

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

日本標準商品分類番号
872329

貯法：室温・気密容器保存
 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

	細粒0.8%	錠2	錠4
承認番号	22000AMX 00549000	(08AM)0656	(08AM)0658
薬価収載	2008年 6月	1996年 7月	1996年 7月
販売開始	1996年 8月	1996年 7月	1996年 7月
再評価結果 (品質再評価)	2000年12月	2000年12月	2000年12月

粘膜防御性胃炎・胃潰瘍治療剤

※日本薬局方

イルソグラジンマレイン酸塩細粒 セレガスロン® 細粒0.8%

※日本薬局方

イルソグラジンマレイン酸塩錠 セレガスロン® 錠2 セレガスロン® 錠4







CEREGASRON

※※【組成・性状】

●セレガスロン細粒0.8%

組成	1g中：イルソグラジンマレイン酸塩……8mg (添加物) エチルセルロース、含水二酸化ケイ素、 クロスポビドン、乳糖水和物、ヒドロキ シプロピルセルロース
性状	においはなく、味はやや甘い白色の細粒剤

●セレガスロン錠2・錠4

	セレガスロン錠2	セレガスロン錠4	
組成	1錠中： イルソグラジンマレ イン酸塩………2mg (添加物) クロスポビドン、結晶セルロース、ステア リン酸マグネシウム、デンプン、グリコール 酸ナトリウム、トウモロコシデンプン、乳 糖水合物、ヒドロキシプロピルセルロース	1錠中： イルソグラジンマレ イン酸塩………4mg	
性状	白色の素錠	白色の片面1/2割線入 り素錠	
識別コード (PTP)	t IM 2	t IM 4mg	
外形(サイズ)	表 (直径mm)	 7.0	 8.0
	裏 (重量mg)	 125	 200
	断面 (厚さmm)	 2.5	 3.2

【効能・効果】

胃潰瘍

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

【用法・用量】

通常、成人イルソグラジンマレイン酸塩として1日4mgを1～
 2回に分割経口投与する。
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査
 を実施していない。

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器		便秘、下痢、嘔 気・嘔吐	
肝臓	AST(GOT)、ALT (GPT)、Al-P、 LDHの上昇		γ-GTP、ビリル ビン等の上昇
皮膚 ^{注)}		発疹、痒痒感	発赤、湿疹、多 形滲出性紅斑、 浮腫性紅斑
その他		胸部圧迫感	発熱

注) 投与を中止すること。

2 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、低用量(例
 えば2mg/日)から投与を開始するなど、患者の状態を観察し
 ながら慎重に投与すること。

3 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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

4 小児等への投与

小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

5 適用上の注意

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

6 その他の注意

健康人における本薬の血漿中からの消失半減期は約150時
 間である。

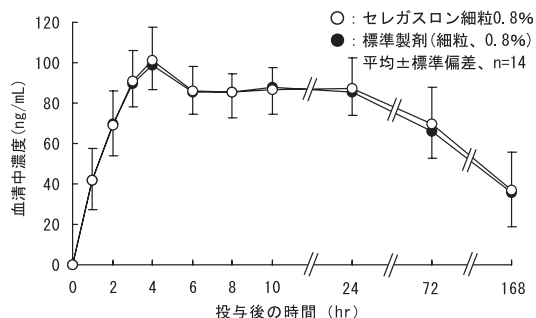
【薬物動態】

1 生物学的同等性試験¹⁾

●セレガスロン細粒0.8%

セレガスロン細粒0.8%と標準製剤を、クロスオーバー法
 によりそれぞれ0.5g(イルソグラジンマレイン酸塩として
 4mg)健康成人男子に絶食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)

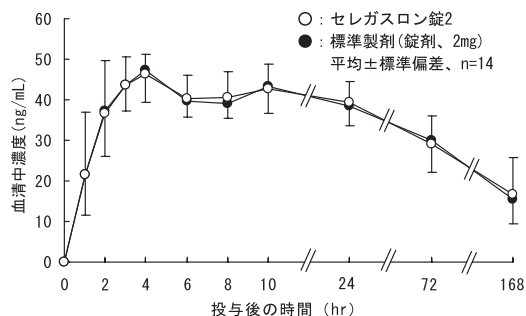
	投与量* (mg)	AUC ₀₋₁₆₈ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
セレガスロン細粒0.8%	4	10883.8±2727.1	101.5±16.9	3.7±0.5	125.2±64.4
標準製剤 (細粒, 0.8%)	4	10529.5±2174.1	100.0±10.9	5.9±5.5	128.8±60.3

*イルソグラジンマレイン酸塩としての投与量

血清中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

●セレガスロン錠2

セレガスロン錠2と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(イルソグラジンマレイン酸塩として2mg)健康成人男子に絶食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、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



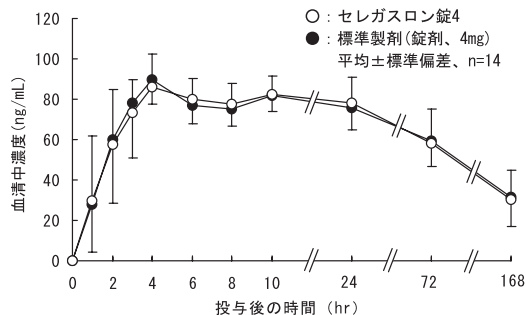
薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₁₆₈ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
セレガスロン錠2	2	4797.1±1104.5	48.5±6.3	3.8±1.4	157.9±152.4
標準製剤 (錠剤, 2mg)	2	4769.4±876.6	48.6±4.3	4.5±2.4	113.8±42.8

血清中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

●セレガスロン錠4

セレガスロン錠4と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(イルソグラジンマレイン酸塩として4mg)健康成人男子に絶食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、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



※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

薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=14)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₁₆₈ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
セレガスロン錠4	4	9331.5±1795.8	91.1±8.7	7.5±7.4	111.8±36.8
標準製剤 (錠剤, 4mg)	4	9385.6±2129.6	91.0±11.7	6.6±5.6	121.2±61.3

血清中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

※2 溶出性²⁾

本剤の溶出性は、日本薬局方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。

※【薬効薬理】³⁾

イルソグラジンマレイン酸塩は、胃粘膜防御因子増強薬に分類される抗潰瘍剤である。胃粘膜内cAMP含量を増加させて細胞間コミュニケーションを活性化することにより胃粘膜細胞の統合性を高め、細胞防御機能を亢進すると考えられる。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：イルソグラジンマレイン酸塩(Irsogladine maleate)

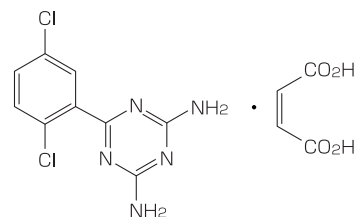
※化学名：6-(2,5-dichlorophenyl)-1,3,5-triazine-2,4-diamine monomaleate

分子式：C₉H₇Cl₂N₅·C₄H₄O₄

分子量：372.16

※性状：イルソグラジンマレイン酸塩は白色の結晶又は結晶性の粉末で、味はやや苦い。酢酸(100)又はエチレングリコールにやや溶けにくく、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

※構造式：



【取扱い上の注意】⁴⁾

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、セレガスロン細粒0.8%、セレガスロン錠2及びセレガスロン錠4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】

- セレガスロン細粒0.8%
分 包：0.25g×1,200包、0.5g×600包
バラ包装：100g、500g
- セレガスロン錠2
PTP包装：100錠(10錠×10)、1,200錠(10錠×120)
バラ包装：1,200錠
- セレガスロン錠4
PTP包装：100錠(10錠×10)、600錠(10錠×60)

【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) 第十六改正日本薬局方解説書
- 4) 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)