

貯法：室温保存

有効期間：3年

承認番号 22500AMX00527000

販売開始 1996年7月

## 緩下剤

ピコスルファートナトリウム水和物錠

ピコスルファートナトリウム錠2.5mg 「日医工」  
Sodium Picosulfate Tablets

## 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

|      |   |
|------|---|
| 販売名  | ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「日医工」  |
| 有効成分 | 1錠中<br>ピコスルファートナトリウム水和物<br>2.5mg  |
| 添加剤  | 乳糖水和物、ヒドロキシプロピルスターチ、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、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、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ |

## 3.2 製剤の性状

|         |                          |  |
|---------|--------------------------|--|
| 販売名     | ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「日医工」 |  |
| 剤形      | フィルムコーティング錠              |  |
| 色調      | 白色                       |  |
| 外形      | 表面                       |  |
|         | 裏面                       |  |
|         | 側面                       |  |
| 直径 (mm) | 6.1                      |  |
| 厚さ (mm) | 3.1                      |  |
| 質量 (mg) | 92                       |  |
| 本体コード   | n 111                    |  |
| 包装コード   | @111                     |  |

## 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ソベロン液承認時（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

<sup>14</sup>C-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<sup>1)</sup>、<sup>2)</sup>。

## 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ル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<sup>1)</sup>、<sup>3)</sup>。

## 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<sup>1)</sup>、<sup>3)</sup>。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<sup>1)</sup>、<sup>3)</sup>。

ラットに<sup>14</sup>C-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時間ま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<sup>1)</sup>。

## 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<sup>4)</sup>。

| 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ル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）<sup>5)</sup>、<sup>6)</sup>。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）<sup>7)</sup>

・水分吸収阻害作用（ラット）<sup>8)</sup>

## 18.2 生物学的同等性試験

下記の薬効比較試験の結果、ピコスルファートナトリウム錠2.5mg「日医工」とラキソベロン錠2.5mgの生物学的同等性が確認された<sup>9)</sup>。

（ラットにピコスルファートナトリウム水和物2.5～10mgを胃内投与；n=8～10）

## 18.2.1 腸管蠕動運動亢進作用

累積瀉下効果発現率から50%瀉下有効量ならびに95%信頼限界をLitchfield and Wilcoxon法により算出した。

## 18.2.2 水分吸収阻害作用

糞便の外観形状の差をWilcoxon法により、また、糞便中水分率の差をt検定により算出した。（p<0.05）

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：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：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

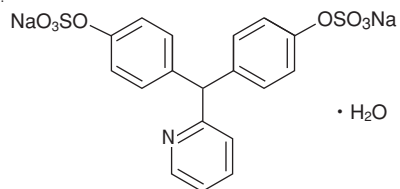
分子量：499.42

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。

化学構造式：



## 22. 包装

100錠 [10錠×10；PTP]  
1000錠 [10錠×100；PTP]

## 23. 主要文献

- 1) Jauch R., et al. : *Arzneim-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. : *Arzneim-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 : 生物学的の同等性試験

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

日医工株式会社 お客様サポートセンター  
〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21  
TEL (0120) 517-215  
FAX (076) 442-8948

## 26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



**日医工株式会社**  
NICHIKO 富山市総曲輪1丁目6番21