

貯法：室温保存

有効期間：

錠20mg 5年
細粒10% 3年

リボフラビン酪酸エステル錠20mg「ツルハラ」

リボフラビン酪酸エステル細粒10%「ツルハラ」

Riboflavin Butyrate Tablets / Fine Granules
[TSURUHARA]

	錠20mg	細粒10%
承認番号	22500AMX 00735000	22500AMX 00734000
販売開始	1978年4月	1978年4月

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	リボフラビン酪酸エステル錠20mg「ツルハラ」	リボフラビン酪酸エステル細粒10%「ツルハラ」
有効成分	1錠中リボフラビン酪酸エステル20mg	1g中リボフラビン酪酸エステル100mg
添加剤	乳糖水和物、パレイショデンプン、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム	乳糖水和物、トウモロコシデンプン造粒物、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク、ポリソルベート80

3.2 製剤の性状

販売名	リボフラビン酪酸エステル錠20mg「ツルハラ」	リボフラビン酪酸エステル細粒10%「ツルハラ」
剤形	割線入り錠剤	細粒剤
色調	橙黄色	橙黄色
外形		—
大きさ	直径 約 8.0mm 厚さ 約 3.5mm	—
質量	約 190mg	—
識別コード	TSU861	—

4. 効能又は効果

- 高コレステロール血症
- ビタミンB₂欠乏症の予防及び治療。
- 下記疾患のうち、ビタミンB₂の欠乏又は代謝障害が関与すると推定される場合。
口角炎、口唇炎、舌炎、脂漏性湿疹、結膜炎、びまん性表層角膜炎
- ビタミンB₂の需要が増大し、食事からの摂取が不十分な際の補給（消耗性疾患、妊産婦、授乳婦、はげしい肉体的労働時等）。高コレステロール血症及びビタミンB₂の欠乏又は代謝障害が関与すると推定される場合の適応に対して、効果がないのに月余にわたって漫然と使用しないこと。

6. 用法及び用量

リボフラビン酪酸エステルとして、通常、成人1日5～20mgを2～3回に分割経口投与する。

高コレステロール血症には、通常、成人1日60～120mgを2～3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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
消化器	下痢、悪心・嘔吐、胃膨満、腹部膨満	胃不快感、食欲不振

注) 再評価結果を含む

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

尿を黄変させ、臨床検査値に影響を与えることがある。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

〈錠〉

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人1名にリボフラビン酪酸エステル87mg（リボフラビンとして50mg）を経口投与すると、血中リボフラビン濃度は2～4時間をピークとする上昇が認められ、24時間後にも投与前よりやや高い値を維持した¹⁾。

16.2 吸収

マウスに¹⁴C-リボフラビン酪酸エステルを経口投与すると、小腸の上半部から吸収された²⁾。

16.3 分布

マウスに¹⁴C-リボフラビン酪酸エステルを経口投与すると、小腸の上半部から吸収され門脈系を経て肝に取り込まれ、肝静脈から各臓器に運ばれた。リンパ系を介するのは僅かであった。肝臓、腎臓、心臓に著明に取り込まれるが、その他の臓器にもよく取り込まれた²⁾。

16.5 排泄

健康成人1名にリボフラビン酪酸エステル87mg（リボフラビンとして50mg）を経口投与すると、尿中に排泄されたリボフラビン量は最初の4時間で負荷量の約0.7%、24時間で約4.0%であった¹⁾。

17. 臨床成績

17.2 製造販売後調査等

17.2.1 国内臨床試験

高脂質血症患者を対象とした二重盲検比較試験において、高コレステロール血症に対する有用性が確認されている³⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

経口投与後、体内各組織に貯留され、徐々に親薬物（リボフラビン）に変換されてビタミンB₂作用を示す。また、肝のコレステロール生合成抑制とコレステロール排泄若しくは異化作用促進によりコレステロール上昇抑制作用を示すと考えられる⁴⁾。

18.2 コレステロール上昇抑制作用

家兔にリボフラビン酪酸エステルを投与すると、ラノリン綿実油投与による血清コレステロール値の上昇を抑制した⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：リボフラビン酪酸エステル

Riboflavin Butyrate (JAN)

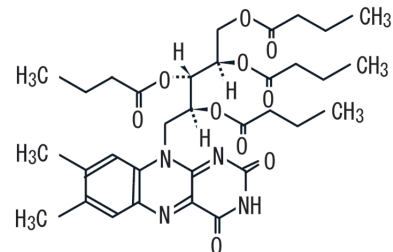
化学名：(2*R*, 3*S*, 4*S*)-5-(7, 8-Dimethyl-2, 4-dioxo-3, 4-dihydrobenzo [g] pteridin-10 (2*H*)-yl) pentan-1, 2, 3, 4-tetrayl tetrabutanoate

分子式：C₃₃H₄₄N₄O₁₀

分子量：656.72

性状：橙黄色の結晶又は結晶性の粉末で、僅かに特異なにおいがあり、味は僅かに苦い。メタノール、エタノール（95）又はクロロホルムに溶けやすく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。光によって分解する。

化学構造式：



融点：146～150℃

20. 取扱い上の注意

アルミ袋開封後は、遮光して保存すること。

22. 包装

〈リボフラビン酪酸エステル錠20mg「ツルハラ」〉

PTP：100錠（10錠×10）、1,000錠（10錠×100、乾燥剤入り）、6,000錠（10錠×600、乾燥剤入り）

バラ【缶】：1,200錠

〈リボフラビン酪酸エステル細粒10%「ツルハラ」〉

バラ【缶】：100g、500g

23. 主要文献

- 1) 吉利 和 他：診断と治療 1971；59：937-940
- 2) 陳 震東：ビタミン 1968；38（4）：283-292
- 3) 五島雄一郎 他：診断と新薬 1994；31（10）：1662-1690
- 4) 第十八改正日本薬局方解説書，廣川書店，2021；C-6120-C-6123
- 5) 大川 博 他：基礎と臨床 1974；8（9）：2641-2649

24. 文献請求先及び問い合わせ先

鶴原製薬株式会社 医薬情報部
〒560-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号
TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

鶴原製薬株式会社

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号