセル 50 mg 「YD」

テプレノン細粒 10% 「YD」

(2) 洋名

TEPRENONE CAPSULES

TEPRENONE FINE GRANULES

(3) 名称の由来

成分名＋剤形＋含量＋屋号

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

テプレノン（JAN）

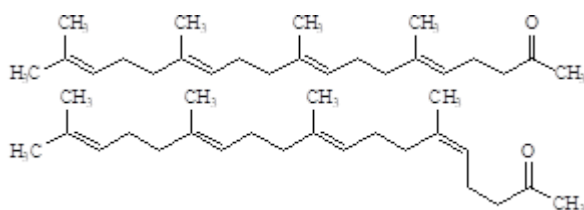
(2) 洋名（命名法）

Teprenone（JAN）

(3) ステム

該当しない

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₃H₃₈O 分子量：330.55

5. 化学名（命名法）

(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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

無色～微黄色澄明の油状の液で、僅かに特異なにおいがある。
空気によって酸化され、徐々に黄色となる。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

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、定量法

確認試験

- (1) 呈色反応 (モリブデンブルーの生成反応を用いた二重結合の確認)
- (2) 沈殿反応 (カルボニル基の確認)
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法 (液膜法)

定量法

ガスクロマトグラフィー


I V. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠

(2) 製剤の外観および性状

販売名		テプレノンカプセル 50mg 「YD」	テプレノン細粒 10% 「YD」
性状		硬カプセル剤 キャップ：灰青緑色不透明 ボディ：淡橙色不透明 内容物：白色～帯黄白色の粉末	細粒剤 白色～帯黄白色
形状	表面		4号

(3) 識別コード

テプレノンカプセル 50 mg 「YD」：YD480

テプレノン細粒 10% 「YD」：YD494

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

	テプレノンカプセル50mg 「YD」	テプレノン細粒10% 「YD」
1錠中もしくは1g中の有効成分	テプレノン 50mg	テプレノン 100mg
添加剤	無水ケイ酸、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、トコフェロール、ゼラチン、酸化チタン、ラウリル硫酸 Na、黄色5号、青色1号	無水ケイ酸、乳糖水和物、D-マンニトール、マクロゴール、カルメロース Ca、トコフェロール

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性³³⁾

<長期保存試験>

テプレノンカプセル 50 mg 「YD」

試験項目	PTP包装	
	試験開始時	36ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	(1)	適合
	(2)	適合
	(3)	適合
溶出試験	適合	適合
質量偏差試験	適合	適合
定量試験(%) (93~107)	99.5	98.0

テプレノン細粒 10% 「YD」

試験項目	バラ包装	
	試験開始時	36ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	(1)	適合
	(2)	適合
	(3)	適合
溶出試験	適合	適合
質量偏差試験	適合	適合
定量試験(%) (93~107)	99.7	96.7

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

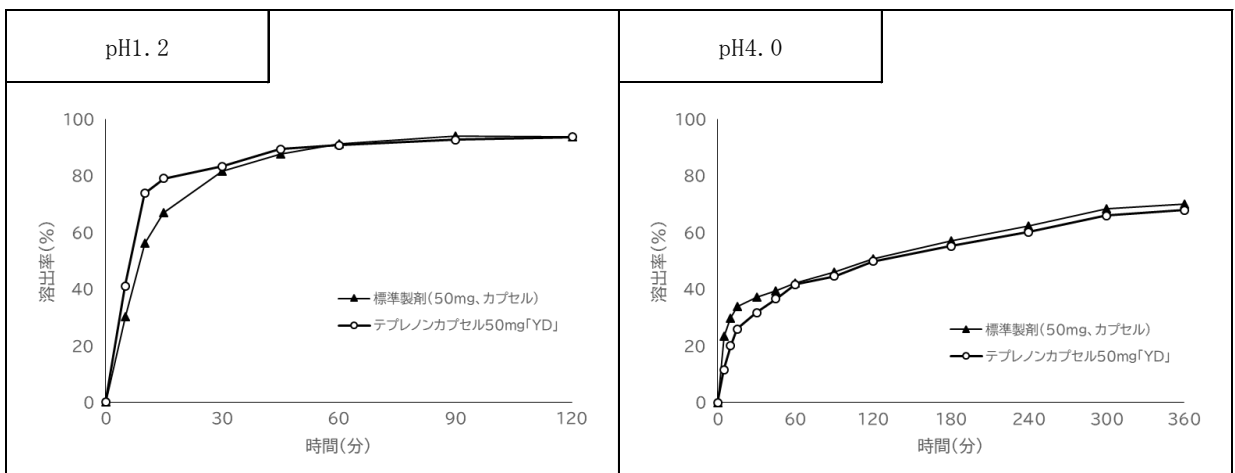
該当資料なし

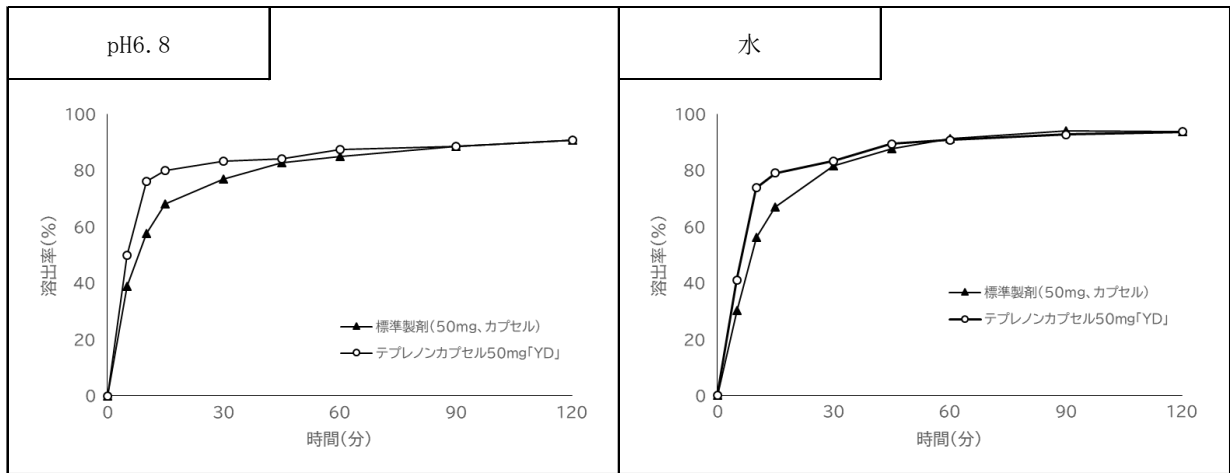
9. 溶出性^{1), 2)}

テプレノンカプセル 50 mg 「YD」

装置	パドル法	温度	37±0.5℃
試験液量	900mL	回転数	100 回転
試験液	<p>pH1.2 - 日本薬局方崩壊試験の第1液+5.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p> <p>pH4.0 - 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 (0.05mol/L) +5.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p> <p>pH6.8 - 薄めた McIlvaine の緩衝液+5.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p> <p>水-日本薬局方精製水+5.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p>		
ガイドライン	医療用医薬品の品質に係る再評価の実施について		
判定基準	pH1.2、pH6.8		
	標準製剤が30分～規定された時間に平均85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が45以上である。		
判定基準	pH4.0、水		
	標準製剤が規定された試験時間内に85%以上溶出しない場合、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15% (標準製剤の平均溶出率が50%未満の場合±8%)の範囲にあるか、又はf2関数の値が50 (標準製剤の平均溶出率が50%未満の場合55)以上である。		

装置 (回転数)	試験液	ポイント	平均溶出率		差 (絶対値)
			標準製剤	試験製剤	
パドル法 (50 回転)	pH1.2	5分	30.2%	41.0%	10.8%
		45分	87.5%	89.3%	1.8%
	pH4.0	45分	39.4%	36.5%	2.9%
		360分	69.9%	67.8%	2.1%
	pH6.8	5分	38.8%	49.9%	11.1%
		45分	82.7%	84.1%	1.4%
	水	60分	41.1%	41.7%	0.6%
		360分	63.1%	68.4%	5.3%

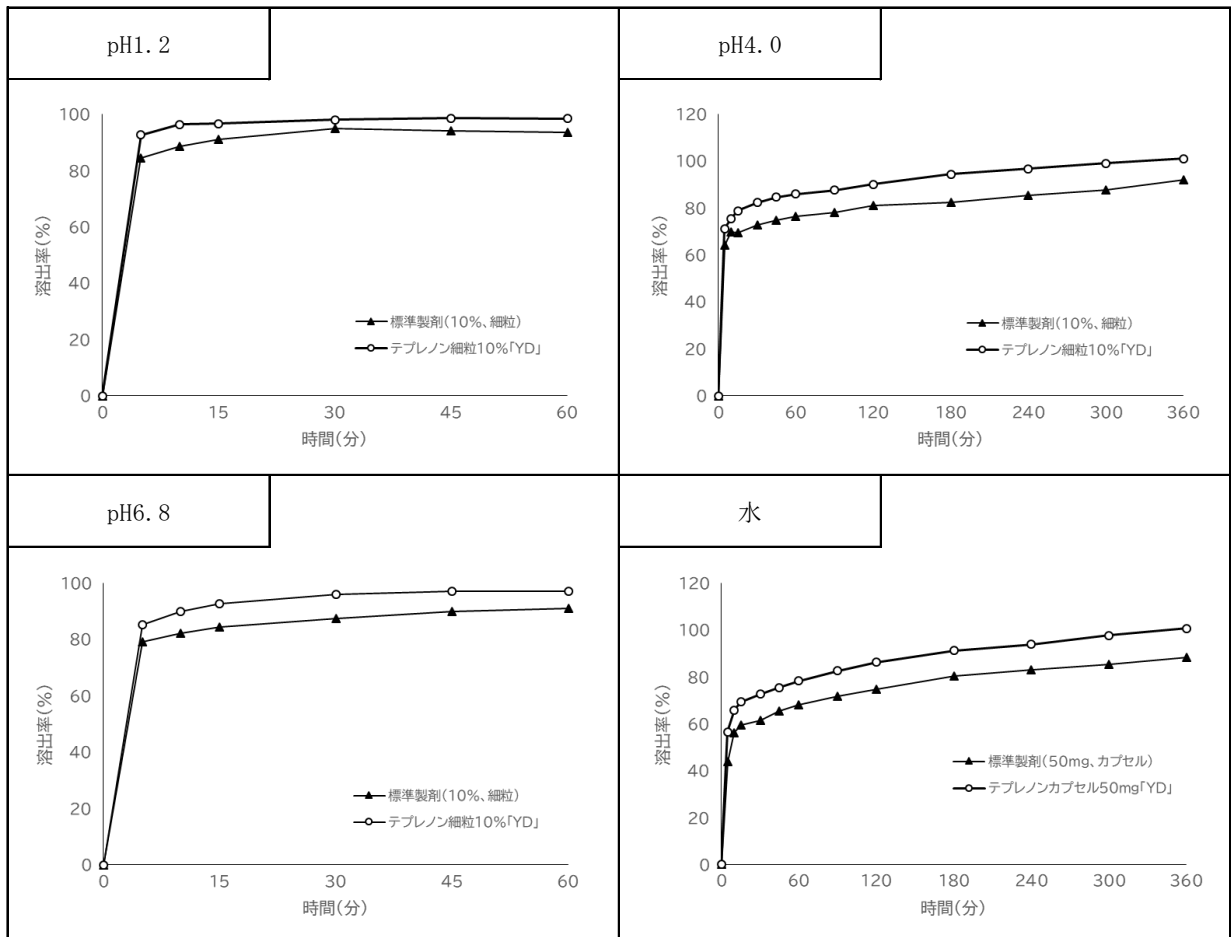




テプレノン細粒 10% 「YD」

装置	パドル法	温度	37±0.5℃
試験液量	900mL	回転数	50 回転
試験液	<p>pH1.2 - 日本薬局方崩壊試験の第1液+2.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p> <p>pH4.0 - 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 (0.05mol/L) +2.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p> <p>pH6.8 - 日本薬局方試薬・試液のリン酸塩緩衝液 (1→2) +2.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p> <p>水-日本薬局方精製水+2.0w/v%ラウリル硫酸ナトリウム</p>		
ガイドライン	医療用医薬品の品質に係る再評価の実施について		
判定基準	pH1.2		
	標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合、試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。		
	pH4.0、水		
	標準製剤が30分～規定された時間に平均85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が45以上である。		
判定基準	pH6.8		
	標準製剤が15分～30分に平均85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が45以上である。		

装置 (回転数)	試験液	ポイント	平均溶出率		差 (絶対値)
			標準製剤	試験製剤	
パドル法 (50 回転)	pH1.2	10 分	88.6%	96.4%	7.8%
		pH4.0	5 分	64.1%	71.1%
	120 分		81.0%	90.0%	9.0%
	pH6.8	5 分	79.1%	85.3%	6.2%
		15 分	84.3%	92.5%	8.2%
	水	5 分	43.7%	56.6%	12.9%
300 分		85.4%	97.6%	12.2%	



10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報
該当しない

(2) 包装

	テプレノンカプセル50mg 「YD」	テプレノン細粒10% 「YD」
PTP	100 カプセル、1000 カプセル	-
バラ	-	100g (アルミ袋・乾燥剤入り) 1000g (アルミ袋・乾燥剤入り)

(3) 予備容量
該当しない

(4) 容器の材質

	テプレノンカプセル50mg 「YD」	テプレノン細粒10% 「YD」
PTP	アルミニウム箔、ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネートフィルム	-
バラ	-	ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネート袋、アルミニウム・ポリ

		エチレン・ポリエチレンテレフタレート ラミネート袋
--	--	------------------------------

1 1. 別途提供される資材類

該当資料なし

1 2. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- 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

2. 効能又は効果に関連する使用上の注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

〈テプレノンカプセル 50mg 「YD」〉

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% 「YD」〉

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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当記載なし

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当しない

V I . 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

アルギン酸ナトリウム、スクラルファート、アルジオキサ、スルピリド、メチルメチオニンスルホニウムクロライド、L-グルタミン、エカベトナトリウム、ポラプレジク、エグアレンナトリウム、セトラキサート塩酸塩、ベネキサートベータデクス塩酸塩、レバミピド、ソファルコン、イルソグラジンマレイン酸塩、トロキシピド、アズレンスルホン酸ナトリウム、ミソプロストール

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

テプレノン[®]は細胞レベルで糖蛋白質代謝を改善し、粘膜の防御機構として胃粘液（糖蛋白質）合成・分泌を正常化し、粘膜の血流を改善することにより、攻撃因子から胃粘膜を防御しているものと考えられている。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗潰瘍作用

ラットを用いた各種実験潰瘍（寒冷拘束ストレス、インドメタシン、アスピリン、プレドニゾロン、レセルピン、酢酸、焼灼、アスピリン-寒冷拘束ストレス）、各種実験胃粘膜病変（塩酸、アスピリン、エタノール、放射線）で、それぞれに強い抗潰瘍作用、胃粘膜病変改善作用が確認されている^{4)~7)}。更に、ラットを用いた実験で、活性酸素が関与していると考えられる compound48/80、血小板活性化因子（PAF）による胃粘膜障害を抑制することも確認されている^{8),9)}。

18.3 胃粘液増加作用

- ・ラット由来の培養胃粘膜上皮細胞において粘液の合成・分泌を促進する¹⁰⁾。
 - ・ラットにおいて粘液を分泌する表層粘液細胞、頸細胞に分布し、これら由来の粘液量を増加させる^{11),12)}。
 - ・ラットにおいて胃粘膜の再生・防御の主要因子である高分子糖蛋白、モルモットにおいてリン脂質の生合成酵素活性を高め、ラット及びヒトにおいてこれらの合成・分泌を促進する^{13)~16)}。
- 更に胃粘液中へ重炭酸塩の分泌を高めることもラット、ウサギで確認されている¹⁷⁾。

18.4 熱ショック蛋白（HSP）誘導による細胞保護作用

モルモットにおいて、胃粘膜細胞内の HSP60、70、90 を誘導し、細胞保護作用を示すことが確認されている¹⁸⁾。

18.5 胃粘膜プロスタグランジン増加作用

ラットにおいて胃粘膜プロスタグランジン E₂, I₂ 含量を増加させる。その機序としてはプロスタグランジン生合成酵素活性を高めることがラットで確認されている¹⁹⁾。

18.6 胃粘膜血流増加並びに改善作用

ラットにおいて胃粘膜血流を増加させ、水浸拘束ストレスによる胃粘膜血流の低下を改善する²⁰⁾。

18.7 胃粘膜保護作用

ラットにおいてエタノールによる胃粘膜障害を抑制する²¹⁾。

健康成人男子においてエタノール負荷による胃粘膜障害を抑制する²²⁾。

18.8 胃粘膜増殖帯細胞の恒常性維持作用

マウスにおいてヒドロコチゾンによる胃粘膜増殖帯細胞の増殖能の低下を改善し、胃粘膜細胞増殖帯の恒常性を保つ²³⁾。

ラット酢酸潰瘍において胃粘膜新生能を賦活して欠損胃粘膜の修復を促進する²⁴⁾。

18.9 脂質過酸化抑制作用

ラットにおいて熱傷ストレス負荷による胃粘膜障害を抑制すると同時に胃粘膜中の過酸化脂質の増加を抑制する²⁵⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

V II. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

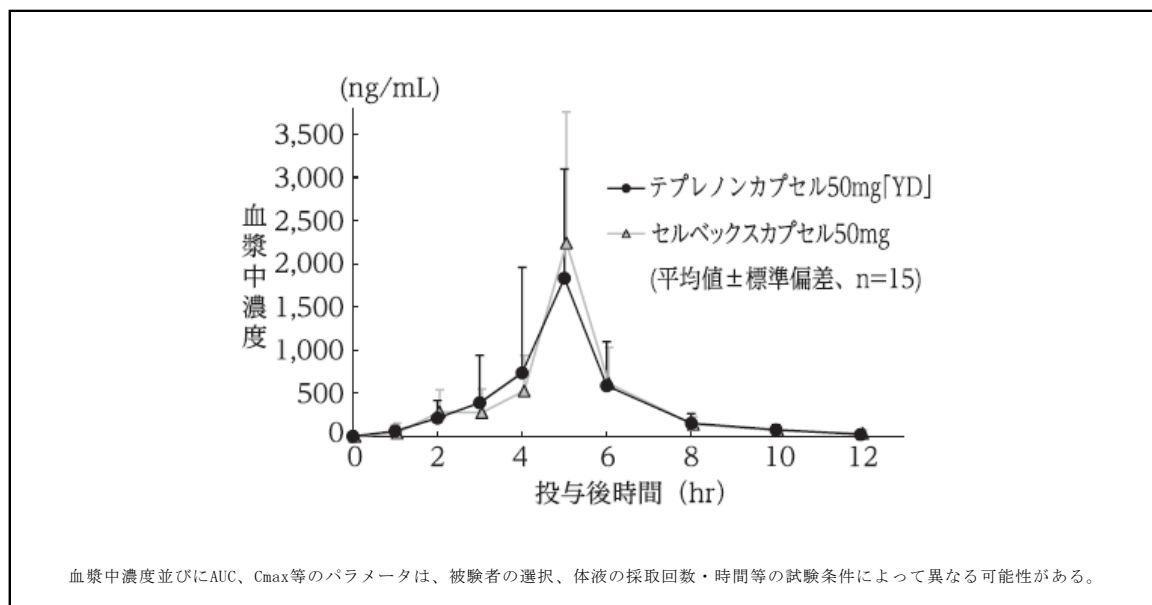
(2) 臨床試験で確認された血中濃度^{1), 2)}

テプレノンカプセル 50 mg 「YD」

ガイドライン	後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン
概要	テプレノンカプセル 50mg 「YD」 とセルベックスカプセル 50mg をクロスオーバー法によりそれぞれ 2 カプセル (テプレノンとして 100mg)、健康成人男子 15 名に食後単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。
結果	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。

	判定パラメータ		参考パラメータ
	AUC ₀₋₁₂ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax(hr)
テプレノンカプセル 50mg 「YD」	4.57 \pm 2.32	2.15 \pm 1.45	4.9 \pm 0.3
セルベックスカプセル 50mg	4.72 \pm 2.14	2.28 \pm 1.47	4.8 \pm 0.6

平均値 \pm 標準偏差、n=15

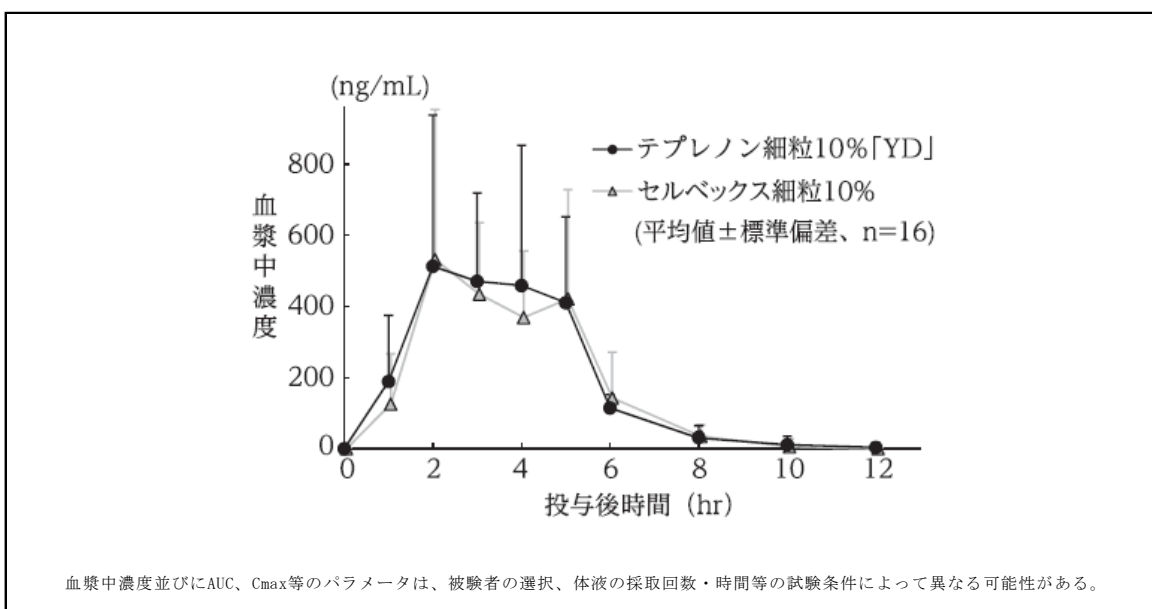


テプレノン細粒 10% 「YD」

ガイドライン	後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン
概要	テプレノン細粒 10% 「YD」 とセルベックス細粒 10% をクロスオーバー法によりそれぞれ 1g (テプレノンとして 100mg) 、健康成人男子 16 名に食後単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。
結果	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。

	判定パラメータ		参考パラメータ
	AUC ₀₋₁₂ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax(hr)
テプレノン細粒 10% 「YD」	2.30 \pm 0.98	0.82 \pm 0.41	3.4 \pm 1.2
セルベックス細粒 10%	2.18 \pm 0.73	0.75 \pm 0.38	3.4 \pm 1.3

平均値 \pm 標準偏差、n=16



(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

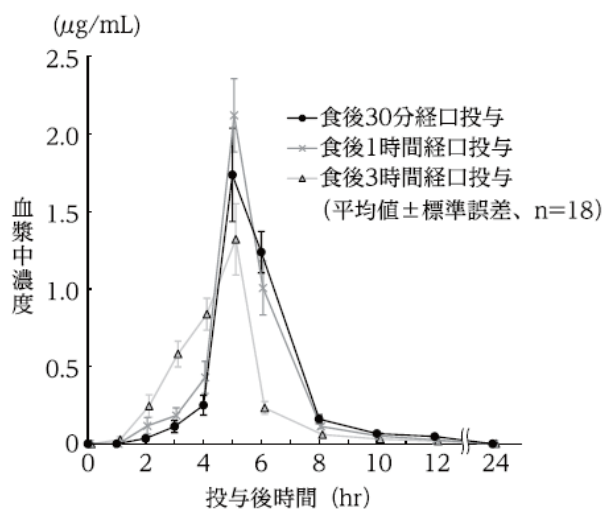
該当資料なし

4. 吸収

16.2 吸収

16.2.1 食事の影響

健康成人男子（18名）にテプレノン3カプセル（テプレノンとして150mg^注）をクロスオーバー法で食後30分、1時間及び3時間に経口投与し、血漿中濃度を測定し、下図及び下表に示した。血漿中濃度曲線下面積（AUC）は食後30分投与を100%とすると、食後1時間投与では変化なく、食後3時間投与では約23%低下した³⁾。



テプレノン 150mg^注単回投与後の血漿中テプレノン濃度

テプレノンの薬物動態パラメータ

	AUC ₀₋₂₄ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)
食後 30 分	4.768 ± 1.368	2.087 ± 1.041	5.4 ± 0.5
食後 1 時間	4.858 ± 1.434	2.274 ± 0.930	5.1 ± 0.6
食後 3 時間	3.671 ± 1.296	1.562 ± 0.852	4.3 ± 0.9

(平均値 ± 標準偏差、n=18)

注) 150mg 単回経口投与は承認外用量である。

5. 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

(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

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 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、寄与率

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

7. 排泄

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

V Ⅲ. 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
設定されていない
2. 禁忌内容とその理由
設定されていない
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由
設定されていない
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由
設定されていない
5. 重要な基本的注意とその理由
設定されていない
6. 特定の背景を有する患者に関する注意
 - (1) 合併症・既往歴等のある患者
設定されていない
 - (2) 腎機能障害患者
設定されていない
 - (3) 肝機能障害患者
設定されていない
 - (4) 生殖能を有するもの
設定されていない
 - (5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。妊娠中の投与を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

一般に、生理機能が低下していることが多い。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

AST、ALT、 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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	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、ALTの上昇		
精神神経系		頭痛	
過敏症		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) 発現頻度は製造販売後調査を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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しないこと。

14.2 薬剤服用時の注意

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ある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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：該当しない

原薬：該当しない

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当しない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり くすりのしおり：あり

その他の患者向資材：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分：セルベックスカプセル、セルベックス細粒

同効薬：アルギン酸ナトリウム、スクラルファート、アルジオキサ、スルピリド、メチルメチオニンスルホニウムクロライド、L-グルタミン、エカベトナトリウム、ポラプレジンク、エグアレンナトリウム、セトラキサート塩酸塩、ベネキサートベータデクス塩酸塩レバミピド、ソファルコン、イルソグラジンマレイン酸塩、トロキシピド、アズレンスルホン酸ナトリウム、ミソプロストール

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価収載年月日、販売開始年月日

製品名	製造販売承認年月	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
テプレノンカプセル 50 mg 「YD」	2017年 6月26日	22900AMX00567	2017年 12月8日	1998年 8月
テプレノン細粒 10% 「YD」	2017年 6月26日	22900AMX00568	2017年 12月8日	1997年 7月

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月及びその内容

変更品目名：アンタゴスチンカプセル、アンタゴスチン細粒 10%（旧販売名）

変更年月日：平成 19 年 2 月 23 日

	変更前	変更後
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 ○胃潰瘍

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

該当しない

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別医薬品 コード (YJ コード)	HOT (9 桁) 番号	レセプト電算 処理システム用 コード
テブレノンカプセル 50 mg 「YD」	2329012M1013	2329012M1374	104484301	620448401
テブレノン細粒 10% 「YD」	2329012C1018	2329012C1344	104457701	620445701

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文献

1. 引用文献

23. 主要文献

- 1) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験（カプセル 50mg）
- 2) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験（細粒 10%）
- 3) 長谷川二郎 他：消化器科. 1987 ; 7(6) : 740-752
- 4) Murakami, M. et al. : *Arzneim. Forsch.* 1981 ; 31-1(5) : 799-804
- 5) Murakami, M. et al. : *Jpn. J. Pharmacol.* 1982 ; 32(5) : 921-924
- 6) 村上学 他：消化器科. 1987 ; 7(6) : 613-616
- 7) 渡辺敦光 他：消化器科. 1987 ; 7(6) : 623-630
- 8) 小林隆 他：*Ulcer Research.* 1994 ; 21(1) : 66-69
- 9) 佐藤泰男 他：*Prog. Med.* 1992 ; 12(3) : 583-586
- 10) Terano, A. et al. : *Digestion.* 1986 ; 33(4) : 206-210
- 11) 中村正彦 他：*Prog. Med.* 1990 ; 10(3) : 561-568
- 12) 滝内比呂也他：臨牀と研究. 1993 ; 70(11) : 3666-3670
- 13) 内田秀一 他：医学のあゆみ. 1987 ; 143(7) : 605-606
- 14) 西崎朗他：日本消化器病学会雑誌. 1990 ; 87(10) : 2352-2357
- 15) Oketani, K. et al. : *Jpn. J. Pharmacol.* 1983 ; 33(3) : 593-601
- 16) 青野充他：日本消化器病学会雑誌. 1984 ; 81(S.) : 2389
- 17) Pappas, T. N. et al. : *Gastroenterology.* 1986 ; 90(5) : 1578
- 18) Hirakawa, T. et al. : *Gastroenterology.* 1996 ; 111(2) : 345-357
- 19) 松田泰行他：基礎と臨床. 1989 ; 23(17) : 6823-6827
- 20) 中村紀夫 他：臨牀と研究. 1984 ; 61(5) : 1533-1541
- 21) Terano, A. et al. : *Digestion.* 1986 ; 35(3) : 182-188
- 22) Arakawa, T. et al. : *Digestion.* 1988 ; 39(2) : 111-117
- 23) 村上学 他：日本薬理学雑誌. 1982 ; 79(6) : 591-597
- 24) Kohli, Y. et al. : 京都府立医科大学雑誌. 1991 ; 100(6) : 637-644
- 25) 竹村俊樹 他：臨床薬理. 1989 ; 20(1) : 97-98
- 26) (株)陽進堂社内資料：安定性資料

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
該当しない
2. 海外における臨床支援情報
該当しない

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

(1) 粉碎

個別に照会すること。

照会先：お客様相談室 0120 - 647 - 734

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること。

照会先：お客様相談室 0120 - 647 - 734

2. その他の資料

該当資料なし

