

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2008 に準拠して作成

## 緩 下 剤

### ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」

Sodium Picosulfate Tablets 2.5mg 「TSURUHARA」

剤 形	白色フィルムコート錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中ピコスルファートナトリウム水和物 2.5mg
一般名	和名：ピコスルファートナトリウム水和物 洋名：Sodium Picosulfate Hydrate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2013年12月24日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2014年6月20日（販売名変更による） 発売年月日：1992年7月10日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：鶴原製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	鶴原製薬株式会社 医薬情報部 TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/">http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/</a>

本 I F は 2014 年 5 月 改 訂 （ 第 9 版 ） の 添 付 文 書 の 記 載 に 基 づ き 改 訂 し た。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/> にてご確認下さい。

## I F 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において新たなIF記載要領が策定された。

### 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとす。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「IF 記載要領 2008」により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

## [IFの発行]

- ①「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）は、平成21年4月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### 3. IFの利用にあたって

「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008年9月)

## 目 次

[ I ] 概要に関する項目	1
[ II ] 名称に関する項目	2
[ III ] 有効成分に関する項目	3
[ IV ] 製剤に関する項目	4
[ V ] 治療に関する項目	9
[ VI ] 薬効薬理に関する項目	10
[ VII ] 薬物動態に関する項目	14
[ VIII ] 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16
[ IX ] 非臨床試験に関する項目	18
[ X ] 管理的事項に関する項目	19
[ X I ] 文 献	21
[ X II ] 参考資料	21
[ X III ] 備 考	21

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

コンスーベン錠は、鶴原製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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、1992年3月4日に承認を取得、1992年7月10日に上市した。その後、医療過誤防止のため、2008年2月28日に製品名を「コンスーベン錠」から「コンスーベン錠 2.5mg」に変更の承認を得て、2008年6月20日より販売の運びとなった。2000年9月19日付医薬発第935号「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取り扱いについて」に基づき、2013年12月24日に「ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」」に販売名変更の承認を得て2014年6月に上市した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

#### 1. 胃・小腸への刺激が少なく、穏やかな作用

ピコスルファートナトリウム水和物は、それ自体は不活性で、大腸に達した後、加水分解されて作用をあらわすため上部消化管に対する刺激が少ない。

#### 2. 連用しても薬剤耐性がみられず安定した効果を示す。

## Ⅱ. 名称に関する項目

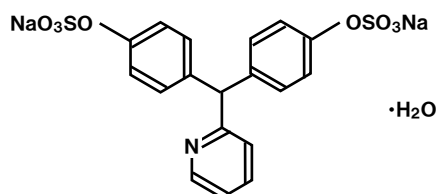
### 1. 販売名

- 1) 和名：ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」
- 2) 洋名：Sodium Picosulfate Tablets 2.5mg 「TSURUHARA」
- 3) 名称の由来：一般名+剤形+規格(含量)+「ツルハラ」  
〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」  
(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

### 2. 一般名

- 1) 和名 (命名法)：ピコスルファートナトリウム水和物
- 2) 洋名 (命名法)：Sodium Picosulfate Hydrate
- 3) ステム：特になし

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式： $\text{C}_{18}\text{H}_{13}\text{NNa}_2\text{O}_8\text{S}_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$

分子量：499.42

### 5. 化学名 (命名法)

Disodium 4,4'-(pyridin-2-ylmethylene)bis(phenyl sulfate) monohydrate

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

特になし

### 7. CAS登録番号

10040-45-6 [無水物]

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

- 1) 外観・性状 : 白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。
- 2) 溶解性 : 水に極めて溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
- 3) 吸湿性 : 該当資料なし
- 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 : 該当資料なし
- 6) 分配係数 : 該当資料なし
- 7) その他の主な示性値 : 本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 7.4~9.4 である。  
吸光度 :  $E_{1\text{cm}}^{1\%}$  (263nm) : 120~130 (脱水物換算、4mg、水、100mL)

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

光により徐々に着色する。

#### 3. 有効成分の確認試験法

- (1)ピリジン環の呈色反応
- (2)塩化バリウムによる定性反応
- (3)紫外可視吸光度測定法
- (4)赤外吸収スペクトル法
- (5)ナトリウム塩の定性反応

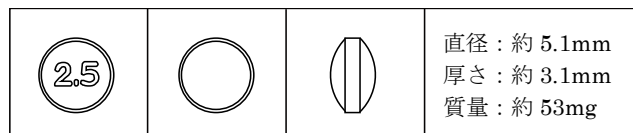
#### 4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

- 1) 剤形の区別及び性状：白色フィルムコート錠
- 2) 製剤の物性：該当資料なし
- 3) 識別コード：2.5
- 4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等：該当資料なし



### 2. 製剤の組成

- 1) 有効成分（活性成分）の含量：1錠中ピコスルファートナトリウム水和物 2.5mg
- 2) 添加物：乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、タルク、酸化チタン、ミツロウ
- 3) その他：該当資料なし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当資料なし

### 4. 製剤の各種条件下における安定性

試験条件及び保管	試験期間	保存包装	試験項目	試験ロット
長期保存試験 室温	3.5年	PTP包装：PTP包装し 紙箱に入れる	(1)性状 (2)確認試験 (3)崩壊試験 (4)定量試験	401 402 403
加速試験 40°C75%RH	6箇月			
苛酷試験 光照射	1箇月			
長期保存試験 室温	3.5年	バラ包装：ポリエチレン袋 にブリキ缶包装		

#### 安定性に関する考察

性状：いずれの条件においても着色、着香、吸湿等の変化は認められなかった。

確認試験：いずれの条件の最終検査時においても規格に適合した。

崩壊試験：いずれの条件の最終検査時でも変化は認められなかった。

定量試験：いずれの条件の最終検査条件においてもほとんど含量の低下は認められなかった。

結論：以上の結果よりピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」はその包装形態で室温 3.5年間安定であった。

従って本品の使用期限は3年間とした。



ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」の経時変化試験成績表

包装	保存条件	保存期間	ロット番号	性状	確認試験	崩壊試験	定量試験 (%)	
P T P 包装	室温	製造時	401	白色フィルムコート錠	(1)適 (2)適 (3)適	3.5~5.1	99.8	
			402	同上	適	2.5~3.8	102.7	
			403	同上	適	1.9~2.6	101.6	
		1 箇月	401	同上	適	3.0~4.7	98.6	
			402	同上	適	2.9~4.2	101.8	
			403	同上	適	2.2~3.2	100.5	
		3 箇月	401	同上	適	3.2~5.5	99.9	
			402	同上	適	3.0~4.5	101.2	
			403	同上	適	2.8~3.5	101.2	
		6 箇月	401	同上	適	2.9~4.5	99.0	
			402	同上	適	2.6~4.4	102.0	
			403	同上	適	2.0~2.7	101.0	
		12 箇月	401	同上	適	3.6~5.0	98.3	
			402	同上	適	3.2~3.9	100.5	
			403	同上	適	1.8~2.5	100.2	
		18 箇月	401	同上	適	3.2~5.1	99.4	
			402	同上	適	3.0~4.3	101.0	
			403	同上	適	2.5~3.0	100.9	
		24 箇月	401	同上	適	3.8~4.9	99.0	
			402	同上	適	2.8~3.5	100.7	
			403	同上	適	2.4~3.6	101.5	
		30 箇月	401	同上	適	4.0~5.3	100.2	
			402	同上	適	3.3~4.0	102.2	
			403	同上	適	2.1~2.9	100.7	
		36 箇月	401	同上	適	3.7~4.8	98.6	
			402	同上	適	2.7~3.8	101.4	
			403	同上	適	1.9~2.8	102.0	
		40°C	1 箇月	401	同上	適	3.3~4.9	100.0
				402	同上	適	2.5~3.4	100.4
				403	同上	適	1.8~2.5	100.7
			3 箇月	401	同上	適	3.6~5.2	98.5
				402	同上	適	2.9~4.0	100.9
				403	同上	適	2.3~3.0	100.9
			6 箇月	401	同上	適	2.8~4.5	99.3
				402	同上	適	3.3~4.1	102.2
				403	同上	適	2.1~2.8	101.3
		2000 ルクス照射	2 週間	401	同上	適	3.5~5.5	99.0
				402	同上	適	2.8~3.4	101.5
				403	同上	適	2.2~2.6	100.4
			1 箇月	401	同上	適	3.0~4.7	99.4
				402	同上	適	3.0~4.0	100.6
				403	同上	適	2.5~3.1	101.6

包装	保存条件	保存期間	ロット番号	性状	確認試験	崩壊試験	定量試験 (%)
バラ包装	室温	製造時	401	白色フィルムコート錠	(1)適 (2)適 (3)適	3.5~5.1	99.8
			402	同上	適	2.5~3.8	102.7
			403	同上	適	1.9~2.6	101.6
		1箇月	401	同上	適	3.3~4.2	98.9
			402	同上	適	3.1~3.7	102.0
			403	同上	適	2.0~3.0	101.2
		3箇月	401	同上	適	3.8~5.3	98.8
			402	同上	適	2.7~4.3	101.8
			403	同上	適	2.4~2.9	102.0
		6箇月	401	同上	適	3.0~4.6	99.3
			402	同上	適	3.2~3.9	100.3
			403	同上	適	2.7~3.3	100.3
		12箇月	401	同上	適	3.4~4.2	100.1
			402	同上	適	2.9~4.2	100.7
			403	同上	適	1.8~2.5	99.4
		18箇月	401	同上	適	3.5~5.3	98.6
			402	同上	適	3.3~4.0	100.4
			403	同上	適	2.0~2.6	99.2
		24箇月	401	同上	適	3.2~4.8	99.3
			402	同上	適	2.6~3.5	101.6
			403	同上	適	1.7~3.0	99.9
		30箇月	401	同上	適	3.0~4.6	99.2
			402	同上	適	3.2~4.4	99.8
			403	同上	適	2.0~2.9	101.5
		36箇月	401	同上	適	4.0~5.2	98.4
			402	同上	適	2.9~3.7	100.5
			403	同上	適	2.2~3.2	100.6

#### 5. 調整法及び溶解後の安定性

該当資料なし

#### 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 7. 溶出性

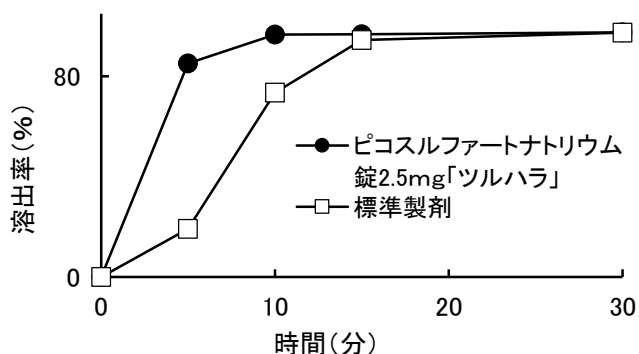
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」の溶出は、日本薬局方外医薬品規格第三部「ピコスルファートナトリウム水和物錠」の溶出規格に適合した。(オレンジブック No. 19 掲載)

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

回転数：毎分50回転

試験液：水

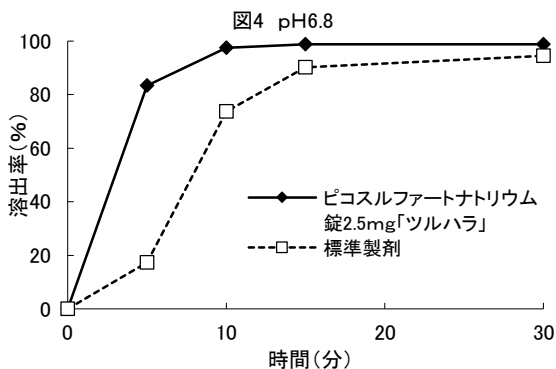
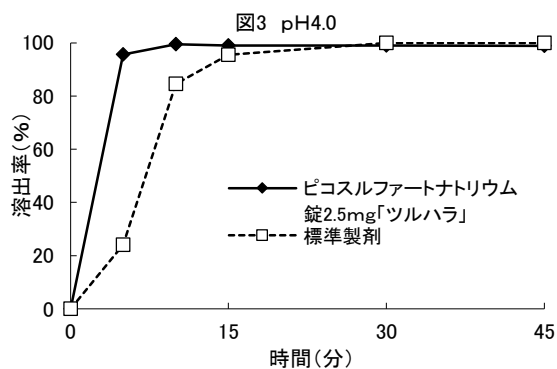
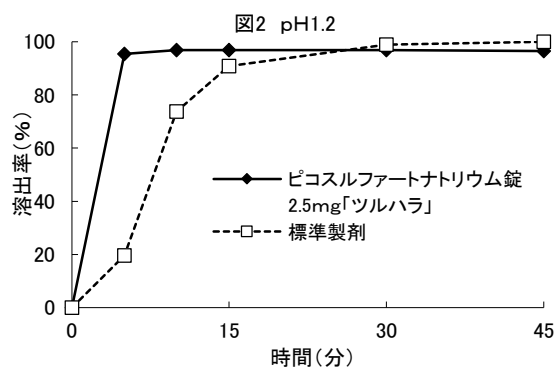
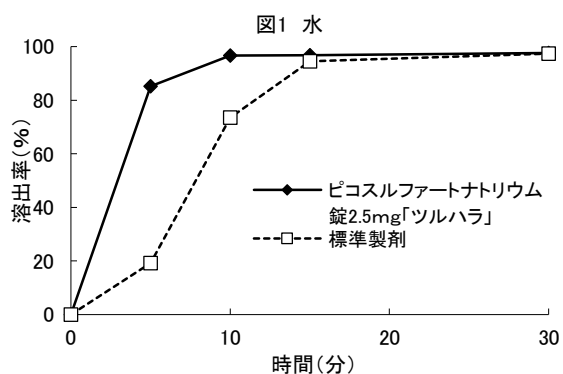
溶出規格：15分 80%以上



ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」につき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

### 試験結果

標準製剤を対照としたピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

(1)塩化バリウムによる沈殿反応

(2)紫外可視吸光度測定法

(3)薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

各種便秘症、術後排便補助、造影剤(硫酸バリウム)投与後の排便促進

### 2. 用法及び用量

各種便秘症には、通常、成人に対して1日1回2～3錠（ピコスルファートナトリウム水和物として5～7.5mg）を経口投与する。

7～15才の小児に対しては、1日1回2錠(ピコスルファートナトリウム水和物として5mg)を経口投与する。

術後排便補助、造影剤(硫酸バリウム)投与後の排便促進には、通常、成人に対して1日1回2～3錠（ピコスルファートナトリウム水和物として5～7.5mg）を経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6) 治療的使用

##### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

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試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

ピコスルファートナトリウムはそのままの型では作用せず、胃、小腸を通過して大腸に到達した後腸内細菌由来の酵素によってジフェノール体に加水分解されて効果を示す。in situ ラット結紮大腸分節で腸管内水分の吸収抑制あるいは腸管壁からの水分分泌亢進作用が認められている<sup>1)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」と標準製剤との生物学的同等性を検討した。両製剤の有効成分であるピコスルファートナトリウム水和物は小腸ではほとんど吸収されず大腸に達した後、腸内細菌の有するアシルスルファテースによって遊離のジフェノール型に分解されて瀉下作用をあらわすとされており、その作用はジフェノール型の腸管に対する直接的刺激によるとされている。従って投与後の血漿中濃度の推移より生物学的同等性を検討することは不適切と判断し、薬効薬理試験を行った。

#### ■使用薬剤

- ・被験薬           ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」
- ・対照薬           標準製剤

#### ① 糞便の性状および糞便中の水分率より水分吸収抑制作用に対する薬効比較試験

##### 1) 実験方法・結果

猫 10 匹にクロスオーバー法を用いて両製剤それぞれ 4 錠を経口投与し、投与前後の糞便の外観形状スコア(表 1 参照)および水分率を測定した。その結果は表 2、表 3 の通りで両製剤ともに 4 錠投与により投与前に比し、糞便の外観形状スコアはさらに増加し、投与前に比し有意差が認められるが、4 錠投与時に比しその差は有意でなかった。水分率は 1 6 錠投与によっても 4 錠投与と比べて明らかな増加はみられなかった。またピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」と標準製剤との比較においては 4 錠、16 錠の両投与量群間とも有意な差は認められなかった。

表 1 スコア基準表

Grade	判定基準	
0	正常便 (Formed stool)	形・硬さともに正常
1	有形軟便 (Formed but Loose stool)	形は保つが軟らかい
2	軟便 (Loose stool)	形が崩れ一ヶ所に停まる軟便
3	粘液便 (Mucous stool)	形が崩れた粘液性便
4	液状便 (Liquid stool)	水様便

##### 2) 統計学的検討・結果

糞便外観スコア、水分率につき F 検定および students t 検定を行った。結果、表 4、表 5 に示した。いずれの群間にも有意の差は認められず動物の割り付けは適切であった。

表2 投与前・後における糞便の外観形状スコア

	投与前	投与後
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」 4錠 (n=10)	0.6±0.2	3.5±0.4*
標準製剤 4錠 (n=10)	0.5±0.2	3.7±0.5*
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」 16錠 (n=10)	0.8±0.2	5.5±0.5*
標準製剤 16錠 (n=10)	0.7±0.2	5.4±0.7*

\* P<0.001

表3 投与前・後における水分率

	投与前	投与後
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」 4錠 (n=10)	61.4±1.0	73.2±1.4*
標準製剤 4錠 (n=10)	62.3±0.9	70.4±1.1*
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「ツルハラ」 16錠 (n=10)	62.3±0.9	75.0±1.2*
標準製剤 16錠 (n=10)	60.0±1.0	71.4±1.3*

\* P<0.001

表4 糞便の外観形状スコアにおける統計学的検討

	F検定	t検定
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」4錠 投与前・投与後の比較	1.94 (N.S)	7.802 (P<0.001)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」16錠 投与前・投与後の比較	2.26 (N.S)	4.372 (P<0.001)
標準製剤4錠 投与前・投与後の比較	3.11 (N.S)	4.351 (P<0.001)
標準製剤16錠 投与前・投与後の比較	3.06 (N.S)	4.453 (P<0.001)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」4錠と 16錠投与後の比較	1.31 (N.S)	1.684 (P<0.05)
標準製剤4錠と 16錠投与後の比較	1.26 (N.S)	1.317 (P<0.05)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」4錠と 標準製剤4錠投与後の比較	1.21 (N.S)	0.172 (P<0.05)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」16錠と 標準製剤16錠投与後の比較	1.16 (N.S)	0.076 (P<0.05)

表5 水分率における統計学的検討

	F検定	t検定
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」4錠 投与前・投与後の比較	1.41 (N.S)	6.444 (P<0.001)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」16錠 投与前・投与後の比較	1.30 (N.S)	7.460 (P<0.001)
標準製剤4錠 投与前・投与後の比較	1.19 (N.S)	4.811 (P<0.001)
標準製剤16錠 投与前・投与後の比較	1.37 (N.S)	6.442 (P<0.001)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」4錠と 16錠投与後の比較	1.21 (N.S)	0.956 (P<0.05)
標準製剤4錠と 16錠投与後の比較	1.22 (N.S)	0.098 (P<0.05)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」4錠と 標準製剤4錠投与後の比較	1.29 (N.S)	1.487 (P<0.05)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」16錠と 標準製剤16錠投与後の比較	1.15 (N.S)	1.758 (P<0.05)



## ②大腸での水分吸収に対するコンスーベン錠 2.5mg と標準製剤の薬効比較試験

### 1) 実験方法・結果

1 群 10 匹のラットを用い、大腸分節内に Tyrode Solution 3mL とともにピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」あるいは標準製剤 1 錠を挿入し結紮を行い 60 分後の大腸分節内に残存する液体量を測定した。その結果表 6 に示した通りで、ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」、標準製剤は両製剤とも 1 錠の大腸分節内挿入により、対照群に比し有意に残存液体量を増加させた。また、両製剤間には有意な差はみられなかった。

### 2) 統計学的検討・結果

使用したラット体重につき F 検定および students t 検定を行った。結果、いずれの群間にも有意の差は認められず動物の割り付けは適切であった。

得られた大腸内残存液体量につき F 検定および students t 検定を行った結果を表 7 に示した。

表 6 大腸内残存液体量

		残存液体量 (mL)
対照群	(n=10)	0.61±0.05
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」 群	(n=10)	1.97±0.14***
標準製剤 群	(n=10)	2.06±0.14***

\*\*\* P<0.01

表 7 統計学的検討

	F 検定	t 検定
対照群とピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」 群	2.67 (N.S)	5.127 P<0.001
対照群と標準製剤群	2.62 (N.S)	5.595 P<0.001
ピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」 群と標準製剤群	1.02 (N.S)	0.287 (N.S)

### 結論

これらの結果よりピコスルファートナトリウム錠 2.5m g 「ツルハラ」、標準製剤は、in situ 大腸分節からの水分吸収抑制あるいは大腸壁からの水分分泌に対して生物学的に同等な作用を有するものと推察された。

### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

(「VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 7.相互作用」の項を参照のこと)

#### (6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメーター

#### (1) コンパートメントモデル

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

#### (4) 消失速度定数

該当資料なし

#### (5) クリアランス

該当資料なし

#### (6) 分布容積

該当資料なし

#### (7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

### 3. 吸収

該当資料なし

### 4. 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

該当資料なし

(3) 乳汁中への移行性

該当資料なし

(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

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当資料なし

(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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 急性腹症が疑われる患者〔腸管蠕動運動の亢進により、症状が増悪するおそれがある。〕
- (2) 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当資料なし

### 5. 慎重投与内容とその理由

該当資料なし

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当資料なし

### 7. 相互作用

該当資料なし

### 8. 副作用

#### (1) 副作用の概要

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。

#### (2) 重大な副作用と初期症状

該当資料なし

#### (3) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には投与を中止する等、適切な処置を行うこと。

頻度 種類	頻度不明
消化器	腹痛、悪心、嘔吐、腹鳴、腹部膨満感、下痢、腹部不快感 等
皮膚	蕁麻疹、発疹 等
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇 等

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

9. 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。

10. 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。〕

11. 小児等への投与

該当資料なし

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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。）

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験

該当資料なし

#### (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### (3) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

- 1) 製剤：該当しない
- 2) 有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存（気密容器）

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### （1）薬局での取り扱いについて

（「規制区分」及び「貯法・保存条件」の項を参照のこと）

#### （2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14.適用上の注意」の項を参照のこと）

### 5. 承認条件等

なし

### 6. 包装

100錠（PTP）、1000錠（PTP）、1200錠（バラ）

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニル アルミ箔

バラ包装：ポリエチレン袋 ブリキ缶

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ラキソベロン錠 2.5m g（帝人ファーマ）

### 9. 国際誕生年月日

不明

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造承認年月日：2013年12月24日

承認番号：22500AMX01965000

11. 薬価基準収載年月日

2014年6月20日

12. 効能・効果追加, 用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

なし

13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

2004年2月23日(品質再評価結果)

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
104888903	2359005F1013	620488803

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。



## **X I . 文 献**

### 1. 引用文献

- 1) Forth, W. et al. : Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol., 274, 46(1972)
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料

### 2. その他の参考文献

第 17 改正 日本薬局方

## **X II . 参 考 資 料**

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## **X III . 備 考**

### 1. その他の関連資料

なし



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

文献請求先：鶴原製薬（株）医薬情報部