

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2018（2019年更新版）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
一般名	和名：ピコスルファートナトリウム水和物（JAN） 洋名：Sodium Picosulfate Hydrate（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	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） 販売開始年月日：2000年11月1日
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：9時～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/for-medical-personnel/)

本IFは2023年12月改訂（第1版）の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IF）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索ページ

(<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5.臨床成績」や「XII.参考資料」、「XIII.備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、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いただきたい。IF は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らが IF の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IF を活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	3. 用法及び用量	10
1. 開発の経緯	1	4. 用法及び用量に関連する注意	10
2. 製品の治療学的特性	1	5. 臨床成績	11
3. 製品の製剤学的特性	1	VI. 薬効薬理に関する項目	12
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	12
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	2. 薬理作用	12
6. RMPの概要	2	VII. 薬物動態に関する項目	14
II. 名称に関する項目	3	1. 血中濃度の推移	14
1. 販売名	3	2. 薬物速度論的パラメータ	14
2. 一般名	3	3. 母集団（ポピュレーション）解析	14
3. 構造式又は示性式	3	4. 吸収	14
4. 分子式及び分子量	3	5. 分布	15
5. 化学名（命名法）又は本質	3	6. 代謝	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	7. 排泄	15
III. 有効成分に関する項目	5	8. トランスポーターに関する情報	16
1. 物理化学的性質	5	9. 透析等による除去率	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	10. 特定の背景を有する患者	16
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	11. その他	16
IV. 製剤に関する項目	6	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
1. 剤形	6	1. 警告内容とその理由	17
2. 製剤の組成	6	2. 禁忌内容とその理由	17
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	17
4. 力価	7	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	17
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	5. 重要な基本的注意とその理由	17
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	17
7. 調製法及び溶解後の安定性	8	7. 相互作用	18
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	8	8. 副作用	18
9. 溶出性	8	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
10. 容器・包装	9	10. 過量投与	18
11. 別途提供される資材類	9	11. 適用上の注意	19
12. その他	9	12. その他の注意	19
V. 治療に関する項目	10	IX. 非臨床試験に関する項目	20
1. 効能又は効果	10	1. 薬理試験	20
2. 効能又は効果に関連する注意	10		

2. 毒性試験	20	11. 再審査期間.....	23
X. 管理的事項に関する項目	22	12. 投薬期間制限に関する情報	23
1. 規制区分	22	13. 各種コード.....	23
2. 有効期間	22	14. 保険給付上の注意.....	24
3. 包装状態での貯法.....	22	XI. 文献	25
4. 取扱い上の注意点.....	22	1. 引用文献.....	25
5. 患者向け資材.....	22	2. その他の参考文献	26
6. 同一成分・同効薬.....	22	XII. 参考資料.....	27
7. 国際誕生年月日	23	1. 主な外国での発売状況	27
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	23	2. 海外における臨床支援情報.....	27
9. 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	XIII. 備考.....	28
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び その内容	23	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うに あたっての参考情報.....	28
		2. その他の関連資料	28

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

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. 製品の治療学的特性

- ・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]
- ・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]
- ・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の項参照]

3. 製品の製剤学的特性

「IV. 製剤に関する項目」の項参照

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

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）

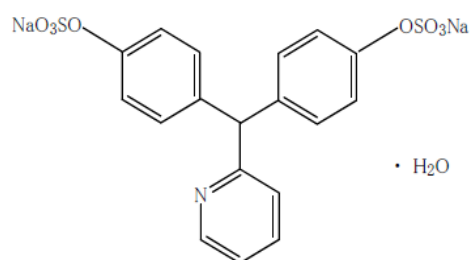
(2) 洋名（命名法）

Sodium Picosulfate Hydrate（JAN）

(3) ステム（stem）

該当しない

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $\text{C}_{18}\text{H}_{13}\text{NNa}_2\text{O}_8\text{S}_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$

分子量：499.42

5. 化学名（命名法）又は本質

化学名：Disodium 4,4'-(pyridin-2-ylmethylene) bis (phenyl sulfate) monohydrate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

治験番号：PS-T（錠剤）

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。光により徐々に着色する¹⁾。

(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¹⁾。

(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）¹⁾

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¹⁾。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 260°C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）¹⁾

pH：本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 7.4～9.4 である¹⁾。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

[確認試験法]

日本薬局方ピコスルファートナトリウム水和物の確認試験による。

[定量法]

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

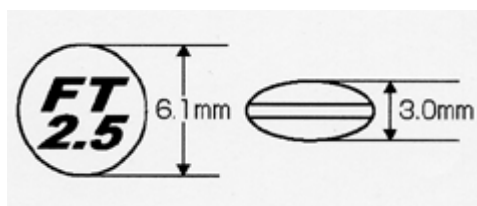
1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠剤 白色のフィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

外観及び性状：直径 6.1mm 厚さ 3.0mm 重量 78mg



(3) 識別コード

FT2.5

(4) 製剤の物性

日本薬局方「一般試験法 崩壊試験法 (2) 適当なコーティング剤で剤皮を施した錠剤」の項により試験をするときこれに適合する。

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「FSK」
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	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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当資料なし

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 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) 室温における粉碎後の安定性³⁾

ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」を乳鉢にて粉碎後薬包紙に分包し、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、粉碎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光照射)

	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。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当資料なし (現在までに報告されたものはない。)

9. 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「ピコスルファートナトリウム錠の溶出規格」に適合していることを確認した。

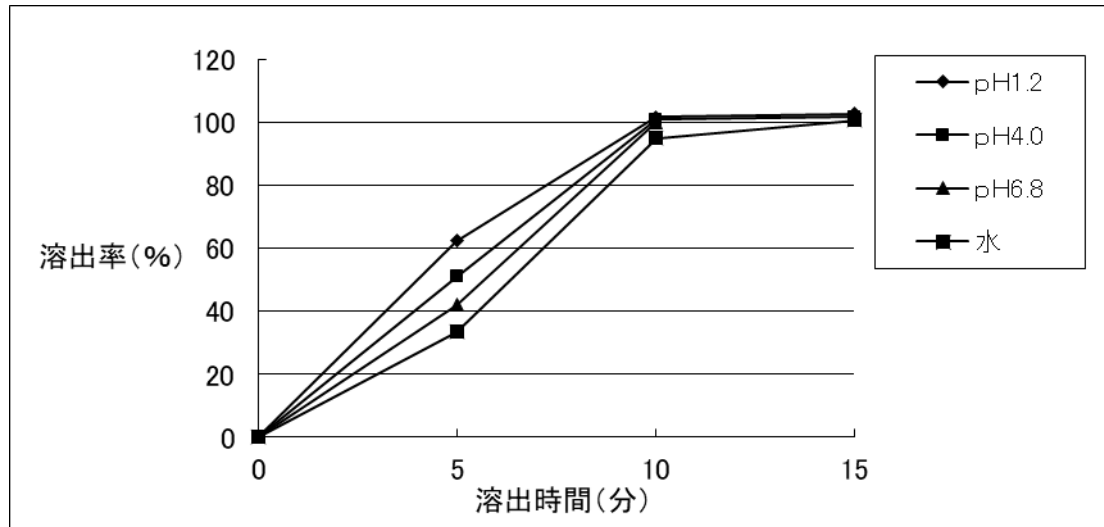
(2) 溶出曲線⁴⁾

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。



10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

PTP 1000錠（10錠×100）

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP 表：ポリ塩化ビニル
裏：アルミ

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. 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. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

<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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

試験区分	目的
国内比較臨床試験①	各種便秘症
国内比較臨床試験②	術後排便補助
国内比較臨床試験③	造影剤（硫酸バリウム）投与後の排便促進

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

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「FSK」とラキソベロン内用液 0.75%を非盲検法により 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）を上部消化管 X線造影検査後に経口投与した。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「FSK」、ラキソベロン内用液 0.75%とも 100%で両群間に有意な差は認められなかった⁵⁾。

2) 安全性試験

臨床試験における有効率^{6)～31)}

適応	症例数（例）	有効以上（例）	有効率（%）	
各種便秘症（合計）	610	427	70.0	
（内訳）	慢性便秘症 ^{6)～18)}	440	294	66.8
	透析による便秘 ^{19)、20)}	49	28	57.1
	褥婦の便秘 ^{21)～24)}	121	105	86.8
術後排便補助 ²⁵⁾	30	20	66.7	
造影剤投与後の排便促進 ^{26)～31)}	303	282	93.1	

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

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

① 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^{32)・33)}。

作用機序¹⁾：

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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

① 経口投与による瀉下活性³⁴⁾

正常ラット（n=10）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³⁵⁾

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」及びラキソベロン内用液 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
ラキソベロン内用液 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

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

- (1) 治療上有効な血中濃度
該当資料なし
- (2) 臨床試験で確認された血中濃度
該当資料なし
- (3) 中毒域
該当資料なし
- (4) 食事・併用薬の影響
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) 消失速度定数
該当資料なし
- (4) クリアランス
該当資料なし
- (5) 分布容積
該当資料なし
- (6) その他
該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) パラメータ変動要因
該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 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

^{14}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^{36)、37)}。

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

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^{36)、38)}。

(2) 代謝に關与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 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^{36)、38)}。

ラットに ^{14}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³⁶⁾。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当しない

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

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. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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。

- (6) 授乳婦
設定されていない
- (7) 小児等
設定されていない
- (8) 高齢者

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。

7. 相互作用

- (1) 併用禁忌とその理由
設定されていない
- (2) 併用注意とその理由
設定されていない

8. 副作用

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。

- (1) 重大な副作用と初期症状
設定されていない

- (2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

頻度 種類	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。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

10. 過量投与

該当資料なし

11. 適用上の注意

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。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床使用に基づく情報

設定されていない

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) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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³⁹⁾

急性毒性 (LD₅₀ g/kg) (経口投与)

動物及び性別	雄	雌
マウス	12.8	13.7
ラット	19.3	17.8

(2) 反復投与毒性試験

① 亜急性毒性⁴⁰⁾

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。

② 慢性毒性⁴⁰⁾

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。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験⁴¹⁾

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。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

① 細胞毒性^{42) ~44)}

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。

③ 抗原性及び突然変異原性⁴⁵⁾

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

4年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意点

設定されていない

5. 患者向け資材

該当資料なし

6. 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キシネート

刺激性下剤：センノシド、センナ、アロエ、ビサコジル

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

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
ピコスルファート ナトリウム 2.5mg 「F S K」	2019年6月26日	30100AMX00050000	2019年12月13日	2000年11月1日

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

9. 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

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

販売名	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 「F S K」 (旧販売名：ファースルー錠)	2004年2月23日	品質再評価

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載 医薬品コード	HOT(9桁)番号	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 「F S K」	2359005F1277	114122101	621412201
	2359005F1013 (統一名収載)		

14. 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) 第十八改正日本薬局方解説書.
- 2) 日本薬局方医薬品情報集 (JPDI) 薬業時報社. 2021
- 3) 社内資料：ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」の安定性試験に関する資料
- 4) 社内資料：ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」の溶出性試験に関する資料
- 5) 松浦隆志 他：臨床と研究. 1990 ; 67(5) : 1611-1618
- 6) 成田光陽 他：基礎と臨床. 1989 ; 23(7) : 2679-2686
- 7) 村井俊介 他：基礎と臨床. 1990 ; 24(3) : 1303-1311
- 8) 川村顕 他：医学と薬学. 1990 ; 23(1) : 209-217
- 9) 古橋修介 他：老年医学. 1990 ; 28(5) : 683-692
- 10) 柏木征三郎 他：臨床と研究. 1990 ; 67(5) : 1530-1537
- 11) 村田育夫 他：臨床と研究. 1991 ; 68(1) : 224-230
- 12) 岡村信一 他：医学と薬学. 1990 ; 24(5) : 1361-1369
- 13) 熊川宏美 他：医学と薬学. 1989 ; 22(5) : 1363-1371
- 14) 篠山重威 他：基礎と臨床. 1990 ; 24(9) : 287-294
- 15) 鈴木潤一 他：基礎と臨床. 1990 ; 24(12) : 467-474
- 16) 大野孝則 他：医学と薬学. 1990 ; 24(1) : 259-267
- 17) 佐藤祐造 他：医学と薬学. 1991 ; 26(1) : 151-158
- 18) 森本日出雄 他：医学と薬学. 1990 ; 24(1) : 268-275
- 19) 大場正二 他：腎と透析. 1989 ; 27(4) : 791-797
- 20) 大塚秀行 他：臨床と研究. 1990 ; 67(9) : 289-294
- 21) 長瀬行之 他：基礎と臨床. 1990 ; 24(3) : 1483-1490
- 22) 森秀弘 他：医学と薬学. 1990 ; 24(4) : 1115-1121
- 23) 中義尚 他：基礎と臨床. 1990 ; 24(10) : 981-988
- 24) 春日井正秀 他：基礎と臨床. 1990 ; 24(9) : 371-376
- 25) 村上穆 他：基礎と臨床. 1988 ; 22(16) : 5860-5870
- 26) 八尾恒良 他：医学と薬学. 1989 ; 22(5) : 1379-1384
- 27) 坂本力 他：基礎と臨床. 1988 ; 22(18) : 6535-6542
- 28) 村井俊介 他：基礎と臨床. 1988 ; 22(14) : 4997-5004
- 29) 山崎秀男 他：日消集検誌. 1988 ; 79号 : 68-73
- 30) 古賀充：医学と薬学. 1989 ; 22(5) : 1373-1377
- 31) 小西淳二 他：基礎と臨床. 1990 ; 24(10) : 1005-1012
- 32) Pala G, et al. : Arch Int Pharmacodyn. 1966 ; 164(2) : 356-369
- 33) 鶴見介登 他：応用薬理. 1977 ; 14(4) : 549-555

- 34) 社内資料：ピコスルファートナトリウム錠 2.5mg 「F S K」の薬効比較試験に関する資料
- 35) 上野光一 他：薬理と治療. 1990 ; 18(1) : 71-81
- 36) Jauch R, et al. : *Arzneim-Forsch.* 1977 ; 27(5) : 1045-1050
- 37) 大沼規男 他：医薬品研究. 1977 ; 8(4) : 485-490
- 38) 大沼規男 他：医薬品研究. 1977 ; 8(4) : 474-484
- 39) 社内資料：ピコスルファートナトリウムの急性毒性
- 40) アレキサンダー・カスト他：医薬品研究. 1977 ; 8(3) : 341-365
- 41) 西村美知代 他：医薬品研究. 1977 ; 8(3) : 366-396
- 42) J. Nishikawa et al : *Arzneim-Forsch.* 1981 ; 31(I) No2 : 321-325
- 43) J. Nishikawa et al : *Arzneim-Forsch.* 1981 ; 31(I) No6 : 1010-1013
- 44) J. Nishikawa et al : *Arzneim-Forsch.* 1981 ; 31(II) No11 : 1872-1875
- 45) 上野光一 他：医薬品研究. 1977 ; 8(3) : 397-401

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

外国では発売していない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし