

# レベチラセタム製剤

普通錠										DS					
会社名	商品名/屋号	添加物	規格 (mg)	大きさ			包装(錠)			写真	会社名	商品名/屋号	添加物	包装	写真
				長さ (mm)	幅 (mm)	高さ (mm)	100	500	バラ						
ユージービー ジャパン	イーケブラ 【製造販売元】 ユージービー ジャパン	先発品 クロスカルボキシナトリウム、マクロール 60000P、軽質無水クイ酸、スチアリン酸 マリン、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール 4000、9gク、青色2号アルミニウムレーキ (250mgのみ)、黄色三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.6	○	○	500		ユージービー ジャパン	イーケブラ ドラシロップ50% 【製造販売元】 ユージービー ジャパン	先発品 D-マンニトール、ネビドン、ア スハルテム(L-フェニルアラニ ン化合物)、軽質無水クイ 酸、香料	100g、500g (バラ)	
			500	16.4	7.7	5.8	○	○	500						
高田製薬	「効効」 【製造販売元】 高田製薬	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、9gク、青 色2号アルミニウムレーキ(250mgの み)、カルナハワロ、黄色三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.6	5.9	4.8	○	-	-		高田製薬	「効効」 【製造販売元】 高田製薬	D-マンニトール、ネビドン、ア スハルテム(L-フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 精製水酸化ナトリウム抽出物、 軽質無水クイ酸、香料	100g(バラ)	
			500	16.5	7.7	5.7	○	-	-						
沢井製薬	「サワイ」 【製造販売元】 沢井製薬	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.6	○	○	200		沢井製薬	「サワイ」 【製造販売元】 沢井製薬	アスハルテム(L-フェニルアラ ニン化合物)、軽質無水クイ 酸、ネビドン、D-マンニ トール、香料	100g(バラ)	
			500	16.4	7.7	5.8	○	○	200						
Meiji Seika ファルマ	「明治」 【製造販売元】 Meiji Seikaファルマ	共通開発の可能性 ネビドン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、青 色2号アルミニウムレーキ(250mgのみ)、 カルナハワロ、黄色三酸化鉄(500 mgのみ)	250	12.9	6.1	4.7	○	-	300		Meiji Seika ファルマ	「明治」 【製造販売元】 Meiji Seikaファルマ	共通開発の可能性 粉末還元麦芽糖水、ア スハルテム(L-フェニルアラ ニン化合物)、軽質無水クイ 酸、ネビドン、D-マンニ トール、香料	100g(バラ)	
			500	16.5	7.8	5.8	○	-	500						
日新製薬	「日新」 【製造販売元】 日新製薬	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.9	6.1	4.7	○	○	100		日新製薬	「日新」 【製造販売元】 日新製薬	共通開発の可能性 粉末還元麦芽糖水、ア スハルテム(L-フェニルアラ ニン化合物)、軽質無水クイ 酸、ネビドン、D-マンニ トール、香料	100g(バラ)	
			500	16.5	7.8	5.8	○	○	100						
キョーリン リメディオ	「杏林」 【製造販売元】 キョーリンリメディオ 【販売元】 杏林製薬	共通開発の可能性 低置換度ドキシロリン酸、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール 4000、9gク、カルナハワロ、青 色2号アルミニウムレーキ(250mg のみ)、黄色三酸化鉄(500mg のみ)	250	12.8	6.0	4.5	○	-	300		キョーリン リメディオ	「杏林」 【製造販売元】 キョーリンリメディオ 【販売元】 杏林製薬	D-マンニトール、ネビドン、ア スハルテム(L-フェニルアラ ニン化合物)、軽質無水クイ 酸、香料、アセトアミンK、 デキストリン	100g(バラ)	
			500	16.5	7.7	5.6	○	-	300						
三和化学	「トーワ」 【製造販売元】 東和薬品 【販売元】 三和化学	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.6	○	-	300		三和化学	「トーワ」 【製造販売元】 東和薬品 【販売元】 三和化学	共通開発の可能性 D-マンニトール、ネビドン、 軽質無水クイ酸、アスハル テム(L-フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 香料	100g(バラ)	
			500	16.4	7.7	5.8	○	-	300						
共創未来 ファーマ	「トーワ」 【製造販売元】 東和薬品 【販売元】 共創未来ファーマ	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.6	○	-	300		共創未来 ファーマ	「トーワ」 【製造販売元】 東和薬品 【販売元】 共創未来ファーマ	共通開発の可能性 D-マンニトール、ネビドン、 軽質無水クイ酸、アスハル テム(L-フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 香料	100g(バラ) 1g × 100包	
			500	16.4	7.7	5.8	○	-	300						
東和薬品	「トーワ」 【製造販売元】 東和薬品	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.6	○	○	300		東和薬品	「トーワ」 【製造販売元】 東和薬品	共通開発の可能性 D-マンニトール、ネビドン、 軽質無水クイ酸、アスハル テム(L-フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 香料	100g(バラ) 1g × 100包	
			500	16.4	7.7	5.8	○	○	300						
日本 ジェネリック	「JG」 【製造販売元】 日本ジェネリック	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、カルナハワロ、 黄色三酸化鉄(500mgのみ)	250	12.9	6.1	4.7	○	○	200		日本 ジェネリック	「JG」 【製造販売元】 日本ジェネリック	共通開発の可能性 D-マンニトール、ドキシロ リン酸、アスハルテム(L- フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 香料	100g(バラ)	
			500	16.5	7.8	6.0	○	○	200						
										陽進堂	「YD」 【製造販売元】 陽進堂	共通開発	100g(バラ)		
日医工	「日医工」 【製造販売元】 日医工	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、黄色三酸化鉄 (500mgのみ)、カルナハワロ	250	12.9	6.1	4.6	○	○	200		日医工	「日医工」 【製造販売元】 日医工	D-マンニトール、ドキシロ リン酸、アスハルテム(L- フェニルアラニ ン化合物)、軽質無水クイ 酸、香料	100g(バラ)	
			500	16.5	7.8	5.7	○	○	200						
フェルゼン ファーマ	「フェルゼン」 【製造販売元】 フェルゼンファーマ	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、黄色三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.7	○	-	-		フェルゼン ファーマ	「フェルゼン」 【製造販売元】 フェルゼンファーマ	共通開発の可能性 D-マンニトール、ネビドン、 軽質無水クイ酸、アスハル テム(L-フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 香料	100g(バラ)	
			500	16.4	7.6	6.0	○	○	500						
共和薬品	「アムル」 【製造販売元】 共和薬品	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、黄色三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.7	○	○	500		共和薬品	「アムル」 【製造販売元】 共和薬品	共通開発の可能性 D-マンニトール、ネビドン、 軽質無水クイ酸、アスハル テム(L-フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 香料	100g(バラ)	
			500	16.4	7.6	6.0	○	○	500						
ウイアリス製薬	「VTRS」 【製造販売元】 グイト 【販売元】 マイランEPD 【販売提携】 ウイアリス	共通開発の可能性 トランブロン、D-マンニトール、軽 質無水クイ酸、スチアリン酸 Mg、9gク、トキシロリン酸 Na、ホリニルアルコール(部分けん化 物)、酸化チタン、マクロール4000、 マクロール4000、青色2号アルミニウム レーキ(250mgのみ)、黄色三酸化鉄 (500mgのみ)	250	12.8	6.0	4.7	○	-	500		ウイアリス製薬	「VTRS」 【製造販売元】 グイト 【販売元】 マイランEPD 【販売提携】 ウイアリス	共通開発の可能性 D-マンニトール、ネビドン、 軽質無水クイ酸、アスハル テム(L-フェニルアラニ ン化合物)、アセトアミンK、 香料	100g(バラ)	
			500	16.4	7.6	6.0	○	-	500						

※参考・引用: 各社添付文書・インタビューフォーム・web・DI学術

《粒状錠》

○先発品にはない新剤形であり、「沢井」のみ製造。錠剤だと大きく飲み下しにくい。嚥下の向上と苦みのマスキングを図り、粒状錠を発売。  
○水分で錠剤表面がゲル化するコーティング技術を採用。(現在、特許取得中)  
○粒状錠は、錠剤と同一剤形とされており、普通錠と同様に水で飲み下して服用する。  
○直径・厚さが2.1mmと小さく、無味無臭。

錠剤サイズ  
直径: 2.1mm  
厚さ: 2.1mm

※図解のために色(錠剤部: 黄色、フィルムコーティング部: 青色)しています。

# レベチラセタム製剤

## 《原薬レベチラセタムに関して》

### 【外觀・性状】

レベチラセタムは、白色～淡灰白色の結晶性の粉末。

### 【光に対する安定性】

光に対して安定。

### 【味】

わずかに特異なおいがあり、味は苦い。

### 【吸湿性】

室温及び37°C、75%RH(相対湿度)で5週間保存した結果、水分の増加量はそれぞれ0.02%及び0.04%であり、吸湿性を示さなかった。

## 《先発品：イーケブラに関して》

### 【用法・用量】

成人：通常成人にはレベチラセタムとして1日1000mgを1日2回に分けて経口投与。3000mg/日を超えない範囲で適宜増減可。増量は2週間以上の間隔を空けて1日用量として1000mg以下ずつ行う。

小児：通常、4歳以上の小児にはレベチラセタムとして1日20mg/kgを1日2回に分けて経口投与。1日60mg/kgを超えない範囲で適宜増減可。増量は2週間以上の間隔を空けて1日用量として20mg/kg以下ずつ行うこと。ただし、体重50kg以上の小児では、成人と同じ用法・用量を用いること。

### 【適応】

○てんかん患者の部分発作(二次性全般化発作を含む)  
○他の抗てんかん薬で十分な効果が認められていないてんかん患者の強直間代発作に対する抗てんかん薬との併用療法。



### 【承認年月および発売経緯】

2010年7月：成人に対し、他の抗てんかん薬で十分な効果が認められていないてんかん患者の部分発作(二次性全般化発作を含む)に対する抗てんかん薬との併用療法)の機能又は効果取得。

2013年5月：4歳以上の小児に対し、同適応取得。  
2013年6月：ドラッグフリーの製造販売承認取得。

2015年2月：機能又は効果「てんかん患者の部分発作(二次性全般化発作を含む)」取得し、単剤療法可能に。

2016年2月：機能又は効果「他の抗てんかん薬で十分な効果が認められていないてんかん患者の強直間代発作に対する抗てんかん薬との併用療法」取得。

### 【錠剤の外觀】

剤形：フィルムコート錠  
色：250mg→青、500mg→黄色  
刻印：250mg→「ucb250」、500mg→「ucb500」  
線：イーケブラ錠250・500mg共に、割線はかざり割線。

### 【製剤の工夫など】

原薬に苦みがあるためフィルムコーティングを施している。

### 【無包装状態での安定性】

250mg錠：30°C 75%RH暗所の条件下で保存した場合、1か月で退色傾向、3か月以降で目視可能な退色あり。含量や溶出性など外観以外の項目は6か月まで規格内。

500mg錠：すべての項目で6か月まで規格内。

### 【粉碎調剤の可否に関する情報】

粉碎後、温度25度、湿度75%、1000luxの蛍光灯照射条件下で90日間含量変化なし。粉碎後の苦みに注意が必要。

### 【簡易懸濁法に対する情報】

錠剤のコーティングを破壊した場合、55°Cの20mlの水で10分以内に崩壊・懸濁し、8Fr.チューブまたはガストロパシを通過する。(ユーシーピーお薬相談室による回答)

※イーケブラはマクロール6000含有薬剤であり、凝固点が56-61°Cのため水温を上げすぎた場合、チューブ通過時に冷えて詰まる恐れがあるため注意。

### 【味(DS)】

甘味のある小児にも飲みやすい粉末製剤。

## 《普通錠の比較》

### 【効能又は効果、用法・用量】

全メーカー、先発品と同様の効能又は効果、用法・用量となっている。

### 【錠剤の外觀】

剤形：すべての製剤が先発品と同じフィルムコーティング錠。  
錠剤の大きさ、形：すべての製剤が先発品と同等でないものはない。

色調：すべての製剤が先発品と同じく、250mg→青色、500mg→黄色となっている。

印字(識別コード)：先発品は「ucb」+含量のみ刻印されているが、後発品では全ての製剤で成分名と含量、屋号が印字されている。(「日新」「明治」は刻印)

割線：先発品では250・500mg錠共に飾り割線があるが、後発品には250mg錠において全製剤に割線なし。

### 【包装規格・包装形状】

すべての包装規格(100・500PTP、バラ)を揃えているのは、『沢井』『日新』『東和』『日本ゼネリック』『日医工』『共和』の6社。

### 【PTPデザイン】

#### 色調：

『日本ゼネリック』：白系をベースに、青系。  
『ウイットリス』：黄系をベースに、オレンジ系(250mg)・赤系(500mg)。  
その他のメーカー：先発品と同色系の黄色系をベースに青系。

#### GSコード：

全メーカー1錠毎に印字されている。

### 【無包装状態での安定性(吸湿性)】

先発品では保存期間1ヵ月は規格内。

2ヵ月規格内：「日医工」

3ヵ月規格内：「トーワ」「サワイ」「杏林」「アム」「効外」「JG」

6ヵ月規格内：「明治」「日新」

(「VTRS」はインヒューフォームに無包装状態での試験結果掲載なし。「フェルゼン」資料入手できず)

又、「トーワ」「サワイ」「明治」は添付文書上「取り扱い上の注意」において高温・高湿等の注意喚起の記載なし。

### 【無包装状態での安定性(光に対する安定性)】

先発品は120月lx・hrで規格内となっている。

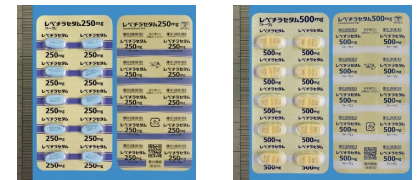
後発品に関しては試験期間(20日～100日)に差はあるものの、120月lx・hrで規格内となっている。「フェルゼン」「VTRS」を除くすべての製剤

## ★普通錠の評価★

➢13社のうち、全ての包装規格を揃えている『沢井』『日新』『東和』『日本ゼネリック』『日医工』『共和』を評価する。

➢レベチラセタム500mgは、その大ききから半錠に分割して調剤する機会は少なくないように思えるため、半錠割線があるメーカーを評価する。また、鑑査の観点から、半錠後も成分名・含量・屋号が識別できる印刷を施している『東和』『沢井』『共和』『日医工』から選択する。

➢上記のうち両面割線を採用しているのは「トーワ」のみ。以上より、普通錠のみでは「東和(レベチラセタム錠「トーワ」)」を推奨メーカーとする。



## 《DSの比較》

### 【効能又は効果、用法・用量】

全メーカー、先発品と同様の効能又は効果、用法・用量となっている。

### 【添加物と散剤の色】

全製剤、白色～微黄白色の粉末又は粒。  
「日新」「明治」は賦形剤に粉末還元麦芽糖水Aを用い、口当たり及び崩壊性を向上。

### 【包装規格】

全メーカー、100gのバラ包装がある。  
『陽進堂』『日本ゼネリック』の2社はアルミラミネート包装(乾燥剤入り)。  
その他メーカーは100gボトル。  
『東和』と『共創未来』からは1g×100包装の分包品も発売される。

### 【分包デザイン】

『共創未来ファーマ』『東和』の1g包装には製品名と含量、屋号が印字されている。又、シート表面に印字されているQRコードを読み取ると最新の指導書が表示される。

### 【経管投与試験(簡易懸濁法)】

◇『東和』『三和』『共創未来』『沢井』『キャリソルメディオ』『日医工』『高田』⇒8Fr.チューブを抵抗なく通過、残存ほぼなし。  
◇『日本ゼネリック』『陽進堂』⇒データ取得予定、現在試験中。  
◇『日新』『明治』⇒簡易懸濁に関する試験の実地なし。

※約55°Cの温湯20mlに溶解し、軽く攪拌後、チューブへの通過性を確認した。

### 【味・飲みやすさ】

先発品：オレンジ風味(メーカー回答)  
「効外」：グレープフルーツ風味。  
「JG」「YD」：リンゴ風味。  
「日医工」：ストロベリーヨーグルト風味。

※味見(職員8名で実施。)

「効外」「サワイ」「明治」「日新」「杏林」「トーワ(東和のみ)」「YD」「日医工」、先発品のイーケブラについて行った。「JG」はDSの製剤見本なし。

#### ★結果★

全メーカー苦みあり。  
その中でもリンゴ風味の「YD」ならば比較的まだ服用しやすいくとの意見あり。  
また、先発品と比較し、後発品の方が服用しやすく工夫されていると回答したものは8名中5名。残りの3名はどちらも差異なしと回答。

## ★DSの評価★

➢現時点で簡易懸濁試験のデータが入ってきた『東和』『三和』『共創未来』『沢井』『キャリソルメディオ』『日医工』『高田』から選択する。

➢DSの苦みはどの後発品メーカーも完全に解決されておらず、その差は微妙であった。

➢『東和』『共創未来』からは1g包装が発売される。コンタを防げることや調剤の手間を省けること、施設等でも保管がしやすいなどの点から非常に評価できる。また、『東和』『共創未来』は指導書を準備している点も評価のポイントに加わった。

以上より、DSのみでは、『東和・共創未来ファーマ(レベチラセタム「トーワ」)』を推奨メーカーとする。



## ★★最終評価★★

➢先発品のイーケブラ製剤に関して、500mg錠についてはその成分量からどうしても大きな製剤になってしまい、DSについては原薬の苦みが残っている製剤である。

➢『沢井』からは普通錠・DSに加えて、錠剤の大きさとDSの苦みの問題を解消できる粒状錠が発売された。粒状錠は錠剤の小ささに加え味もなく、普通錠同様に水で服用するものであるが、嚥下のしやすさは普通錠と比べると格段に向上している。

➢粒状錠を追加剤型として発売することで、剤形選択に幅が広がりがコンプライアンスの向上も期待できる。錠剤やDSにおいて明らかに突出して工夫・改善されているメーカーが見当たらない中、総合評価としては大きなアドバンテージとなると考えた。

以上により、総合的に評価するならば、

『沢井(レベチラセタム錠「サワイ」・レベチラセタムDS「サワイ」・レベチラセタム粒状錠「サワイ」)』を推奨メーカーとする。



※参考・引用：各社添付文書・インヒューフォーム・web・DI学術