

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 2013 に準拠して作成

緩下剤

ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「FSK」

Sodium Picosulfate Tablets 2.5mg “FSK”

剤形	錠剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中 日局 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 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2019年6月26日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2019年12月13日（販売名変更による） 発売年月日：2000年11月1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：株式会社 伏見製薬所 発売元：伏見製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	伏見製薬株式会社 営業企画部 TEL：03-5328-7801／FAX：03-5328-7802 受付時間：8時30分～17時（土、日、祝日を除く） 医療関係者向けホームページ： http://www.fushimi.co.jp/

本 IF は 2019 年 12 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要—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

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（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）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独) 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ (<http://www.info.pmda.go.jp/>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切に審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「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、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの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。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。

- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。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、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の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」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	2. 用法及び用量	10
1. 開発の経緯	1	3. 臨床成績	10
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	VI. 薬効薬理に関する項目	12
II. 名称に関する項目	2	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12
1. 販売名	2	2. 薬理作用	12
2. 一般名	2	VII. 薬物動態に関する項目	14
3. 構造式又は示性式	2	1. 血中濃度の推移・測定法	14
4. 分子式及び分子量	2	2. 薬物速度論的パラメータ	14
5. 化学名（命名法）	2	3. 吸収	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	4. 分布	15
7. CAS登録番号	2	5. 代謝	15
III. 有効成分に関する項目	3	6. 排泄	15
1. 物理化学的性質	3	7. トランスポーターに関する情報	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	8. 透析等による除去率	16
3. 有効成分の確認試験法	3	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
4. 有効成分の定量法	4	1. 警告内容とその理由	17
IV. 製剤に関する項目	5	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17
1. 剤形	5	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	17
2. 製剤の組成	5	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	5. 慎重投与内容とその理由	17
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	7. 相互作用	17
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7	8. 副作用	18
7. 溶出性	7	9. 高齢者への投与	19
8. 生物学的試験法	8	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	11. 小児等への投与	19
10. 製剤中の有効成分の定量法	8	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
11. 力価	8	13. 過量投与	19
12. 混入する可能性のある夾雑物	8	14. 適用上の注意	19
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	9	15. その他の注意	19
14. その他	9		
V. 治療に関する項目	10		
1. 効能又は効果	10		

16.	その他.....	19	12.	効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	23
IX.	非臨床試験に関する項目	20	13.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	24
1.	薬理試験	20	14.	再審査期間	24
2.	毒性試験	20	15.	投薬期間制限医薬品に関する情報.....	24
X.	管理的事項に関する項目	22	16.	各種コード	24
1.	規制区分	22	17.	保険給付上の注意	24
2.	有効期間又は使用期限	22	XI.	文献.....	25
3.	貯法・保存条件	22	1.	引用文献.....	25
4.	薬剤取扱い上の注意点	22	2.	その他の参考文献	25
5.	承認条件等	22	XII.	参考資料.....	26
6.	包装	22	1.	主な外国での発売状況.....	26
7.	容器の材質	22	2.	海外における臨床支援情報.....	26
8.	同一成分・同効薬	23	XIII.	備考.....	27
9.	国際誕生年月日	23	1.	その他の関連資料	27
10.	製造販売承認年月日及び承認番号.....	23			
11.	薬価基準収載年月日	23			

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯¹⁾

ピコスルファートナトリウム水和物は1964年イタリアのデ・アンジェリ社において合成された緩下剤である。フェノール系緩下剤の瀉下作用が原理的にはその構造中の遊離水酸基に基づくものであることより、その水酸基を種々ブロックして、種々の化合物が合成された。その瀉下作用を検討した結果、胃・小腸で殆ど作用せず、大腸において細菌叢由来の酵素により加水分解されてジフェノール体となり、優れた緩下作用を発揮するピコスルファートナトリウム水和物が発見された。ピコスルファートナトリウム水和物は液剤型緩下剤としてそのおだやかですぐれた効果により広く使用され高い評価を得ているが、その後服用の簡便化を計り錠剤化して承認された。

ピコスルファートナトリウム水和物は12局より収載されている。

当社では2000年8月に「ファースルー錠」の承認を取得、2000年11月に販売開始した。

その後、2008年3月に「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成12年9月19日付医薬発第935号厚生省医薬安全局長通知）に基づき、販売名を「ファースルー錠 2.5mg」に変更した。

更に、2019年12月に「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成17年9月22日付薬食審査発第0922001号厚生労働省医薬食品局審査管理課長通知）に基づき、販売名を「ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「FSK」」に変更して販売を継続している。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 刺激性の緩下剤で、便秘症の他に術後排便補助、造影剤排出促進などの適応を持つ。[「V. 治療に関する項目」1. 効能又は効果の項参照][「VI. 薬効薬理に関する項目」2. 薬理作用の項参照]
- (2) 通常、成人に対し1日1回経口投与する。年齢、症状により適宜増減する。[「V. 治療に関する項目」2. 用法及び用量の項参照]
- (3) 急性腹症が疑われる患者、また本剤の成分に対して過敏症のある患者に使用しないこと。[「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）の項参照]

II. 名称に関する項目

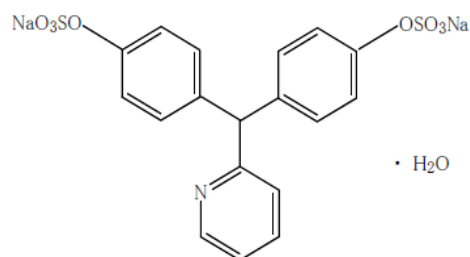
1. 販売名

- (1) 和名：ピコスルファートナトリウム錠 2.5 mg 「F S K」
- (2) 洋名：Sodium Picosulfate Tablets 2.5 mg “F S K”
- (3) 名称の由来：一般的名称

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) ステム：特になし

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₈H₁₃NNa₂O₈S₂·H₂O

分子量：499.42 (IUPAC 式)

5. 化学名（命名法）

Disodium 4,4'-(pyridin-2-ylmethylene) bis (phenyl sulfate) monohydrate (IUPAC 式)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

治験番号：PS-T (錠剤)

7. CAS 登録番号

10040-45-6 [無水物]

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性粉末で、におい及び味はない。光により徐々に着色する。¹⁹⁾

(2) 溶解性

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。¹⁹⁾

(3) 吸湿性

80%RH 以上では、吸湿性を示す。²⁾

水分：3.0～4.5%（0.5g、容量滴定法、直接滴定）

本品に含まれる水は結晶水で、水分含量の理論値は 3.61%である。1 水塩である本品は吸湿性を示さないが、乾燥物は吸湿性が強い。¹⁹⁾

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：260℃以上（分解）乾燥後²⁾

(5) 酸塩基解離定数

pKa：5.50（滴定法）²⁾

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

吸光度：E_{1cm}^{1%}（263nm）：120～130（脱水物換算、4mg、水、100mL）¹⁹⁾

pH：本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 7.4～9.4 である。¹⁹⁾

2. 有効成分の各種条件下における安定性²⁾

熱に対する安定性	気密容器・室温で 36 ヶ月、45℃で 12 ヶ月間安定である。
温度、湿度に対する安定性	湿度に対しては、比較的影響を受けやすく、85%RH 開放保存で、水分含有量は 15～16%（25℃）、20%以上（45℃）に増加する。
光に対する安定性	室内散光 12 ヶ月では、ほとんど影響はない。直射日光により変色する。

3. 有効成分の確認試験法

- ・ピリジン環の呈色反応（Vongerichten 反応）
 - ・塩化バリウムによる定性反応（硫酸エステルの確認）
 - ・紫外可視吸光度測定法
 - ・赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
 - ・ナトリウム塩の定性反応
-

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法

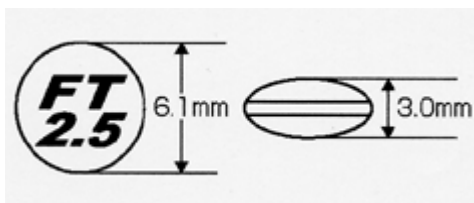
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

剤形の区別：白色フィルムコーティング錠

外観及び性状：直径 6.1mm 厚さ 3.0mm 重量 78mg



(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

FT2.5

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1錠中 日局 ピコスルファートナトリウム水和物 2.5mg 含有

(2) 添加物

結晶セルロース、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルスターチ、精製白糖、酸化チタン、プロピレングリコール、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸Mg、青色2号を含有する。

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 室温における長期安定性³⁾

ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」長期安定性 (PTP 包装、室温保存、4 年間)

PTP		試験開始時	6ヶ月	1年	2年	3年	4年
	外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	崩壊 (分)	8.58	7.50	5.25	6.83	5.83	6.50
	含量 (%)	101.5	102.0	100.6	103.0	101.8	103.0

(2) 加速試験³⁾

ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」加速試験 (PTP 包装、40°C75%RH、6ヶ月間)

PTP		試験開始時	1ヶ月	2ヶ月	4ヶ月	6ヶ月
	外観	異常なし				異常なし
	崩壊 (分)	3.75~4.83				3.67~4.42
	含量 (%)	102.63				102.55

(3) 室温における粉砕後の安定性³⁾

ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」を乳鉢にて粉砕後薬包紙に分包し、ポリ袋に入れ保存 (24°C±2°C、55±20%RH、2週間)

	1週間	2週間
外観	異常なし	異常なし
含量 (%)	100.2	99.4

※上記の条件、期間では安定であったが、ピコスルファートナトリウム水和物は光により着色しやすいため、粉砕後の保存は十分注意すること。

(4) 錠剤の無包装状態の安定性 (参考)³⁾

① ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」無包装の安定性 (25°C75%RH、3ヶ月間)

	試験開始時	2週間	4週間	2ヶ月	3ヶ月	判定
外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	◎
硬度 (N)	58.3±9.5	34.3±1.4	35.7±2.4	44.0±3.8	40.3±5.2	○
含量 (%)	99.0	101.8	101.0	100.4	101.4	◎
溶出率 (%) (15分*)	100.4±0.9	100.8±1.1	101.6±1.2	101.9±0.9	101.9±1.1	◎ n=6 全例適合

② ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」 無包装の安定性 (40°C、3ヶ月間)

	試験開始時	1ヶ月	2ヶ月	3ヶ月	判定
外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	◎
硬度 (N)	58.3±9.5	53.0±4.1	54.7±4.2	49.0±6.3	◎
含量 (%)	99.0	102.8	100.9	100.9	◎
溶出率 (%) (15分※)	100.4±0.9	101.3±0.5	101.6±2.0	101.3±0.7	◎ n=6 全例適合

③ ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」 無包装の光安定性 (フェードテスターによる照射)

	試験前	120万 Lux・hr 遮光	120万 Lux・hr 曝光	判定
外観	異常なし	異常なし	異常なし	◎
硬度 (N)	58.3±9.5	53.2±3.3	56.2±5.3	◎
含量 (%)	99.0	100.8	99.8	◎
溶出率 (%) (15分※)	100.4±0.9	99.4±0.5	103.6±1.5	◎ n=6 全例適合

(※) 局外規第3部溶出試験：ピコスルファートナトリウム錠 試験液：水 規格 15分 80%以上

判定：◎規格内で変化をほとんど認めない。○規格内でわずかな変化がある。△規格外の変化がある。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当資料なし

7. 溶出性

(1) 溶出規格⁴⁾

試験方法：日局溶出試験法第2法 (パドル法)

試験条件：回転数 50rpm

試験液：水

日本薬局方一般試験・溶出試験第2法 (パドル法) に従い試験を行った結果、15分間の溶出率が80%以上であり、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試験に適合していることを確認した。

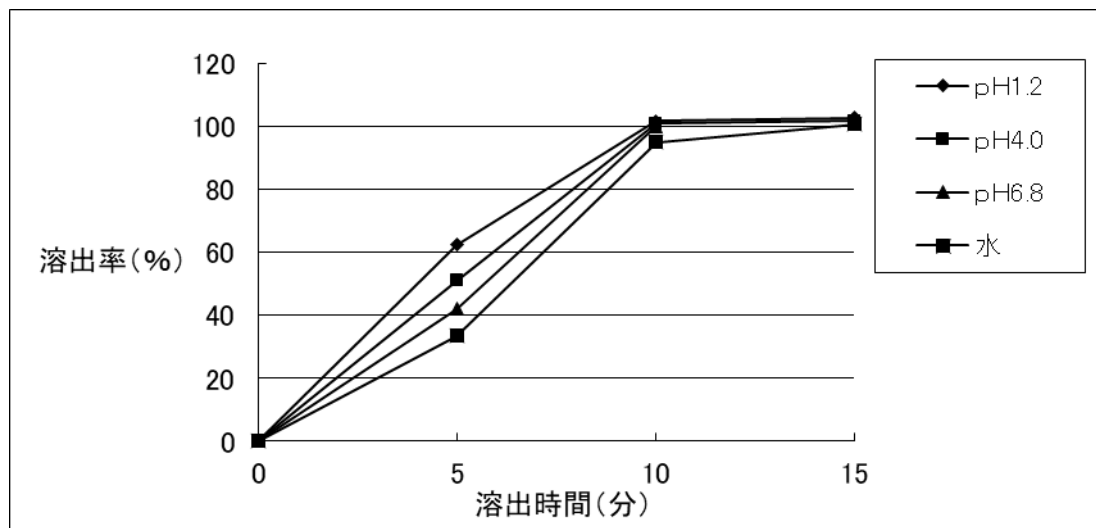
(2) 溶出曲線⁴⁾

試験方法：日局溶出試験法第2法（パドル法）

試験条件：回転数 50rpm

試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8 のリン酸塩緩衝液及び水

結果：溶出曲線を以下に示す。



8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- ・塩化バリウムによる定性反応(硫酸エステルの確認)
- ・紫外可視吸光度測定法（吸収極大：261～265nm）
- ・薄層クロマトグラフ法

10. 製剤中の有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法（測定波長：263nm）

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 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

○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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果^{5)～17)}

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）
褥婦の便秘症	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）

(3) 臨床薬理試験

1) 忍容性試験（単回、反復）

該当資料なし

2) 薬力学的試験

該当資料なし

3) QT/QTc 評価試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

造影剤投与後の排便促進を目的としてピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」と市販液剤を非盲検法で1回 5.0～7.5mg（ピコスルファートナトリウム水和物として）をX線検査終了後に経口投与した。

その結果、有効率（有効以上）は、ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」100%、市販液剤 100%で、無効例（試験期間内排便なし）はなく、両群間に有意な差はみられなかった。¹⁷⁾

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当しない

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

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

大腸刺激性下剤：センナ、センノシド、ピサコジル、ダイオウ、アロエ

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序^{18)~20)}

作用部位：大腸

ラットにピコスルファートナトリウム水和物を経口投与後、炭末を投与して、胃腸管での通過距離と胃腸管全体（胃・小腸・大腸）の排泄速度を調べた結果、小腸での蠕動運動は亢進させず、大腸の蠕動を亢進させることが認められた。

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と考えられている。（無菌処理したラットでは、ピコスルファートナトリウム水和物は加水分解されず未変化体のままであった。）⁹⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

① 経口投与による瀉下活性²¹⁾

正常ラットに各用量の薬物を粉砕して経口投与し、その後 8 時間まで 2 時間毎に軟便～下痢便を排出しているかどうか（瀉下効果）を観察し、この瀉下効果発現率から 50% 瀉下有効量（ED₅₀）を求めた。

薬剤	ED ₅₀ (mg/kg)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」	1.1
センノシド剤	3.6
生薬配合剤（センナ葉、センナ実）	165.0

② 液剤との錠剤の薬効比較試験²²⁾

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「F S K」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、両剤の生物学的同等性が確認された。

判定パラメータ

健常時および薬剤投与後の糞便中水分率 (%) (Mean±S.D.、3日間、n=10)

薬剤	健常時および薬剤投与後の糞便中水分率 (%)	
	低用量 (10mg/head)	高用量 (40mg/head)
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「F S K」	71.4±4.4	68.0±2.5
標準製剤 (液剤、0.75%)	72.0±4.1	69.0±3.4
健常時	63.1±4.2	

(3) 作用発現時間・持続時間

投与後1日以内に排便がみられ、個人差はあるもののその効果発現は投与後約7~12時間である。²⁾

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

- (1) 治療上有効な血中濃度
該当資料なし
- (2) 最高血中濃度到達時間
該当資料なし
- (3) 臨床試験で確認された血中濃度
該当資料なし
- (4) 中毒域
該当資料なし
- (5) 食事・併用薬の影響
該当資料なし
- (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因
該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) 吸収速度定数
該当資料なし
- (3) バイオアベイラビリティ
該当資料なし
- (4) 消失速度定数
該当資料なし
- (5) クリアランス
該当資料なし
- (6) 分布容積
該当資料なし
- (7) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

- (1) 血液－脳関門通過性
該当資料なし
- (2) 血液－胎盤関門通過性
該当資料なし
- (3) 乳汁への移行性
該当資料なし
- (4) 髄液への移行性
該当資料なし
- (5) その他の組織への移行性
該当資料なし

5. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
経口投与後、胃、小腸ではほとんど吸収されず、大腸細菌叢由来の酵素により加水分解を受け活性化された後、腸管粘膜に作用する。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臓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。¹⁹⁾
- (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種
該当資料なし
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
該当資料なし
- (4) 代謝物の活性の有無及び比率
該当資料なし
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
該当資料なし

6. 排泄

- (1) 排泄部位及び経路
主に糞便及び尿
- (2) 排泄率
該当資料なし
- (3) 排泄速度
該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

VIII. 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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

- (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

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

(3) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

種類\頻度	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	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇等

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧^{5)~17)}

		症 例 数 (%)	
適 応		各種便秘症 術後排便補助	造影剤投与後の排便促進
総症例数		290 例	156 例
副作用発現症例数		3(1.03)	3(1.92)
副 作 用 の 種 類	腹 痛	2(0.69)	2(1.28)
	腹 鳴	—	—
	悪心・嘔吐	—	1(0.64)
	下 痢	1(0.34)	—
	光線過敏症	—	1(0.38)
合 計		3(1.03)	4(2.56)

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

禁忌：本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。

その他の副作用：皮膚（蕁麻疹、発疹等）があらわ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。

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。]

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。）

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」の項 参照）
- (2) 副次的薬理試験
該当資料なし
- (3) 安全性薬理試験
該当資料なし
- (4) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

急性毒性 (LD₅₀ g/kg)²⁾

経口：マウス雄 14.8、雌 15.8、ラット雄 11.3、雌 12.2

(2) 反復投与毒性試験

① 亜急性毒性

ラットにピコスルファートナトリウム水和物を 1、100、7500mg/kg/日 1 ヶ月間経口投与した結果、1mg/kg 投与群では無作用、100、7500mg/kg 両投与群においては激しい下痢、軟便が認められたが、いずれも 24 時間以内に回復した。期間中の死亡率は、7500mg/kg 投与群で雄 12%、雌 16%であった。組織学的異常は腸管上部に僅かに認められただけで、死因は脱水あるいは下痢による栄養失調であった。²³⁾

② 慢性毒性

ラットにピコスルファートナトリウム水和物を 1、10、100mg/kg/日 6 ヶ月間経口投与した結果、1mg/Kg 投与群は無作用、10、100mg/kg 投与群においては緩下作用が持続して現れた。組織学的変化は腸粘膜の浮腫、充血、上皮細胞の剥離亢進等が見られ、亜急性試験より顕著であった。死亡例は見られなかった。²³⁾

(3) 生殖発生毒性試験

妊娠前、妊娠中、授乳期のラット及び妊娠中のウサギにピコスルファートナトリウム水和物を経口投与した。妊娠前の投与では生殖機能影響を及ぼさなかった。器官形成期投与においてラットでは 1000、10000mg/kg で胎仔体重の低下、ウサギでは 1000mg/kg 以上で胎仔死亡数の増加が見られた。また、周産期投与では 10mg/kg 及び 100mg/kg で出生仔重量の減少が見られた。しかし、催奇形性及び生殖能力への影響は認められなかった。²⁴⁾

(4) その他の特殊毒性^{25)~28)}

①細胞毒性

ピコスルファートナトリウム水和物が、ヒト、ラット及びウサギの培養肝細胞に与える影響を検討した結果、かなり高濃度（ラットでは 5mg/kg 以上）でも低細胞毒性であった。

②抗原性及び突然変異原性

ピコスルファートナトリウム水和物のモルモットにおける抗原性及び突然変異誘発性試験を行ったが、ともに認められなかった。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後 3 年

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ.安全性（使用上の注意等）に関する項目」14. 適用上の注意の項 参照

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

PTP 1000 錠(10 錠×100)

7. 容器の材質

PTP 表：ポリ塩化ビニル
裏：アルミ

8. 同一成分・同効薬

(1) 同一成分薬

ラキソベロン内用液 0.75%、ラキソベロン錠 2.5mg 等

(2) 同効薬

膨張性下剤：カルボキシメチルセルロース、ポリカルボフィルカルシウム

浸透圧性下剤（塩類下剤）：酸化マグネシウム、クエン酸マグネシウム、水酸化マグネシウム、
硫酸マグネシウム

（糖類下剤）：ラクツロース、D-ソルビトール、ラクチトール

（浸潤性下剤）：ジオクチルソジウムスルホサクシネート

刺激性下剤：センノシド、センナ、アロエ、ピサコジル

その他：ルビプロストン、リナクロチド、モサプリド、炭酸水素ナトリウム坐剤 等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

	製造販売承認年月日	承認番号
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」	2019年6月26日	30100AMX00050000

旧販売名：ファースルー錠：承認年月日 2000年8月31日

旧販売名：ファースルー錠 2.5mg：承認年月日 2008年3月7日

11. 薬価基準収載年月日

ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」：2019年12月13日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

	再評価結果公表年月日	内容
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「FSK」 (旧販売名：ファースルー錠)	2004年2月23日	品質再評価

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

該当しない

16. 各種コード

販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg「FSK」	114122101	2359005F1277	621412201

17. 保険給付上の注意

該当しない

なお、本剤は診療報酬上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 深井三郎：今日の新薬, 3, 477(1981)
- 2) 日本薬局方医薬品情報集 (JPDI) 薬業時報社 (2011)
- 3) 社内資料
- 4) 社内資料
- 5) 成田光陽他：腎と透析, 27(4), 791(1989)
- 6) 八尾恒良他：医学と薬学, 22(5), 1379(1989)
- 7) 長瀬行之他：基礎と臨床, 24(3), 1483(1990)
- 8) 村上 穆他：基礎と臨床, 22(16), 5860(1988)
- 9) 成田光陽他：基礎と臨床, 23(7), 2679(1989)
- 10) 村井俊介他：基礎と臨床, 24(3), 1303(1990)
- 11) 川村 顕他：医学と薬学, 23(1), 209(1990)
- 12) 村井俊介他：基礎と臨床, 22(14), 4997(1988)
- 13) 山崎秀男他：日消集検誌, 79, 68(1988)
- 14) 折茂 肇他：老年医学, 28(5), 683(1990)
- 15) 柏木征三郎：臨床と研究, 67(5), 1530(1990)
- 16) 熊川宏美他：医学と薬学, 22(5), 1363(1989)
- 17) 増田康治他：臨床と研究, 67(5), 1611(1990)
- 18) Bruzzese T, et al : *Arzneim-Forsch. Drug Res.* , 22(3), 531(1972)
- 19) 第17改正日本薬局方解説書
- 20) Jauch R, et al : *Arzneim-Forsch. Drug Res.* , 25(11), 1796(1975)
- 21) 社内資料
- 22) 上野光一他：薬理と治療, 18(1), 71(1990)
- 23)アレキサンダー・カスト他：医薬品研究, 8(3), 341(1977)
- 24) 西村美知代他：医薬品研究, 8(3), 366(1977)
- 25) J. Nishikawa et al : *Arzneim-Forsch. Drug Res.* , 31(I) No2, 321(1981)
- 26) J. Nishikawa et al : *Arzneim-Forsch. Drug Res.* , 31(I) No6, 1010(1981)
- 27) J. Nishikawa et al : *Arzneim-Forsch. Drug Res.* , 31(II) (11), 1872(1981)
- 28) 上野光一他：医薬品研究, 8(3), 397(1977)

2. その他の参考文献

医療用医薬品品質情報集 (オレンジブック) No. 19 (財) 日本公定書協会編

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

1. その他の関連資料

該当資料なし