

液剤型緩下剤・大腸検査前処置用下剤
ピコスルファートナトリウム水和物製剤**ピコスルファートナトリウム内用液0.75%「イワキ」**

Sodium Picosulfate Oral Solution 0.75% "IWAKI"

貯法：室温保存

有効期間：3年

承認番号 23100AMX00052

販売開始 1987年10月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

〈効能共通〉

- 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
〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉
- 2.3 腸管に閉塞のある患者又はその疑いのある患者〔腸管蠕動運動の亢進により腸管の閉塞による症状が増悪し、腸管穿孔に至るおそれがある。〕

3. 組成・性状**3.1 組成**

有効成分	1mL中 日局ピコスルファートナトリウム水和物 7.5mg（0.75%）
添加剤	パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、 精製白糖、クエン酸ナトリウム水和物、クエン酸水和物

3.2 製剤の性状

性状・剤形	無色～微黄色の澄明な液剤で、わずかに粘性が有り無臭で甘味を有する。
-------	-----------------------------------

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
- 手術前における腸管内容物の排除
- 大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除

6. 用法及び用量

〈各種便秘症〉

通常1日1回下記の量を経口投与する。

年齢	成人	14～7才	6～4才	3～1才	1才未満～7ヵ月	7ヵ月未満
ピコスルファートナトリウム水和物	5.0～7.5mg	5.0mg	3.5mg	3.0mg	1.5mg	1.0mg
ピコスルファートナトリウム内用液0.75%「イワキ」	10～15滴	10滴	7滴	6滴	3滴	2滴

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈術後排便補助〉

通常、成人1日1回10～15滴（0.67～1.0mL）を経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈造影剤（硫酸バリウム）投与後の排便促進〉

通常、成人6～15滴（0.4～1.0mL）を経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈手術前における腸管内容物の排除〉

通常、成人14滴（0.93mL）を経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

通常、成人に対して検査予定時間の10～15時間前に20mLを経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

◎本剤1mL（ピコスルファートナトリウム水和物7.5mg）は、本滴下型容器では約15滴（1滴は0.5mg）に相当する。滴下する場合は容器の胴の部分をやさしく押し、1滴ずつ滴下する。

8. 重要な基本的注意**〈手術前における腸管内容物の排除〉**

8.1 必要に応じて浣腸を併用すること。

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

8.2 腸管蠕動運動の亢進により腸管内圧の上昇を来し、虚血性大腸炎を生じることがある。また、腸管に狭窄のある患者では、腸閉塞を生じて腸管穿孔に至るおそれがあるため、投与に際しては次の点を留意すること。〔11.1.1、11.1.2参照〕

8.2.1 患者の日常の排便状況を確認し、本剤投与前日あるいは投与前に通常程度の排便があったことを確認してから投与すること。

8.2.2 本剤投与後に腹痛等の異常が認められた場合には、腹部の診察や画像検査（単純X線、超音波、CT等）を行い、適切な処置を行うこと。

8.3 自宅で行う際には、副作用があらわれた場合に対応が困難なことがあるので、ひとりでの服用は避けるよう指導すること。

8.4 水を十分に摂取させること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意**9.1 合併症・既往歴等のある患者****〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉****9.1.1 腸管狭窄及び重度な便秘の患者**

腸管蠕動運動の亢進により虚血性大腸炎又は腸閉塞を生じることがある。また、腸閉塞を生じた場合には腸管穿孔に至るおそれがある。

9.1.2 腸管憩室のある患者

腸管蠕動運動の亢進により病態が増悪するおそれがある。

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。

11.1 重大な副作用

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

11.1.1 腸閉塞、腸管穿孔（いずれも頻度不明）

腸管に狭窄のある患者において腸閉塞を生じ、腸管穿孔に至るおそれがあるので、観察を十分に行い、腹痛等の異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。[8.2 参照]

11.1.2 虚血性大腸炎（頻度不明）

[8.2 参照]

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
精神神経系		めまい ^{注2)} 、一過性の意識消失 ^{注2)}

注1) 副作用の頻度は承認時までの臨床試験及び使用成績調査を含む。

注2) 大腸検査前処置に用いた場合、排便や腹痛による血管迷走神経反射に伴い症状があらわれることがある。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

眼科用（点眼）として使用しないこと。

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⁾。

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）^{4)、5)}。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）⁶⁾

・水分吸収阻害作用（ラット）⁷⁾

18.2 生物学的同等性試験

正常ラット（n = 10）にピコスルファートナトリウム内用液 0.75%「イワキ」及びラキソベロン内用液 0.75%を経口投与し、投与6時間まで2時間毎に下痢便排出の有無を観察し、その瀉下効果の発現率から50%瀉下有効量（ED₅₀）ならびに95%信頼限界を算出した結果、両剤の生物学的同等性が確認された⁸⁾。

	ED ₅₀ (95%信頼限界) mg/kg
ピコスルファートナトリウム内用液 0.75%「イワキ」	2.69 (1.92-3.77)
ラキソベロン内用液 0.75%	2.48 (1.71-3.60)

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般の名称：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

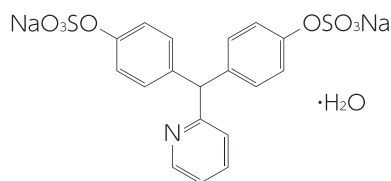
分子式：C₁₈H₁₃NNa₂O₈S₂ · H₂O

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。

化学構造式：



22. 包装

10本 [10mL (ボトル) × 10]

100mL [ボトル]

23. 主要文献

- 1) Jauch R, et al.: Arzneimittel-Forsch. 1977; 27(5): 1045-1050
- 2) 大沼規男ほか.: 医薬品研究. 1977; 8(4): 485-490
- 3) 大沼規男ほか.: 医薬品研究. 1977; 8(4): 474-484
- 4) 鶴見介登ほか.: 応用薬理. 1977; 14(4): 549-555
- 5) Jauch R, et al.: Arzneimittel-Forsch. 1975; 25(11): 1796-1800
- 6) Pala G, et al.: Arch Int Pharmacodyn. 1966; 164(2): 356-369
- 7) Forth W, et al.: Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol. 1972; 274(1): 46-53
- 8) 岩城製薬株式会社 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

岩城製薬株式会社 マーケティング部 学術グループ
〒103-8434 東京都中央区日本橋本町4-8-2
TEL 03-6626-6251 FAX 03-6626-6261

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



岩城製薬株式会社

東京都中央区日本橋本町4-8-2