

## 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

## プロトンポンプ・インヒビター

## ラベプラゾールナトリウム錠

ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」  
ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」  
ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

## RABEPRAZOLE Na Tablets [SAWAI]

|                                   |                                                                                                                                                                         |
|-----------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 剤形                                | 腸溶性フィルムコーティング錠                                                                                                                                                          |
| 製剤の規制区分                           | 該当しない                                                                                                                                                                   |
| 規格・含量                             | 錠5mg：1錠中日局ラベプラゾールナトリウム5mg含有<br>錠10mg：1錠中日局ラベプラゾールナトリウム10mg含有<br>錠20mg：1錠中日局ラベプラゾールナトリウム20mg含有                                                                           |
| 一般名                               | 和名：ラベプラゾールナトリウム(JAN)<br>洋名：Rabeprazole Sodium(JAN)                                                                                                                      |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載年月日<br>販売開始年月日 | 製造販売承認年月日：2020年2月17日(錠5mg)<br>2010年7月15日(錠10mg/錠20mg)<br>薬価基準収載年月日：2020年6月19日(錠5mg)<br>2010年11月19日(錠10mg/錠20mg)<br>販売開始年月日：2020年6月19日(錠5mg)<br>2010年11月19日(錠10mg/錠20mg) |
| 製造販売(輸入)・提携・<br>販売会社名             | 製造販売元：沢井製薬株式会社                                                                                                                                                          |
| 医薬情報担当者の連絡先                       |                                                                                                                                                                         |
| 問い合わせ窓口                           | 沢井製薬株式会社 医薬品情報センター<br>TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966<br>医療関係者向け総合情報サイト： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>                              |

本IFは2025年3月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 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―

### 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・表現には薬機法の広告規則や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、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を活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。

(2020年4月改訂)

# 目次

|                       |    |                                          |    |
|-----------------------|----|------------------------------------------|----|
| I. 概要に関する項目           | 1  | VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目                 | 37 |
| 1. 開発の経緯              | 1  | 1. 警告内容とその理由                             | 37 |
| 2. 製品の治療学的特性          | 1  | 2. 禁忌内容とその理由                             | 37 |
| 3. 製品の製剤学的特性          | 2  | 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由                    | 37 |
| 4. 適正使用に関して周知すべき特性    | 2  | 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由                    | 37 |
| 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項  | 2  | 5. 重要な基本的注意とその理由                         | 37 |
| 6. RMPの概要             | 2  | 6. 特定の背景を有する患者に関する注意                     | 38 |
|                       |    | 7. 相互作用                                  | 39 |
| II. 名称に関する項目          | 3  | 8. 副作用                                   | 39 |
| 1. 販売名                | 3  | 9. 臨床検査結果に及ぼす影響                          | 42 |
| 2. 一般名                | 3  | 10. 過量投与                                 | 42 |
| 3. 構造式又は示性式           | 3  | 11. 適用上の注意                               | 42 |
| 4. 分子式及び分子量           | 3  | 12. その他の注意                               | 42 |
| 5. 化学名(命名法)又は本質       | 3  |                                          |    |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号     | 4  | IX. 非臨床試験に関する項目                          | 44 |
|                       |    | 1. 薬理試験                                  | 44 |
| III. 有効成分に関する項目       | 5  | 2. 毒性試験                                  | 44 |
| 1. 物理化学的性質            | 5  |                                          |    |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性  | 5  | X. 管理的事項に関する項目                           | 45 |
| 3. 有効成分の確認試験法、定量法     | 6  | 1. 規制区分                                  | 45 |
|                       |    | 2. 有効期間                                  | 45 |
| IV. 製剤に関する項目          | 7  | 3. 包装状態での貯法                              | 45 |
| 1. 剤形                 | 7  | 4. 取扱い上の注意                               | 45 |
| 2. 製剤の組成              | 8  | 5. 患者向け資材                                | 45 |
| 3. 添付溶解液の組成及び容量       | 8  | 6. 同一成分・同効薬                              | 45 |
| 4. 力価                 | 8  | 7. 国際誕生年月日                               | 45 |
| 5. 混入する可能性のある夾雑物      | 8  | 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準<br>収載年月日、販売開始年月日 | 46 |
| 6. 製剤の各種条件下における安定性    | 8  | 9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等<br>の年月日及びその内容    | 46 |
| 7. 調製法及び溶解後の安定性       | 15 | 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその<br>内容           | 46 |
| 8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)  | 15 | 11. 再審査期間                                | 46 |
| 9. 溶出性                | 16 | 12. 投薬期間制限に関する情報                         | 47 |
| 10. 容器・包装             | 19 | 13. 各種コード                                | 47 |
| 11. 別途提供される資材類        | 19 | 14. 保険給付上の注意                             | 47 |
| 12. その他               | 19 |                                          |    |
|                       |    | XI. 文献                                   | 48 |
| V. 治療に関する項目           | 20 | 1. 引用文献                                  | 48 |
| 1. 効能又は効果             | 20 | 2. その他の参考文献                              | 49 |
| 2. 効能又は効果に関連する注意      | 20 |                                          |    |
| 3. 用法及び用量             | 21 | XII. 参考資料                                | 50 |
| 4. 用法及び用量に関連する注意      | 22 | 1. 主な外国での発売状況                            | 50 |
| 5. 臨床成績               | 22 | 2. 海外における臨床支援情報                          | 50 |
|                       |    |                                          |    |
| VI. 薬効薬理に関する項目        | 27 | XIII. 備考                                 | 51 |
| 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 | 27 | 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ<br>たっての参考情報      | 51 |
| 2. 薬理作用               | 27 | 2. その他の関連資料                              | 51 |
|                       |    |                                          |    |
| VII. 薬物動態に関する項目       | 30 |                                          |    |
| 1. 血中濃度の推移            | 30 |                                          |    |
| 2. 薬物速度論的パラメータ        | 34 |                                          |    |
| 3. 母集団(ポピュレーション)解析    | 35 |                                          |    |
| 4. 吸収                 | 35 |                                          |    |
| 5. 分布                 | 35 |                                          |    |
| 6. 代謝                 | 36 |                                          |    |
| 7. 排泄                 | 36 |                                          |    |
| 8. トランスポーターに関する情報     | 36 |                                          |    |
| 9. 透析等による除去率          | 36 |                                          |    |
| 10. 特定の背景を有する患者       | 36 |                                          |    |
| 11. その他               | 36 |                                          |    |

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg/錠20mg「サワイ」は、日局ラベプラゾールナトリウムを含有するプロトンポンプ・インヒビターである。

ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」は、後発医薬品として、沢井製薬株式会社、日医工株式会社の計2社が共同開発を実施した。下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施のうえ、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

ラベプラゾールNa錠10mg/錠20mg「サワイ」は、後発医薬品として、下記通知に基づき、沢井製薬株式会社が製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

|                | 錠5mg                   | 錠10mg/錠20mg             |
|----------------|------------------------|-------------------------|
| 承認申請に際し準拠した通知名 | 平成26年11月21日 薬食発1121第2号 | 平成17年3月31日 薬食発第0331015号 |
| 承認             | 2020年2月                | 2010年7月                 |
| 上市             | 2020年6月                | 2010年11月                |

2010年11月に「非びらん性胃食道逆流症」の効能又は効果が追加承認された[錠10mg]。(X. -9. 参照)

2011年4月にプロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な逆流性食道炎に対する用法及び用量が追加承認された[錠10mg/錠20mg]。(X. -9. 参照)

2012年11月に「ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能又は効果が追加承認された[錠10mg]。(X. -9. 参照)

2013年6月に「ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能又は効果が追加承認された[錠10mg]。(X. -9. 参照)

2017年12月にプロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な逆流性食道炎の維持療法に対する用法及び用量が追加承認された[錠10mg]。(X. -9. 参照)

2020年6月に「低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制」の効能又は効果が追加承認された[錠10mg]。(X. -9. 参照)

### 2. 製品の治療学的特性

1) ラベプラゾールナトリウムは酸分泌細胞の酸性領域で活性体(スルフェンアミド体)になり、プロトンポンプ( $H^+$ 、 $K^+$ -ATPase)のSH基を修飾して酵素活性を阻害し、酸分泌を抑制する<sup>1)</sup>。さらに阻害された酵素活性の回復には、主に作用部位からの薬物の消失あるいはグルタチオンによる活性体の消失が関与しているものと考えられる。その他、グルタチオンによって酵素活性が回復する可能性も推測される<sup>2)</sup>。(VI. -2. 参照)

2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少、溶血性貧血、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、間質性肺炎、皮膚障害、急性腎障害、間質性腎炎、低ナトリウム血症、横紋筋融解症、視力障害、錯乱状態が報告されている。(VIII. -8. 参照)

## I. 概要に関する項目

### 3. 製品の製剤学的特性 .....

1) ラベプラゾールの胃酸での失活を避けるため、腸溶性フィルムコーティング錠としている。

(Ⅳ. - 1. 参照)

2) 錠剤に「ラベプラ」の文字と含量を両面印字している。(Ⅳ. - 1. 参照)

### 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  |

(2025年4月1日時点)

### 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

ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」

ラベプラゾールNa錠 10mg「サワイ」

ラベプラゾールNa錠 20mg「サワイ」

#### 2) 洋名

RABEPRAZOLE Na Tablets [SAWAI]

#### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

### 2. 一般名 .....

#### 1) 和名(命名法)

ラベプラゾールナトリウム(JAN)

#### 2) 洋名(命名法)

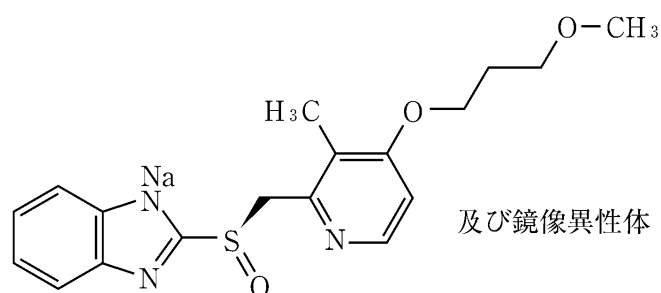
Rabeprazole Sodium(JAN)

Rabeprazole(INN)

#### 3) ステム(stem)

–prazole : antiulcer, benzimidazole derivatives

### 3. 構造式又は示性式 .....



### 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 :  $C_{18}H_{20}N_3NaO_3S$

分子量 : 381.42

### 5. 化学名(命名法)又は本質 .....

Monosodium (*RS*)-2-( {[ 4-(3-methoxypropoxy)-3-methylpyridin-2-yl]methyl} sulfinyl)-1 *H*-benzimidazolide (IUPAC)

## Ⅱ. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....
- 特になし



# Ⅲ. 有効成分に関する項目

## 1. 物理化学的性質

### 1) 外観・性状

白色～微黄白色の粉末である。

結晶多形が認められる。

### 2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けやすい。0.01mol/L水酸化ナトリウム試液に溶ける。

### 3) 吸湿性

吸湿性である。

乾燥減量：1.0%以下(1g、減圧、酸化リン(V)、24時間。ただし、試料の採取は吸湿を避けて行う)

### 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

pKa＝約8.8<sup>3)</sup>

### 6) 分配係数

該当資料なし

### 7) その他の主な示性値

水溶液(1→20)は旋光性を示さない。

## 2. 有効成分の各種条件下における安定性

原薬の安定性<sup>3)</sup>

水：なし

液性(pH)：なし

光：苛酷試験

| 保存条件   | 包装形態  | 保存期間 | 測定項目                                   | 結果                                                |
|--------|-------|------|----------------------------------------|---------------------------------------------------|
| 10001x | 石英管密栓 | 3ヵ月  | 性状<br>確認試験<br>溶状<br>純度試験<br>乾燥減量<br>含量 | わずかに類縁物質の増加(0.1%)が認められたが、含量等その他の測定項目に変化は認められなかった。 |

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

その他：ラベプラゾールナトリウムは湿度に対し不安定であるが、気密容器に保存することにより安定性が保たれる。

| 試験方法   |    | 保存条件      | 包装形態         | 保存期間 | 測定項目                                   | 結果                                                |
|--------|----|-----------|--------------|------|----------------------------------------|---------------------------------------------------|
| 長期保存試験 |    | 25℃       | ポリエチレン袋＋アルミ袋 | 36ヵ月 | 性状<br>確認試験<br>溶状<br>純度試験<br>乾燥減量<br>含量 | 含量及び類縁物質等に変化を認めず、安定であった。                          |
| 加速試験   |    | 40℃・75%RH | ポリエチレン袋＋アルミ袋 | 6ヵ月  |                                        | 含量及び類縁物質等に変化を認めず、安定であった。                          |
| 苛酷試験   | 温度 | 60℃       | ガラス瓶密栓       | 3ヵ月  |                                        | わずかに類縁物質の増加(0.1%)が認められたが、含量等その他の測定項目に変化は認められなかった。 |
|        | 湿度 | 25℃・53%RH | ガラス瓶開放       | 6週間  |                                        | 分解が認められ、外観も黒色に固化した。                               |

### 3. 有効成分の確認試験法、定量法……………

#### <確認試験法>

日局「ラベプラゾールナトリウム」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 3) ナトリウム塩の定性反応

#### <定量法>

日局「ラベプラゾールナトリウム」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)

## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

## 1) 剤形の区別

腸溶性フィルムコーティング錠

## 2) 製剤の外観及び性状

| 品 名    | ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」                                                                                                                                                                                                                                   | ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」                                                                                                                                                                                                                                         |
|--------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 外 形    |    |    |
| 性 状    | 淡黄色                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                             |
| 直径(mm) | 5.4                                                                                                                                                                                                                                                   | 6.9                                                                                                                                                                                                                                                         |
| 厚さ(mm) | 2.7                                                                                                                                                                                                                                                   | 3.6                                                                                                                                                                                                                                                         |
| 重量(mg) | 約68                                                                                                                                                                                                                                                   | 約143                                                                                                                                                                                                                                                        |

| 品 名    | ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」                                                                                                                                                                                                                                        |
|--------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 外 形    |    |
| 性 状    | 淡黄色                                                                                                                                                                                                                                                        |
| 直径(mm) | 7.4                                                                                                                                                                                                                                                        |
| 厚さ(mm) | 3.8                                                                                                                                                                                                                                                        |
| 重量(mg) | 約171                                                                                                                                                                                                                                                       |

## 3) 識別コード

## ●ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：サワイ ラベプラ 5

## ●ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：サワイ ラベプラ 10

## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：サワイ ラベプラ 20

## 4) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## 5) その他

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

#### 2. 製剤の組成

##### 1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

| 品 名           | ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」                                                                        | ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」       |
|---------------|--------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------|
| 有効成分<br>[1錠中] | 日局ラベプラゾールナトリウム                                                                             |                           |
|               | 5mg                                                                                        | 10mg                      |
| 添加剤           | カルナウバロウ、カルメロースCa、グリセリン脂肪酸エステル、酸化チタン、酸化Mg、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、タルク、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロースフタル酸エステル |                           |
|               | エチルセルロース、没食子酸プロピル、D-マンニトール                                                                 | トレハロース、マクロゴール6000、リン酸水素Ca |

| 品 名           | ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」                                                                                                  |  |
|---------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|
| 有効成分<br>[1錠中] | 日局ラベプラゾールナトリウム 20mg                                                                                                  |  |
| 添加剤           | カルナウバロウ、カルメロースCa、グリセリン脂肪酸エステル、酸化チタン、酸化Mg、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、タルク、トレハロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロースフタル酸エステル、マクロゴール6000、リン酸水素Ca |  |

##### 2) 電解質等の濃度

該当資料なし

##### 3) 熱量

該当資料なし

#### 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

##### ●ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」

##### 1) 加速試験<sup>4)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、加速試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。  
その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミニウム箔  
[ピロー]アルミニウム袋、乾燥剤

## IV. 製剤に関する項目

|         | イニシャル           | 40°C75%RH・遮光<br>6 ヶ月 |
|---------|-----------------|----------------------|
| 性状      | 淡黄色のフィルムコーティング錠 | 同左                   |
| 確認試験    | 規格に適合           | 同左                   |
| 純度試験    | 規格に適合           | 同左                   |
| 含量均一性試験 | 規格に適合           | 同左                   |
| 崩壊試験    | 規格に適合           | 同左                   |
| 定量試験※   | 101.7           | 98.5                 |

※：表示量に対する含有率(%), 平均値

2) 無包装下の安定性試験<sup>5)</sup>

## 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

## 試験検体及び保存条件

| ロット番号      | 保存条件 |                              |
|------------|------|------------------------------|
| 521T7S3334 | 温度   | 40°C、遮光気密容器                  |
|            | 湿度   | 25°C/75%RH、遮光開放              |
|            | 室温   | 25°C/60%RH、遮光開放              |
|            | 光    | 25°C/60%RH、D65ランプ(2000lx)、開放 |

## 試験項目及び試験回数

| 試験項目                                | 試験回数 |
|-------------------------------------|------|
| 性状・硬度*(3錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・崩壊試験・定量試験 | 1回   |

\*：本製剤の未設定規格のため参考値

## 結果

| 試験項目<br>保存条件・期間 |      | 性状   | 硬度(N)          | 純度試験<br>(類縁物質) | 崩壊試験 | 定量試験※                 |
|-----------------|------|------|----------------|----------------|------|-----------------------|
| イニシャル           |      | (a)  | 85.67          | 適合             | 適合   | 100.0                 |
| 温度              | 1 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>92.33  | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>100.2         |
|                 | 3 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>101.00 | 変化なし           | 変化なし | 変化あり<br>(規格内)<br>96.1 |
| 湿度              | 1 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>97.67  | 変化なし           | 変化なし | 変化あり<br>(規格内)<br>94.9 |
|                 | 3 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>104.00 | 変化なし           | 変化なし | 変化あり<br>(規格外)<br>81.9 |

#### IV. 製剤に関する項目

|                                           |      |               |      |      |               |
|-------------------------------------------|------|---------------|------|------|---------------|
| 室温(3ヵ月)                                   | 変化なし | 変化なし<br>83.00 | 変化なし | 変化なし | 変化なし<br>97.7  |
| 光(120万lx・hr、<br>≥200W・hr/m <sup>2</sup> ) | 変化なし | 変化なし<br>93.33 | 変化なし | 変化なし | 変化なし<br>100.4 |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：淡黄色のフィルムコーティング錠

#### 3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>6)</sup>

##### 目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

##### 試験検体及び保存条件

| ロット番号      | 保存条件 |                |
|------------|------|----------------|
| 521T7S3334 | 室温   | 25℃/60%RH、遮光開放 |

##### 試験項目及び試験回数

| 試験項目                                | 試験回数 |
|-------------------------------------|------|
| 性状・硬度*(3錠の平均値)・純度試験(類縁物質)・崩壊試験・定量試験 | 1回   |

\*：本製剤の未設定規格のため参考値

##### 結果

| 試験項目<br>保存条件・期間 | 性状   | 硬度(N)         | 純度試験<br>(類縁物質) | 崩壊試験 | 定量試験※        |
|-----------------|------|---------------|----------------|------|--------------|
| イニシャル           | (a)  | 85.67         | 適合             | 適合   | 100.0        |
| 室温(6ヵ月)         | 変化なし | 変化なし<br>85.67 | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>99.1 |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：淡黄色のフィルムコーティング錠

#### ●ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」

##### 1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>7)</sup>

ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ箔、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

| 保 存 条 件       | イニシャル                  | 40℃75%RH・遮光<br>6ヵ月 |
|---------------|------------------------|--------------------|
| 性 状           | 淡黄色の腸溶性フィルムコーティング錠であった | 同左                 |
| 確 認 試 験       | 規格に適合                  | 同左                 |
| 純 度 試 験       | 規格に適合                  | 同左                 |
| 含 量 均 一 性 試 験 | 規格に適合                  | 同左                 |
| 崩 壊 試 験       | 規格に適合                  | 同左                 |
| 定 量 試 験 ※     | 102.4                  | 99.3               |

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)<sup>7)</sup>

ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

| 保 存 条 件       | イニシャル                  | 40°C75%RH・遮光<br>6 ヶ月 |
|---------------|------------------------|----------------------|
| 性 状           | 淡黄色の腸溶性フィルムコーティング錠であった | 同左                   |
| 確 認 試 験       | 規格に適合                  | 同左                   |
| 純 度 試 験       | 規格に適合                  | 同左                   |
| 含 量 均 一 性 試 験 | 規格に適合                  | 同左                   |
| 崩 壊 試 験       | 規格に適合                  | 同左                   |
| 定 量 試 験 ※     | 102.4                  | 99.8                 |

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性試験<sup>8)</sup>

## 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

## 保存条件

|    |                                |
|----|--------------------------------|
| 温度 | 40°C、遮光気密容器                    |
| 湿度 | 25°C/75%RH、遮光開放                |
| 室温 | 25°C/60%RH、遮光開放                |
| 光  | ①25°C/60%RH、D65ランプ(1000lx)、開放  |
|    | ②25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(1000lx)、開放 |

## 試験検体、試験項目及び試験回数

| ロット番号       | 試験項目                     | 試験回数 |
|-------------|--------------------------|------|
| 521T1S15703 | 性状・硬度*(5錠の平均値)・崩壊試験・定量試験 | 1回   |
| 720307      | 純度試験(類縁物質)               | 1回   |

\*：本製剤の未設定規格のため参考値

## 結果

| 試験項目<br>保存条件・期間 |      | 性状   | 硬度(kgf)      | 純度試験<br>(類縁物質) | 崩壊試験 | 定量試験※                 |
|-----------------|------|------|--------------|----------------|------|-----------------------|
| イニシャル           |      | (a)  | 24.5         | 適合             | 適合   | 100.0                 |
| 温度              | 1 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>23.2 | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>98.0          |
|                 | 3 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>24.0 | 変化あり<br>(規格外)  | 変化なし | 変化あり<br>(規格内)<br>96.6 |
| 湿度              | 1 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>23.3 | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>99.7          |
|                 | 3 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>21.5 | 変化なし           | 変化なし | 変化あり<br>(規格内)<br>96.7 |

#### IV. 製剤に関する項目

|                                           |      |              |      |      |              |
|-------------------------------------------|------|--------------|------|------|--------------|
| 室温(3ヵ月)                                   | 変化なし | 変化なし<br>22.5 | 変化なし | 変化なし | 変化なし<br>98.4 |
| 光①(60万lx・hr、<br>≥100W・hr/m <sup>2</sup> ) | 変化なし | 変化なし<br>22.4 | —    | 変化なし | 変化なし<br>99.5 |
| 光②(60万lx・hr)                              | —    | —            | 変化なし | —    | —            |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)  
(a)：淡黄色のフィルムコーティング錠  
—：実施無し

#### 4) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>9)</sup>

##### 目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

##### 保存条件

|    |                |
|----|----------------|
| 室温 | 25℃/60%RH、遮光開放 |
|----|----------------|

##### 試験検体、試験項目及び試験回数

| ロット番号       | 試験項目                     | 試験回数 |
|-------------|--------------------------|------|
| 521T1S15703 | 性状・硬度*(5錠の平均値)・崩壊試験・定量試験 | 1回   |
| 720307      | 純度試験(類縁物質)               | 1回   |

\*：本製剤の未設定規格のため参考値

##### 結果

| 試験項目<br>保存条件・期間 | 性状   | 硬度(kgf)       | 純度試験<br>(類縁物質) | 崩壊試験 | 定量試験※         |
|-----------------|------|---------------|----------------|------|---------------|
| イニシャル           | (a)  | 240.3         | 適合             | 適合   | 100.0         |
| 室温(6ヵ月)         | 変化なし | 変化なし<br>182.5 | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>100.0 |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)  
(a)：淡黄色のフィルムコーティング錠



## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>10)</sup>

ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ箔、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

| 保 存 条 件       | イニシャル                  | 40°C75%RH・遮光<br>6 ヶ月 |
|---------------|------------------------|----------------------|
| 性 状           | 淡黄色の腸溶性フィルムコーティング錠であった | 同左                   |
| 確 認 試 験       | 規格に適合                  | 同左                   |
| 純 度 試 験       | 規格に適合                  | 同左                   |
| 含 量 均 一 性 試 験 | 規格に適合                  | 同左                   |
| 崩 壊 試 験       | 規格に適合                  | 同左                   |
| 定 量 試 験 ※     | 102.3                  | 100.7                |

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>11)</sup>

## 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

## 保存条件

|    |                                |
|----|--------------------------------|
| 温度 | 40°C、遮光気密容器                    |
| 湿度 | 25°C/75%RH、遮光開放                |
| 室温 | 25°C/60%RH、遮光開放                |
| 光  | ①25°C/60%RH、D65ランプ(1000lx)、開放  |
|    | ②25°C/60%RH、白色蛍光ランプ(1000lx)、開放 |

## 試験検体、試験項目及び試験回数

| ロット番号      | 試験項目                     | 試験回数 |
|------------|--------------------------|------|
| 521T2S7904 | 性状・硬度*(5錠の平均値)・崩壊試験・定量試験 | 1回   |
| 719601     | 純度試験(類縁物質)               | 1回   |

\*：本製剤の未設定規格のため参考値

## 結果

| 試験項目<br>保存条件・期間 |      | 性状   | 硬度(kgf)      | 純度試験<br>(類縁物質) | 崩壊試験 | 定量試験※                 |
|-----------------|------|------|--------------|----------------|------|-----------------------|
| イニシャル           |      | (a)  | 23.2         | 適合             | 適合   | 100.0                 |
| 温度              | 1 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>22.2 | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>99.0          |
|                 | 3 ヶ月 | 変化なし | 変化なし<br>22.4 | 変化なし           | 変化なし | 変化あり<br>(規格内)<br>96.8 |
| 湿度(3 ヶ月)        |      | 変化なし | 変化なし<br>22.9 | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>99.6          |

#### IV. 製剤に関する項目

|                                           |      |              |      |      |              |
|-------------------------------------------|------|--------------|------|------|--------------|
| 室温(3ヵ月)                                   | 変化なし | 変化なし<br>22.9 | 変化なし | 変化なし | 変化なし<br>99.3 |
| 光①(60万lx・hr、<br>≥100W・hr/m <sup>2</sup> ) | 変化なし | 変化なし<br>20.0 | —    | 変化なし | 変化なし<br>99.9 |
| 光②(60万lx・hr)                              | —    | —            | 変化なし | —    | —            |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：淡黄色のフィルムコーティング錠

—：実施無し

#### 3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>12)</sup>

##### 目的

本製剤のPTP包装品(ピロー包装なし)の安定性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

##### 保存条件

|    |                |
|----|----------------|
| 室温 | 25℃/60%RH、遮光開放 |
|----|----------------|

##### 試験検体、試験項目及び試験回数

| ロット番号      | 試験項目                     | 試験回数 |
|------------|--------------------------|------|
| 521T2S7904 | 性状・硬度*(5錠の平均値)・崩壊試験・定量試験 | 1回   |
| 719601     | 純度試験(類縁物質)               | 1回   |

\*：本製剤の未設定規格のため参考値

##### 結果

| 試験項目<br>保存条件・期間 |     | 性状   | 硬度(kgf)      | 純度試験<br>(類縁物質) | 崩壊試験 | 定量試験※                 |
|-----------------|-----|------|--------------|----------------|------|-----------------------|
| イニシャル           |     | (a)  | 23.2         | 適合             | 適合   | 100.0                 |
| 室温              | 3ヵ月 | 変化なし | 変化なし<br>20.3 | 変化なし           | 変化なし | 変化なし<br>99.7          |
|                 | 6ヵ月 | 変化なし | 変化なし<br>19.6 | 変化なし           | 変化なし | 変化あり<br>(規格内)<br>96.0 |

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：淡黄色のフィルムコーティング錠

## A) 評価分類基準

## 【性状】

| 分類        | 評価基準                                                |
|-----------|-----------------------------------------------------|
| 変化なし      | 外観上の変化を、ほとんど認めない場合                                  |
| 変化あり(規格内) | わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合 |
| 変化あり(規格外) | 形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合                         |

## 【硬度】

| 分類        | 評価基準                              |
|-----------|-----------------------------------|
| 変化なし      | 硬度変化が30%未満の場合                     |
| 変化あり(規格内) | 硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合 |
| 変化あり(規格外) | 硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合 |

## 【定量試験】

| 分類        | 評価基準               |
|-----------|--------------------|
| 変化なし      | 含量低下が3%未満の場合       |
| 変化あり(規格内) | 含量低下が3%以上で、規格値内の場合 |
| 変化あり(規格外) | 規格値外の場合            |

## 【その他の試験項目】

| 分類        | 評価基準                |
|-----------|---------------------|
| 変化なし      | 変化なし、または規格値内で変化する場合 |
| 変化あり(規格外) | 規格値外の場合             |

## 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(物理化学的変化) .....

該当資料なし

# IV. 製剤に関する項目

9.

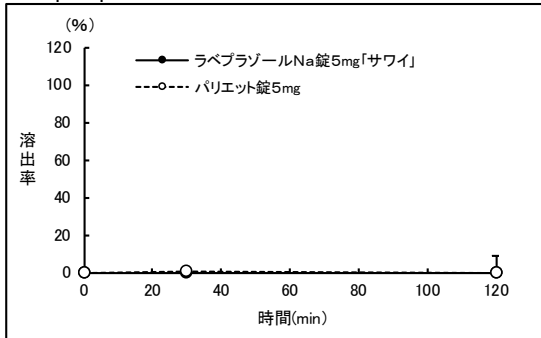
溶出性 .....

## <溶出挙動における同等性及び類似性>

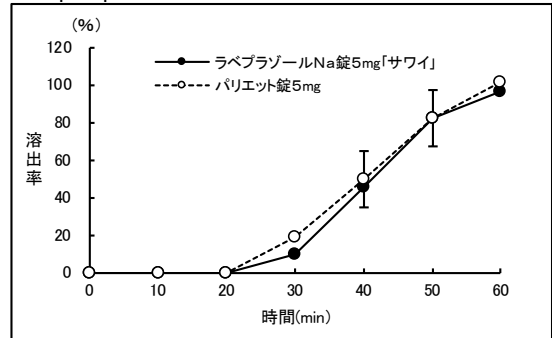
### ●ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」<sup>13)</sup>

|        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                             |
|--------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------|
| 試験方法   | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に従い、試験を実施した。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                             |
| 試験条件   | パドル法                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | 50rpm : pH1.2、pH6.0、pH6.8<br>100rpm : pH6.0 |
| 試験回数   | 12ベッセル                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                             |
| 試験製剤   | ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                             |
| 標準製剤   | パリエット錠 5mg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                             |
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm : pH1.2&gt;<br/>規定された試験時間(120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±9%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40%(40分)及び85%(50分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(40分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH6.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(40分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p> |                                             |

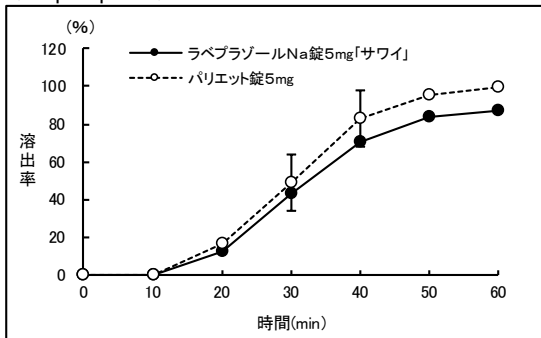
<50rpm : pH1.2>



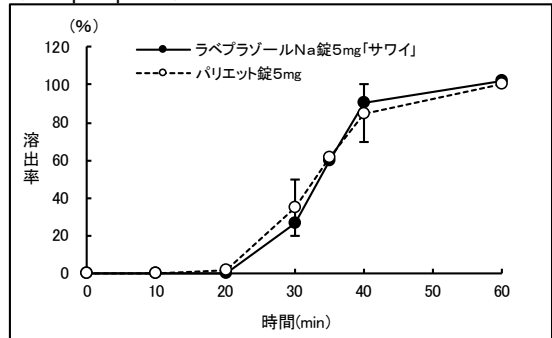
<50rpm : pH6.0>



<50rpm : pH6.8>



<100rpm : pH6.0>

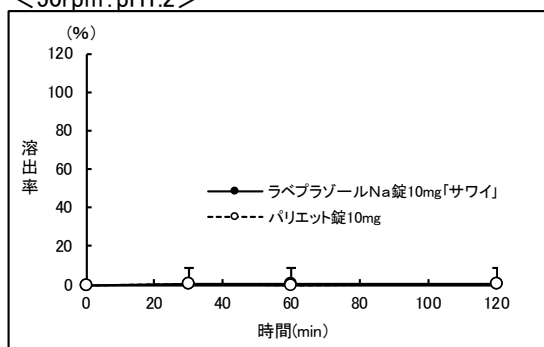


( I : 判定基準の適合範囲)

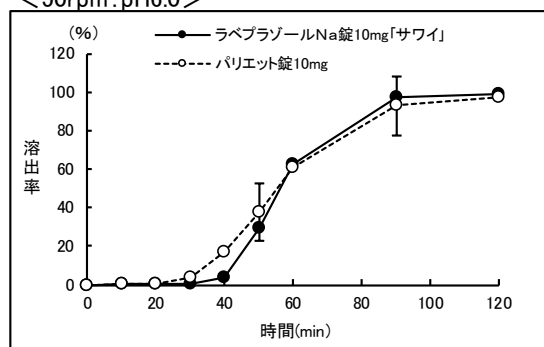
●ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」<sup>14)</sup>

|        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                         |
|--------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------|
| 試験方法   | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に従い、試験を実施した。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                         |
| 試験条件   | パドル法                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | 50rpm : pH1.2、6.0、6.8<br>100rpm : pH6.0 |
| 試験回数   | 12ベッセル                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                         |
| 試験製剤   | ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                         |
| 標準製剤   | パリエット錠10mg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                         |
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm : pH1.2&gt;<br/>測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率<math>\pm 9\%</math>の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40% (50分) 及び85% (90分) 付近の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<math>\pm 15\%</math>の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40% (40分) 及び85% (60分) 付近の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<math>\pm 15\%</math>の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH6.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40% (40分) 及び85% (60分) 付近の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<math>\pm 15\%</math>の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p> |                                         |

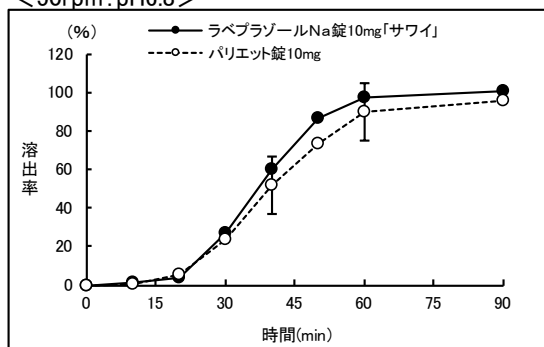
&lt;50rpm : pH1.2&gt;



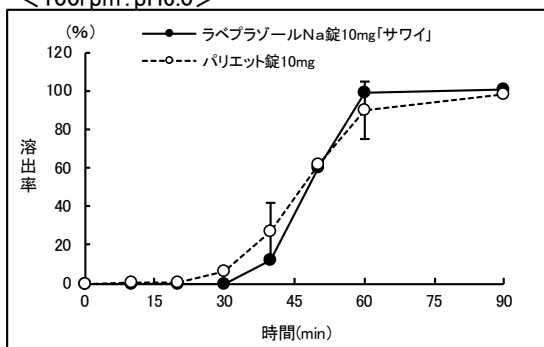
&lt;50rpm : pH6.0&gt;



&lt;50rpm : pH6.8&gt;



&lt;100rpm : pH6.0&gt;



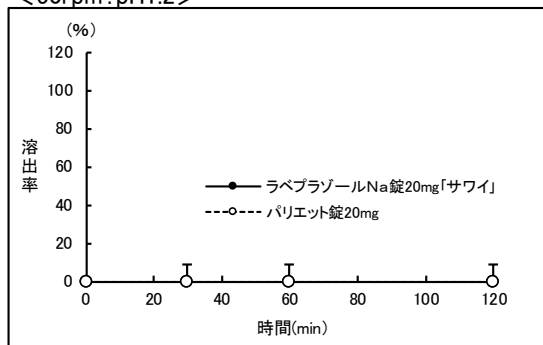
( I : 判定基準の適合範囲)

#### IV. 製剤に関する項目

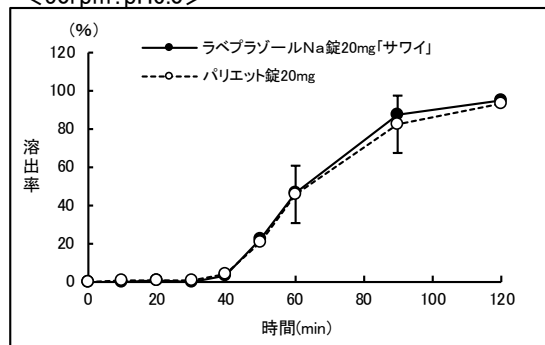
##### ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」<sup>15)</sup>

|        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                         |
|--------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------|
| 試験方法   | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に従い、試験を実施した。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                         |
| 試験条件   | パドル法                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | 50rpm : pH1.2、6.0、6.8<br>100rpm : pH6.0 |
| 試験回数   | 12ベッセル                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                         |
| 試験製剤   | ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                         |
| 標準製剤   | パリエット錠20mg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                         |
| 結果及び考察 | <p>&lt;50rpm : pH1.2&gt;<br/>測定した全ての時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率<math>\pm 9\%</math>の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40% (60分) 及び85% (90分) 付近の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<math>\pm 15\%</math>の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40% (40分) 及び85% (90分) 付近の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<math>\pm 15\%</math>の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH6.0&gt;<br/>標準製剤の平均溶出率が40% (50分) 及び85% (60分) 付近の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<math>\pm 15\%</math>の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p> |                                         |

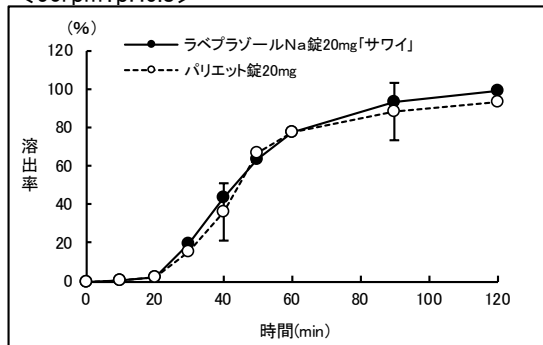
<50rpm:pH1.2>



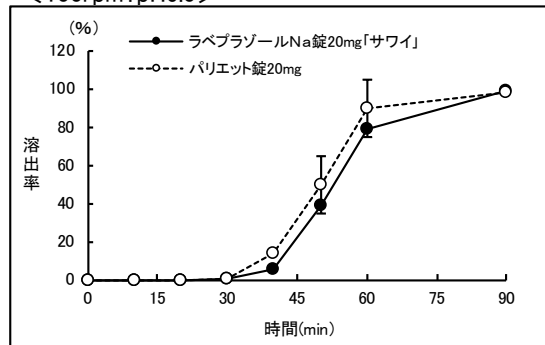
<50rpm:pH6.0>



<50rpm:pH6.8>



<100rpm:pH6.0>



( I : 判定基準の適合範囲)

## 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

該当資料なし

## 2) 包装

## ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg「サワイ」

## 22. 包装

〈ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)

〈ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」〉

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)、140錠(14錠×10)、500錠(10錠×50)

バラ[乾燥剤入り]：100錠

## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

## 22. 包装

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)

## 3) 予備容量

該当しない

## 4) 容器の材質

## ●ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミニウム箔

[ピロー]アルミニウム袋

## ●ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

バラ：[本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

## 11. 別途提供される資材類 .....

該当しない

## 12. その他 .....

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### ●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

##### 4. 効能又は効果

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群、非びらん性胃食道逆流症、低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制
- 下記におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助  
胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃MALTリンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

#### ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

##### 4. 効能又は効果

- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### ●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

##### 5. 効能又は効果に関連する注意

###### 〈効能共通〉

- 5.1 本剤の投与が胃癌による症状を隠蔽することがあるので、悪性でないことを確認のうえ投与すること（胃MALTリンパ腫、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助を除く）。

###### 〈非びらん性胃食道逆流症〉

- 5.2 投与開始2週間後を目安として効果を確認し、症状の改善傾向が認められない場合には、酸逆流以外の原因が考えられるため他の適切な治療への変更を検討すること。

###### 〈低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制〉

- 5.3 血栓・塞栓の形成抑制のために低用量アスピリンを継続投与している患者を投与対象とし、投与開始に際しては、胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の既往を確認すること。

###### 〈ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助〉

- 5.4 進行期胃MALTリンパ腫に対するヘリコバクター・ピロリ除菌治療の有効性は確立していない。
- 5.5 特発性血小板減少性紫斑病に対しては、ガイドライン等を参照し、ヘリコバクター・ピロリ除菌治療が適切と判断される症例にのみ除菌治療を行うこと。
- 5.6 早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃以外には、ヘリコバクター・ピロリ除菌治療による胃癌の発症抑制に対する有効性は確立していない。
- 5.7 ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎に用いる際には、ヘリコバクター・ピロリが陽性であること及び内視鏡検査によりヘリコバクター・ピロリ感染胃炎であることを確認すること。

#### ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

##### 5. 効能又は効果に関連する注意

- 本剤の投与が胃癌による症状を隠蔽することがあるので、悪性でないことを確認のうえ投与すること。



## 3. 用法及び用量

## 1) 用法及び用量の解説

## ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg「サワイ」

## 6. 用法及び用量

## 〈胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison症候群〉

通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mgを1日1回経口投与するが、病状により1回20mgを1日1回経口投与することができる。なお、通常、胃潰瘍、吻合部潰瘍では8週間まで、十二指腸潰瘍では6週間までの投与とする。

## 〈逆流性食道炎〉

## ・治療

逆流性食道炎の治療においては、通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mgを1日1回経口投与するが、病状により1回20mgを1日1回経口投与することができる。なお、通常、8週間までの投与とする。また、プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な場合、1回10mg又は1回20mgを1日2回、さらに8週間経口投与することができる。ただし、1回20mg 1日2回投与は重度の粘膜傷害を有する場合に限る。

## ・維持療法

再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法においては、通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mgを1日1回経口投与する。また、プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な逆流性食道炎の維持療法においては、1回10mgを1日2回経口投与することができる。

## 〈非びらん性胃食道逆流症〉

通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mgを1日1回経口投与する。なお、通常、4週間までの投与とする。

## 〈低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制〉

通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回5mgを1日1回経口投与するが、効果不十分な場合は1回10mgを1日1回経口投与することができる。

## 〈ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助〉

通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びクラリスロマイシンとして1回200mg(力価)の3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価) 1日2回を上限とする。

プロトンポンプインヒビター、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合は、これに代わる治療として、通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びメトロニダゾールとして1回250mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

## 6. 用法及び用量

## 〈胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison症候群〉

通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mgを1日1回経口投与するが、病状により1回20mgを1日1回経口投与することができる。なお、通常、胃潰瘍、吻合部潰瘍では8週間まで、十二指腸潰瘍では6週間までの投与とする。

## 〈逆流性食道炎〉

逆流性食道炎の治療においては、通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mgを1日1回経口投与するが、病状により1回20mgを1日1回経口投与することができる。なお、通常、8週間までの投与とする。また、プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な場合、1回10mg又は1回20mgを1日2回、さらに8週間経口投与することができる。ただし、1回20mg 1日2回投与は重度の粘膜傷害を有する場合に限る。

## V. 治療に関する項目

### 2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

## 4. 用法及び用量に関連する注意

### 7. 用法及び用量に関連する注意

〈胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison症候群〉

7.1 病状が著しい場合及び再発性・難治性の場合に1回20mgを1日1回投与することができる。

〈逆流性食道炎〉

7.2 病状が著しい場合及び再発性・難治性の場合に1回20mgを1日1回投与することができる(再発・再燃を繰り返す逆流性食道炎の維持療法、プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な場合は除く)。また、プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な患者に対し1回10mg又は1回20mgを1日2回、さらに8週間投与する場合は、内視鏡検査で逆流性食道炎が治癒していないことを確認すること。なお、本剤1回20mgの1日2回投与は、内視鏡検査で重度の粘膜傷害を確認した場合に限る[17.1.1参照]。

## 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

VI. -2. -2) 参照

### 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

#### ●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

### 17. 臨床成績

#### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎〉

##### 17.1.1 一般臨床試験及び二重盲検比較試験

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、逆流性食道炎及び吻合部潰瘍を対象に1日1回10mg又は20mgを投与した一般臨床試験及び二重盲検比較試験(投与期間: 6～8週間)の成績は下表のとおりである<sup>16)~25)</sup>。

| 対象疾患   | 内視鏡治癒率           |
|--------|------------------|
| 胃潰瘍    | 94.0%(189例/201例) |
| 十二指腸潰瘍 | 99.4%(159例/160例) |
| 逆流性食道炎 | 90.9%(50例/55例)   |
| 吻合部潰瘍  | 83.3%(10例/12例)   |

また、H<sub>2</sub>受容体拮抗剤抵抗性の逆流性食道炎を対象に1日1回10mgを24週間投与した維持療法(二重盲検比較試験)における内視鏡的非再発率は78.6%(33例/42例)であった<sup>26)</sup>。通常用法及び用量のプロトンポンプインヒビター治療に抵抗性<sup>注1)</sup>の逆流性食道炎患者を対象とした投与8週後の内視鏡検査による治癒率は下表のとおりであった<sup>27)</sup>。[7.2参照]

|                        | 1回20mg<br>1日1回      | 1回10mg<br>1日2回      | 1回20mg<br>1日2回      |
|------------------------|---------------------|---------------------|---------------------|
| 全体                     | 58.8%<br>(60例/102例) | 78.4%<br>(80例/102例) | 77.0%<br>(77例/100例) |
| grade A 及び<br>grade B* | 65.1%<br>(56例/86例)  | 87.1%<br>(74例/85例)  | 79.5%<br>(66例/83例)  |
| grade C 及び<br>grade D* | 25.0%<br>(4例/16例)   | 35.3%<br>(6例/17例)   | 64.7%<br>(11例/17例)  |

注1) ラベプラゾールナトリウム10mg/日、ランソプラゾール30mg/日、オメプラゾール20mg/日を8週間以上投与後に未治癒又は維持療法中に再発

※ロサンゼルス分類(改変2)による重症度

通常用法及び用量のプロトンポンプインヒビター治療に抵抗性<sup>注2)</sup>の逆流性食道炎を対象とした維持療法52週投与の内視鏡検査による非再発率(中央判定)は下表のとおりであった<sup>28, 29)</sup>。

|                 | 1回10mg<br>1日1回     | 1回10mg<br>1日2回      | 非再発率の群間差 <sup>a)</sup><br>(95%信頼区間)<br><i>P</i> 値 <sup>b)</sup> |
|-----------------|--------------------|---------------------|-----------------------------------------------------------------|
| 投与52週後の非再<br>発率 | 44.8%<br>(73/163例) | 73.9%<br>(119/161例) | 29.1(18.9, 39.3)<br><i>P</i> <0.001                             |

a) 10mg 1日2回-10mg 1日1回、b)  $\chi^2$ 検定

注2) ラベプラゾールナトリウム10mg/日・20mg/日、ランソプラゾール30mg/日、オメプラゾール20mg/日、エソメプラゾール20mg/日を8週間以上投与後に未治癒又は維持療法中に再発

#### 〈非びらん性胃食道逆流症〉

##### 17.1.2 二重盲検比較試験

非びらん性胃食道逆流症を対象に1日1回10mgを投与した二重盲検比較試験(投与期間: 4週間)における胸やけ症状の完全消失率及び緩解率は、それぞれ43.6%(44例/101例)、55.4%(56例/101例)であった。

副作用は、10mg投与の102例中12例(11.8%)に認められた。主な副作用は、便秘3例(2.9%)及び腹部膨満2例(2.0%)であった<sup>30)</sup>。

#### 〈低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制〉

##### 17.1.3 二重盲検比較試験

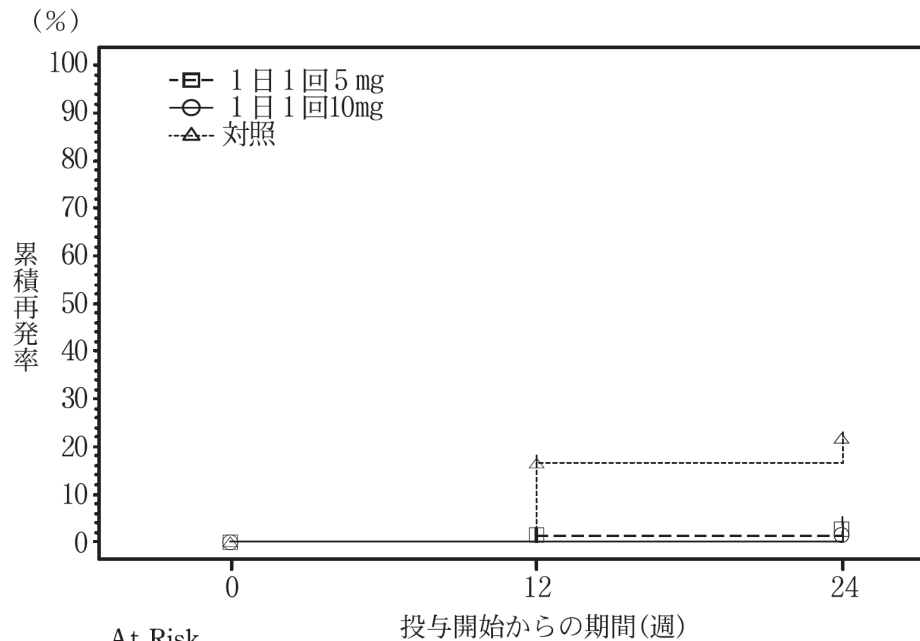
低用量アスピリン(1日81mg又は100mg)の長期投与を必要とし、かつ胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の既往歴を有する患者を対象とした二重盲検比較試験の結果、Kaplan-Meier法により推定した投与24週間後の胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の累積再発率は下表のとおりであった。

副作用は、ラベプラゾールナトリウム10mg投与群で157例中14例(8.9%)、5mg投与群で156例中7例(4.5%)に認められた。主な副作用は10mg投与群で下痢及び湿疹各2例(1.3%)、5mg投与群で下痢3例(1.9%)、肝機能異常2例(1.3%)であった<sup>31, 32)</sup>。

|                                         | 1日1回5mg<br>(150例)    | 1日1回10mg<br>(151例)   | 対照 <sup>c)</sup><br>(151例) |
|-----------------------------------------|----------------------|----------------------|----------------------------|
| 再発例数                                    | 4例                   | 2例                   | 32例                        |
| 投与24週後の累積再発率 <sup>a)</sup><br>(95%信頼区間) | 2.8%<br>(1.04, 7.17) | 1.4%<br>(0.35, 5.51) | 21.7%<br>(15.84, 29.27)    |
| 対照に対するハザード比<br>(95%信頼区間)                | 0.11<br>(0.04, 0.31) | 0.05<br>(0.01, 0.23) | -                          |
| <i>P</i> 値 <sup>b)</sup>                | <i>P</i> <0.001      | <i>P</i> <0.001      | -                          |

a) Kaplan-Meier法による推定、b) Log-rank検定、c) 対照はデプレノン(1回50mg 1日3回)

# V. 治療に関する項目



| At Risk  | 0   | 12  | 24  |
|----------|-----|-----|-----|
| 1日1回5mg  | 150 | 150 | 139 |
| 1日1回10mg | 151 | 151 | 142 |
| 対照       | 151 | 151 | 114 |

Kaplan-Meier法による胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の累積再発率

さらに、投与24週以降、ラベプラゾールナトリウムを最大52週間継続投与した場合(累計で最大76週間投与)、Kaplan-Meier法により推定した胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の累積再発率は、1日1回5mgで3.7%(95%信頼区間: 1.53, 8.64)、1日1回10mgで2.2%(95%信頼区間: 0.72, 6.75)であった。なお、投与24週以降、対照群はラベプラゾールナトリウム1日1回5mg又は1日1回10mgに切り替えて、最大52週間継続投与した<sup>33)</sup>。

## <胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助>

### 17.1.4 国内臨床試験

ヘリコバクター・ピロリ陽性の胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の患者を対象とした国内の臨床試験(ラベプラゾールナトリウム、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの1日2回7日間経口投与)における除菌率は下表のとおりである。

副作用は、ラベプラゾールナトリウム10mg、アモキシシリン水和物750mg(力価)、クラリスロマイシン200mg(力価)投与により、129例中40例(31.0%)に認められ、主な副作用は下痢16例(12.4%)、軟便13例(10.1%)であった。また、ラベプラゾールナトリウム10mg、アモキシシリン水和物750mg(力価)、クラリスロマイシン400mg(力価)投与により、123例中55例(44.7%)に副作用が認められ、主な副作用は下痢26例(21.1%)、軟便13例(10.6%)、味覚異常13例(10.6%)、腹痛7例(5.7%)であった<sup>34, 35)</sup>。

| 各薬剤の1回投与量                                                     | 投与回数 | 除菌率                |                    |                      |
|---------------------------------------------------------------|------|--------------------|--------------------|----------------------|
|                                                               |      | 胃潰瘍                | 十二指腸潰瘍             | 計                    |
| ラベプラゾールナトリウム10mg<br>アモキシシリン水和物750mg(力価)<br>クラリスロマイシン200mg(力価) | 2回/日 | 87.7%<br>(57例/65例) | 83.3%<br>(45例/54例) | 85.7%<br>(102例/119例) |
| ラベプラゾールナトリウム10mg<br>アモキシシリン水和物750mg(力価)<br>クラリスロマイシン400mg(力価) | 2回/日 | 89.7%<br>(61例/68例) | 87.8%<br>(36例/41例) | 89.0%<br>(97例/109例)  |

なお、海外で行われたヘリコバクター・ピロリ陽性の胃・十二指腸潰瘍等に対する除菌の臨床試験<sup>注3)</sup>においても、同程度の成績が得られている<sup>36)</sup>。

注3)各薬剤の投与量、及び投与期間は下記のとおりであり、国内の承認用法及び用量とは異なる。

ラベプラゾールナトリウムとして1回20mg、アモキシシリン水和物として1回1000mg(力価)及びクラリスロマイシンとして1回500mg(力価)の3剤を1日2回、7日間経口投与

また、プロトンポンプインヒビター(ランソプラゾール)、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功であったヘリコバクター・ピロリ陽性患者を対象とした国内の検討(ラベプラゾールナトリウム、アモキシシリン水和物及びメトロニダゾールの1日2回7日間経口投与)における除菌率は82%(49例/60例)と報告されている<sup>37)</sup>。

### ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

#### 17. 臨床成績

##### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

##### 17.1.1 一般臨床試験及び二重盲検比較試験

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、逆流性食道炎及び吻合部潰瘍を対象に1日1回10mg又は20mgを投与した一般臨床試験及び二重盲検比較試験(投与期間:6～8週間)の成績は下表のとおりである<sup>16～25)</sup>。

| 対象疾患   | 内視鏡治癒率           |
|--------|------------------|
| 胃潰瘍    | 94.0%(189例/201例) |
| 十二指腸潰瘍 | 99.4%(159例/160例) |
| 逆流性食道炎 | 90.9%(50例/55例)   |
| 吻合部潰瘍  | 83.3%(10例/12例)   |

通常用法及び用量のプロトンポンプインヒビター治療に抵抗性<sup>注)</sup>の逆流性食道炎患者を対象とした投与8週後の内視鏡検査による治癒率は下表のとおりであった<sup>27)</sup>。[7.2参照]

|                        | 1回20mg<br>1日1回      | 1回10mg<br>1日2回      | 1回20mg<br>1日2回      |
|------------------------|---------------------|---------------------|---------------------|
| 全体                     | 58.8%<br>(60例/102例) | 78.4%<br>(80例/102例) | 77.0%<br>(77例/100例) |
| grade A 及び<br>grade B* | 65.1%<br>(56例/86例)  | 87.1%<br>(74例/85例)  | 79.5%<br>(66例/83例)  |
| grade C 及び<br>grade D* | 25.0%<br>(4例/16例)   | 35.3%<br>(6例/17例)   | 64.7%<br>(11例/17例)  |

注)ラベプラゾールナトリウム10mg/日、ランソプラゾール30mg/日、オメプラゾール20mg/日を8週間以上投与後に未治癒又は維持療法中に再発

※ロサンゼルス分類(改変2)による重症度

また、臨床薬理試験において胃内pH上昇作用がラベプラゾールナトリウム1日1回20mg投与で1日1回10mg投与に比べて強く、難治性潰瘍に対するラベプラゾールナトリウム1日1回20mg投与の有用性が認められている<sup>17,19)</sup>。

#### (2) 安全性試験

V. -5. -4). -(1) 参照

#### 5) 患者・病態別試験

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 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

該当資料なし

- (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

該当資料なし

## VI. 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

プロトンポンプ阻害作用：オメプラゾール、ランソプラゾール、エソメプラゾールマグネシウム水和物、ボノプラザンフマル酸塩<sup>38)</sup>

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### 1) 作用部位・作用機序

##### ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg「サワイ」

#### 18.1 作用機序

ラベプラゾールナトリウムは酸分泌細胞の酸性領域で活性体(スルフェンアミド体)になり、プロトンポンプ( $H^+$ 、 $K^+$ -ATPase)のSH基を修飾して酵素活性を阻害し、酸分泌を抑制する<sup>1)</sup>。さらに阻害された酵素活性の回復には、主に作用部位からの薬物の消失あるいはグルタチオンによる活性体の消失が関与しているものと考えられる。その他、グルタチオンによって酵素活性が回復する可能性も推測される<sup>2)</sup>。

#### 18.6 作用機序

##### 〈ヘリコバクター・ピロリ除菌の補助〉

アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシン、アモキシシリン水和物及びメトロニダゾールとの3剤併用療法におけるラベプラゾールナトリウムの役割は胃内pHを上昇させることにより、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの抗菌活性を高めることにあると考えられる<sup>39, 40)</sup>。

##### ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

#### 18.1 作用機序

ラベプラゾールナトリウムは酸分泌細胞の酸性領域で活性体(スルフェンアミド体)になり、プロトンポンプ( $H^+$ 、 $K^+$ -ATPase)のSH基を修飾して酵素活性を阻害し、酸分泌を抑制する<sup>1)</sup>。さらに阻害された酵素活性の回復には、主に作用部位からの薬物の消失あるいはグルタチオンによる活性体の消失が関与しているものと考えられる。その他、グルタチオンによって酵素活性が回復する可能性も推測される<sup>2)</sup>。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg「サワイ」

#### 18.2 胃酸分泌抑制作用

18.2.1 健康成人男子におけるガストリン刺激酸分泌に対し、1日1回10mg投与、1日1回20mg投与とともに投与初日から著明な抑制作用を示し、投与1日目及び7日目の酸分泌量の減少率は1日1回10mg投与で72～76%、90～96%、1日1回20mg投与で88～89%、99%である<sup>41, 42)</sup>。

18.2.2 ウサギ摘出胃腺標本におけるジブチリルサイクリックAMP刺激による胃酸分泌を抑制する<sup>43)</sup> (*in vitro*)。

18.2.3 慢性胃ろう管装着犬におけるヒスタミン、ペンタガストリン刺激胃酸分泌、並びにラットにおける基礎胃酸分泌及びヒスタミン刺激胃酸分泌に対し強力な抑制作用を示す<sup>43～45)</sup>。

イヌあるいはラットにおける胃酸分泌抑制作用の回復は、他のプロトンポンプ阻害剤に比較し速く、血中ガストリンの上昇は少ない<sup>43, 46)</sup>。

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 18.3 胃内pH上昇作用

健康成人男子における胃内pHに対し、1日1回5mg投与、1日1回10mg投与、1日1回20mg投与とともに著明な上昇作用を示し、投与5日目の24時間中にpH4以上を示す時間の割合は1日1回5mg投与のEM<sup>\*</sup>で46%、PM<sup>\*</sup>で63%、1日1回10mg投与のEM<sup>\*</sup>で58%、PM<sup>\*</sup>で72%、1日1回20mg投与のEM<sup>\*</sup>で61%、PM<sup>\*</sup>で76%である<sup>47)</sup>。

※肝代謝酵素チトクロームP450 2C19(CYP2C19)表現型は、下記遺伝子型より分類される。

EM(extensive metabolizer) : CYP2C19\*1/\*1、CYP2C19\*1/\*2 又はCYP2C19\*1/\*3

PM(poor metabolizer) : CYP2C19\*2/\*2、CYP2C19\*2/\*3 又はCYP2C19\*3/\*3

### 18.4 H<sup>+</sup>、K<sup>+</sup>-ATPase阻害作用

ブタ胃粘膜より調製したH<sup>+</sup>、K<sup>+</sup>-ATPaseに対し、強い阻害作用を示す<sup>2, 48)</sup> (*in vitro*)。

### 18.5 抗潰瘍作用

ラットを用いた各種実験潰瘍あるいは実験胃粘膜病変(寒冷拘束ストレス、水浸拘束ストレス、幽門結紮、システアミン、塩酸-エタノール及びアスピリン)に対し、強い抗潰瘍作用あるいは胃粘膜病変改善作用を示す<sup>44, 49, 50)</sup>。

### 18.7 除菌効果

#### 〈ヘリコバクター・ピロリ除菌の補助〉

スナネズミを用いたヘリコバクター・ピロリ感染モデルにおいて、胃内生菌数に対するアモキシシリン水和物とクラリスロマイシンの2剤併用の効果は、ラベプラゾールナトリウムを加えることにより、相乗効果が認められた<sup>51)</sup>。

## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

### 18.2 胃酸分泌抑制作用

18.2.1 健康成人男子におけるガストリン刺激酸分泌に対し、1日1回10mg投与、1日1回20mg投与とともに投与初日から著明な抑制作用を示し、投与1日目及び7日目の酸分泌量の減少率は1日1回10mg投与で72~76%、90~96%、1日1回20mg投与で88~89%、99%である<sup>41, 42)</sup>。

18.2.2 ウサギ摘出胃腺標本におけるジブチルサイクリックAMP刺激による胃酸分泌を抑制する<sup>43)</sup> (*in vitro*)。

18.2.3 慢性胃ろう管装着犬におけるヒスタミン、ペンタガストリン刺激胃酸分泌、並びにラットにおける基礎胃酸分泌及びヒスタミン刺激胃酸分泌に対し強力な抑制作用を示す<sup>43~45)</sup>。

イヌあるいはラットにおける胃酸分泌抑制作用の回復は、他のプロトンポンプ阻害剤に比較し速く、血中ガストリンの上昇は少ない<sup>43, 46)</sup>。

### 18.3 胃内pH上昇作用

健康成人男子における胃内pHに対し、1日1回5mg投与、1日1回10mg投与、1日1回20mg投与とともに著明な上昇作用を示し、投与5日目の24時間中にpH4以上を示す時間の割合は1日1回5mg投与のEM<sup>\*</sup>で46%、PM<sup>\*</sup>で63%、1日1回10mg投与のEM<sup>\*</sup>で58%、PM<sup>\*</sup>で72%、1日1回20mg投与のEM<sup>\*</sup>で61%、PM<sup>\*</sup>で76%である<sup>47)</sup>。

※肝代謝酵素チトクロームP450 2C19(CYP2C19)表現型は、下記遺伝子型より分類される。

EM(extensive metabolizer) : CYP2C19\*1/\*1、CYP2C19\*1/\*2 又はCYP2C19\*1/\*3

PM(poor metabolizer) : CYP2C19\*2/\*2、CYP2C19\*2/\*3 又はCYP2C19\*3/\*3

### 18.4 H<sup>+</sup>、K<sup>+</sup>-ATPase阻害作用

ブタ胃粘膜より調製したH<sup>+</sup>、K<sup>+</sup>-ATPaseに対し、強い阻害作用を示す<sup>2, 48)</sup> (*in vitro*)。

### 18.5 抗潰瘍作用

ラットを用いた各種実験潰瘍あるいは実験胃粘膜病変(寒冷拘束ストレス、水浸拘束ストレス、幽門結紮、システアミン、塩酸-エタノール及びアスピリン)に対し、強い抗潰瘍作用あるいは胃粘膜病変改善作用を示す<sup>44, 49, 50)</sup>。



3) 作用発現時間・持続時間

VI. -2. -2) 参照

## VII. 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

該当しない

## 2) 臨床試験で確認された血中濃度

## ●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

## 16.1 血中濃度

## 16.1.1 ラベプラゾールナトリウム単剤投与

健康成人男子に20mgを絶食下又は食後に経口投与した時の被験者毎に算出した薬物動態パラメータの平均値を表に示す<sup>52)</sup>。[16.2.1参照]

食事効果試験時の血漿中薬物動態パラメータ

| 投与条件 | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | t <sub>max</sub><br>(hr) | AUC<br>(ng・hr/mL) |
|------|-----------------------------|--------------------------|-------------------|
| 絶食下  | 437±237                     | 3.6±0.9                  | 937±617           |
| 食後   | 453±138                     | 5.3±1.4                  | 901±544           |

(Mean±S. D., n=12)

また、健康成人男子に5mg、10mg、20mgを絶食下で反復投与した時(投与5日目)の薬物動態パラメータは以下のとおりである<sup>47)</sup>。

健康成人男子における反復投与時(5mg、10mg、20mg)の血漿中ラベプラゾールナトリウムの薬物動態パラメータ

| 投与量  | 表現型             | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | t <sub>max</sub><br>(hr) | AUC <sub>(0-t)</sub><br>(ng・hr/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
|------|-----------------|-----------------------------|--------------------------|------------------------------------|--------------------------|
| 5mg  | EM <sup>※</sup> | 146±56                      | 3.0(2.0-4.5)             | 236±97                             | 1.8±0.9                  |
|      | PM <sup>※</sup> | 252±55                      | 2.5(1.5-5.5)             | 585±137                            | 4.2±0.5                  |
| 10mg | EM <sup>※</sup> | 383±83                      | 3.3(2.0-5.0)             | 539±200                            | 1.5±0.4                  |
|      | PM <sup>※</sup> | 509±64                      | 2.8(2.0-4.5)             | 1230±200                           | 3.8±0.3                  |
| 20mg | EM <sup>※</sup> | 654±348                     | 4.0(2.5-8.0)             | 994±477                            | 2.3±1.4                  |
|      | PM <sup>※</sup> | 822±232                     | 3.3(3.0-6.0)             | 2331±663                           | 3.7±0.3                  |

(Mean±S. D., t<sub>max</sub>はMedian(Min-Max), EM n=16, PM n=8)

※肝代謝酵素チトクロームP450 2C19(CYP2C19)表現型は、下記遺伝子型より分類される。

EM(extensive metabolizer): CYP2C19\*1/\*1、CYP2C19\*1/\*2又はCYP2C19\*1/\*3

PM(poor metabolizer): CYP2C19\*2/\*2、CYP2C19\*2/\*3又はCYP2C19\*3/\*3

## 16.1.2 3剤併用投与

健康成人男子にラベプラゾールナトリウム20mg<sup>註1)</sup>、アモキシシリン水和物750mg(力価)、及びクラリスロマイシン400mg(力価)を1日2回7日間(計12回)反復経口投与した時のラベプラゾールナトリウムの薬物動態パラメータは以下のとおりである<sup>53)</sup>。

健康成人男子における3剤併用反復投与時の血漿中ラベプラゾールナトリウムの薬物動態パラメータ

|                        | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | t <sub>max</sub><br>(hr) | AUC <sub>0-12</sub><br>(ng・hr/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
|------------------------|-----------------------------|--------------------------|-----------------------------------|--------------------------|
| EM <sup>※</sup> (n=15) | 578±293                     | 3.0(2.0-4.0)             | 934±438                           | 0.72±0.19                |
| PM <sup>※</sup> (n=4)  | 948±138                     | 3.0(2.0-3.0)             | 2600±474                          | 1.80±0.32                |

(Mean±S. D., t<sub>max</sub>はMedian(Min-Max))

※肝代謝酵素チトクロームP450 2C19(CYP2C19)表現型は、下記遺伝子型より分類される。

EM(extensive metabolizer):CYP2C19\*1/\*1、CYP2C19\*1/\*2又はCYP2C19\*1/\*3  
PM(poor metabolizer):CYP2C19\*2/\*2、CYP2C19\*2/\*3又はCYP2C19\*3/\*3

注1)承認用法及び用量は「通常、成人にはラベプラゾールナトリウムとして1回10mg、アモキシシリン水和物として1回750mg(力価)及びクラリスロマイシンとして1回200mg(力価)の3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。」である。

## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

### 16.1 血中濃度

16.1.1 健康成人男子に20mgを絶食下又は食後に経口投与した時の被験者毎に算出した薬物動態パラメータの平均値を表に示す<sup>52)</sup>。[16.2.1参照]

食事効果試験時の血漿中薬物動態パラメータ

| 投与条件 | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | t <sub>max</sub><br>(hr) | AUC<br>(ng・hr/mL) |
|------|-----------------------------|--------------------------|-------------------|
| 絶食下  | 437±237                     | 3.6±0.9                  | 937±617           |
| 食後   | 453±138                     | 5.3±1.4                  | 901±544           |

(Mean±S. D., n=12)

また、健康成人男子に5mg、10mg、20mgを絶食下で反復投与した時(投与5日目)の薬物動態パラメータは以下のとおりである<sup>47)</sup>。

健康成人男子における反復投与時(5mg、10mg、20mg)の血漿中ラベプラゾールナトリウムの薬物動態パラメータ

| 投与量  | 表現型 | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | t <sub>max</sub><br>(hr) | AUC <sub>(0-t)</sub><br>(ng・hr/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
|------|-----|-----------------------------|--------------------------|------------------------------------|--------------------------|
| 5mg  | EM※ | 146±56                      | 3.0(2.0-4.5)             | 236±97                             | 1.8±0.9                  |
|      | PM※ | 252±55                      | 2.5(1.5-5.5)             | 585±137                            | 4.2±0.5                  |
| 10mg | EM※ | 383±83                      | 3.3(2.0-5.0)             | 539±200                            | 1.5±0.4                  |
|      | PM※ | 509±64                      | 2.8(2.0-4.5)             | 1230±200                           | 3.8±0.3                  |
| 20mg | EM※ | 654±348                     | 4.0(2.5-8.0)             | 994±477                            | 2.3±1.4                  |
|      | PM※ | 822±232                     | 3.3(3.0-6.0)             | 2331±663                           | 3.7±0.3                  |

(Mean±S. D., t<sub>max</sub>はMedian(Min-Max), EM n=16, PM n=8)

※肝代謝酵素チトクロームP450 2C19(CYP2C19)表現型は、下記遺伝子型より分類される。

EM(extensive metabolizer):CYP2C19\*1/\*1、CYP2C19\*1/\*2又はCYP2C19\*1/\*3  
PM(poor metabolizer):CYP2C19\*2/\*2、CYP2C19\*2/\*3又はCYP2C19\*3/\*3

## <生物学的同等性試験>

### ●ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」<sup>54,55)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」とパリエット錠5mgを健康成人男子※にそれぞれ1錠(ラベプラゾールナトリウムとして5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ラベプラゾール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～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。

※肝代謝酵素CYP2C19の遺伝子型がEM(Extensive Metabolizer)に分類された者

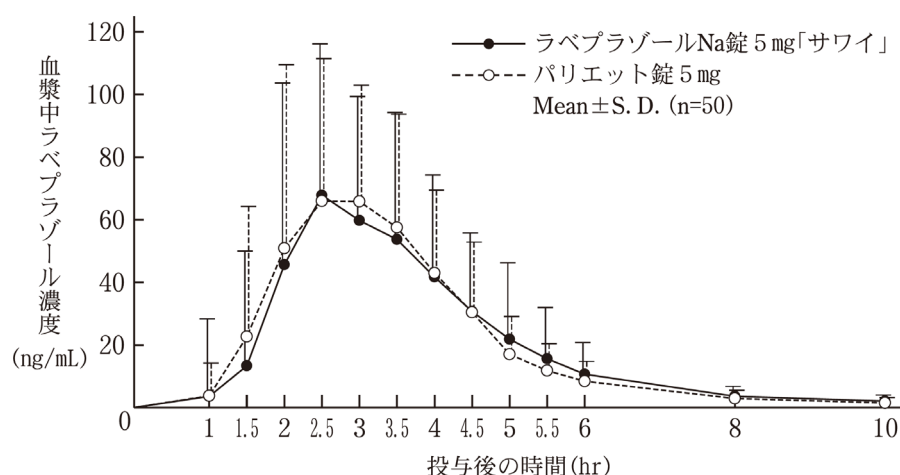
# VII. 薬物動態に関する項目

|      |                                          |
|------|------------------------------------------|
| 採血時点 | 0、1、1.5、2、2.5、3、3.5、4、4.5、5、5.5、6、8、10hr |
| 休薬期間 | 3日間                                      |
| 測定方法 | LC/MS法                                   |
| 試験製剤 | ラベプラゾールNa錠 5mg「サワイ」                      |
| 標準製剤 | パリエット錠 5mg                               |

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|                        | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>0-10hr</sub><br>(ng・hr/mL) |
|------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|-------------------------------------|
| ラベプラゾールNa錠<br>5mg「サワイ」 | 117±42          | 2.8±1.0      | 1.6±0.5                  | 200±78                              |
| パリエット錠 5mg             | 113±36          | 2.7±0.8      | 1.5±0.4                  | 203±76                              |

(Mean±S.D., n=50)



|                       | 対数値の平均値の差 | 対数値の平均値の差の90%信頼区間   |
|-----------------------|-----------|---------------------|
| AUC <sub>0-10hr</sub> | log(0.99) | log(0.94)～log(1.03) |
| Cmax                  | log(1.02) | log(0.94)～log(1.11) |

血漿中濃度ならびにAUCt、Cmax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。

## ●ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」<sup>56, 57)</sup>

|      |                                                        |
|------|--------------------------------------------------------|
| 通知等  | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：<br>平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号 |
| 採血時点 | 0、1、2、2.5、3、3.5、4、4.5、5、5.5、6、8、10hr                   |
| 休薬期間 | 3日間                                                    |
| 測定方法 | LC/MS法                                                 |
| 試験製剤 | ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」                                    |
| 標準製剤 | パリエット錠10mg                                             |

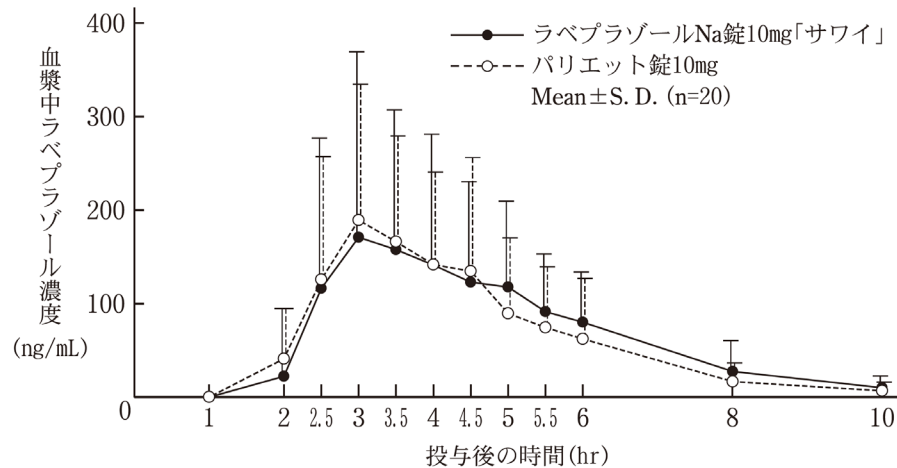
ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」とパリエット錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ラベプラゾールナトリウムとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ラベプラゾール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|                         | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>t</sub><br>(ng・hr/mL) |
|-------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|--------------------------------|
| ラベプラゾールNa錠<br>10mg「サワイ」 | 301±163         | 3.9±1.2      | 1.2±0.5                  | 640±377                        |
| パリエット錠10mg              | 294±118         | 3.3±0.9      | 1.1±0.3                  | 610±320                        |

(Mean±S.D.)



|                  | 対数値の平均値の差  | 対数値の平均値の差の90%信頼区間         |
|------------------|------------|---------------------------|
| AUC <sub>t</sub> | log (1.03) | log (0.92) ~ log (1.15)   |
| Cmax             | log (0.96) | log (0.803) ~ log (1.137) |

血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、Cmax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。

●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」<sup>56, 58)</sup>

|      |                                                        |
|------|--------------------------------------------------------|
| 通知等  | 「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：<br>平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号 |
| 採血時点 | 0、1、2、2.5、3、3.5、4、4.5、5、5.5、6、8、10hr                   |
| 休薬期間 | 3日間                                                    |
| 測定方法 | LC/MS法                                                 |
| 試験製剤 | ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」                                    |
| 標準製剤 | パリエット錠20mg                                             |

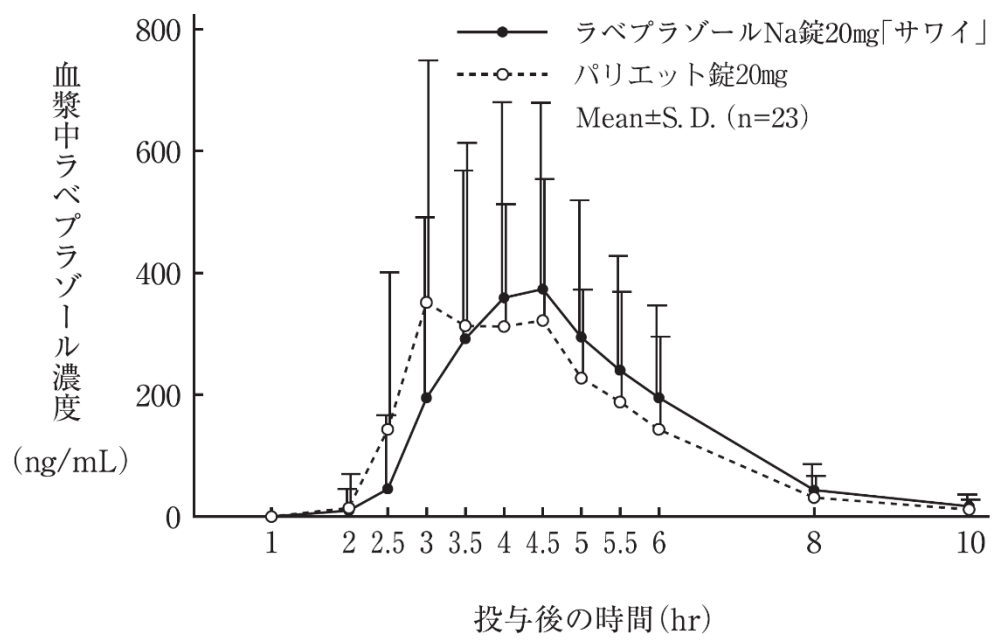
ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」とパリエット錠20mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ラベプラゾールナトリウムとして20mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ラベプラゾール濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80)~log (1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

|                         | Cmax<br>(ng/mL) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) | AUC <sub>0-10hr</sub><br>(ng・hr/mL) |
|-------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|-------------------------------------|
| ラベプラゾールNa錠<br>20mg「サワイ」 | 618±233         | 4.0±1.0      | 1.0±0.2                  | 1255±759                            |
| パリエット錠20mg              | 628±290         | 3.7±0.9      | 1.0±0.3                  | 1193±667                            |

(Mean±S.D.)

VII. 薬物動態に関する項目



|                       | 対数値の平均値の差  | 対数値の平均値の差の90%信頼区間       |
|-----------------------|------------|-------------------------|
| AUC <sub>0-10hr</sub> | log (1.04) | log (0.97) ~ log (1.12) |
| Cmax                  | log (1.03) | log (0.89) ~ log (1.19) |

血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、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。

3) 中毒域  
該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

16.2 吸収

16.2.1 食事の影響

健康成人男子に20mgを絶食下又は食後に経口投与した時、食後投与では絶食下投与に比し $t_{max}$ が1.7時間遅延するとともに吸収に個体差が認められている<sup>52)</sup>。[16.1.1参照]

16.7 薬物相互作用

類薬(オメプラゾール)で肝代謝酵素チトクロームP450 2C19(CYP2C19)への代謝競合により相互作用が認められているジアゼパム、ワルファリン(R-ワルファリン)に対してラベプラゾールナトリウムはこれらの薬剤の血中濃度に影響を与えないことが報告されている。また、類薬(ランソプラゾール)で肝代謝酵素チトクロームP450 1A2(CYP1A2)の誘導により相互作用が認められているテオフィリンに対してもラベプラゾールナトリウムは血中濃度に影響を与えないことが報告されている<sup>59, 60)</sup>。

VIII. -7. 参照

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

●ラベプラゾールNa錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(ラベプラゾールナトリウムとして 5 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>54, 55)</sup>

$0.478 \pm 0.163 \text{ hr}^{-1}$

●ラベプラゾールNa錠 10 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(ラベプラゾールナトリウムとして 10 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>56, 57)</sup>

$0.673 \pm 0.249 \text{ hr}^{-1}$

●ラベプラゾールNa錠 20 mg「サワイ」を健康成人男子に 1 錠(ラベプラゾールナトリウムとして 20 mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>56, 58)</sup>

$0.729 \pm 0.152 \text{ hr}^{-1}$

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 .....

VII. - 1. -4) 参照

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

VIII. - 6. -5) 参照

3) 乳汁への移行性

VIII. - 6. -6) 参照

## VII. 薬物動態に関する項目

### 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

#### 16.4 代謝

健康成人男子に10mg、20mgを経口投与した時の血漿中の代謝物は、主に非酵素的な還元反応により生成したチオエーテル体であった。その他に肝代謝酵素チトクロームP450 2C19 (CYP2C19) が関与する脱メチル化反応により生成した脱メチル体、3A4 (CYP3A4) が関与するスルホン化反応により生成したスルホン体が認められた<sup>52, 59, 61)</sup>。  
[10参照]

### 2) 代謝に関与する酵素 (CYP等) の分子種、寄与率

VII. -6. -1) 参照

### 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活性比、存在比率

VII. -6. -1) 参照

## 7. 排泄 .....

#### 16.5 排泄

健康成人男子に20mgを経口投与した場合、投与後24時間までに尿中にラベプラゾールナトリウムの未変化体は検出されず、代謝物であるカルボン酸体及びそのグルクロン酸抱合体が投与量の約29～40%、メルカプツール酸抱合体が13～19%排泄された<sup>52, 61)</sup>。

## 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



## VIII. 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……………  
2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)  
2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者  
2.2 リルピピリン塩酸塩を投与中の患者[10.1参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………  
V. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………  
V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由……………  
●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

8. 重要な基本的注意  
〈効能共通〉  
8.1 本剤の投与中には、血液像や肝機能に注意し、定期的に血液学的検査・血液生化学的検査を行うことが望ましい。  
〈胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、非びらん性胃食道逆流症〉  
8.2 長期の使用経験が十分でないので、維持療法には用いないことが望ましい。  
〈逆流性食道炎の維持療法〉  
8.3 再発・再燃を繰り返す患者やプロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な患者に対し行うこととし、本来、維持療法の必要のない患者に行うことのないよう留意すること。また、食事制限、アルコール摂取制限等の生活習慣の改善が図られ、寛解状態が長期にわたり継続する場合には休薬又は減量を考慮すること。なお、維持療法中は定期的に内視鏡検査を実施するなど観察を十分に行うことが望ましい。  
〈非びらん性胃食道逆流症〉  
8.4 問診により胸やけ、呑酸等の酸逆流症状が繰り返されること(1週間あたり2日以上)を確認のうえ投与すること。なお、本剤の投与が胃癌、食道癌等の悪性腫瘍及び他の消化器疾患による症状を隠蔽することがあるので、内視鏡検査等によりこれらの疾患でないことを確認すること。

●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

8. 重要な基本的注意  
〈効能共通〉  
8.1 本剤の投与中には、血液像や肝機能に注意し、定期的に血液学的検査・血液生化学的検査を行うことが望ましい。  
〈胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍〉  
8.2 長期の使用経験が十分でないので、維持療法には用いないことが望ましい。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 薬物過敏症の既往歴のある患者

2) 腎機能障害患者

設定されていない

3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

肝硬変患者で肝性脳症の報告がある。

4) 生殖能を有する者

設定されていない

5) 妊婦

●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

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。動物実験(ラット経口400mg/kg、ウサギ静注30mg/kg)で胎児毒性(ラットで化骨遅延、ウサギで体重の低下、化骨遅延)が報告されている。また、ラットにラベプラゾールナトリウム(25mg/kg/日)、アモキシシリン水和物(400mg/kg/日以上)及びクラリスロマイシン(50mg/kg/日以上)を4週間併用投与した試験で、雌で栄養状態の悪化が認められている。

●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

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。動物実験(ラット経口400mg/kg、ウサギ静注30mg/kg)で胎児毒性(ラットで化骨遅延、ウサギで体重の低下、化骨遅延)が報告されている。

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。動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。

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

消化器症状等の副作用があらわれた場合は休薬するなど慎重に投与すること。本剤は主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能が低下していることが多く、副作用があらわれることがある。

## 7. 相互作用

## 10. 相互作用

本剤の代謝には肝代謝酵素チトクロームP450 2C19(CYP2C19)及び3A4(CYP3A4)の関与が認められている。[16.4参照]

また、本剤の胃酸分泌抑制作用により、併用薬剤の吸収を促進又は抑制することがある。

## 1) 併用禁忌とその理由

## 10.1 併用禁忌(併用しないこと)

| 薬剤名等                         | 臨床症状・措置方法                | 機序・危険因子                                                         |
|------------------------------|--------------------------|-----------------------------------------------------------------|
| リルピピリン塩酸塩(エジュラント)<br>[2.2参照] | リルピピリン塩酸塩の作用を減弱するおそれがある。 | 本剤の胃酸分泌抑制作用により、胃内pHが上昇し、リルピピリン塩酸塩の吸収が低下し、リルピピリンの血中濃度が低下することがある。 |

## 2) 併用注意とその理由

## 10.2 併用注意(併用に注意すること)

| 薬剤名等                        | 臨床症状・措置方法                                                             | 機序・危険因子                                     |
|-----------------------------|-----------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------|
| ジゴキシン<br>メチルジゴキシン           | 相手薬剤の血中濃度が上昇することがある。                                                  | 本剤の胃酸分泌抑制作用により、胃内pHが上昇し、相手薬剤の吸収を促進する。       |
| イトラコナゾール<br>ゲフィチニブ          | 相手薬剤の血中濃度が低下するおそれがある。                                                 | 本剤の胃酸分泌抑制作用により、胃内pHが上昇し、相手薬剤の吸収を抑制するおそれがある。 |
| 水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウム含有の制酸剤 | 本剤単独投与に比べ制酸剤同時服用、制酸剤投与1時間後服用で平均血漿中濃度曲線下面積がそれぞれ8%、6%低下したとの報告がある。       | 機序は不明である。                                   |
| メトトレキサート                    | メトトレキサートの血中濃度が上昇することがある。高用量のメトトレキサートを投与する場合は、一時的に本剤の投与を中止することを考慮すること。 | 機序は不明である。                                   |

## 8. 副作用

## 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。

## 1) 重大な副作用と初期症状

## 11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック(頻度不明)、アナフィラキシー(頻度不明)

11.1.2 汎血球減少(頻度不明)、無顆粒球症(頻度不明)、血小板減少(0.1%未満)、溶血性貧血(頻度不明)

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

|                                                                                                                    |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 11.1.3 劇症肝炎(頻度不明)、肝機能障害(0.1～5%未満)、黄疸(頻度不明)                                                                         |
| 11.1.4 間質性肺炎(0.1%未満)<br>発熱、咳嗽、呼吸困難、肺音の異常(捻髪音)等が認められた場合には、速やかに胸部X線等の検査を実施し、本剤の投与を中止するとともに、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。 |
| 11.1.5 皮膚障害(頻度不明)<br>中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、多形紅斑等があらわれることがある。   |
| 11.1.6 急性腎障害(頻度不明)、間質性腎炎(頻度不明)<br>腎機能検査(BUN、クレアチニン等)に注意すること。                                                       |
| 11.1.7 低ナトリウム血症(頻度不明)                                                                                              |
| 11.1.8 横紋筋融解症(頻度不明)<br>筋肉痛、脱力感、CK上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがある。                                         |
| 11.1.9 視力障害(頻度不明)                                                                                                  |
| 11.1.10 錯乱状態(頻度不明)<br>せん妄、異常行動、失見当識、幻覚、不安、焦燥、攻撃性等があらわれることがある。                                                      |

2) その他の副作用

●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

|                                                                                                            |                                    |                                       |                                                        |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------|---------------------------------------|--------------------------------------------------------|
| 11.2 その他の副作用<br>〈胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison症候群、非びらん性胃食道逆流症、低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制〉 |                                    |                                       |                                                        |
|                                                                                                            | 0.1～5%未満                           | 0.1%未満                                | 頻度不明                                                   |
| 過敏症                                                                                                        | 発疹、瘙痒感                             | 蕁麻疹                                   |                                                        |
| 血液                                                                                                         | 白血球減少、白血球増加、好酸球增多、貧血               | 赤血球減少、好中球增多、リンパ球減少                    |                                                        |
| 肝臓                                                                                                         | AST、ALT、Al-P、 $\gamma$ -GTP、LDHの上昇 | 総ビリルビンの上昇                             |                                                        |
| 循環器                                                                                                        | 血圧上昇                               | 動悸                                    |                                                        |
| 消化器                                                                                                        | 便秘、下痢、腹部膨満感、嘔気、口内炎                 | 腹痛、苦味、カンジダ症、胃もたれ、口渇、食欲不振、鼓腸           | 舌炎、嘔吐、顕微鏡的大腸炎(collagenous colitis、lymphocytic colitis) |
| 精神神経系                                                                                                      | 頭痛                                 | めまい、ふらつき、眠気、四肢脱力、知覚鈍麻、握力低下、口のもつれ、失見当識 | せん妄、昏睡                                                 |
| その他                                                                                                        | 総コレステロール・中性脂肪・BUNの上昇、蛋白尿、血中TSH増加   | かすみ目、浮腫、倦怠感、発熱、脱毛症、しびれ感、CKの上昇         | 目のちらつき、関節痛、筋肉痛、高アンモニア血症、低マグネシウム血症、女性化乳房                |

注) 発現頻度は製造販売後調査を含む。

| 〈ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助〉 |                                         |                                                     |
|---------------------|-----------------------------------------|-----------------------------------------------------|
|                     | 0.1～5 %未満                               | 0.1%未満                                              |
| 過敏症                 | 発疹、蕁麻疹                                  | 痒痒感                                                 |
| 血液                  | 白血球減少                                   | 好酸球増多、好中球減少、リンパ球減少、リンパ球増多、血小板減少、白血球増加               |
| 肝臓                  | ALT、AST、 $\gamma$ -GTPの上昇               | Al-P、LDHの上昇                                         |
| 循環器                 |                                         | 動悸、血圧上昇                                             |
| 消化器                 | 下痢、軟便、味覚異常、腹痛、腹部膨満感、嘔気、便秘、舌炎、胃部不快感、鼓腸放屁 | 口渇、口内炎、胸やけ、口唇炎、痔核、食道炎、食欲不振、腸炎                       |
| 精神神経系               | 頭痛                                      | めまい                                                 |
| その他                 | 中性脂肪の上昇                                 | 顔面浮腫、倦怠感、舌のしびれ感、熱感、蛋白尿、眼圧上昇、手足のしびれ感、尿酸の上昇、尿糖異常、勃起増強 |

注) 発現頻度は胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるラベプラゾールナトリウム、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの3剤投与の承認時までの臨床試験及び製造販売後調査を含む。

●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

| 11.2 その他の副作用 |                                    |                                       |                                                        |
|--------------|------------------------------------|---------------------------------------|--------------------------------------------------------|
|              | 0.1～5 %未満                          | 0.1%未満                                | 頻度不明                                                   |
| 過敏症          | 発疹、痒痒感                             | 蕁麻疹                                   |                                                        |
| 血液           | 白血球減少、白血球増加、好酸球増多、貧血               | 赤血球減少、好中球増多、リンパ球減少                    |                                                        |
| 肝臓           | AST、ALT、Al-P、 $\gamma$ -GTP、LDHの上昇 | 総ビリルビンの上昇                             |                                                        |
| 循環器          | 血圧上昇                               | 動悸                                    |                                                        |
| 消化器          | 便秘、下痢、腹部膨満感、嘔気、口内炎                 | 腹痛、苦味、カンジダ症、胃もたれ、口渇、食欲不振、鼓腸           | 舌炎、嘔吐、顕微鏡的大腸炎(collagenous colitis、lymphocytic colitis) |
| 精神神経系        | 頭痛                                 | めまい、ふらつき、眠気、四肢脱力、知覚鈍麻、握力低下、口のもつれ、失見当識 | せん妄、昏睡                                                 |
| その他          | 総コレステロール・中性脂肪・BUNの上昇、蛋白尿、血中TSH増加   | かすみ目、浮腫、倦怠感、発熱、脱毛症、しびれ感、CKの上昇         | 目のちらつき、関節痛、筋肉痛、高アンモニア血症、低マグネシウム血症、女性化乳房                |

注) 発現頻度は製造販売後調査を含む。

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

#### ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg「サワイ」

##### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

##### 〈ヘリコバクター・ピロリの除菌の補助〉

##### 12.1 ヘリコバクター・ピロリの除菌判定上の注意

ラベプラゾールナトリウム等のプロトンポンプインヒビターやアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン等の抗生物質及びメトロニダゾールの服用中や投与終了直後では、 $^{13}\text{C}$ -尿素呼気試験の判定が偽陰性になる可能性があるため、 $^{13}\text{C}$ -尿素呼気試験による除菌判定を行う場合は、これらの薬剤の投与終了後4週以降の時点で実施することが望ましい。

### 10. 過量投与

設定されていない

### 11. 適用上の注意

##### 14. 適用上の注意

##### 14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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。

14.1.2 本剤は腸溶錠であり、服用にあたっては、嚥んだり、砕いたりせずに、のみくだすよう注意すること。

### 12. その他の注意

#### 1) 臨床使用に基づく情報

##### 15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 本剤の長期投与中に良性の胃ポリープを認めたとの報告がある。

15.1.2 海外における複数の観察研究で、プロトンポンプインヒビターによる治療において骨粗鬆症に伴う股関節骨折、手関節骨折、脊椎骨折のリスク増加が報告されている。特に、高用量及び長期間(1年以上)の治療を受けた患者で、骨折のリスクが増加した。

15.1.3 海外における主に入院患者を対象とした複数の観察研究で、プロトンポンプインヒビターを投与した患者においてクロストリジウム・ディフィシルによる胃腸感染のリスク増加が報告されている。

#### 2) 非臨床試験に基づく情報

#### ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg「サワイ」

##### 15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 ラットに5mg/kg以上を2年間経口投与した毒性試験において、雌で胃にカルチノイドの発生がみられたとの報告がある。

15.2.2 動物実験(ラット経口投与25mg/kg以上)で甲状腺重量及び血中サイロキシンの増加が報告されているので、使用にあたっては甲状腺機能に注意する。

15.2.3 ラットに類薬であるランソプラゾール(50mg/kg/日)、アモキシシリン水和物(500mg/kg/日)及びクラリスロマイシン(160mg/kg/日)を併用投与した試験で、母動物での毒性の増強とともに胎児の発育抑制の増強が認められている。

#### ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

##### 15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 ラットに5mg/kg以上を2年間経口投与した毒性試験において、雌で胃にカルチノイドの発生がみられたとの報告がある。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

15.2.2 動物実験(ラット経口投与25mg/kg以上)で甲状腺重量及び血中サイロキシンの増加が報告されているので、使用にあたっては甲状腺機能に注意する。

---

## 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」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  
VIII. -12. -2) 参照



## X. 管理的事項に関する項目

## 1. 規制区分

|      | 規制区分  |
|------|-------|
| 製剤   | 該当しない |
| 有効成分 | 該当しない |

## 2. 有効期間

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

## ●ラベプラゾールNa錠5mg/錠10mg「サワイ」

## 20. 取扱い上の注意

20.1 PTP包装はアルミ袋開封後、バラ包装は開栓後、湿気を避けて保存すること。

## ●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

## 20. 取扱い上の注意

20.1 アルミ袋開封後は湿気を避けて保存すること。

## 5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資料

XIII. -2. 参照

## 6. 同一成分・同効薬

同一成分：パリエット錠5mg/錠10mg/錠20mg

同効薬：プロトンポンプ阻害作用

オメプラゾール、ランソプラゾール、エソメプラゾールマグネシウム水和物、ボノプラザンフマル酸塩<sup>38)</sup>

## 7. 国際誕生年月日

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日……………

| 製品名                     | 製造販売承認<br>年月日 | 承認番号             | 薬価基準収載<br>年月日 | 販売開始<br>年月日 |
|-------------------------|---------------|------------------|---------------|-------------|
| ラベプラゾールNa錠<br>5mg「サワイ」  | 2020年2月17日    | 30200AMX00200000 | 2020年6月19日    | 2020年6月19日  |
| ラベプラゾールNa錠<br>10mg「サワイ」 | 2010年7月15日    | 22200AMX00564000 | 2010年11月19日   | 2010年11月19日 |
| ラベプラゾールNa錠<br>20mg「サワイ」 | 2010年7月15日    | 22200AMX00802000 | 2010年11月19日   | 2010年11月19日 |

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内容……………

●ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」

- ・承認年月日：2010年11月15日  
効能又は効果内容：「非びらん性胃食道逆流症」の効能又は効果を追加した。  
用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。
- ・承認年月日：2011年4月5日  
用法及び用量内容：プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な逆流性食道炎に対する用法及び用量を追加した。
- ・承認年月日：2012年11月19日  
効能又は効果内容：「胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃MALTリンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能又は効果を追加した。  
用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。
- ・承認年月日：2013年6月17日  
効能又は効果内容：「ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎におけるヘリコバクター・ピロリの除菌の補助」の効能又は効果を追加した。
- ・承認年月日：2017年12月13日  
用法及び用量内容：プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な逆流性食道炎の維持療法に対する用法及び用量を追加した。
- ・承認年月日：2020年6月24日  
効能又は効果内容：「低用量アスピリン投与時における胃潰瘍又は十二指腸潰瘍の再発抑制」の効能又は効果を追加した。  
用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。

●ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」

- ・承認年月日：2011年4月5日  
用法及び用量内容：プロトンポンプインヒビターによる治療で効果不十分な逆流性食道炎に対する用法及び用量を追加した。

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 .....

V. -2. 参照

## 13. 各種コード .....

| 製品名                     | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | 個別医薬品コード<br>(YJコード) | HOT番号     | レセプト電算処理<br>システム用コード |
|-------------------------|-----------------------|---------------------|-----------|----------------------|
| ラベプラゾールNa錠<br>5mg「サワイ」  | 2329028F3077          | 2329028F3077        | 128139201 | 622813901            |
| ラベプラゾールNa錠<br>10mg「サワイ」 | 2329028F1104          | 2329028F1104        | 120112301 | 622011201            |
| ラベプラゾールNa錠<br>20mg「サワイ」 | 2329028F2100          | 2329028F2100        | 120113001 | 622011301            |

## 14. 保険給付上の注意 .....

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## X I . 文 献

1. 引用文献……………
- 1) 第十八改正日本薬局方解説書，廣川書店，2021；C-5995-6001
- 2) 藤崎秀明他：日本薬理学雑誌，1993；102(6)：389-397
- 3) 医療用医薬品最新品質情報集(ブルーブック) <<https://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>> (2025/4/1 アクセス)
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」
- 13) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」
- 14) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」
- 15) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」
- 16) 中澤三郎他：Modern Physician, 1994；14(S.)：38-68
- 17) 本村明他：Modern Physician, 1994；14(S.)：23-37
- 18) 篠村恭久他：Modern Physician, 1994；14(S.)：69-84
- 19) 八尾恒良他：Modern Physician, 1994；14(S.)：85-99
- 20) 中澤三郎他：Modern Physician, 1994；14(S.)：1-22
- 21) 中川充文他：Modern Physician, 1994；14(S.)：100-107
- 22) 吉田豊他：Modern Physician, 1994；14(S.)：108-115
- 23) 中野哲他：Modern Physician, 1994；14(S.)：116-123
- 24) 谷内昭他：Modern Physician, 1994；14(S.)：124-136
- 25) 吉田豊他：Modern Physician, 1994；14(S.)：137-147
- 26) 一般臨床試験及び二重盲検比較試験①(パリエット錠：2003年7月17日承認、申請資料概要ト.1.(5)-II.3))
- 27) Kinoshita, Y. et al. : Am. J. Gastroenterol., 2012；107(4)：522-530
- 28) Kinoshita, Y. et al. : Gastroenterol., 2018；53(7)：834-844
- 29) 一般臨床試験及び二重盲検比較試験②(パリエット錠：2017年9月22日承認、審査報告書)
- 30) Kinoshita, Y. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 2011；33(2)：213-224
- 31) Iwakiri, R. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 2014；40(7)：780-795
- 32) 二重盲検比較試験①(パリエット錠：2014年12月26日承認、申請資料概要2.7.6.2)
- 33) 二重盲検比較試験②(パリエット錠：2014年12月26日承認、申請資料概要2.7.6.3)
- 34) Kuwayama, H. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 2007；25(9)：1105-1113

- 35)国内臨床試験①(パリエット錠：2007年1月26日承認、申請資料概要2.7.6.3)
- 36)国内臨床試験②(パリエット錠：2007年1月26日承認、申請資料概要2.7.3.3)
- 37)Isomoto, H. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 2003 ; 18(1) : 101-107
- 38)薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>  
(2025/4/1 アクセス)
- 39)作用機序①(パリエット錠：2007年1月26日承認、申請資料概要2.6.2.6)
- 40)作用機序②(パリエット錠：2007年8月23日承認、審査報告書)
- 41)岩崎有良他：薬理と治療, 1999 ; 27(4) : 705-712
- 42)井上正規他：内科宝函, 1994 ; 41(7) : 143-150
- 43)Fujisaki, H. et al. : Biochem. Pharmacol., 1991 ; 42(2) : 321-328
- 44)Fujisaki, H. et al. : Drug Invest., 1991 ; 3(5) : 328-332
- 45)村上学他：G. I. Research, 1993 ; 1(5) : 493-496
- 46)河合隆他：G. I. Research, 1993 ; 1(3) : 274-280
- 47)日本人健康成人男性を対象としたE3810の臨床薬理試験(パリエット錠：2014年12月26日承認、申請資料概要2.7.6.1)
- 48)Morii, M. et al. : Biochem. Pharmacol., 1990 ; 39(4) : 661-667
- 49)村上学他：G. I. Research, 1993 ; 1(5) : 497-500
- 50)抗潰瘍作用(パリエット錠：2014年12月26日承認、申請資料概要2.6.2.2)
- 51)除菌効果(パリエット錠：2007年1月26日承認、申請資料概要2.6.2.2)
- 52)Yasuda, S. et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther., 1994 ; 32(9) : 466-473
- 53)3剤併用投与(パリエット錠：2007年1月26日承認、申請資料概要2.7.6.1)
- 54)渡辺紘他：新薬と臨床, 2020 ; 69(5) : 605-615
- 55)沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ラベプラゾールNa錠5mg「サワイ」
- 56)辻哲朗他：診療と新薬, 2010 ; 47(9) : 839-847
- 57)沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ラベプラゾールNa錠10mg「サワイ」
- 58)沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ラベプラゾールNa錠20mg「サワイ」
- 59)Ishizaki, T. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 1999 ; 13(Suppl. 3) : 27-36
- 60)Ishizaki, T. et al. : Clin. Pharmacol. Ther., 1995 ; 58(2) : 155-164
- 61)Yasuda, S. et al. : Clin. Pharmacol. Ther., 1995 ; 58(2) : 143-154

## 2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
2. 海外における臨床支援情報.....  
    該当資料なし

## 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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### 1) 粉砕

##### ＜粉砕後の安定性試験＞

ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg/錠20mg「サワイ」は、粉砕すると放出制御（腸溶性）の特性が失われるため、粉砕不可である。

#### 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

##### ＜崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験＞

###### 【製剤上の注意】

ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg/錠20mg「サワイ」は腸溶性フィルムコーティング錠である。崩壊懸濁、あるいは粉砕による経管投与法を用いる場合は、本剤の放出制御の特性が失われる。

上記の理由から、本剤において崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験データを取得しておりません。

### 2. その他の関連資料

#### 患者向け資料

##### ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg/錠20mg「サワイ」

・最近、こんな症状が…逆流性食道炎

##### ●ラベプラゾールNa錠 5mg/錠10mg「サワイ」

・ヘリコバクター・ピロリ除菌療法を受けられる患者さんへ

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

