

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領(1998年9月)に準拠して作成

緩下剤

**ピコスルファットカプセル2.5mg**

PICOSULFAT CAPSULE 2.5 mg

ピコスルファートナトリウム水和物カプセル

剤形	軟カプセル剤
規格・含量	1カプセル中日本薬局方ピコスルファートナトリウム水和物2.5mg含有
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	2007年8月31日（販売名変更に伴う承認）
薬価基準収載年月日	2007年12月（販売名変更に伴う収載）
発売年月日	1992年9月
製造・輸入・販売会社名	製造販売元：東洋カプセル株式会社
担当者の連絡先 電話番号・FAX番号	

本IFは2007年12月改訂の添付文書に基づき改訂した。

## IF 利用手引きの概要—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

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR と略す)等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会(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)として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けと IF 記載要領が策定された。

### 2. IF とは

IF は「医療用医薬品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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報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。

### 3. IF の様式・作成・発行

規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価(臨床試験実施による)がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

### 4. IF の利用にあたって

IF 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。

MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update(医薬品安全対策情報)等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全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」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

# 目 次

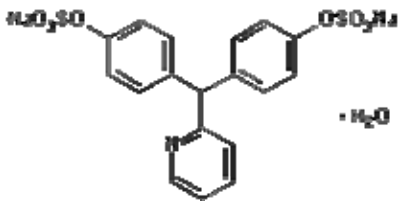
1. 概要に関する項目	1	5. 治療に関する項目	6
1-1 開発の経緯	1	5-1 効能又は効果	6
1-2 製品の特徴及び有用性	1	5-2 用法及び用量	6
2. 名称に関する項目	2	5-3 臨床成績	6
2-1 販売名	2	1) 臨床効果	6
1) 和名	2	2) 臨床薬理試験：忍容性試験	6
2) 洋名	2	3) 探索的試験：用量反応探索試験	6
2-2 一般名	2	4) 検証的試験	6
1) 和名(命名法)	2	(1) 無作為化平行用量反応試験	6
2) 洋名(命名法)	2	(2) 比較試験	6
2-3 構造式又は示性式	2	(3) 安全性試験	6
2-4 分子式及び分子量	2	(4) 患者・病態別試験	6
2-5 化学名(命名法)	2	5) 治療的使用	6
2-6 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験	6
2-7 CAS登録番号	2	(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	6
3. 有効成分に関する項目	3	6. 薬効薬理に関する項目	7
3-1 有効成分の規制区分	3	6-1 薬理学的に関連のある化合物又は化合物群	7
3-2 物理化学的性質	3	6-2 薬理作用	7
1) 外観・性状	3	1) 作用部位・作用機序	7
2) 溶解性	3	2) 薬効を裏付ける試験成績	7
3) 吸湿性	3	7. 薬物動態に関する項目	8
4) 融点(分解点)・沸点・凝固点	3	7-1 血中濃度の推移・測定法	8
5) 酸塩基解離定数	3	1) 治療上有効な血中濃度	8
6) 分配係数	3	2) 最高血中濃度到達時間	8
7) その他の主な示性値	3	3) 通常用量での血中濃度	8
3-3 有効成分の各種条件下における安定性	3	4) 中毒症状を発現する血中濃度	8
3-4 有効成分の確認試験法	3	7-2 薬物速度論的パラメーター	8
3-5 有効成分の定量法	3	1) 吸収速度定数	8
4. 製剤に関する項目(内用剤)	4	2) バイオアベイラビリティ	8
4-1 剤形	4	3) 消失速度定数	8
1) 剤形の区別及び性状	4	4) クリアランス	8
2) 製剤の物性	4	5) 分布容積	8
3) 識別コード	4	6) 血漿蛋白結合率	8
4-2 製剤の組成	4	7) AUC	8
1) 有効成分(活性成分)の含量	4	7-3 吸収	8
2) 添加物	4	7-4 分布	8
4-3 製剤の各種条件下における安定性	4	1) 血液-脳関門通過性	8
4-4 他剤との配合変化(物理化学的変化)	4	2) 胎児への移行性	8
4-5 混入する可能性のある來雑物	5	3) 乳汁中への移行性	8
4-6 溶出試験	5	4) 髄液への移行性	9
4-7 製剤中の有効成分の確認試験法	5	5) その他の組織への移行性	9
4-8 製剤中の有効成分の定量法	5	7-5 代謝	9
4-9 力価	5	1) 代謝部位及び代謝経路	9
4-10 容器の材質	5		
4-11 その他	5		

2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種	9	10-7 国際誕生年月日	12
3) 初回通過効果の有無及びその割合	9	10-8 製造・輸入承認年月日及び承認番号	12
4) 代謝物の活性の有無及び比率	9	10-9 薬価基準収載年月日	12
5) 活性代謝物の速度論的パラメーター	9	10-10 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	12
7-6 排泄	9	10-11 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	12
1) 排泄部位	9	10-12 再審査期間	12
2) 排泄率	9	10-13 長期投与の可否	12
3) 排泄速度	9	10-14 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	12
7-7 透析等による除去率	9	10-15 保険給付上の注意	12
1) 腹膜透析	9		
2) 血液透析	9		
3) 直接血液灌流	9		
<b>8. 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	<b>10</b>	<b>11. 文献</b>	<b>13</b>
8-1 警告内容とその理由	10	11-1 引用文献	13
8-2 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	10	11-2 文献請求先	13
8-3 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	10	<b>12. 参考資料</b>	<b>13</b>
8-4 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	10	<b>13. 備考</b>	<b>13</b>
8-5 慎重投与内容とその理由	10		
8-6 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	10		
8-7 相互作用	10		
8-8 副作用	10		
8-9 高齢者への投与	10		
8-10 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	10		
8-11 小児等への投与	10		
8-12 臨床検査結果に及ぼす影響	10		
8-13 過量投与	10		
8-14 適用上及び薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)	10		
8-15 その他の注意	10		
8-16 その他	10		
<b>9. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>11</b>		
9-1 一般薬理	11		
9-2 毒性	11		
1) 単回投与毒性試験	11		
2) 反復投与毒性試験	11		
3) 生殖発生毒性試験	11		
4) その他の特殊毒性	11		
<b>10. 取扱い上の注意等に関する項目</b>	<b>12</b>		
10-1 有効期間又は使用期限	12		
10-2 貯法・保存条件	12		
10-3 薬剤取扱い上の注意点	12		
10-4 承認条件	12		
10-5 包装	12		
10-6 同一成分・同効薬	12		

## 1. 概要に関する項目

1. 開発の経緯	<p>イタリアの Angelini 社の研究陣は、フェノール性緩下薬の緩下作用とその胃腸への刺激性も本質的にはその構造中の遊離水酸基に基づくものであるという観点から、その水酸基を有機酸や無機酸あるいは短鎖のアルキル基で保護した化合物が検討され、ピサコジル (ピコスルファートナトリウム水和物の 4,4' 一位が Acetoxy 基) などの緩下薬が開発されている。またこれら化合物はグルクロン酸や硫酸抱合対として排泄されることがわかり、ピサコジルのアセチル基を硫酸エステル基に代えた水溶性のピコスルファートナトリウム水和物が経口用薬として登場した。</p> <p>本剤は、1992年9月より「ピコスルファートカプセル」として販売を開始し、2007年12月に医療事故防止対策の観点から販売名を「ピコスルファートカプセル 2.5 mg」に変更した。</p>
2. 製品の特徴及び有用性	




## 2. 名称に関する項目

1. 販売名	1) 和名 ピコスルファットカプセル 2.5 mg 2) 洋名 PICOSULFAT CAPSULE 2.5 mg
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(JAN) 2) 洋名(命名法) Sodium Picosulfate Hydrate(JAN, INN)
3. 構造式又は示性式	
4. 分子式及び分子量	$C_{18}H_{13}NNa_2O_8S_2 \cdot H_2O$ : 499.42
5. 化学名(命名法)	Disodium 4,4'-(pyridin-2-ylmethylene) bis(phenyl sulfate) monohydrate(IUPAC)
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	
7. CAS 登録番号	10040-45-6

### 3. 有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分	規制区分なし
2. 物理化学的性質	<p>1) 外観・性状 白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。本品は光により徐々に着色する。</p> <p>2) 溶解性 本品は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。 本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 7.4~9.4 である。</p> <p>3) 吸湿性 RH80%以上では、吸湿性を示す。<sup>1)</sup></p> <p>4) 融点(分解点)・沸点・凝固点 該当資料なし</p> <p>5) 塩基解離定数 該当資料なし</p> <p>6) 分配係数 該当資料なし</p> <p>7) その他の主な示性値 吸光度 : <math>E_{1\text{cm}}^{1\%}</math> (263nm) : 120~130(脱水物換算, 4mg, 水, 100ml)<sup>1)</sup></p>
3. 有効成分の各種条件下における安定性	該当資料なし
4. 有効成分の確認試験法	日本薬局方「ピコスルファートナトリウム」確認試験法による (ピリジン環の呈色反応、硫酸エステルの確認試験、紫外可視吸光度測定法、赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法、ナトリウム塩の定性反応)
5. 有効成分の定量法	日本薬局方「ピコスルファートナトリウム」定量法による (電位差滴定法)

#### 4. 製剤に関する項目(内用剤)

<p>1. 剤形</p>	<p>1) 剤形の区別及び性状</p> <table border="1" data-bbox="547 331 1347 535"> <tr> <td>性 状</td> <td colspan="2">乳白色の軟カプセル剤である。</td> </tr> <tr> <td>内 容 物</td> <td colspan="2">無色～帯黄色澄明のやや粘性のある液体である。</td> </tr> <tr> <td>外 形</td> <td style="text-align: center;"></td> <td>直径：6.4mm 重量：160mg</td> </tr> </table> <p>2) 製剤の物性 崩壊試験 本品は日本薬局方一般試験法、崩壊試験法カプセル剤の項により試験するときこれに適合する。 質量偏差試験 本品は日本薬局方一般試験法、質量偏差試験法カプセル剤の項により試験するときこれに適合する。</p> <p>3) 識別コード TC30 (PTP シート上に記載)</p>	性 状	乳白色の軟カプセル剤である。		内 容 物	無色～帯黄色澄明のやや粘性のある液体である。		外 形		直径：6.4mm 重量：160mg																																			
性 状	乳白色の軟カプセル剤である。																																												
内 容 物	無色～帯黄色澄明のやや粘性のある液体である。																																												
外 形		直径：6.4mm 重量：160mg																																											
<p>2. 製剤の組成</p>	<p>1) 有効成分(活性成分)の含量 1 カプセル中日本薬局方ピコスルファートナトリウム 2.5mg</p> <p>2) 添加物 マクロゴール 400、濃グリセリン カプセル本体にゼラチン、濃グリセリン、D-ソルビトール液(70%)、パラオキシ安息香酸エチル、パラオキシ安息香酸プロピル、酸化チタン</p>																																												
<p>3. 製剤の各種条件下における安定性</p>	<p>安全性試験における安定性</p> <table border="1" data-bbox="536 1234 1358 1912"> <thead> <tr> <th>保存条件</th> <th>保存形態</th> <th>保存期間</th> <th>試験結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td rowspan="3">室温</td> <td rowspan="3">PTP 包装/紙箱詰め (市販包装形態)</td> <td>1 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>3 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>6 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td rowspan="3">室温</td> <td rowspan="3">バラ包装</td> <td>1 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>3 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>6 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td rowspan="3">温度 40° (±1°) 湿度 75%RH (±5%)</td> <td rowspan="3">PTP 包装/紙箱詰め (市販包装形態)</td> <td>1 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>3 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>6 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td rowspan="3">温度 40° (±1°) 湿度 75%RH (±5%)</td> <td rowspan="3">バラ包装</td> <td>1 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>3 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>6 ヶ月</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td rowspan="3">光 蛍光灯下 (2000 ルクス、 8hr/day)</td> <td rowspan="3">開放状態</td> <td>1 週間</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>2 週間</td> <td>変化なし</td> </tr> <tr> <td>4 週間</td> <td>変化なし</td> </tr> </tbody> </table> <p>試験項目：性状、確認試験、質量偏差試験、崩壊試験、定量試験<sup>2)</sup></p>	保存条件	保存形態	保存期間	試験結果	室温	PTP 包装/紙箱詰め (市販包装形態)	1 ヶ月	変化なし	3 ヶ月	変化なし	6 ヶ月	変化なし	室温	バラ包装	1 ヶ月	変化なし	3 ヶ月	変化なし	6 ヶ月	変化なし	温度 40° (±1°) 湿度 75%RH (±5%)	PTP 包装/紙箱詰め (市販包装形態)	1 ヶ月	変化なし	3 ヶ月	変化なし	6 ヶ月	変化なし	温度 40° (±1°) 湿度 75%RH (±5%)	バラ包装	1 ヶ月	変化なし	3 ヶ月	変化なし	6 ヶ月	変化なし	光 蛍光灯下 (2000 ルクス、 8hr/day)	開放状態	1 週間	変化なし	2 週間	変化なし	4 週間	変化なし
保存条件	保存形態	保存期間	試験結果																																										
室温	PTP 包装/紙箱詰め (市販包装形態)	1 ヶ月	変化なし																																										
		3 ヶ月	変化なし																																										
		6 ヶ月	変化なし																																										
室温	バラ包装	1 ヶ月	変化なし																																										
		3 ヶ月	変化なし																																										
		6 ヶ月	変化なし																																										
温度 40° (±1°) 湿度 75%RH (±5%)	PTP 包装/紙箱詰め (市販包装形態)	1 ヶ月	変化なし																																										
		3 ヶ月	変化なし																																										
		6 ヶ月	変化なし																																										
温度 40° (±1°) 湿度 75%RH (±5%)	バラ包装	1 ヶ月	変化なし																																										
		3 ヶ月	変化なし																																										
		6 ヶ月	変化なし																																										
光 蛍光灯下 (2000 ルクス、 8hr/day)	開放状態	1 週間	変化なし																																										
		2 週間	変化なし																																										
		4 週間	変化なし																																										

4. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)	該当資料なし
5. 混入する可能性のある 来雑物	該当資料なし
6. 溶出試験	該当資料なし
7. 製剤中の有効成分の 確認試験法	<p>1) 内容物に2,4-ジニクロルベンゼンを加えて混合し、5~6秒間穏やかに加熱して融解し、冷後、水酸化カリウム・エタノール試液を加えるとき、液はだいたい赤色を呈する。<sup>2)</sup></p> <p>2) 内容物に希塩酸を加え、5分間煮沸し、冷後、塩化バリウム試液を加えるとき、白色の沈殿を生じる。<sup>2)</sup></p> <p>3) 内容物に水を加えた液につき、日本薬局方一般試験、吸光度試験を行うとき、波長262~264nmに吸収の極大を、268~270nmに吸収の肩を示す。<sup>2)</sup></p>
8. 製剤中の有効成分の 定量法	<p>液体クロマトグラフ法による</p> <p>検出器：紫外吸光光度計(測定波長 264nm)</p> <p>カラム：内径4.6mm、長さ250mmのステンレス管に5<math>\mu</math>mのオクタデシルシリル化シリカゲルを充填したもの。</p> <p>カラム温度：40° 付近の一定温度</p> <p>移動相：リン酸溶液・メタノール混液(7:3)</p> <p>流量：ピコスルファートナトリウムの保持時間が4~6分になるように調整する。</p> <p>カラムの選定：標準溶液10<math>\mu</math>lにつき、上記の条件で操作するとき、ピコスルファートナトリウム、カフェイン(内標準物質)の順に溶出し、分離度が2.0以上のものを用いる。</p> <p>注)内標準溶液：無水カフェイン溶液<sup>2)</sup></p>
9. 力価	該当しない
10. 容器の材質	PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔
11. その他	

## 5. 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	<p>1) 各種便秘症には、通常、成人に対して1日1回2～3カプセル(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歳以上の小児に対しては、1日1回2カプセル(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。</p> <p>2) 術後排便補助には、通常、成人に対して1日1回2～3カプセル(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。</p> <p>3) 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2～3カプセル(ピコスルファートナトリウム水和物として3.0～7.5mg)を経口投与する。</p>
3. 臨床成績	<p>1) 臨床効果 6施設で140症例について臨床試験を実施し、次のような成績が得られた。</p> <p>(1) 各種便秘症 各種便秘症に対しては、67.7%(63/93)が有効以上、87.1%(81/93)がやや有効以上と判定された。 また、投与後の排出便はほとんどの症例が軟便によるものであった。 随伴症状(腹痛、腹部膨満感、食欲不振、悪心・嘔吐)については、便通状態の改善とともに軽快した。<sup>3)～6)</sup></p> <p>(2) 造影剤(硫酸バリウム)の排便促進 造影剤の排便促進に対しては、93.6%(44/47)が有効以上、95.7%(45/47)がやや有効以上と判定された。<sup>3)～6)</sup></p> <p>2) 臨床薬理試験：忍容性試験 該当資料なし</p> <p>3) 探索的試験：用量反応探索試験 該当資料なし</p> <p>4) 検証的試験</p> <p>(1) 無作為化平行用量反応試験 該当資料なし</p> <p>(2) 比較試験 該当資料なし</p> <p>(3) 安全性試験 該当資料なし</p> <p>(4) 患者・病態別試験 該当資料なし</p> <p>5) 治療的使用</p> <p>(1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験 該当資料なし</p> <p>(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 該当資料なし</p>

## 6. 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	ピサコジル
2. 薬理作用	<p>1) 作用部位・作用機序  胃、小腸ではほとんど作用せず、大腸の蠕動運動を亢進させ、緩和な瀉下作用を示す。経口投与後はほとんど吸収されることなく大腸部位にそのまま到達した後、大腸細菌叢由来のアリルスルファターゼにより加水分解されて活性型のジフェノール体を生じ、このジフェノール体が大腸粘膜を刺激し、蠕動運動を亢進させると共に水分吸収を阻害することにより、緩下作用が現れる。また一部吸収されたものはジフェノール体として胆汁中に排泄されるが、やはり大腸部位で局所的に作用するものと考えられている。<sup>1)</sup></p> <p>2) 薬効を裏付ける試験成績  該当資料なし</p>

## 7. 薬物動態に関する項目

<p>1. 血中濃度の推移、測定法</p>	<p>1) 治療上有効な血中濃度 該当資料なし</p> <p>2) 最高血中濃度到達時間 該当資料なし</p> <p>3) 通常用量での血中濃度 健常人に、ピコスルファートナトリウム 5, 7.5, 10, 15mg を経口投与したが、定量限界値(0.5 μg/ml)以下で検出できなかった。<sup>8)</sup></p> <p>4) 中毒症状を発現する血中濃度 該当資料なし</p>
<p>2. 薬物速度論的パラメーター</p>	<p>1) 吸収速度定数 該当資料なし</p> <p>2) バイオアベイラビリティ 該当資料なし</p> <p>3) 消失速度定数 該当資料なし</p> <p>4) クリアランス 該当資料なし</p> <p>5) 分布容積 該当資料なし</p> <p>6) 血漿蛋白結合率 該当資料なし</p> <p>7) AUC 該当資料なし</p>
<p>3. 吸収</p>	<p>ラットでは大部分はふん便と共に排泄され、一部吸収されたものは肝で更にグルクロン酸抱合を受けた後、尿中及び胆汁中に排泄される。<sup>1)</sup></p>
<p>4. 分布</p>	<p>1) 血液-脳関門通過性 該当資料なし</p> <p>2) 胎児への移行性 該当資料なし</p> <p>3) 乳汁中への移行性 該当資料なし</p> <p>4) 髄液への移行性 該当資料なし</p> <p>5) その他の組織への移行性 該当資料なし</p>
<p>5. 代謝</p>	<p>1) 代謝部位及び代謝経路 ラットにおいて、経口的に投与された本剤は、小腸内で加水分解されず大腸に移行し、大腸の微生物叢の働きにより、ジフェノール体に加水分解される。生成したジフェノール体の一部は吸収されて肝臓でグルクロン酸抱合をうける。<sup>8)</sup></p> <p>2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種 該当資料なし</p> <p>3) 初回通過効果の有無及びその割合 該当資料なし</p>

	<p>4) 代謝物の活性の有無及び比率 大腸での、加水分解物であるジフェノール体が、蠕動運動亢進活性がある。<sup>8)</sup></p> <p>5) 活性代謝物の速度論的パラメーター 該当資料なし</p>
<p>6. 排泄</p>	<p>1) 排泄部位 該当資料なし</p> <p>2) 排泄率 ラットにおいて、<sup>14</sup>C-ピコスルファートナトリウム 5mg/kg を経口投与し、72 時間で投与量の 21%が尿中に、72%が糞中に排泄された。<sup>8)</sup></p> <p>3) 排泄速度 ラットにおいて、<sup>14</sup>C-ピコスルファートナトリウム 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。<sup>8)</sup></p>
<p>7. 透析等による除去率</p>	<p>1) 腹膜透析 該当資料なし</p> <p>2) 血液透析 該当資料なし</p> <p>3) 直接血流灌流 該当資料なし</p>

### 8. 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	該当資料なし								
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	<p style="text-align: center;"><b>【禁忌(次の患者には投与しないこと)】</b></p> <p>1) 急性腹症が疑われる患者 [腸管蠕動運動の亢進により、症状が悪化するおそれがある。]</p> <p>2) 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者</p>								
3. 効能・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・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	<p>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。</p> <table border="1" style="margin-left: auto; margin-right: auto;"> <tr> <td></td> <td style="text-align: center;">頻度不明</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">消 化 器</td> <td>腹部不快感、腹痛、悪心、嘔吐、腹鳴、腹部膨満感、下痢等</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">皮 膚</td> <td>蕁麻疹、発疹等</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">肝 臓</td> <td>GOT 上昇、GPT 上昇等</td> </tr> </table>		頻度不明	消 化 器	腹部不快感、腹痛、悪心、嘔吐、腹鳴、腹部膨満感、下痢等	皮 膚	蕁麻疹、発疹等	肝 臓	GOT 上昇、GPT 上昇等
	頻度不明								
消 化 器	腹部不快感、腹痛、悪心、嘔吐、腹鳴、腹部膨満感、下痢等								
皮 膚	蕁麻疹、発疹等								
肝 臓	GOT 上昇、GPT 上昇等								
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	妊娠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. 適用上及び薬剤交付 時の注意 (患者等に留意すべき 必須事項等)	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。]								
15. その他の注意	該当資料なし								
16. その他									

## 9. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理	該当資料なし
2. 毒性	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

## 10. 取扱い上の注意等に関する項目

1. 有効期限又は使用期限	使用期限：3年(外箱に表示の使用期限内に使用すること)
2. 貯法・保存条件	室温保存
3. 薬剤取扱い上の注意点	該当資料なし
4. 承認条件	なし
5. 包装	PTP：500 カプセル、1,000 カプセル
6. 同一成分・同効薬	ラキソベロン液
7. 国際誕生年月日	不明
8. 製造・輸入承認年月日 及び承認番号	製造承認年月日：2007年8月31日(販売名変更に伴う承認) 〔ピコスルファットカプセルとして1991年1月25日〕 承認番号：21900AMZ01329000(販売名変更に伴う承認) 〔ピコスルファットカプセルとして20300AMZ01011000〕
9. 薬価基準収載年月日	2007年12月21日(販売名変更に伴う薬価収載) 〔ピコスルファットカプセルとして1992年7月収載〕
10. 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	該当資料なし
11. 再審査結果、 再評価結果公表 年月日及びその内容	再評価公表年月日：2004年2月23日 内容：公的溶出試験規格が定められた。(品質評価)
12. 再審査期間	該当しない
13. 長期投与の可否	該当しない
14. 厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	2171014M2275
15. 保険給付上の注意	なし

## 11. 文献

1. 引用文献	1) “第15改正日本薬局方”解説書 じほう, 東京, 2006, pp. C-3212-C-3216. 2) 東洋カプセル株式会社 社内資料 3) 佐々木大輔 他 : progress in Medicine, 9(6), 1880, 1989. 4) 市井吉三郎 他 : progress in Medicine, 9(6), 1888, 1989. 5) 久保 明良 他 : progress in Medicine, 9(6), 1897, 1989. 6) 久保 明良 他 : progress in Medicine, 9(6), 1907, 1989. 7) 北里研究所 未発表 8) “日本薬局方 医薬品情報 2001,” じほう, 東京, 2001, pp. 1396-1399.
2. 文献請求先	東洋カプセル株式会社 〒418-0046 静岡県富士宮市中里東町 560

## 12. 参考資料

--	--

## 13. 備考

--	--