

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

胃炎・消化性潰瘍治療剤

ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」

PIRENZEPINE HYDROCHLORIDE Tablets [SAWAI]

ピレンゼピン塩酸塩錠

剤形	割線入り素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中日局ピレンゼピン塩酸塩水和物26.1mg(無水物として25mg)含有
一般名	和名:ピレンゼピン塩酸塩水和物 洋名:Pirenzepine Hydrochloride Hydrate
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日:2015年2月12日(販売名変更) 薬価基準収載年月日:2015年6月19日(販売名変更) 販売開始年月日:1990年7月13日
製造販売(輸入)・提携・販売会社名	製造販売元:沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL:0120-381-999、FAX:06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト: https://med.sawai.co.jp/

本IFは2022年9月改訂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 一日本病院薬剤師会一

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と略す)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のページ(<http://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、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の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、その取り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な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。

(2020年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	18
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	18
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	18
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	18
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	18
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	5. 重要な基本的注意とその理由	18
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	18
7. 相互作用	19		
8. 副作用	19		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	20		
10. 過量投与	20		
11. 適用上の注意	20		
12. その他の注意	20		
II. 名称に関する項目	3	IX. 非臨床試験に関する項目	21
1. 販売名	3	1. 薬理試験	21
2. 一般名	3	2. 毒性試験	21
3. 構造式又は示性式	3		
4. 分子式及び分子量	3		
5. 化学名(命名法)又は本質	4		
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4		
III. 有効成分に関する項目	5	X. 管理的事項に関する項目	22
1. 物理化学的性質	5	1. 規制区分	22
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	2. 有効期間	22
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	3. 包装状態での貯法	22
IV. 製剤に関する項目	6	4. 取扱い上の注意	22
1. 剤形	6	5. 患者向け資材	22
2. 製剤の組成	6	6. 同一成分・同効薬	22
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	7. 国際誕生年月日	22
4. 力価	7	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	22
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	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
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	23
7. 調製法及び溶解後の安定性	7	11. 再審査期間	23
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	12. 投薬期間制限に関する情報	23
9. 溶出性	8	13. 各種コード	23
10. 容器・包装	9	14. 保険給付上の注意	23
11. 別途提供される資材類	9		
12. その他	9		
V. 治療に関する項目	10	XI. 文献	24
1. 効能又は効果	10	1. 引用文献	24
2. 効能又は効果に関連する注意	10	2. その他の参考文献	25
3. 用法及び用量	10		
4. 用法及び用量に関連する注意	10		
5. 臨床成績	10		
VI. 薬効薬理に関する項目	12	XII. 参考資料	26
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12	1. 主な外国での発売状況	26
2. 薬理作用	12	2. 海外における臨床支援情報	26
VII. 薬物動態に関する項目	14		
1. 血中濃度の推移	14		
2. 薬物速度論的パラメータ	15		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	15		
4. 吸収	16		
5. 分布	16		
6. 代謝	16		
7. 排泄	17		
8. トランスポーターに関する情報	17		
9. 透析等による除去率	17		
10. 特定の背景を有する患者	17		
11. その他	17		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」は、日局ピレンゼピン塩酸塩水和物を含有する胃炎・消化性潰瘍治療剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

	ピロデイン錠(旧販売名)
承認申請に際し準拠した通知名	昭和55年5月30日 薬発第698号
承認	1990年1月
上市	1990年7月

2007年12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)に基づき、「ピロデイン錠25mg」に販売名を変更した。

2012年4月にメディサ新薬株式会社から沢井製薬株式会社に製造販売承認が承継された。

2015年6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 薬食審査発第0922001号)に基づき、『ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ』に販売名を変更した。

2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤の用法は、「1日3～4回投与」である。(V. -3. 参照)
- 2) ムスカリン受容体遮断薬で、アトロピンと同様に副交感神経興奮による反応を抑制する。ただし、本薬はムスカリン受容体のうち、M₁受容体に対する選択性が高く、比較的選択性的に胃酸分泌を抑制するので、消化性潰瘍治療薬として用いられ、M₂受容体やM₃受容体遮断に由来する副作用が少ない¹⁾。(VI. -2. 参照)
- 3) 重大な副作用として、無顆粒球症、アナフィラキシーが報告されている。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

特になし

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

I. 概要に関する項目

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

ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」

2) 洋名

PIRENZEPINE HYDROCHLORIDE Tablets [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

ピレンゼピン塩酸塩水和物(JAN)

2) 洋名(命名法)

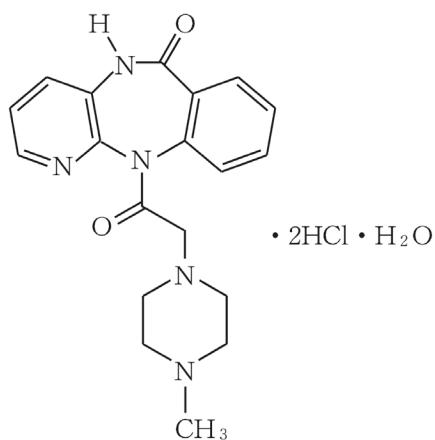
Pirenzepine Hydrochloride Hydrate(JAN)

Pirenzepine (INN)

3) ステム(stem)

-zepine : 三環系抗潰瘍薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $\text{C}_{19}\text{H}_{21}\text{N}_5\text{O}_2 \cdot 2\text{HCl} \cdot \text{H}_2\text{O}$

分子量 : 442.34

II. 名称に関する項目

5. 化学名(命名法)又は本質 ······

11-[(4-Methylpiperazin-1-yl)acetyl]-5,11-dihydro-6H-pyrido[2,3-*b*][1,4]benzodiazepin-6-one dihydrochloride monohydrate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 ······

特になし

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～微黄色の結晶性の粉末である。

2) 溶解性

水又はギ酸に溶けやすく、メタノールに溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。

溶解度²⁾ : pH1.2 : 10mg/mL以上、pH4.0 : 10mg/mL以上、pH6.8 : 10mg/mL以上、水 : 10mg/mL以上

3) 吸湿性

水分 : 3.5～5.0% (0.3g、容量滴定法、直接滴定)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点 : 約245°C (分解)

5) 酸塩基解離定数

$pK_{a1} = 1.8$ (25°C)²⁾

$pK_{a2} = 7.9$ (25°C)²⁾

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

本品1gを水10mLに溶かした液のpHは1.0～2.0である。

比吸光度 $E_{1cm}^{1\%}$ (281nm) : 約195 [本品の水溶液(1→40000)]¹⁾

2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に着色する。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

<確認試験法>

日局「ビレンゼビン塩酸塩水和物」の確認試験に準ずる。

1) 紫外線可視吸光度測定法

2) 赤外吸収スペクトル測定法

3) 塩化物の定性反応

<定量法>

日局「ビレンゼビン塩酸塩水和物」の定量法に準ずる。(電位差滴定法)

IV. 製剤に関する項目

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の區別

割線入り素錠

2) 製剤の外観及び性状

品名	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「サワイ」	 7.0	 約120	 2.4	白色

3) 識別コード

表示部位：錠剤本体(片面)

表示内容：SW 904

4) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。
(水、30分：85%以上)

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

有効成分 [1錠中]	日局ピレンゼピン塩酸塩水和物 26.1mg(無水物として25mg)
添加剤	カルメロース、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

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
該当しない

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) PTP包装品の安定性(長期保存試験)³⁾

ピレンゼビン塩酸塩錠25mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)について、安定性試験を行った。
その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	室温・遮光 3年
性 状	白色の割線入り素錠であった	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.1	100.5

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁴⁾

ピレンゼビン塩酸塩錠25mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、光の条件下で性状変化が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3カ月)	湿度 (25°C 75%RH 3カ月)	光 (総照射量 60万lx·hr)
性 状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	薄く黄白色に変化
硬度(kg)	4.9	6.9	4.9	6.0
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.2	101.3	100.0

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

7. 調製法及び溶解後の安定性
該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)
該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

9. 溶出性

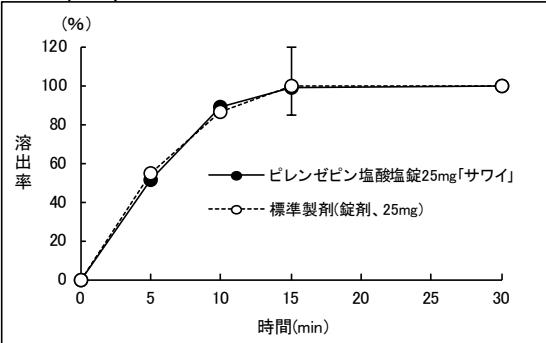
本製剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

＜溶出挙動における同等性及び類似性＞⁵⁾

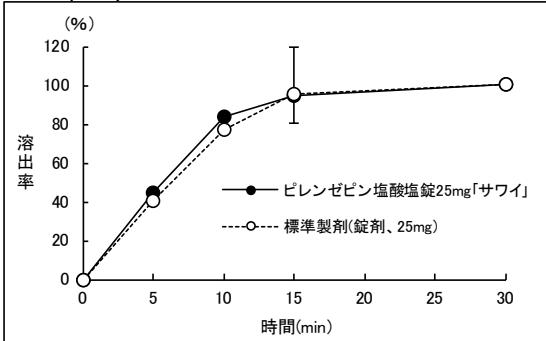
品質再評価結果通知日	2000年10月12日	オレンジブック収載	No. 6
通知等	「医療用医薬品の品質再評価に係る公的溶出試験(案)等について」: 平成12年2月7日 医薬審第36号		
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)	
試験回数	6ベッセル		
試験製剤	ピレンゼビン塩酸塩錠25mg「サワイ」		
標準製剤	ガストロゼビン錠25mg		
結果及び考察	<p>＜50rpm : pH1.2＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>＜50rpm : pH4.0＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>＜50rpm : pH6.8＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>＜50rpm : 水＞ 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p>		

(溶出曲線)

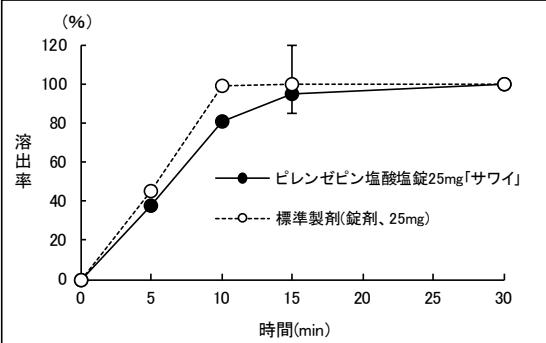
＜50rpm:pH1.2＞



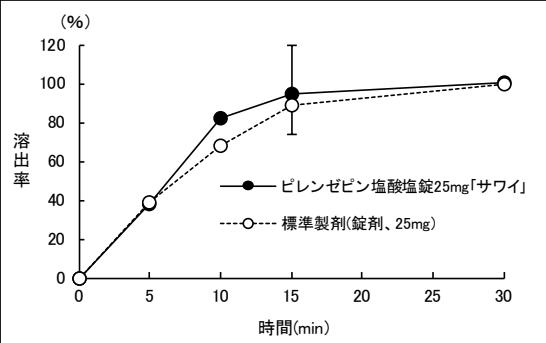
＜50rpm:pH4.0＞



＜50rpm:pH6.8＞



＜50rpm:水＞



(〔 〕: 判定基準の適合範囲)

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

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

PTP : 100 錠 (10 錠×10)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

- 下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、付着粘液)並びに消化器症状の改善
急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期
- 胃潰瘍、十二指腸潰瘍

2. 効能又は効果に関する注意

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

6. 用法及び用量

通常成人には1回1錠(ピレンゼピン塩酸塩無水物として25mg)を、1日3～4回経口投与する。
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

該当資料なし

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

17.1.1 国内二重盲検比較試験

(1) 胃潰瘍を対象とした二重盲検比較試験において、ピレンゼビン塩酸塩錠75mg/日を8週または12週間投与により、本剤の有用性が認められた⁶⁾。

有効例数／効果判定例数	有効率(有効以上)
104/120	86.7%

副作用発現率は6.7% (8/120例) で、副作用は口渴2.5% (3例)、便秘2.5% (3例)、発疹1.7% (2例)、残尿感0.8% (1例) であった。

(2) 十二指腸潰瘍を対象とした二重盲検比較試験において、ピレンゼビン塩酸塩錠100mg/日を8週間投与により、本剤の有用性が認められた⁷⁾。

有効例数／効果判定例数	有効率(有効以上)
55/65	84.6%

副作用発現率は3.1% (2/65例) で、副作用は口渴1.5% (1例)、便秘1.5% (1例) であった。

(3) 胃炎を対象とした二重盲検比較試験において、ピレンゼビン塩酸塩錠75mg/日を2週間投与により、本剤の有用性が認められた⁸⁾。

有効例数／効果判定例数	有効率(有効以上)
87/141	61.7%

副作用発現率は4.2% (6/142例) で、副作用は口渴3.5% (5例)、便秘0.7% (1例)、嘔声0.7% (1例)、脱力感0.7% (1例)、頭重感0.7% (1例) であった。

(2) 安全性試験

該当資料なし

5) 患者・病態別試験

該当資料なし

6) 治療の使用

(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

該当資料なし

(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. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

ムスカリンM₁受容体遮断作用：ピレンゼビン塩酸塩以外の化合物はない⁹⁾。

2. 薬理作用

1) 作用部位・作用機序

ムスカリン受容体遮断薬で、アトロピンと同様の副交感神経興奮による反応を抑制することにより様々な作用を現す¹⁾。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 胃液分泌抑制作用に対する選択制

胃液分泌を選択的かつ著明に抑制し、心臓、唾液腺、眼、膀胱などに対する作用は弱い(ラット、イヌ)¹⁰⁾。生体の各種ムスカリン受容体(high affinity site, low affinity site)に対し、それぞれ区別して結合できる性質を有するためと考えられている(ラット)¹¹⁾。

18.3 胃酸分泌抑制作用

カルバコール、ガストリン、ヒスタミン及び肉エキスなどによる胃液、胃酸、ペプシンの分泌亢進を抑制する(ラット、イヌ)^{10, 12~14)}。

18.4 抗ガストリン作用

肉エキス投与血中ガストリン値の上昇を抑制する(イヌ)¹²⁾。

18.5 防御因子増強作用

18.5.1 胃粘膜血流増加作用が認められ(ラット、イヌ)、また、全身拘束ストレス負荷時に見られる胃粘膜微小循環の異常も改善することが認められている(ラット)^{15~17)}。

18.5.2 ストレス負荷時、レセルピン投与時の胃粘液産生減少を抑制する(ラット)¹⁸⁾。

18.6 各種実験潰瘍に対する効果

18.6.1 シエイ、ストレス、レセルピン、アスピリン、インドメタシン、ヒスタミン及びシスティアミン等の急性潰瘍に対して抗潰瘍作用を示す(ラット、モルモット、ミニブタ)^{12, 13, 19~21)}。

18.6.2 热灼潰瘍と热灼-コーチゾン潰瘍等の慢性潰瘍、さらに抗コリン剤では無効とされている酢酸潰瘍に対しても、治癒促進効果を示す(ラット)^{19, 21, 22)}。

18.7 実験的急性胃炎に対する効果

塩酸-タウロコール酸、エタノール投与時の胃粘膜損傷に対して抑制効果を示す(ラット)^{23, 24)}。

18.8 実験的慢性胃炎に対する効果

タウロコール酸投与時の慢性(萎縮性)胃炎の発症に対して抑制効果を示す(ラット)²⁵⁾。

18.9 臨床薬理

18.9.1 胃液分泌抑制作用

健康成人において、基礎及び刺激分泌抑制試験で、胃液、胃酸、ペプシン分泌量の有意な減少及び分泌亢進を抑制する²⁶⁾。

18.9.2 抗ガストリン作用

胃潰瘍患者において、試験食負荷による血中ガストリン値の上昇抑制及び空腹時血中ガストリン値を低下させる²⁷⁾。

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

16.1.1 単回投与

健康成人男性3例にピレンゼピン塩酸塩無水物25mgを経口投与した場合、2～4時間で最高血中濃度約32ng/mLに達する。血中濃度の半減期は約13時間である²⁸⁾。

<生物学的同等性試験>²⁹⁾

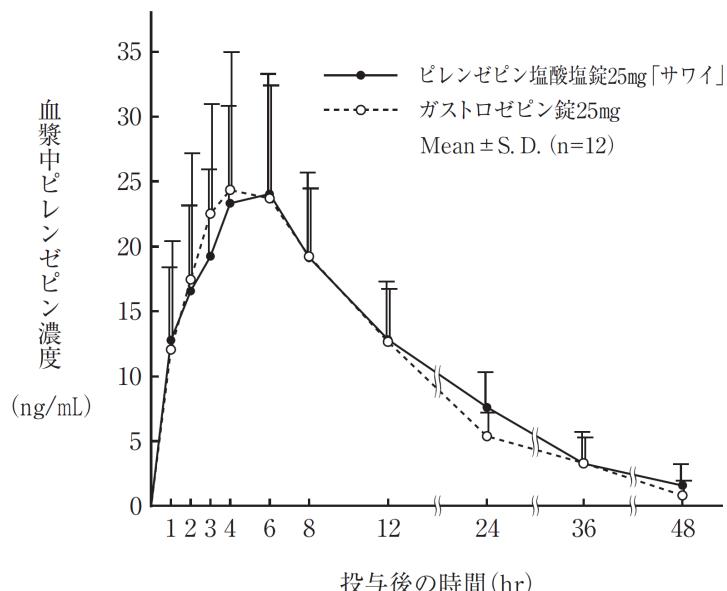
通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」：昭和55年5月30日 薬審第718号
採血時点	0、1、2、3、4、6、8、12、24、36、48hr
休薬期間	14日間
測定方法	ラジオレセプターアッセイ
試験製剤	ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」
標準製剤	ガストロゼピン錠25mg

ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」とガストロゼピン錠25mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ピレンゼピン塩酸塩無水物として25mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ピレンゼピン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC_{0-48hr}、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-48hr} (ng · hr/mL)
ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「サワイ」	26.1±8.1	5.2±1.0	12.0±3.9	431.7±139.1
ガストロゼピン錠 25mg	26.8±9.6	4.3±1.6	11.9±3.2	404.2±130.3

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUCt、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

16.2.2 食事の影響

健康成人男性20例にピレンゼピン塩酸塩無水物50mgを単回経口投与(空腹時又は食後)した場合、食事により血中濃度-時間曲線下面積(AUC)が30%低下した³⁰⁾(外国人データ)。

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

ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ピレンゼピン塩酸塩無水物として25mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数²⁹⁾

$$0.063 \pm 0.018 \text{hr}^{-1}$$

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

VII. 薬物動態に関する項目

4. 吸収

16.2.1 吸収率

健康成人男性5例にピレンゼピン塩酸塩無水物25mgを経口投与した場合、服用量の約26%が吸収された³¹⁾(外国人データ)。

5. 分布

連続投与しても蓄積性は認められない²⁸⁾。

1) 血液-脳関門通過性

＜参考＞静脈内投与した場合、中枢神経系にはほとんど移行しない(ラット、マウス)^{32~34)}。

2) 血液-胎盤関門通過性

＜参考＞静脈内投与した場合、胎児内にはほとんど移行しない(ラット、マウス)^{32~34)}。

3) 乳汁への移行性

＜参考＞静脈内投与した場合、乳汁中へは移行した(ラット)^{32~34)}。

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

＜参考＞静脈内投与した場合、消化管内、腎、唾液腺に高濃度に分布した(ラット)^{32~34)}。

6) 血漿蛋白結合率

16.3.2 蛋白結合率

ヒト血漿蛋白との結合率は約12%である³¹⁾(外国人データ)。

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人にピレンゼピン塩酸塩無水物25mgを経口投与した場合、ほとんど代謝を受けず、血漿、尿及び糞中では大部分が未変化体である³¹⁾(外国人データ)。

2) 代謝に関与する酵素(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 ······

16.5 排泄

尿中への排泄率は約10%であり、24時間で大部分が排泄され、連続投与しても蓄積性は認められない²⁸⁾。

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
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)
本剤の成分に対し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
 8. 重要な基本的注意
眼の調節障害等を起こすことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に注意させること。
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
 9. 1. 1 前立腺肥大のある患者
排尿困難を起こすことがある。
 9. 1. 2 緑内障の患者
眼圧を上昇させことがある。
 - 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

妊娠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

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物で乳汁への移行が認められている。

7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

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

11.1 重大な副作用

11.1.1 無顆粒球症(頻度不明)

11.1.2 アナフィラキシー(頻度不明)

発疹、蕁麻疹等があらわれることがある。

2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1~5%未満	0.1%未満
消化器	口渴、便秘、下痢、恶心・嘔吐	歯肉痛、膨満感
過敏症	発疹	

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	0.1～5%未満	0.1%未満
泌尿器		排尿困難、残尿感
肝臓		AST、ALTの上昇
循環器		心悸亢進
その他		頭重感、たちくらみ、脱力感、嘔声、眼のちらつき、眼の乾燥感に伴う流涙、眼の調節障害

注) 使用成績調査を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

抗コリン作用によるとみられる口渴、せん妄、頻脈、イレウス、尿閉等があらわれることがある。

13.2 処置

通常早期には、活性炭の投与、胃洗浄等を行う。また、必要に応じ、副交感神経興奮薬の投与および尿閉の場合の導尿等、適切な支持療法を行うこと。

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) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

ビレンゼビン塩酸塩の非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

1. 薬理試験

1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」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

該当資料なし

2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

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

該当資料なし

6) 局所刺激性試験

該当資料なし

7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	劇薬

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

開封後は遮光して保存すること。

VIII. -11. 参照

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「日医工」

同効薬：ムスカリンM₁受容体遮断作用：ピレンゼピン塩酸塩以外の化合物はない⁹⁾。

7. 国際誕生年月日

該当しない

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

●ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2015年2月12日(販売名変更)、承認番号：22700AMX00181000

薬価基準収載年月日：2015年6月19日(販売名変更)

販売開始年月日：1990年7月13日

X. 管理的事項に関する項目

ピロデイン錠25mg(旧販売名)

製造販売承認年月日：2007年6月19日(販売名変更)、承認番号：21900AMX00955000

薬価基準収載年月日：2007年12月21日(販売名変更)

販売開始年月日：1990年7月13日

ピロデイン錠(旧販売名)

製造販売承認年月日：1990年1月31日、承認番号：(02AM)0150

薬価基準収載年月日：1990年7月13日

販売開始年月日：1990年7月13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

該当しない

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

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
ピレンゼピン塩酸塩 錠25mg「サワイ」	2329005F1014	2329005F1286	112729416	621272916

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI . 文献

1. 引用文献.....

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十八改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021, C-4481—C-4484.
- 2) 日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集, No. 6, 薬事日報社, 2000, p. 94.
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験] ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」
- 6) 三好秋馬他: 内科宝函, 1980 ; 27 : 33-48
- 7) 増田正典他: 薬理と治療, 1980 ; 8 : 2307-2325
- 8) 三好秋馬他: Therapeutic Research, 1985 ; 2 : 883-905
- 9) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaIMenu/>>
(2022/10/7 アクセス)
- 10) Jennewein, H. M. : Die Behandlung des Ulcus pepticum mit Pirenzepin, 1979 : 41-48
- 11) Hammer, R. et al. : Nature, 1980 ; 283 : 90-92
- 12) 松尾裕他: 基礎と臨床, 1977 ; 11 : 897-909
- 13) Kitagawa, H. et al. : Arzneimittelforschung, 1978 ; 28 : 2122-2127
- 14) Leitold, M. et al. : Therapiewoche, 1977 ; 27 : 1517-1531
- 15) Matsuo, Y. et al. : Symposium Advances in Gastroenterology with the Selective Antimuscarinic Compound-Pirenzepine Stockholm 17th June 1982 ed by G Dotevall Excerpta Medica Amsterdam-Oxford-Princeton, 1982 : 37-46
- 16) 岩崎仁他: 診療と新薬, 1983 ; 20 : 973-980
- 17) Oda, M. et al. : Proceedings of the First Symposium on the Regulation and Disturbances of Gastrointestinal Function Tokyo September 18 1982 ed by Y Kasuya Excerpta Medica Amsterdam-Oxford-Princeton, 1983 : 145-173
- 18) 小林礼子他: 臨牀と研究, 1984 ; 61 : 149-153
- 19) 岡部進他: 応用薬理, 1978 ; 15 : 1235-1240
- 20) 岡部進他: 基礎と臨床, 1980 ; 14 : 1880-1883
- 21) Leitold, M. et al. : Therapiewoche, 1977 ; 27 : 1532-1548
- 22) Inatomi, N. et al. : Jpn. J. Pharmacol., 1979 ; 29 : 486-488
- 23) Takeda, F. et al. : Jpn. J. Pharmacol., 1985 ; 38 : 337-346
- 24) 神尾弘他: 薬理と治療, 1985 ; 13 : 3325-3331
- 25) 岸本真也他: 薬理と治療, 1985 ; 13 : 2791-2795
- 26) 須山哲次他: 基礎と臨床, 1980 ; 14 : 792-800
- 27) 竜田正晴他: 臨牀と研究, 1980 ; 57 : 3103-3111
- 28) 大橋一郎他: 臨床薬理, 1980 ; 11 : 153-159
- 29) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」
- 30) Matzek, K. M. et al. : Int. J. Pharm., 1986 ; 28 : 151-155
- 31) Hammer, R. et al. : Therapiewoche, 1977 ; 27 : 1575-1593
- 32) 朝倉誠他: 薬理と治療, 1986 ; 14 : 1277-1284
- 33) Hammer, R. et al. : Therapiewoche, 1977 ; 27 : 1567-1574
- 34) Kobayashi, S. et al. : Arzneimittelforschung, 1981 ; 31 : 679-690

- 35) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」
36) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
 2. 海外における臨床支援情報
- 該当資料なし

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.....

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

1) 粉碎

粉碎後の安定性試験³⁵⁾

ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「サワイ」を粉碎後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性 状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験※	100.0	99.7	99.7	99.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性³⁶⁾

試験方法

1. ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「サワイ」を 1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約 55°C)20mL を採取して数回転倒混和し、10 分間放置した。
2. 10 分後シリンジを再度数回転倒混和し、8 Fr. (外径 2.7mm) フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結果

懸 濁 状 態	錠剤は約 3 分で崩壊し、ほぼ溶液となった
チューブ通過性	通過した

2. その他の関連資料

該当資料なし

