

緩下剤

ピコスルファートナトリウム錠

ピコスルファートNa錠2.5mg「サワイ」

PICOSULFATE Na Tablets [SAWAI]

承認番号	22600AMX00111000
販売開始	1992年7月

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 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。]
- 2.2 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分 [1錠中]	日局ピコスルファートナトリウム水和物 2.5mg
添加剤	カルメロースCa、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース

3.2 製剤の性状

外 形	
剤 形	割線入り素錠
性 状	白色 におい及び味はない
直径(mm)	6.0
厚さ(mm)	2.4
重量(mg)	約85
識別コード	SW 905

4. 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

6. 用法及び用量

〈各種便秘症〉

通常、成人に対して1日1回2～3錠を経口投与する。7～15才の小児に対しては、1日1回2錠を経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈術後排便補助、造影剤(硫酸バリウム)投与後の排便促進〉

通常、成人に対して1日1回2～3錠を経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

11. 副作用

次の副作用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。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	頻度不明
消化器	腹痛、悪心、嘔吐、腹鳴、腹部膨満感、下痢等	腹部不快感
皮膚		蕁麻疹、発疹等
肝臓		AST上昇、ALT上昇等

注)副作用の頻度はラキシベロン液承認時(1979年)までの臨床試験及び使用成績調査を含む。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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

を併発することがある。

16. 薬物動態

16.3 分布

¹⁴C-ピコスルファートナトリウム水和物5mg/kgをラットに経口投与し放射能測定及び全身オートラジオグラフィーを実施した。その結果、大部分が胃腸管部に局在し、わずかが肝臓、腎臓、血液及び肺に分布した。また、繰り返し投与によってもほとんど変化がなかった^{1)、2)}。

16.4 代謝

ラットに経口投与されたピコスルファートナトリウム水和物は、小腸内で加水分解されず大腸に移行し、大腸細菌叢由来の酵素アリスルファターゼによりジフェノール体に加水分解される。ジフェノール体の一部は吸収され肝臓でグルクロン酸抱合を受ける^{1)、3)}。

16.5 排泄

大腸で加水分解を受け生成したジフェノール体の大部分は、そのまま糞便中に排泄される。一部吸収されたジフェノール体は、肝臓でグルクロン酸抱合を受け、尿中に排泄されるか、胆汁とともに再度十二指腸内に分泌され腸管を経由して糞便中に排泄される^{1)、3)}。

ラットに¹⁴C-ピコスルファートナトリウム水和物5mg/kgを経口投与し、72時間までの尿中、糞便中排泄量を測定した。その結果、体内からの放射能の排泄は、投与後48時間でほとんど終了した。更に72時間では投与量の21%が尿中に、72%が糞便中に排泄された¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内一般臨床試験

国内7施設で実施された一般臨床試験の効果判定症例85例における有効率は次のとおりであった⁴⁾。

疾患名\有効率(%)	有効以上
常習性便秘	82.4%(70/85)

本試験における安全性評価対象85例において、副作用は認められなかった。また、副作用とされた臨床検査値の変動はなかった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ピコスルファートナトリウム水和物は、胃、小腸ではほとんど作用せず、大腸細菌叢由来の酵素アリスルファターゼにより加水分解され、活性型のジフェノール体となる(ラット)^{5)、6)}。ジフェノール体は、腸管粘膜への以下の作用により瀉下作用を示す。

- ・腸管蠕動運動の亢進作用(ラット)⁷⁾
- ・水分吸収阻害作用(ラット)⁸⁾

18.2 生物学的同毒性試験

雌雄ネコにピコスルファートNa錠2.5mg「サワイ」10錠とラキシベロン内用液0.75%3.3mL(ピコスルファートナトリウム水和物として25mg)をそれぞれ経口投与し、腸管蠕動運動の亢進作用について初回排便時間及び排便回数、また、腸管内での水分吸収阻害作用について便硬度を指標に検討した。その結果、両剤とも対照群に比して初回排便時間、排便回数を有意に亢進し、また、便を有意に軟化した。両剤間に有意な差は認められず、両剤は同等の薬理効果を有すると判断された⁹⁾。

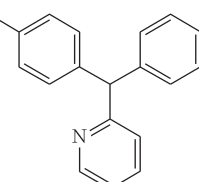
19. 有効成分に関する理化学的知見

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：C₁₈H₁₃NNa₂O₈S₂・H₂O

分子量：499.42

構造式：NaO₃SO--OSO₃Na

・H₂O

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。

22. 包装

PTP[乾燥剤入り]：100錠(10錠×10)

23. 主要文献

- 1) Jauch, R. et al. : Arzneimittel.-Forsch., 1977 ; 27(5) : 1045-1050
- 2) 大沼規男他：医薬品研究, 1977 ; 8(4) : 485-490
- 3) 大沼規男他：医薬品研究, 1977 ; 8(4) : 474-484
- 4) 平塚秀雄他：基礎と臨床, 1988 ; 22(11) : 3517-3524
- 5) 鶴見介登他：応用薬理, 1977 ; 14(4) : 549-555
- 6) Jauch, R. et al. : Arzneimittel.-Forsch., 1975 ; 25(11) : 1796-1800
- 7) Pala, G. et al. : Arch. Int. Pharmacodyn., 1966 ; 164(2) : 356-369
- 8) Forth, W. et al. : Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol., 1972 ; 274(1) : 46-53
- 9) 社内資料：生物学的同等性試験

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒108-0014 東京都港区芝五丁目33番11号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

*26.2 販売元



日本ジェネリック株式会社
東京都港区芝五丁目33番11号