

## 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

## 尿失禁・頻尿・過活動膀胱治療剤

日本薬局方 プロピペリン塩酸塩錠

プロピペリン塩酸塩錠 10mg「サワイ」  
プロピペリン塩酸塩錠 20mg「サワイ」

## PROPIVERINE HYDROCHLORIDE Tablets [SAWAI]

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠10mg：1錠中日局プロピペリン塩酸塩10mg含有 錠20mg：1錠中日局プロピペリン塩酸塩20mg含有
一般名	和名：プロピペリン塩酸塩(JAN) 洋名：Propiverine Hydrochloride(JAN)
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	錠10mg 製造販売承認年月日：2023年6月26日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：薬価基準収載(販売名変更) 販売開始年月日：2006年7月7日 錠20mg 製造販売承認年月日：2023年6月26日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：2023年12月8日(販売名変更) 販売開始年月日：2006年7月7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： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2023年12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 —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)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	22
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	22
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	22
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	22
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	22
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	22
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	22
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	23
1. 販売名	3	8. 副作用	24
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	25
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	25
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	25
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	IX. 非臨床試験に関する項目	26
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理試験	26
1. 物理化学的性質	4	2. 毒性試験	26
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	X. 管理的事項に関する項目	27
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 規制区分	27
IV. 製剤に関する項目	5	2. 有効期間	27
1. 剤形	5	3. 包装状態での貯法	27
2. 製剤の組成	5	4. 取扱い上の注意	27
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	5. 患者向け資材	27
4. 力価	6	6. 同一成分・同効薬	27
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	7. 国際誕生年月日	27
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	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	27
7. 調製法及び溶解後の安定性	9	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	28
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	9	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	28
9. 溶出性	9	11. 再審査期間	28
10. 容器・包装	12	12. 投薬期間制限に関する情報	28
11. 別途提供される資材類	12	13. 各種コード	28
12. その他	12	14. 保険給付上の注意	28
V. 治療に関する項目	13	XI. 文献	29
1. 効能又は効果	13	1. 引用文献	29
2. 効能又は効果に関連する注意	13	2. その他の参考文献	29
3. 用法及び用量	13	XII. 参考資料	30
4. 用法及び用量に関連する注意	13	1. 主な外国での発売状況	30
5. 臨床成績	13	2. 海外における臨床支援情報	30
VI. 薬効薬理に関する項目	16	XIII. 備考	31
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	16	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	31
2. 薬理作用	16	2. その他の関連資料	33
VII. 薬物動態に関する項目	17		
1. 血中濃度の推移	17		
2. 薬物速度論的パラメータ	20		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	20		
4. 吸収	20		
5. 分布	20		
6. 代謝	21		
7. 排泄	21		
8. トランスポーターに関する情報	21		
9. 透析等による除去率	21		
10. 特定の背景を有する患者	21		
11. その他	21		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

プロピペリン塩酸塩錠10mg/錠20mg「サワイ」は、日局プロピペリン塩酸塩を含有する尿失禁・頻尿・過活動膀胱治療剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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。

	塩酸プロピペリン錠10mg/錠20mg「SW」
承認申請に際し準拠した通知名	平成11年4月8日 医薬発第481号
承認	2005年10月
上市	2006年7月

塩酸プロピペリン錠10mg「SW」及び塩酸プロピペリン錠20mg「SW」は、第十八改正日本薬局方の記載内容に基づき、2023年12月に『プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」』及び『プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」』へ販売名を変更した。(X. -8. 参照)

### 2. 製品の治療学的特性

- 1) 摘出膀胱においてアセチルコリン及び塩化カリウム収縮を抑制し、ムスカリン受容体への親和性を有し、アトロピンで抑制されない経壁電気刺激収縮の抑制作用を示す。また、骨盤神経の切断末梢端刺激による膀胱収縮が抑制されることより、プロピペリン塩酸塩の作用は膀胱平滑筋側にあることが示唆される。一方、主代謝物である1-メチル-4-ピペリジルジフェニルプロポキシ酢酸 *N*-オキシド(プロピペリン塩酸塩の *N*-オキシド体であり、以下M-1と略す。)は平滑筋直接作用を、1-メチル-4-ピペリジルベンジル酸 *N*-オキシド(M-1の脱プロピル体であり、以下M-2と略す。)は抗コリン作用を有する。(VI. -2. 参照)
- 2) 重大な副作用として、急性緑内障発作、尿閉、麻痺性イレウス、幻覚・せん妄、腎機能障害、横紋筋融解症、血小板減少、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、QT延長、心室性頻拍、肝機能障害、黄疸が報告されている。(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

(2023年12月1日時点)

### 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

I. 概要に関する項目

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

プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」

プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」

## 2) 洋名

PROPIVERINE 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)

プロピペリン塩酸塩(JAN)

## 2) 洋名(命名法)

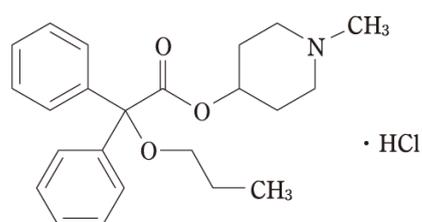
Propiverine Hydrochloride (JAN)

Propiverine(INN)

## 3) ステム(stem)

-verine : papaverine作用をもつ鎮けい剤

## 3. 構造式又は示性式 .....



## 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 :  $C_{23}H_{29}NO_3 \cdot HCl$ 

分子量 : 403.94

## 5. 化学名(命名法)又は本質 .....

1-Methylpiperidin-4-yl 2, 2-diphenyl-2-propoxyacetate monohydrochloride  
(IUPAC)

## 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....

別名 : 塩酸プロピペリン

---

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

1. 物理化学的性質 .....

1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

2) 溶解性

水又はエタノール(99.5)にやや溶けやすい。

3) 吸湿性

乾燥減量：1.0%以下(1g、105℃、1時間)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：213～218℃

5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....

保存条件：容器 気密容器

3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....

<確認試験法>

日局「プロピペリン塩酸塩」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 3) 硝酸銀試液による沈殿反応

<定量法>

日局「プロピペリン塩酸塩」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)

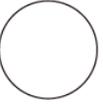
## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

## 1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

## 2) 製剤の外観及び性状

品名	プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」	プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」
外形	  	  
性状	白色	
直径(mm)	7.1	7.1
厚さ(mm)	3.3	3.3
重量(mg)	約129	約129

## 3) 識別コード

## ●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW PPV 10

## ●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW PPV 20

## 4) 製剤の物性

製剤均一性：日局プロピペリン塩酸塩錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局プロピペリン塩酸塩錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。  
(溶出試験 第2液、20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

品名	プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」	プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局プロピペリン塩酸塩	
	10mg	20mg
添加剤	カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、マクロゴール6000	
	カルメロースCa、結晶セルロース	—

IV. 製剤に関する項目

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

●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」

1) 加速試験<sup>1)</sup>

目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を短期間で推定するため、加速試験を実施する。

方法

本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

試験条件及び検体

保存条件	40°C/75%RH
保存期間	6 ヶ月
試験回数	3 回/ロット
保存形態	PTP(ポリ塩化ビニルフィルム/アルミニウム箔)
ロット番号	①119M2507、②119M2508、③119M2509

結果

いずれのロットもすべての試験項目において規格に適合した。

試験実施：2002年11月

ロット番号 試験項目	イニシャル			6 ヶ月後		
	①	②	③	①	②	③
性状	白色のフィルムコーティング錠			白色のフィルムコーティング錠		
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合

結論

本製剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

2) 無包装下の安定性試験<sup>2)</sup>

## 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

## 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
119M2507	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	光	1000lx、開放
	室温	なりゆき温湿度、散光下開放

## 結果

試験実施：2005年3月

試験項目	性状	硬度* (kgf)	溶出試験	定量試験*
保存条件・期間				
イニシャル	(a)	8.5	適合	100.0
温度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 10.5	変化なし	変化なし 101.4
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 8.9	変化なし	変化なし 99.4
光(60万lx・hr)	変化なし	変化なし 9.1	変化なし	変化なし 99.5
室温(3ヵ月)	変化なし	変化なし 8.7	変化なし	変化なし 99.8

\*：本製剤の未設定規格のため参考値、n=3の平均値

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)、n=3の平均値

(a)：白色のフィルムコーティング錠

## ●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」

1) 加速試験<sup>3)</sup>

## 目的

本製剤の一定の流通期間中における品質の安定性を短期間で推定するため、加速試験を実施する。

## 方法

本製剤の[規格及び試験方法]により実施する。

## 試験条件及び検体

保存条件	40°C/75%RH
保存期間	6ヵ月
試験回数	3回/ロット
保存形態	PTP(ポリ塩化ビニルフィルム/アルミニウム箔)
ロット番号	①120M3303、②120M3304、③120M3305

#### IV. 製剤に関する項目

##### 結果

いずれのロットもすべての試験項目において規格に適合した。

試験実施：2003年1月

ロット番号 試験項目	イニシャル			6ヵ月後		
	①	②	③	①	②	③
性状	白色のフィルムコーティング錠			白色のフィルムコーティング錠		
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合

##### 結論

本製剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

#### 2) 無包装下の安定性試験<sup>4)</sup>

##### 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

##### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
120M3303	温度	40℃、遮光気密容器
	湿度	25℃/75%RH、遮光開放
	光	1000lx、開放
	室温	なりゆき温湿度、散光下開放

##### 結果

試験実施：2005年3月

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度* (kgf)	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	7.4	適合	100.0
温度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 7.7	変化なし	変化なし 101.5
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 6.9	変化なし	変化なし 98.7
光(60万lx・hr)	変化なし	変化なし 6.5	変化なし	変化なし 99.6
室温(3ヵ月)	変化なし	変化なし 5.8	変化なし	変化なし 98.9

\*：本製剤の未設定規格のため参考値、n=3の平均値  
 ※：イニシャルを100としたときの含有率(%), n=3の平均値  
 (a)：白色のフィルムコーティング錠

## A) 評価分類基準

## 【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり(規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合

## 【硬度】

分類	評価基準
変化なし	硬度変化が30%未満の場合
変化あり(規格内)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合
変化あり(規格外)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合

## 【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 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

## 9. 溶出性 .....

&lt;溶出挙動における同等性及び類似性&gt;

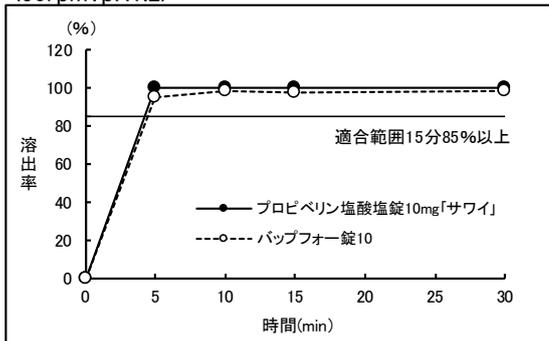
●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」<sup>5)</sup>

目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性の判定を行うため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成13年5月31日 医薬審発第786号)に準じ、溶出試験を実施する。	
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法	
条件	回転数・試験液	50rpm : pH1.2、50rpm : pH4.0、50rpm : pH6.8、 50rpm : 水、100rpm : pH6.8
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5℃
	試験数	12 ベッセル
検体	試験製剤	プロピペリン塩酸塩錠 10mg「サワイ」 (ロット番号 : 119M2507)
	標準製剤	バップフォー錠 10(ロット番号 : 9L972)
結果	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 <50rpm : pH4.0> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。	

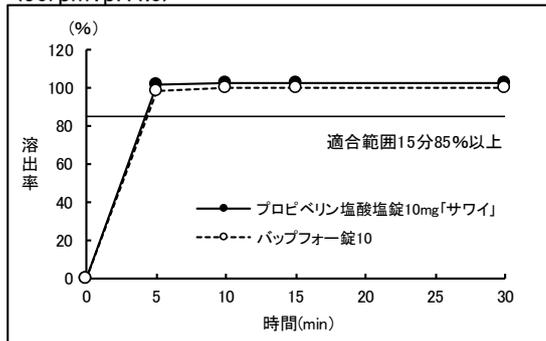
IV. 製剤に関する項目

	<p>&lt;50rpm : pH6.8&gt;                  両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。                  &lt;50rpm : 水&gt;                  標準製剤の平均溶出率が 60% (10 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、                  試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。                  &lt;100rpm : pH6.8&gt;                  両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。</p>
結論	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。

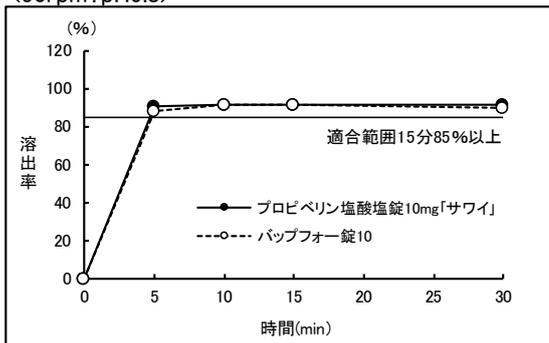
<50rpm : pH1.2>



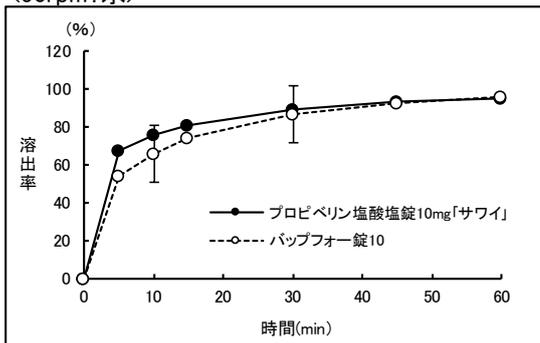
<50rpm : pH4.0>



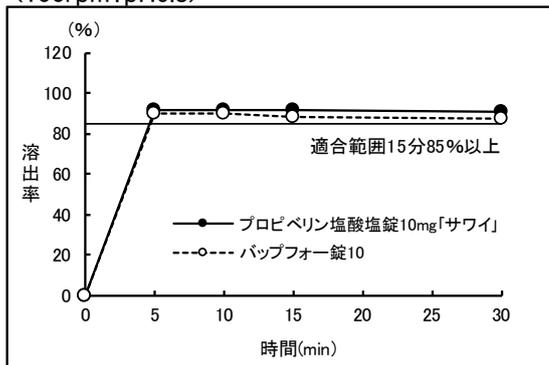
<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH6.8>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

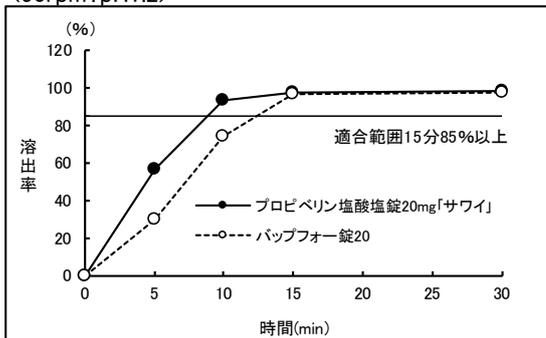
●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」<sup>(6)</sup>

目的	試験製剤と標準製剤の生物学的同等性試験における溶出挙動の類似性の判定を行うため、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 13 年 5 月 31 日 医薬審発第 786 号)に準じ、溶出試験を実施する。
方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法

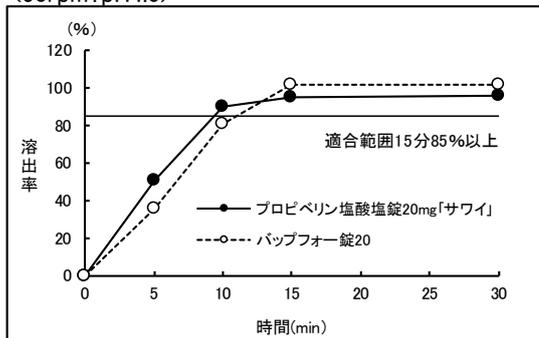
IV. 製剤に関する項目

条件	回転数・試験液	50rpm : pH1.2、50rpm : pH4.0、50rpm : pH6.8、 50rpm : 水、100rpm : pH6.8
	試験液量	900mL
	液温度	37±0.5℃
	試験数	12 ベッセル
検体	試験製剤	プロピペリン塩酸塩錠 20mg「サワイ」 (ロット番号 : 120M3303)
	標準製剤	バップフォー錠 20(ロット番号 : 0 I 731)
結果	<p>&lt;50rpm : pH1.2&gt; 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : pH4.0&gt; 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt; 15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : 水&gt; 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。</p> <p>&lt;100rpm : pH6.8&gt; 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。</p>	
結論	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。	

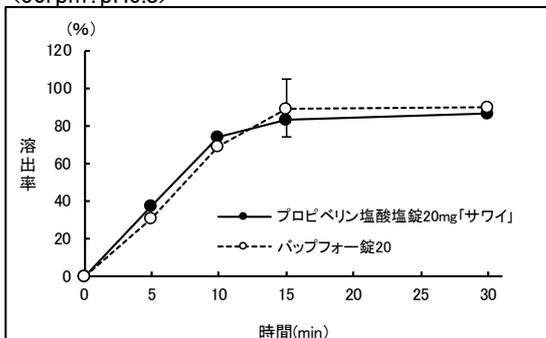
<50rpm : pH1.2>



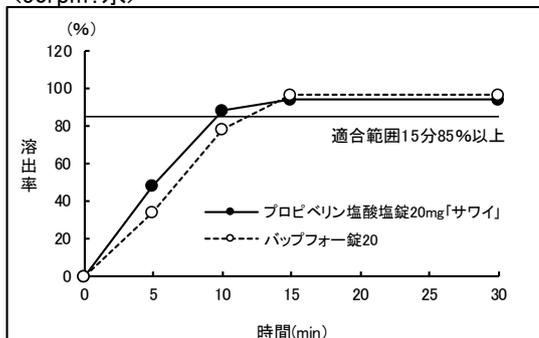
<50rpm : pH4.0>



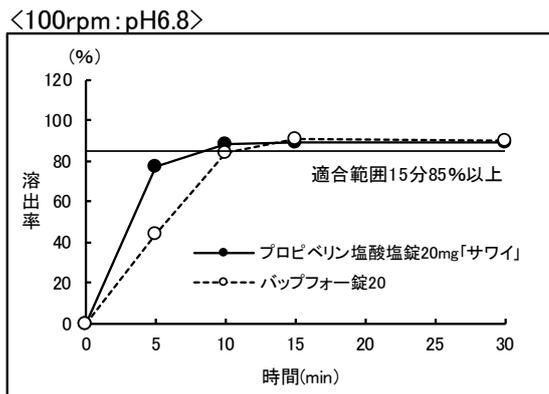
<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



IV. 製剤に関する項目



( [ ] : 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

<プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」>

PTP : 100錠 (10錠×10)

<プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」>

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

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

### 1. 効能又は効果

#### 4. 効能又は効果

- 下記疾患又は状態における頻尿、尿失禁  
神経因性膀胱、神経性頻尿、不安定膀胱、膀胱刺激状態(慢性膀胱炎、慢性前立腺炎)
- 過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

- 5.1 本剤を適用する際、十分な問診により臨床症状を確認するとともに、類似の症状を呈する疾患(尿路感染症、尿路結石、膀胱癌や前立腺癌等の下部尿路における新生物等)があることに留意し、尿検査等により除外診断を実施すること。なお、必要に応じて専門的な検査も考慮すること。
- 5.2 下部尿路閉塞疾患(前立腺肥大症等)を合併している患者では、それに対する治療を優先させること。

### 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、成人にはプロピペリン塩酸塩として20mgを1日1回食後経口投与する。  
年齢、症状により適宜増減するが、効果不十分の場合は、20mgを1日2回まで増量できる。

#### 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

#### 7. 用法及び用量に関連する注意

20mgを1日1回投与で効果不十分であり、かつ安全性に問題がない場合に増量を検討すること。

### 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

V. 治療に関する項目

4) 検証的試験

(1) 有効性検証試験

<下記疾患又は状態における頻尿、尿失禁

神経因性膀胱、神経性頻尿、不安定膀胱、膀胱刺激状態(慢性膀胱炎、慢性前立腺炎)>

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

頻尿・尿失禁を主訴とした神経因性膀胱及び不安定膀胱患者を対象としたプラセボ対照二重盲検比較試験において、プロピペリン塩酸塩20mg又はプラセボを1日1回経口投与した結果、プロピペリン塩酸塩の全般改善度評価可能症例は64例で、改善率(有効以上)は51.6%(33/64例)で優越性が検証された(U-test:  $p < 0.01$ 、 $\chi^2$ -test:  $p < 0.01$ )<sup>7)</sup>。

プロピペリン塩酸塩の副作用評価可能症例は65例であり、副作用発現率は6.2%(4/65例)であった。主な副作用は口渇3.1%(2/65例)であった。

さらに頻尿を主訴とした神経性頻尿及び刺激膀胱患者を対象としたフラボキサート塩酸塩対照二重盲検比較試験において、プロピペリン塩酸塩20mgを1日1回経口投与又はフラボキサート塩酸塩1日600mgを毎食後3回投与した結果、プロピペリン塩酸塩の全般改善度評価可能症例は96例で、改善率(有効以上)は45.8%(44/96例)で優越性が検証された(U-test:  $p < 0.05$ 、 $\chi^2$ -test:  $p < 0.05$ )<sup>8)</sup>。

プロピペリン塩酸塩の副作用評価可能症例は100例であり、副作用発現率は25%(25/100例)であった。主な副作用は口渇15%(15/100例)、排尿困難4%(4/100例)、腹痛3%(3/100例)、頭痛2%(2/100例)であった。

<過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁>

17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験

過活動膀胱患者を対象にプロピペリン塩酸塩20mgを1日1回経口投与した無作為化二重盲検並行群間比較試験(投与期間:12週間)における成績は以下のとおりであった。主要評価項目である24時間あたりの平均排尿回数の変化量、副次評価項目である24時間あたりの平均尿意切迫感回数の変化量及び24時間あたりの平均切迫性尿失禁回数の変化量に関してプロピペリン塩酸塩20mg群がプラセボ群に比し有意な減少が認められた<sup>9,10)</sup>。

最終評価時の24時間あたりの平均排尿回数変化量

投与群	症例数	投与前値		最終評価時変化量			
		平均値	標準偏差	平均値	標準偏差	両側95%信頼区間	
						下限	上限
プラセボ	270	11.10	2.52	-1.36	1.67	-1.56	-1.16
プロピペリン塩酸塩20mg	284	11.03	2.16	-1.86	1.86	-2.07	-1.64

最終評価時の24時間あたりの平均尿意切迫感回数変化量

投与群	症例数	投与前値		最終評価時変化量			
		平均値	標準偏差	平均値	標準偏差	両側95%信頼区間	
						下限	上限
プラセボ	270	4.17	3.01	-1.99	2.59	-2.30	-1.68
プロピペリン塩酸塩20mg	284	4.33	2.92	-2.84	2.52	-3.13	-2.54

最終評価時の24時間あたりの平均切迫性尿失禁回数変化量

投与群	症例数	投与前値		最終評価時変化量			
		平均値	標準偏差	平均値	標準偏差	両側95%信頼区間	
						下限	上限
プラセボ	229	1.22	1.05	-0.68	1.04	-0.81	-0.54
プロピペリン塩酸塩20mg	231	1.61	1.84	-1.18	1.64	-1.40	-0.97

プロピペリン塩酸塩の副作用評価可能症例は291例であり、副作用発現率は27.5%(80/291例)であった。主な副作用は口渇19.6%(57/291例)、便秘6.2%(18/291例)等であった。

### 17.1.3 国内第Ⅲ相高用量試験

プロピペリン塩酸塩20mgを1日1回投与で効果不十分な過活動膀胱患者を対象に、プロピペリン塩酸塩20mgを1日2回へ増量した高用量試験(非盲検非対照試験)(投与期間:12週間)の結果、評価対象44例において過活動膀胱の主症状である排尿回数、尿意切迫感及び切迫性尿失禁のすべての症状に対して増量前後で有意差が認められた<sup>11)</sup>。副作用評価可能症例は45例であり、副作用発現率は42.2%(19/45例)であった。主な副作用は口渇24.4%(11/45例)、便秘15.6%(7/45例)等であった。

#### (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. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

膀胱平滑筋弛緩作用(抗コリン作用(抗ムスカリン作用))

オキシブチニン塩酸塩、ソリフェナシンコハク酸塩、酒石酸トルテロジン、イミダフェナシン、フェソテロジンフマル酸塩<sup>12)</sup>

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### 1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

摘出膀胱においてアセチルコリン及び塩化カリウム収縮を抑制し、ムスカリン受容体への親和性を有し、アトロピンで抑制されない経壁電気刺激収縮の抑制作用を示す。また、骨盤神経の切断末梢端刺激による膀胱収縮が抑制されることより、プロピペリン塩酸塩の作用は膀胱平滑筋側にあることが示唆される。一方、主代謝物であるM-1は平滑筋直接作用を、M-2は抗コリン作用を有する。

プロピペリン塩酸塩は平滑筋直接作用及び抗コリン作用を有し、主として平滑筋直接作用により排尿運動抑制作用を示すと推定される<sup>13~16)</sup>。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 生体位膀胱の排尿運動抑制作用

###### 18.2.1 膀胱容量の増加作用

麻酔ラット及びイヌを用いたシストメトリーにおいて最大膀胱容量の増加作用を、また、除脳イヌを用いたシストメトリーにおいて最大膀胱容量並びに有効膀胱容量(1回排尿量)の増加作用を示すが、残尿量の有意な増加は認められなかった<sup>17~20)</sup>。

###### 18.2.2 排尿運動の抑制作用

麻酔ラット及びイヌにおいて膀胱充満時の律動的収縮(排尿運動)の回数減少が認められた<sup>17,18)</sup>。

###### 18.2.3 電気刺激による膀胱収縮の抑制作用

骨盤神経を切断した麻酔イヌにおいて骨盤神経の電気刺激による膀胱収縮力の低下作用が認められた<sup>16)</sup>。

##### 18.3 摘出膀胱に対する作用

膀胱平滑筋においてアセチルコリン及び塩化カリウムによる収縮(ラット、イヌ及びモルモット)と経壁電気刺激による収縮(ラット及びイヌ)の抑制が用量依存的に認められた<sup>13,15)</sup>。

#### 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 血中濃度

健康成人男子にプロピペリン塩酸塩20mgを経口投与し、血漿中の未変化体及び代謝物を測定した。

## 16.1.1 単回投与

単回投与における未変化体とその主代謝物であるM-1及びM-2の血漿中薬物動態パラメータは以下のとおりであった<sup>21)</sup>。

	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	AUC <sub>0~48hr</sub> (ng·hr/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)
未変化体	1.67±0.52	52.42± 17.32	559.97± 167.17	14.78±3.12 <sup>*1</sup>
M-1	1.04±0.40	682.41±151.02	5540.65±1349.29	9.60±1.12
M-2	1.69±0.48	9.50± 2.23	117.88± 23.33	10.07±1.95 <sup>*2</sup>

(n=16, mean±S. D., ただし<sup>\*1</sup>: n=15, <sup>\*2</sup>: n=5)

## 16.1.2 反復投与

1日1回、7日間反復投与における未変化体の血漿中濃度は4日目まで漸次上昇し、以降4～7日の投与期間中はほぼ一定した値を示し、投与終了後の半減期は約25時間であった。一方、主代謝物であるM-1の血漿中濃度は未変化体同様の推移を示し、投与終了後の半減期は約14時間であった<sup>22)</sup>。

## &lt;生物学的同等性試験&gt;

●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」<sup>23)</sup>

## 目的

プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

## 方法

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成13年5月31日 医薬審発第786号以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」とバップフォー錠10をそれぞれ1錠(プロピペリン塩酸塩として10mg)健康成人男性に絶食下单回経口投与し、血漿中プロピペリン濃度を測定する。

採血時点	0、0.5、1、1.5、2、4、6、8、12、24、32、48hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」(ロット番号:119M2507)
標準製剤	バップフォー錠10(ロット番号:9L972)

## 評価

ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUC<sub>t</sub>およびC<sub>max</sub>の対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれlog(0.8)～log(1.25)の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

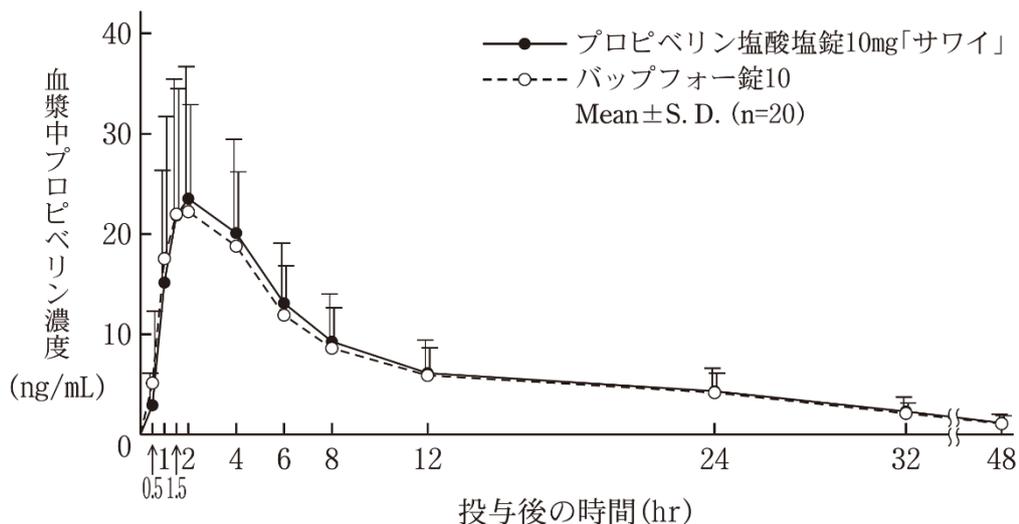
VII. 薬物動態に関する項目

結果

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-48hr</sub> (ng・hr/mL)
プロピペリン塩酸塩錠 10mg「サワイ」	24.3±13.0	2.4±1.0	14.0±3.9	273.0±139.0
バップフォー錠10	23.8±12.3	2.2±1.0	14.0±3.1	260.4±121.3

(Mean±S.D., n=20)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-48hr</sub>	log (1.03)	log (0.92) ~ log (1.15)
Cmax	log (1.00)	log (0.90) ~ log (1.12)

血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、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。

結論

得られた薬物動態パラメータ (AUC<sub>t</sub>、Cmax)の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準であるlog (0.8)~log (1.25)の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」<sup>24)</sup>

目的

プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」について、治療学的同等性を保証するため、健康成人男性を対象とした薬物動態試験により、標準製剤との生物学的同等性を検証する。

方法

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成13年5月31日 医薬審発第786号以下、ガイドラインと記載)に準じて、2剤2期のクロスオーバー試験により、プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」とバップフォー錠20をそれぞれ1錠(プロピペリン塩酸塩として20mg)健康成人男性に絶食下单回経口投与し、血漿中プロピペリン濃度を測定する。

採血時点	0、0.5、1、1.5、2、4、6、8、12、24、48hr
休薬期間	14日間
測定方法	LC/MS法

試験製剤	プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」(ロット番号:120M3303)
標準製剤	バップフォー錠20(ロット番号:0I731)

**評価**

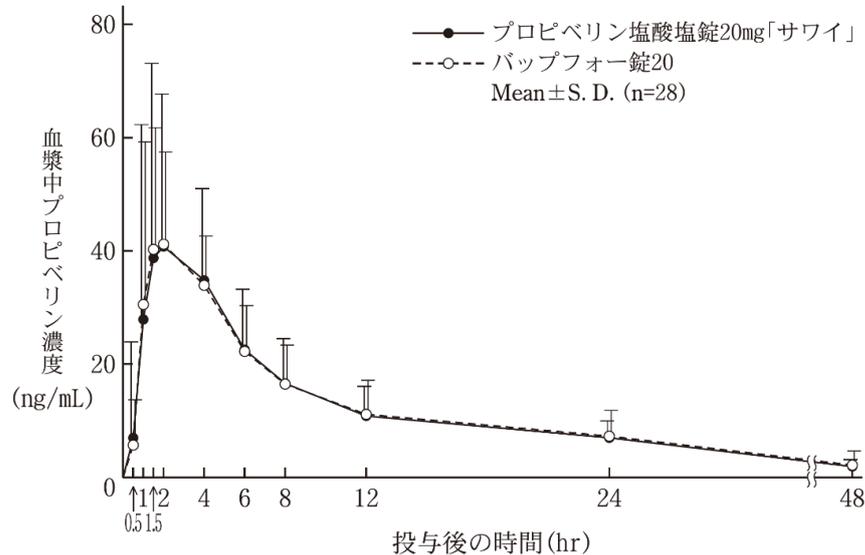
ガイドラインの判定基準に従い、両製剤のAUCtおよびCmaxの対数値の平均値の差の90%信頼区間がそれぞれlog(0.8)~log(1.25)の範囲内にあるとき、両製剤は生物学的に同等であると判定する。

**結果**

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-48hr</sub> (ng・hr/mL)
プロピペリン塩酸塩錠 20mg「サワイ」	44.0±32.7	2.2±1.0	14.1±3.9	487.4±242.5
バップフォー錠20	45.3±22.8	2.1±0.9	14.0±3.5	497.3±247.8

(Mean±S.D., n=28)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-48hr</sub>	log(0.98)	log(0.87)~log(1.10)
Cmax	log(0.94)	log(0.81)~log(1.09)

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。

**結論**

得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)の対数値の平均値の差の90%信頼区間は、いずれもガイドラインの基準であるlog(0.8)~log(1.25)の範囲内であったことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 参照

## VII. 薬物動態に関する項目

### 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

●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(プロピペリン塩酸塩として10mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>23)</sup>

$0.053 \pm 0.014 \text{hr}^{-1}$

●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(プロピペリン塩酸塩として20mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>24)</sup>

$0.053 \pm 0.013 \text{hr}^{-1}$

#### 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

### 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

VIII. -6. -5) 参照

#### 3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 参照

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

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

16.4 代謝

プロピペリン塩酸塩から主代謝物M-1への代謝には主としてCYP3A4が関与する<sup>22)</sup>。  
[9.3.1参照]

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

VII. -6. -1) 参照

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

VII. -1. -2) 参照

7. 排泄 .....

16.5 排泄

健康成人男子にプロピペリン塩酸塩20mgを単回経口投与した時の0～48時間尿には代謝物であるM-1、M-2及び2,2-ジフェニル-5-メチル-1,4-ジオキサン-3-オンなどが主に排泄され、それらの尿中総排泄量は投与量の約16%であった<sup>25)</sup>。[9.2.1参照]

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)
- 2.1 幽門、十二指腸又は腸管が閉塞している患者[胃腸の平滑筋の収縮及び運動が抑制され、症状が悪化するおそれがある。][11.1.3参照]
  - 2.2 胃アトニー又は腸アトニーのある患者[抗コリン作用により症状が悪化するおそれがある。]
  - 2.3 尿閉を有する患者[抗コリン作用により排尿時の膀胱収縮が抑制され、症状が悪化するおそれがある。][11.1.2参照]
  - 2.4 閉塞隅角緑内障の患者[抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状が悪化するおそれがある。][11.1.1参照]
  - 2.5 重症筋無力症の患者[抗コリン作用により症状が悪化するおそれがある。]
  - 2.6 重篤な心疾患の患者[期外収縮等が報告されており、症状が悪化するおそれがある。][11.1.9参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………  
V. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………  
V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由……………

8. 重要な基本的注意
- 眼調節障害、眠気、めまいがあらわれることがあるので、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従事させないよう十分に注意すること。

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 合併症・既往歴等のある患者
- 9.1.1 排尿困難のある患者  
前立腺肥大症等では排尿困難が更に悪化又は残尿が増加するおそれがある。[11.1.2参照]
  - 9.1.2 緑内障の患者(閉塞隅角緑内障の患者を除く)  
閉塞隅角緑内障以外でも抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状が悪化するおそれがある。[11.1.1参照]
  - 9.1.3 不整脈又はその既往歴のある患者  
期外収縮等が報告されており、症状が悪化又は再発するおそれがある。[11.1.9参照]
  - 9.1.4 パーキンソン症状又は脳血管障害のある患者  
症状の悪化あるいは精神神経症状があらわれるおそれがある。
  - 9.1.5 潰瘍性大腸炎のある患者  
中毒性巨大結腸があらわれるおそれがある。

9.1.6 甲状腺機能亢進症の患者

抗コリン作用により頻脈等の交感神経興奮症状が悪化するおそれがある。

2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 腎障害又はその既往歴のある患者

腎排泄が減少し、副作用が発現しやすいおそれがある。[16.5参照]

3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 肝障害又はその既往歴のある患者

主として肝で代謝されるため、副作用が発現しやすいおそれがある。[16.4参照]

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投与しないことが望ましい。

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。動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている<sup>26)</sup>。

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

安全性を考慮して10mg/日より投与を開始するなど慎重に投与すること。肝機能、腎機能が低下していることが多い。

7. 相互作用

1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意(併用に注意すること)		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
抗コリン作用を有する薬剤 三環系抗うつ剤 フェノチアジン系薬剤 モノアミン酸化酵素阻害剤	口渇、便秘、排尿困難等が あらわれるおそれがある。	抗コリン作用が増強され るおそれがある。

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 急性緑内障発作(頻度不明)

眼圧亢進、嘔気・頭痛を伴う眼痛、視力低下等があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、直ちに適切な処置を行うこと。[2.4、9.1.2参照]

11.1.2 尿閉(0.62%)

[2.3、9.1.1参照]

11.1.3 麻痺性イレウス(頻度不明)

著しい便秘、腹部膨満等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。[2.1参照]

11.1.4 幻覚・せん妄(0.25%)

11.1.5 腎機能障害(頻度不明)

BUN、血中クレアチニンの上昇があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.6 横紋筋融解症(頻度不明)

筋肉痛、脱力感、CK上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.7 血小板減少(0.12%)

11.1.8 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)(頻度不明)

発熱、紅斑、そう痒感、眼充血、口内炎等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.9 QT延長(0.25%)、心室性頻拍(頻度不明)

QT延長、心室性頻拍、房室ブロック、徐脈等があらわれることがある。[2.6、9.1.3参照]

11.1.10 肝機能障害(1.0%)、黄疸(頻度不明)

AST、ALT、 $\gamma$ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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			
	5%以上	0.1~5%未満	頻度不明
消化器	口渇(12.8%)	便秘、腹痛、嘔気・嘔吐、食欲不振、下痢、口内炎	消化不良、舌炎
泌尿器		排尿困難、残尿	尿意消失

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	5%以上	0.1～5%未満	頻度不明
精神神経系		めまい、頭痛、しびれ、 眠気	意識障害(見当識障害、一過性健忘)、パーキンソン症状(すくみ足、小刻み歩行等の歩行障害、振戦等)、ジスキネジア
循環器		血圧上昇	動悸、徐脈、期外収縮、胸部不快感
過敏症		そう痒、発疹、蕁麻疹	
眼		調節障害、眼球乾燥	
肝臓		AST上昇、ALT上昇、 Al-P上昇	
腎臓			BUN上昇、クレアチニン上昇
血液		白血球減少	
その他		浮腫、脱力感、味覚異常	倦怠感、咽頭部痛、腰痛、嘔声、痰のからみ

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 .....

<p><b>13. 過量投与</b>  <b>13.1 症状</b>                  せん妄、興奮、全身痙攣、歩行障害、言語障害、散瞳、麻痺性イレウス、尿閉、頻脈、血圧上昇、全身紅潮、肝機能障害等。  <b>13.2 処置</b>                  胃洗浄し、次にアトロピン過量投与の場合と同様の処置を行う。例えば、ネオスチグミン(抗コリン症状に対して)、抗不安剤、補液等の対症療法を行う。</p>
--

11. 適用上の注意 .....

<p><b>14. 適用上の注意</b>  <b>14.1 薬剤交付時の注意</b>                  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。</p>
--

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

<p><b>15.2 非臨床試験に基づく情報</b>                  雌雄ラット及びマウスに2年間経口投与したところ、雄ラットにおいて臨床用量の122倍(49mg/kg/日)投与群に腎腫瘍、雄マウスにおいて臨床用量の447倍(179mg/kg/日)投与群に肝腫瘍の発生率が対照群に比べ高いとの報告がある。</p>
---

---

## 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」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

## 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

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

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

## 6. 同一成分・同効薬

同一成分：バップフォー錠10/錠20/細粒2%

同効薬：膀胱平滑筋弛緩作用(抗コリン作用(抗ムスカリン作用))

オキシブチニン塩酸塩、ソリフェナシンコハク酸塩、酒石酸トルテロジン、イミダフェナシン、フェソテロジンフマル酸塩<sup>12)</sup>

## 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

## ●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」

製品名	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
旧販売名 <sup>注)</sup> 塩酸プロピペリン錠 10mg「SW」	2005年10月14日	21700AMZ00751000	2006年7月7日	2006年7月7日
販売名変更 プロピペリン塩酸塩 錠10mg「サワイ」	2023年6月26日	30500AMX00141000	薬価基準収載	2024年1月12日

注)経過措置期限 2024年3月31日

X. 管理的事項に関する項目

●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」

製品名	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
旧販売名 <sup>注)</sup> 塩酸プロピペリン錠 20mg「SW」	2005年10月14日	21700AMZ00752000	2006年7月7日	2006年7月7日
販売名変更 プロピペリン塩酸塩 錠20mg「サワイ」	2023年6月26日	30500AMX00142000	2023年12月8日	2024年1月12日

注)経過措置期限 2024年3月31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

承認年月日：2010年4月8日

効能又は効果内容：「過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：効能不十分の場合の増量を追加した。

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
プロピペリン塩酸塩 錠10mg「サワイ」	2590007F1013	2590007F1374	117389501	621738901
プロピペリン塩酸塩 錠20mg「サワイ」	2590007F2362	2590007F2362	117390101	621739001

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。

---

## X I . 文 献

---

### 1. 引用文献

- 1) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」
- 7) 高安久雄他：医学のあゆみ，1990；153(8)：459-471
- 8) 高安久雄他：西日本泌尿器科，1990；52(2)：248-258
- 9) Gotoh, M., et al. : Int. J. Urol., 2011；18(5)：365-373
- 10) 国内第Ⅲ相比較試験(バップフォー錠/細粒：2009年12月18日承認、審査報告書)
- 11) 横山修他：泌尿器外科，2011；24(6)：1023-1030
- 12) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>  
(2023/12/1 アクセス)
- 13) 春野明弘他：日本薬理学雑誌，1989；94(2)：145-150
- 14) 長尾光啓他：日本薬理学雑誌，1999；113(3)：157-166
- 15) 金子茂他：日本薬理学雑誌，1999；113(3)：145-156
- 16) 金子茂他：日本薬理学雑誌，1989；94(2)：151-157
- 17) 金子茂他：日本薬理学雑誌，1989；93(2)：55-60
- 18) 野村鳴夫他：日本薬理学雑誌，1989；94(3)：173-180
- 19) 金子茂他：日本薬理学雑誌，1990；95(2)：55-61
- 20) 土田正義他：泌尿器科紀要，1990；36(8)：915-919
- 21) 西村貴子他：薬理と治療，2006；34(7)：859-867
- 22) 第十八改正日本薬局方解説書，廣川書店，2021；C-5060-5063
- 23) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」
- 24) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」
- 25) 釘宮豊城他：臨床薬理，1990；21(3)：555-565
- 26) 宇田和彦他：薬物動態，1989；4(5)：581-593
- 27) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」
- 28) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」
- 29) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」
- 30) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」

### 2. その他の参考文献

(社)日本病院薬剤師会“錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申),平成11年8月20日”西岡豊他.錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報.改訂6版,医薬ジャーナル社,2009,p441-444

---

## 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>

##### ●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」<sup>27)</sup>

##### 目的

本製剤の粉碎後の安定性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

本製剤を粉碎し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施する。

##### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件
05601	透明瓶開放、なりゆき温湿度
	透明瓶密栓、なりゆき室温
	褐色瓶密栓、なりゆき室温

##### 結果

試験実施：2005年12月

試験項目 保存条件・期間	性状	定量試験※
イニシャル	白色の粉末	100.5
透明瓶開放 (1ヵ月)	白色の粉末	規格内 98.7
透明瓶密栓 (1ヵ月)	白色の粉末	規格内 99.2
褐色瓶密栓 (1ヵ月)	白色の粉末	規格内 99.1

※：表示量に対する含有率(%)

##### ●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」<sup>28)</sup>

##### 目的

本製剤の粉碎後の安定性を確認するため試験を実施する。

##### 方法

本製剤を粉碎し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施する。

### 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件
05601	透明瓶開放、なりゆき温湿度
	透明瓶密栓、なりゆき室温
	褐色瓶密栓、なりゆき室温

### 結果

試験実施：2005年12月

試験項目 保存条件・期間	性状	定量試験※
イニシャル	白色の粉末	99.7
透明瓶開放 (1ヵ月)	白色の粉末	規格内 97.9
透明瓶密栓 (1ヵ月)	白色の粉末	規格内 98.4
褐色瓶密栓 (1ヵ月)	白色の粉末	規格内 99.2

※：表示量に対する含有率(%)

### B) 評価分類基準

#### 【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり	形状変化や色調変化が認められる場合

#### 【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

#### 【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

### 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

#### <崩壊・懸濁性及びチューブ通過性試験>

#### ●プロピペリン塩酸塩錠10mg「サワイ」<sup>29)</sup>

#### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、試験を実施する。

#### 方法

1. 本製剤を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℃)20mLを採取して放置した。
2. 10分後シリンジを再度数回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
3. シリンジ内の液を8Fr.(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

崩壊・懸濁状態	錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

### ●プロピペリン塩酸塩錠20mg「サワイ」<sup>30)</sup>

#### 目的

本製剤の崩壊・懸濁性及び懸濁後のチューブ通過性を評価するため、試験を実施する。

#### 方法

1. 本製剤を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℃)20mLを採取して放置した。
2. 10分後シリンジを再度数回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。
3. シリンジ内の液を8Fr. (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

崩壊・懸濁状態	錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった
チューブ通過性	通過した

## 2. その他の関連資料.....

### 患者向け資材

- ・過活動膀胱OABノート～活動的な毎日を送るために～
- ・自動車運転等にはしないでください・お知らせ指導箋

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照





