

※※印：2012年4月改訂(第10版、社名変更等に伴う改訂)  
 ※印：2010年8月改訂

日本標準商品分類番号
873999

貯 法：しゃ光・室温保存  
 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。  
 取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照  
 規制区分：処方せん医薬品  
 (注意－医師等の処方せんにより使用すること)

	細粒40%「タイヨー」	錠200mg「タイヨー」
承認番号	21900AMX01003000	21900AMX01004000
薬価収載	2008年 6月	2007年12月
販売開始	1997年 7月	1996年 7月
再評価結果 (品質再評価)	2003年11月	2002年 3月

骨粗鬆症治療剤

# イプリフラボン細粒40%「タイヨー」

イプリフラボン細粒

※日本薬局方

# イプリフラボン錠

# イプリフラボン錠200mg「タイヨー」



IPRIFLAVONE

### 【組成・性状】

#### ●イプリフラボン細粒40%「タイヨー」

組成	1g中：イプリフラボン……………400mg (添加物) 含水二酸化ケイ素、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール
性状	においはなく、味はわずかに甘い、白色～帯黄白色の細粒剤

#### ●イプリフラボン錠200mg「タイヨー」

組成	1錠中：イプリフラボン……………200mg (添加物) ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、部分アルファー化デンプン		
性状	白色～帯黄白色の素錠		
識別コード (PTP)	IF 200mg		
外形 (サイズ)	表(直径mm)  8.5	裏(重量mg)  270	断面(厚さmm)  5.0

### 【効能・効果】

骨粗鬆症における骨量減少の改善

### 【用法・用量】

- イプリフラボン細粒40%「タイヨー」  
通常、成人には1回0.5g(イプリフラボンとして200mg)を1日3回食後経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
- イプリフラボン錠200mg「タイヨー」  
通常、成人には1回1錠(イプリフラボンとして200mg)を1日3回食後経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

### 【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)  
消化性潰瘍又はその既往歴のある患者〔消化性潰瘍、胃腸出血等が発現又は悪化する可能性がある〕
- 重要な基本的注意
  - 本剤は骨粗鬆症における骨量減少の改善剤であり、その適用にあたっては、厚生省「老人性骨粗鬆症の予防及び治療に関する総合的研究班」の診断基準(骨量減少の有無、骨折の有無、腰痛の有無などの総合による)等を参考に、骨粗鬆症との診断が確立した患者を対象とすること。なお、必要に応じ腰痛に対する適切な治療を併用すること。
  - 本剤は高齢者に長期にわたって投与されることが多い薬剤であるので、投与中は患者の状態を十分観察し、消化器症状等の副作用があらわれた場合には適切な処置を行うこと。

### 3 相互作用

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
エストロゲン製剤	卵巣摘出動物にエストロンと本剤を併用投与した場合、エストロンのエストロゲン作用が増加するとの報告がある。	
テオフィリン	テオフィリンの血中濃度が上昇するとの報告があるので、テオフィリンを減量するなど慎重に投与すること。	本剤がテオフィリンの代謝を阻害することが考えられている。
クマリン系抗凝血剤 ワルファリン等	クマリン系抗凝血剤の作用が増強するとの報告があるので、クマリン系抗凝血剤を減量するなど慎重に投与すること。	本剤によりクマリン系抗凝血剤が血漿蛋白から遊離することが考えられている。

### 4 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。

- 重大な副作用(頻度不明)
  - 消化性潰瘍、胃腸出血等が発現又は悪化させることがあるので、このような症状がみられた場合には本剤の投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、消化性潰瘍又はその既往歴のある患者には慎重に投与すること。
  - 黄疸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。
- その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹、痒痒
消化器	悪心・嘔吐、食欲不振、胃部不快感、胸やけ、胃痛、腹痛、腹部膨満感、下痢、便秘、口内炎、口渇、舌炎、味覚異常
精神神経系	めまい、ふらつき、頭痛
血液	貧血、顆粒球減少
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、LDH、γ-GTPの上昇
腎臓	BUN、クレアチニンの上昇
その他	倦怠感、浮腫、女性化乳房 <sup>注)</sup> 、舌・口唇のしびれ

注) このような場合には投与を中止すること。

- 高齢者への投与  
高齢者には慎重に投与すること。(「重要な基本的注意」の項参照)
- 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まわ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〕
  - 授乳中の婦人には慎重に投与すること。〔動物試験(ラット)で母乳中へ移行することが報告されている〕



## 7 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

## 8 適用上の注意

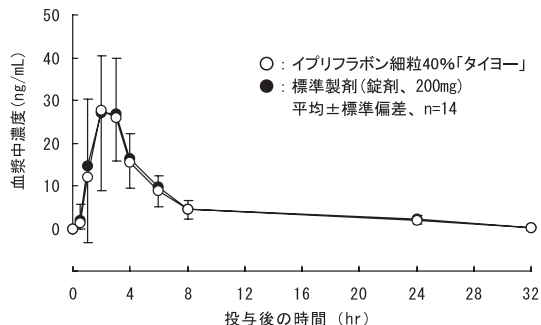
薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

### 【薬物動態】

#### 1 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

##### ●イプリフラボン細粒40%「タイヨー」

イプリフラボン細粒40%「タイヨー」0.5gと標準製剤1錠(イプリフラボンとしていずれも200mg)を、クロスオーバー法により健康成人男子に食後単回経口投与して血漿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)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=14)

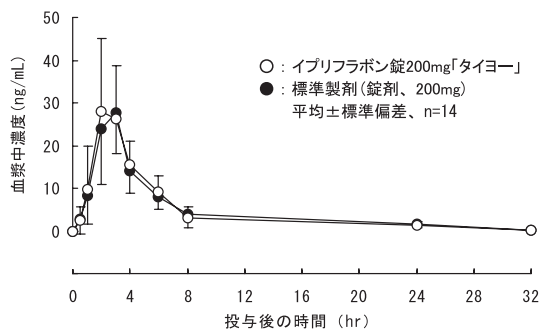
	投与量* (mg)	AUC <sub>0-32</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
イプリフラボン細粒40% 「タイヨー」	200	168.8±36.9	31.6±12.0	2.4±0.8	13.4±14.1
標準製剤(錠剤、200mg)	200	177.2±49.7	32.6±12.6	2.4±0.8	13.2±11.4

\*イプリフラボンとしての投与量

血漿中濃度並びに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。

##### ●イプリフラボン錠200mg「タイヨー」

イプリフラボン錠200mg「タイヨー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(イプリフラボンとして200mg)健康成人男子に食後単回経口投与して血漿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)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=14)

	投与量 (mg)	AUC <sub>0-32</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
イプリフラボン錠200mg 「タイヨー」	200	145.9±27.9	36.8±8.7	2.4±0.5	20.5±44.0
標準製剤(錠剤、200mg)	200	150.7±25.5	36.3±6.5	2.5±0.5	14.3±21.6

血漿中濃度並びに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 溶出性<sup>2)</sup>

本剤の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

### 【臨床成績】<sup>3)</sup>

#### 1 臨床効果

骨粗鬆症51例を対象に国内6施設でイプリフラボン細粒40%「タイヨー」の臨床試験を実施した。その結果、投与24週後における有効性評価症例42例に対する全般改善度は「中等度改善」以上73.8%(31/42例)、「軽度改善」以上85.7%(36/42例)であった。

#### 2 副作用及び臨床検査値の変動

安全性検討症例46例のうち、副作用が報告されたのは8例(17.4%)10件であり、その内訳は胃部不快感、胃痛、便秘が各2件、心窩部痛、胸やけ、顔面・体幹の掻痒感、発疹が各1件であった。

また、臨床検査は27例に実施されたが、本剤に起因すると考えられる臨床検査値の異常変動は認められなかった。

### ※【薬効薬理】<sup>4)</sup>

イプリフラボンは、骨に直接作用して骨吸収を抑制すると共に、エストロゲンのカルシトニン分泌促進作用を増強して骨吸収を抑制することにより、骨粗鬆症における疼痛を軽減し、骨量の減少を抑制する。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：イプリフラボン(Ipriflavone)

※化学名：7-(1-methylethyl)oxy-3-phenyl-4H-chromen-4-one

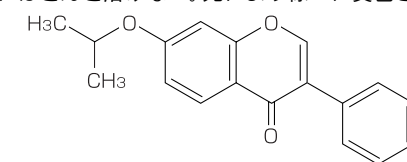
分子式：C<sub>18</sub>H<sub>16</sub>O<sub>3</sub>

分子量：280.32

融点：116~119℃

※性状：イプリフラボンは白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。アセトニトリルにやや溶けやすく、メタノール又はエタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。光により徐々に黄色となる。

構造式：



### 【取扱い上の注意】<sup>5)</sup>

安定性試験結果の概要

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、イプリフラボン細粒40%「タイヨー」及びイプリフラボン錠200mg「タイヨー」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】

●イプリフラボン細粒40%「タイヨー」

バラ包装：500g

●イプリフラボン錠200mg「タイヨー」

PTP包装：100錠(10錠×10)、1,200錠(10錠×120)

### 【主要文献】

- 1) テバ製薬(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) テバ製薬(株)社内資料(溶出試験)
- 3) 糸満等：診療と新薬，32(10)，1787，1995
- ※、※※4) 第十六改正日本薬局方解説書
- 5) テバ製薬(株)社内資料(安定性試験)

### ※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

テバ製薬株式会社 DIセンター

〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

TEL 0120-923-093 FAX 052-459-2853

受付時間 9:00~17:00(土・日・祝日を除く)

※※製造販売元

テバ製薬株式会社

名古屋市中村区太閤一丁目24番11号