

**ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」**※

**ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」**※

**Sodium Picosulfate Tablets 2.5mg・7.5mg “IWAKI”**※  
(ピコスルファートナトリウム水和物錠)

貯法：室温保存

使用期限：容器又は外箱に記載

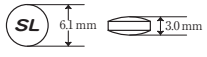
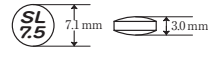
	錠2.5	錠7.5
※ 承認番号	23100AMX00050	23100AMX00051
※ 薬価収載	2019年6月	2019年6月
※ 販売開始	2019年6月	2019年6月

**【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

○造影剤（硫酸バリウム）投与後の排便促進  
通常成人に対して1日1回1錠（なお、ピコスルファートナトリウム水和物としての一般的用量は1回3.0～7.5mgである。）を経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

※【組成・性状】

	販売名	ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」	ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」
組	成分・含量 (1錠中)	日本薬局方 ピコスルファート ナトリウム水和物 2.5mg	日本薬局方 ピコスルファート ナトリウム水和物 7.5mg
成	添加物	乳糖水和物、ヒドロキシプロピルスターチ、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、精製白糖、酸化チタン、プロピレングリコール、青色2号	
性 状	色・剤形	白色のフィルムコーティング錠	
	形 状		
	識別コード	SL2.5	SL7.5

**【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。  
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。

種類\頻度	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

**【効能・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

※【用法・用量】

**ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」**

- 各種便秘症  
通常成人には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5.0～7.5mg）を経口投与する。  
7歳以上の小児には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5.0mg）を経口投与する。
- 術後排便補助  
通常成人には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5.0～7.5mg）を経口投与する。
- 造影剤（硫酸バリウム）投与後の排便促進  
通常成人には1回2～3錠（ピコスルファートナトリウム水和物として5.0～7.5mg）を経口投与する。  
（ピコスルファートナトリウム水和物としての一般的用量は3.0～7.5mgである。）  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

**ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」**

- 各種便秘症・術後排便補助  
通常成人に対して1日1回1錠（なお、ピコスルファートナトリウム水和物としての一般的用量は1回5.0～7.5mgである。）を経口投与する。

**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. 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】

**溶出挙動<sup>1)</sup>**

ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」及びピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたピコスルファートナトリウム錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

## 【臨床成績】

22施設、446例について行われた一般臨床試験の成績は次の通りであった。<sup>2)~12)</sup>

対象疾患名	症例数	有効率（有効以上）
各種便秘症	260	70.4% (183/260)
慢性便秘症	194	70.6% (137/194)
透析による便秘	31	54.8% ( 17/ 31)
褥瘡の便秘症	35	82.9% ( 29/ 35)
術後排便補助	30	66.7% ( 20/ 30)
造影剤投与後の排便促進	156	98.1% (153/156)

## ※【薬効薬理】

### 1. 薬効薬理

本剤は大腸において、大腸細菌叢由来の酵素により加水分解され、活性型のジフェノール体となり腸管粘膜を刺激し、大腸の蠕動運動亢進作用と水分吸収抑制作用により緩下作用を示す。本剤のラットでの50%瀉下有効量(ED<sub>50</sub>)は1.1mg/kgであり、センノシド剤は3.6mg/kg、生薬配合剤(センナ葉、センナ実等)は165.0mg/kgであった<sup>13)</sup>。

### 2. 生物学的同源性試験

#### ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」<sup>14)</sup>

雌雄日本ネコ(n=10)にピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」及び標準製剤(液剤、0.75%)を、それぞれ低用量(ピコスルファートナトリウム水和物として10mg/head)及び高用量(ピコスルファートナトリウム水和物として40mg/head)の2段階とり、クロスオーバー法による単回投与を行い、緩下作用を糞便の外観形状のスコア及び糞便中水分率を指標に検討した結果、両剤の生物学的同源性が確認された。

判定パラメータ

糞便中水分率(%) (Mean±S.D., 3日間, n=10)

	低用量	高用量
ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」	71.4±4.4	68.0±2.5
標準製剤(液剤、0.75%)	72.0±4.1	69.0±3.4

#### ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」<sup>15)</sup>

Wistar雄性ラット(n=10)にピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」及び標準製剤(錠剤、7.5mg)を、それぞれ1錠直接胃内に投与し、瀉下活性、水分吸収阻害作用及び腸管蠕動運動阻害作用を下痢便排泄動物数、糞便中水分率及び消化管内通過時間を指標に検討した結果、両剤の生物学的同源性が確認された。

判定パラメータ

下痢便排泄動物数(下痢便排泄動物数/全動物数)

製剤\時間(hr)	0~4	4~6	6~8	8~10	10~12
ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」	0/10	1/10	8/10	10/10	10/10
標準製剤(錠剤、7.5mg)	0/10	2/10	7/10	10/10	10/10

糞便中水分率(%)

製剤\時間(hr)	0~4	4~6	6~8	8~10	10~12
ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」	50.1±4.6(9)	55.3±4.5(9)	75.5±2.6(10)	83.4±0.9(10)	83.0±1.5(10)
標準製剤(錠剤、7.5mg)	57.1±4.5(8)	54.4±3.9(9)	76.0±3.6(9)	83.3±0.8(10)	82.9±1.4(10)

それぞれの数値は( )に示した例数の平均値±標準誤差を表す。

消化管内通過時間(分)

ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」	548±36.5
標準製剤(錠剤、7.5mg)	490±32.3

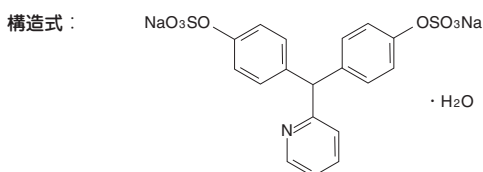
それぞれの数値は10例の平均値±標準誤差を表す。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ピコスルファートナトリウム水和物  
(Sodium Picosulfate Hydrate)

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

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>13</sub>NNa<sub>2</sub>O<sub>8</sub>S<sub>2</sub>・H<sub>2</sub>O



性状：白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。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。光により徐々に着色する。1.0gを水20mLに溶かした液のpHは7.4~9.4である。

## ※【取扱い上の注意】

### 安定性試験

#### ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」<sup>16)</sup>

最終包装製品を用いたなりゆき室温(通常の流通下における保存条件)、4年間の長期保存試験の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、通常の市場流通下において4年間安定であることが確認された。

#### ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」<sup>17)</sup>

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、外観及び含量等は規格の範囲内であり、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】

ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「イワキ」：PTP(100錠、500錠、1000錠)、バラ(1000錠)

ピコスルファートナトリウム錠7.5mg「イワキ」：PTP(100錠、500錠)、バラ(500錠)

## 【主要文献及び文献請求先】

### (主要文献)

- 1) 岩城製薬株式会社 社内資料(溶出試験)
- 2) 成田 光陽 他：腎と透析 27(4)791(1989)
- 3) 八尾 恒良 他：医学と薬学 22(5)1379(1989)
- 4) 長瀬 行之 他：基礎と臨床 24(3)1483(1990)
- 5) 村上 穆 他：基礎と臨床 22(16)5860(1988)
- 6) 成田 光陽 他：基礎と臨床 23(7)2679(1989)
- 7) 村井 俊介 他：基礎と臨床 24(3)1303(1990)
- 8) 川村 顕 他：医学と薬学 23(1)209(1990)
- 9) 坂本 力 他：基礎と臨床 22(18)6535(1988)
- 10) 村井 俊介 他：基礎と臨床 22(14)4997(1988)
- 11) 山崎 秀男 他：日消集検誌 79号 68(1988)
- 12) 古賀 充 他：医学と薬学 22(5)1373(1989)
- 13) 岩城製薬株式会社 社内資料(緩下効力試験)
- 14) 上野 光一 他：薬理と治療 18(1)71(1990)
- 15) 岩城製薬株式会社 社内資料(生物学的同源性試験)
- 16) 岩城製薬株式会社 社内資料(安定性試験)
- 17) 岩城製薬株式会社 社内資料(安定性試験)

### ※(文献請求先)

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

岩城製薬株式会社 学術部

〒103-8434 東京都中央区日本橋本町 4-8-2

TEL 03-6626-6251 FAX 03-6626-6261



製造販売

岩城製薬株式会社

東京都中央区日本橋本町4-8-2