

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

日本標準商品分類番号
8 7 2 3 2 9

*イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「サワイ」

*イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「サワイ」

IRSOGLADINE MALEATE

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

	錠 2 mg	錠 4 mg
* 承認番号	22600AMX00850000	22600AMX00679000
薬価収載	2014年12月	2014年12月
販売開始	1998年7月	2010年11月

【組成・性状】

・組成

イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「サワイ」：1錠中に日局イルソグラジンマレイン酸塩 2mgを含有する。

添加物として、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「サワイ」：1錠中に日局イルソグラジンマレイン酸塩 4mgを含有する。

添加物として、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、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。

・製剤の性状

品名	剤形	外形			性状
		直径(mm)	重量(mg)	厚さ(mm)	
イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「サワイ」	素錠		約95	3.1	白色
イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「サワイ」	割線入り素錠		約130	2.6	白色

【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4mgを1～2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。

【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、γ-GTP、ビリルビン等の上昇
皮膚 ^{注)}	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ので、低用量(例えば2mg/日)から投与を開始するなど、患者の状態を観察しながら

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)

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

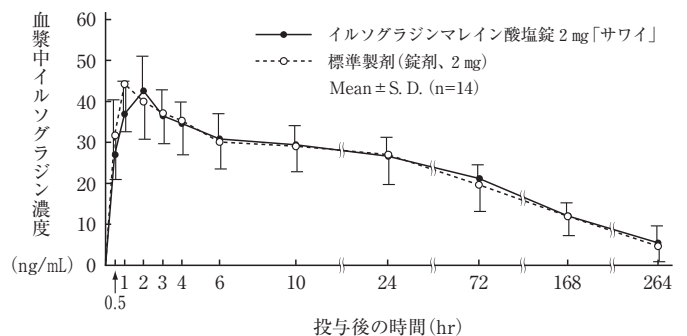
○イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「サワイ」

イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(イルソグラジンマレイン酸塩として2mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中イルソグラジン濃度を測定した。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1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-264hr} (ng·hr/mL)
イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「サワイ」	43.7 ± 7.7	2.1 ± 1.2	121 ± 32	4296 ± 816
標準製剤 (錠剤、2mg)	46.5 ± 10.4	1.5 ± 0.7	137 ± 68	4148 ± 1097

(Mean ± S. D.)



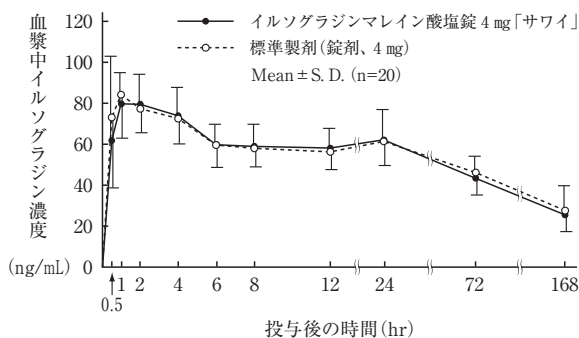
○イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「サワイ」

イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(イルソグラジンマレイン酸塩として4mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中イルソグラジン濃度を測定した。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錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-168hr} (ng・hr/mL)
イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「サワイ」	90.2 ± 18.9	1.3 ± 0.9	139 ± 99	7328 ± 1905
標準製剤 (錠剤、4mg)	92.5 ± 16.2	2.0 ± 5.2	138 ± 64	7585 ± 1601

(Mean ± S. D.)



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

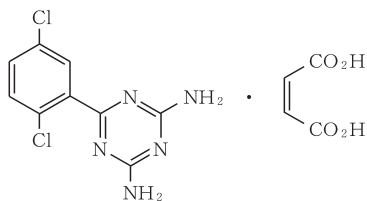
本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

胃粘膜内cAMP含量を増加させて細胞間コミュニケーションを活性化することにより胃粘膜細胞の統合性を高め、細胞防御機能を亢進すると考えられる。³⁾

【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：C₉H₇Cl₂N₅・C₄H₄O₄
 分子量：372.16
 構造式：



性状：イルソグラジンマレイン酸塩は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はやや苦い。酢酸(100)又はエチレンジ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、水にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

錠 2mg：PTP包装及びバラ包装したもの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⁾

錠 4mg：PTP包装(PTPシートをアルミピロー包装)したものを用いた長期保存試験(25℃60%RH、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】

イルソグラジンマレイン酸塩錠 2mg「サワイ」：
 PTP：100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)
 イルソグラジンマレイン酸塩錠 4mg「サワイ」：
 PTP：100錠(10錠×10)

【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-614 ~C-617.
- 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

K11 A150702

