

胃炎・胃潰瘍治療剤
 ※ 日本薬局方 テプレノンカプセル

※※ テプレノンカプセル50mg「ツルハラ」
 Teprenone Capsules 50mg 「TSURUHARA」

※※ テプレノン細粒10%「ツルハラ」
 Teprenone Fine Granules 10% 「TSURUHARA」

	カプセル 50mg	細粒 10%
承認番号	30100AMX 00403000	30200AMX 00003000
薬価収載	2020年6月	2020年6月
販売開始	1998年7月	
効能追加	2007年2月	

貯法	気密容器、室温保存
使用期限	外箱、容器に表示
注意	取扱以上の注意参照

【組成・性状】

組成

テプレノンカプセル 50mg「ツルハラ」は1カプセル中テプレノン 50mg および添加物として含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、トコフェロール、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、トウモロコシデンプン、タルクを、また、同じく添加物としてカプセル本体中に黄色5号、青色1号、ラウリル硫酸ナトリウム、酸化チタン、ゼラチンを含有する。

テプレノン細粒10%「ツルハラ」は1g中テプレノン 100mg および添加物としてトコフェロール、乳糖水和物、軽質無水ケイ酸、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

製剤の性状

テプレノンカプセル 50mg「ツルハラ」は頭部灰青緑色不透明、胴部橙色不透明の質量約 140mg、4号硬カプセル剤で内容物は白色～帯黄白色の粉末である。

テプレノン細粒10%「ツルハラ」は白色～帯黄白色の細粒である。本品は1包の内容容量 0.5g の分包もある。

【効能・効果】

- ・下記疾患の胃粘膜病変（びらん、出血、発赤、浮腫）の改善
 急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期
- ・胃潰瘍

【用法・用量】

テプレノンカプセル 50mg「ツルハラ」

通常成人、3カプセル（テプレノンとして150mg）を1日3回に分けて食後に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

テプレノン細粒 10%「ツルハラ」

通常成人、細粒 1.5g（テプレノンとして150mg）を1日3回に分けて食後に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

(1) 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用（頻度不明）

肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP、Al-Pの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、異常が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
消化器	便秘、下痢、嘔気、口渇、腹痛、腹部膨満感
肝臓	AST(GOT)の上昇、ALT(GPT)の上昇
精神神経系	頭痛
過敏症 ^{注)}	発疹、痒痒感
その他	総コレステロールの上昇、眼瞼の発赤・熱感、血小板減少

注)：このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

(2) 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

(3) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

(4) 小児等への投与

小児に対する安全性は確立していない。（使用経験が少ない）

(5) 適用上の注意

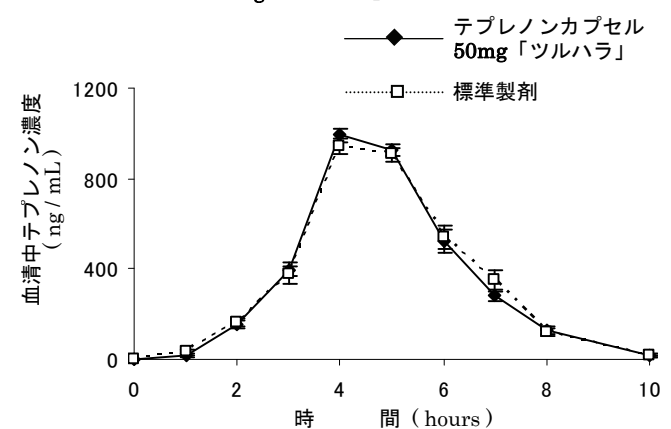
薬剤交付時（カプセル）：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

【薬物動態】

(1) 生物学的同等性試験

テプレノンカプセル50mg「ツルハラ」¹⁾、テプレノン細粒10%「ツルハラ」²⁾あるいはそれぞれの標準製剤をクロスオーバー法により、テプレノンとして150mg*（カプセル：3カプセル、細粒：1.5g）を健康成人男子に食後単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～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。（*1回150mg投与は承認外用量）

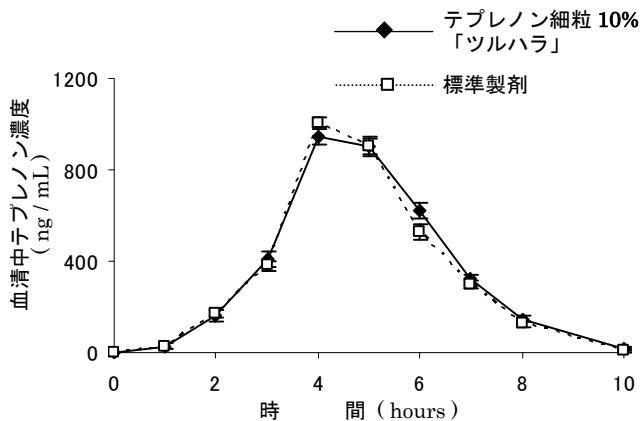
テプレノンカプセル50mg「ツルハラ」



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₀ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
テプレノンカプセル 50mg「ツルハラ」	3496 ± 101	1023 ± 23	4.3 ± 0.1	1.1 ± 0.1
標準製剤 (カプセル、50mg)	3501 ± 147	1008 ± 16	4.3 ± 0.1	1.0 ± 0.1

(Mean ± S.E., n=12)

テプレノン細粒10%「ツルハラ」



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₀ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
テプレノン細粒10% 「ツルハラ」	3618±87	1013±24	4.3±0.1	1.0±0.1
標準製剤 (細粒、10%)	3509±64	1038±20	4.3±0.1	1.0±0.1

(Mean±S.E., n=12)

血中濃度並びに AUC、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。

※(2) 溶出挙動

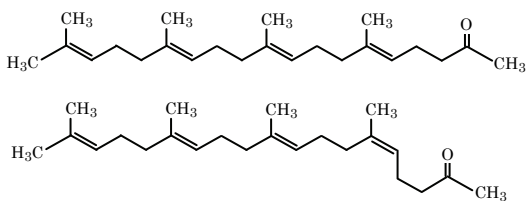
テプレノンカプセル 50mg「ツルハラ」³⁾ は日本薬局方医薬品各条に定められたテプレノンカプセルの溶出規格に適合していることが確認されている。また、テプレノン細粒10%「ツルハラ」⁴⁾ は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたテプレノン細粒の溶出規格に適合していることが確認されている。

※※【薬効薬理】

テプレノンは防御因子増強型抗潰瘍薬で、胃粘液の合成及び分泌を促進することにより、胃粘膜を保護し、胃粘膜組織を修復する。プロスタグランジン E₂、I₂ の産生増加など様々な作用が示されており、これらが総合して奏功すると考えられている⁵⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：テプレノン(Teprenone)

化学名：(5*E*, 9*E*, 13*E*)-6,10,14,18-Tetramethylnonadeca-5,9,13,17-tetraen-2-one

(5*Z*, 9*E*, 13*E*)-6,10,14,18-Tetramethylnonadeca-5,9,13,17-tetraen-2-one

本品はモノシス体及びオールトランス体からなり、その比は約2：3である。

分子式：C₂₃H₃₈O

分子量：330.55

性状：テプレノンは無色～微黄色澄明な油状の液で、わずかに特異なにおいがある。

本品はエタノール(99.5)、酢酸エチル又はヘキサンと混和する。

本品は水にほとんど溶けない。

本品は空気によって酸化され、徐々に黄色となる。

【取扱い上の注意】

調剤上の留意事項

細粒剤は、合成ケイ酸アルミニウムとの配合により、次第に黄変し、含量が低下するので配合剤とせず、組み合わせ剤とすること。

安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、テプレノンカプセル 50mg「ツルハラ」⁶⁾・テプレノン細粒10%「ツルハラ」⁷⁾ は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

【包装】

テプレノンカプセル50mg「ツルハラ」

100 カプセル(PTP)、1200 カプセル(PTP)

テプレノン細粒10%「ツルハラ」

100g、1000g、0.5g (1包) ×1500包

【主要文献】

1) 鶴原製薬株式会社 社内資料

2) 鶴原製薬株式会社 社内資料

3) 鶴原製薬株式会社 社内資料

4) 鶴原製薬株式会社 社内資料

※※5) 第十七改正日本薬局方解説書(広川書店) C-3261(2016)

6) 鶴原製薬株式会社 社内資料

7) 鶴原製薬株式会社 社内資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料についても下記へご請求ください。

鶴原製薬株式会社 医薬情報部

〒563-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

TEL: 072-761-1456 (代表) FAX: 072-760-5252



製造販売元
鶴原製薬株式会社

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

(D10)
(D11)-15 15-2004
A004-S