

貯法：気密容器で室温保存  
 使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること

	錠 2 mg	錠 4 mg	細粒 0.8%
承認番号	22500AMX00530000	22500AMX00531000	22500AMX00529000
薬価収載	2013年6月	2013年6月	2013年6月
販売開始	2013年6月	2013年6月	2013年6月

### 粘膜防御性胃炎・胃潰瘍治療剤

## 日本薬局方 イルソグラジンマレイン酸塩錠 イルソグラジンマレイン酸塩錠 2 mg 「日医工」 イルソグラジンマレイン酸塩錠 4 mg 「日医工」

## 日本薬局方 イルソグラジンマレイン酸塩細粒 イルソグラジンマレイン酸塩細粒 0.8% 「日医工」 Irsogladine Maleate

#### 【組成・性状】

#### 1. 組成

##### イルソグラジンマレイン酸塩錠 2 mg 「日医工」

日本薬局方イルソグラジンマレイン酸塩錠で、1錠中イルソグラジンマレイン酸塩 2 mg を含有する。

添加物として乳糖、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリソルベート80、ステアリン酸マグネシウムを含有する。

##### イルソグラジンマレイン酸塩錠 4 mg 「日医工」

日本薬局方イルソグラジンマレイン酸塩錠で、1錠中イルソグラジンマレイン酸塩 4 mg を含有する。

添加物として乳糖、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリソルベート80、ステアリン酸マグネシウムを含有する。

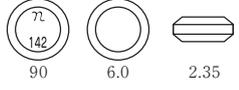
##### イルソグラジンマレイン酸塩細粒 0.8% 「日医工」

日本薬局方イルソグラジンマレイン酸塩細粒で、1 g 中イルソグラジンマレイン酸塩 8 mg を含有する。

添加物として乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリソルベート80を含有する。

#### 2. 製剤の性状

イルソグラジンマレイン酸塩錠 2 mg 「日医工」及びイルソグラジンマレイン酸塩錠 4 mg 「日医工」は白色の素錠である。

販売名	形状 重量(mg) 直径(mm) 厚さ(mm)	本体 コード	包装 コード
イルソグラジンマレイン酸塩錠 2 mg 「日医工」		n 142	㊦ 142
イルソグラジンマレイン酸塩錠 4 mg 「日医工」		n 143	㊦ 143

イルソグラジンマレイン酸塩細粒 0.8% 「日医工」は白色の細粒剤である。

#### 【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】

通常、成人イルソグラジンマレイン酸塩として1日4 mg（錠 2 mg：2錠、錠 4 mg：1錠、細粒 0.8%：0.5 g）を1～2回に分けて経口投与する。

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。

	頻度不明
消化器	便秘，下痢，嘔気・嘔吐
肝臓	AST(GOT)，ALT(GPT)，Al-P，LDH， $\gamma$ -GTP，ビリルビン等の上昇
皮膚 <sup>注)</sup>	発疹，痒痒感，発赤，湿疹，多形滲出性紅斑，浮腫性紅斑
その他	胸部圧迫感，発熱

注：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ため、低用量（例えば2 mg/日）から投与を開始するなど、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

##### 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。]

##### 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。）

##### 6. その他の注意

健康人における本薬の血漿中からの消失半減期は約150時間である。

#### 【薬物動態】

##### 1. 生物学的同等性試験

イルソグラジンマレイン酸塩錠 2 mg 「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（イルソグラジンマレイン酸塩として4 mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中イルソグラジン濃度を測定し、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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

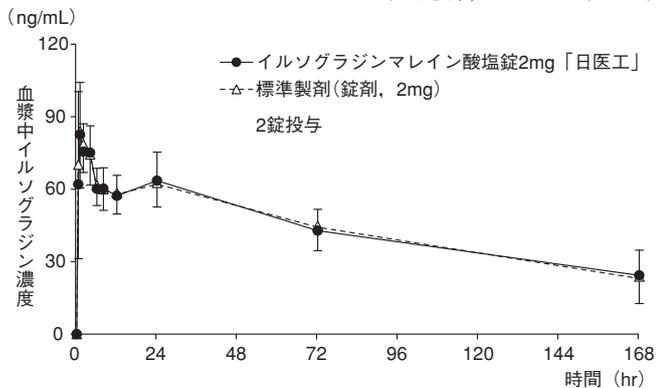
また、イルソグラジンマレイン酸塩錠 4 mg 「日医工」及び標準製剤をそれぞれ1錠（イルソグラジンマレイン酸塩として4 mg）投与した場合、並びにイルソグラジンマレイン酸塩細粒 0.8% 「日医工」及び標準製剤をそれぞれ0.5 g（イルソグラジンマレイン酸塩として4 mg）投与した場合におい

ても、同様に両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

<イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg 「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→168</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg 「日医工」	7264.3±1416.9	89.8±17.3	1.45±1.33	119.8±43.4
標準製剤 (錠剤, 2mg)	7381.8±1443.1	95.2±18.1	1.30±1.38	120.4±58.9

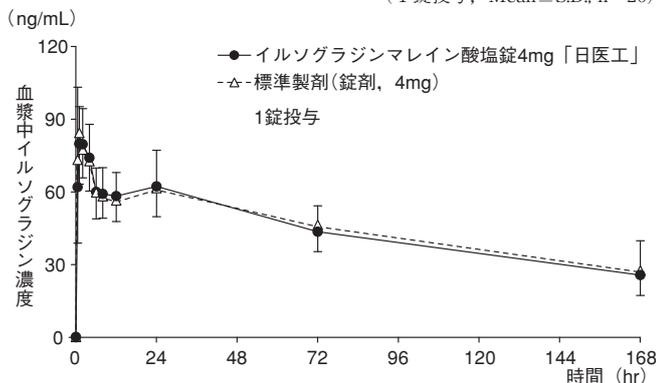
(2錠投与, Mean±S.D., n=20)



<イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg 「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→168</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg 「日医工」	7328.0±1905.3	90.2±18.9	1.33±0.91	139.1±99.3
標準製剤 (錠剤, 4mg)	7584.9±1601.2	92.5±16.2	2.03±5.18	138.0±64.3

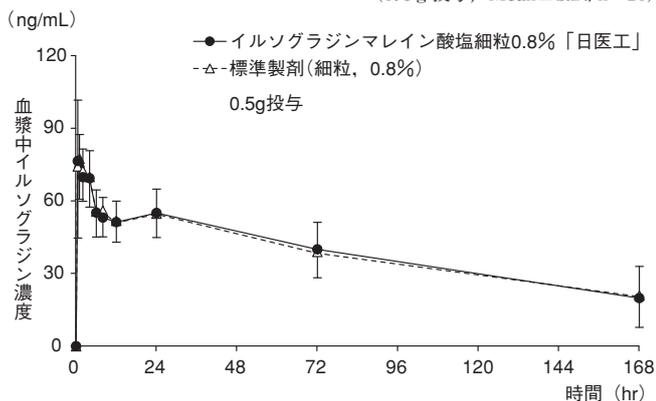
(1錠投与, Mean±S.D., n=20)



<イルソグラジンマレイン酸塩細粒 0.8% 「日医工」>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→168</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
イルソグラジンマレイン酸塩細粒 0.8% 「日医工」	6503.5±1747.7	83.2±16.2	1.35±1.41	122.0±43.4
標準製剤 (細粒, 0.8%)	6488.9±1688.0	83.7±17.9	0.90±0.53	151.6±148.8

(0.5g投与, Mean±S.D., n=20)



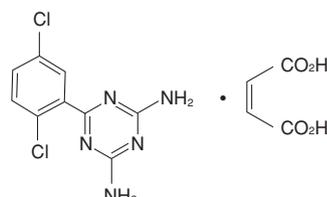
血漿中濃度並びにAUC, C<sub>max</sub>等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg 「日医工」、イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg 「日医工」及びイルソグラジンマレイン酸塩細粒0.8% 「日医工」は、日本薬局方医薬品各条に定められたイルソグラジンマレイン酸塩錠及びイルソグラジンマレイン酸塩細粒の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>2)</sup>

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：イルソグラジンマレイン酸塩 (Irsogladine Maleate)  
化学名：6-(2,5-Dichlorophenyl)-1,3,5-triazine-2,4-diamine monomaleate



分子式：C<sub>9</sub>H<sub>7</sub>Cl<sub>2</sub>N<sub>5</sub> · C<sub>4</sub>H<sub>4</sub>O<sub>4</sub>

分子量：372.16

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、味はやや苦い。  
酢酸(100)又はエチレングリコールにやや溶けにくく、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けにくく、水にはほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

安定性試験

本品につき加速試験 (40℃, 相対湿度75%, 6ヵ月) を行った結果、イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg 「日医工」、イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg 「日医工」及びイルソグラジンマレイン酸塩細粒0.8% 「日医工」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>

【包装】

イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg 「日医工」  
100錠 (10錠×10; PTP)  
1000錠 (10錠×100; PTP)  
イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg 「日医工」  
100錠 (10錠×10; PTP)  
イルソグラジンマレイン酸塩細粒0.8% 「日医工」  
500g

【主要文献】

- 1) 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター  
〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21  
☎ (0120)517-215  
Fax (076)442-8948

