

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
ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg 「日医工」
Pirenzepine Hydrochloride Tablets

剤形	素錠
製剤の規制区分	なし
規格・含量	1 錠中ピレンゼピン塩酸塩水和物 26.06mg 含有 (ピレンゼピン塩酸塩無水物として 25mg)
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・販売開始 年月日	製造販売承認：2007 年 9 月 27 日 薬価基準収載：2007 年 12 月 21 日 販売開始：1990 年 7 月 13 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ https://www.nichiiko.co.jp/

本 IF は 2022 年 12 月改訂（第 1 版）の添付文書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（<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。

目 次

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

略 語 表

6.	同一成分・同効薬.....	19
7.	国際誕生年月日	19
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.....	19
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.....	19
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	19
11.	再審査期間	19
12.	投薬期間制限に関する情報.....	19
13.	各種コード	20
14.	保険給付上の注意	20
X I.	文献	21
1.	引用文献	21
2.	その他の参考文献.....	21
X II.	参考資料	22
1.	主な外国での発売状況.....	22
2.	海外における臨床支援情報	22
X III.	備考	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.....	23
2.	その他の関連資料.....	23

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
tmax	最高血中濃度到達時間
t1/2	消失半減期

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤はピレンゼピン塩酸塩水和物を有効成分とする胃炎・消化性潰瘍治療剤である。

「ピレンゼット錠」はダイト株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、1989 年 8 月 7 日に承認取得、1990 年 7 月 13 日に日医工株式会社が販売を開始した。

その後、医療事故防止のため販売名を「ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工）」とし、2007 年 9 月 27 日に販売名変更の承認を得て、2007 年 12 月 21 日より販売した。

「ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工）」は、2014 年 7 月 31 日にダイト株式会社から日医工株式会社に製造販売承認が承継された。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、ピレンゼピン塩酸塩水和物を有効成分とする胃炎・消化性潰瘍治療剤である。
- (2) 重大な副作用（頻度不明）として、無顆粒球症、アナフィラキシーが報告されている。

3. 製品の製剤学的特性

- (1) 包装は 100 錠の小包装を有する。
- (2) PTP シートはピッチコントロールを行い、1 錠ごとに成分名、含量を表示した。

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	タイトル、参照先
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

ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg 「日医工」

(2) 洋名

Pirenzepine Hydrochloride Tablets

(3) 名称の由来

一般名より

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)

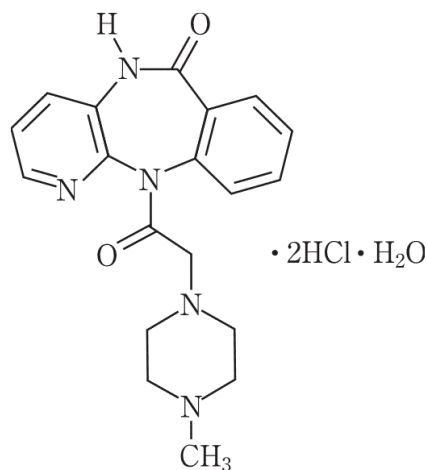
Pirenzepine Hydrochloride Hydrate (JAN)

(3) ステム (stem)

三環系抗うつ薬: -pine

3. 構造式又は示性式

化学構造式:



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

5. 化学名 (命名法) 又は本質

11-[(4-Methylpiperazin-1-yl)acetyl]-5,11-dihydro-6*H*-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。

光によって徐々に着色する。

(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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融 点：約 245℃（分解）

(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

1g を水 10mL に溶かした液の pH は 1.0～2.0 である。

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

(1) 確認試験法

1) 紫外可視吸光度測定法

本品の水溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

2) 赤外吸収スペクトル測定法

塩化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

3) 定性反応

本品の水溶液は塩化物の定性反応を呈する。

(2) 定量法

電位差滴定法

本品をギ酸に溶かし無水酢酸を加え、過塩素酸で滴定する。


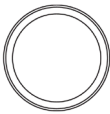

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

素錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg 「日医工」	
剤形	素錠	
色調	白色～微黄白色	
外形	表面	
	裏面	
	側面	
直径 (mm)	7.1	
厚さ (mm)	2.4	
質量 (mg)	120	
本体コード	n 120	
包装コード	Ⓝ120	

(3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

(4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

(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	ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg 「日医工」
有効成分	1錠中 ピレンゼピン塩酸塩水和物 26.06mg (ピレンゼピン塩酸塩無水物として 25mg)
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ポビドン、クロスカルメ ロースナトリウム、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム

(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⁾

(1) 加速試験

●保存包装：PTP 包装（最終包装形態）

保存条件：加速試験（40℃，75%RH）

測定項目：性状，溶出試験，定量試験

測定時期：開始時，1，3，6 ヶ月

ロット番号：1901901

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜白色の素錠＞	1901901	適合	同左	同左	同左
溶出性（%） ＜30 分，85%以上＞	1901901	100.3	100.3	97.6	98.6
含量（%）* ＜93.0～107.0%＞	1901901	99.1	98.8	97.4	98.1

※：表示量に対する含有率（%）

(2) 無包装状態の安定性

◇ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	保存期間			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 ＜白色～微黄白色の素錠＞	適合	適合	適合	適合
溶出性（%） ＜30 分，85%以上＞	100.1	99.8	98.8	98.8
含量（%）* ＜93.0～107.0%＞	99.7	97.9	98.0	98.0
（参考値）硬度（N）	41.2	42.1	38.2	40.2

※：表示量に対する含有率（%）

◇ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	保存期間			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 ＜白色～微黄白色の素錠＞	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) ＜30 分、85%以上＞	100.1	100.2	99.6	99.4
含量 (%) ※ ＜93.0～107.0%＞	99.7	99.4	99.4	98.6
(参考値) 硬度 (N)	41.2	23.5	22.5	25.5

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工」 無包装 25℃・曝光量 60 万 Lx・hr [気密容器]

試験項目 ＜規格＞	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 ＜白色～微黄白色の素錠＞	適合	適合
溶出性 (%) ＜30 分、85%以上＞	100.1	99.6
含量 (%) ※ ＜93.0～107.0%＞	99.7	97.5
(参考値) 硬度 (N)	41.2	42.1

※：表示量に対する含有率 (%)

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（物理化学的変化）

該当しない

9. 溶出性

(1) 溶出規格

ピレンゼピン塩酸塩錠25mg「日医工」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩酸ピレンゼピン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

(試験液に水 900mL を用い、溶出試験法第 2 法により 50rpm で試験を行う。)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
25mg	30 分	85%以上

(2) 溶出試験²⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成9年12月22日 医薬審発第487号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

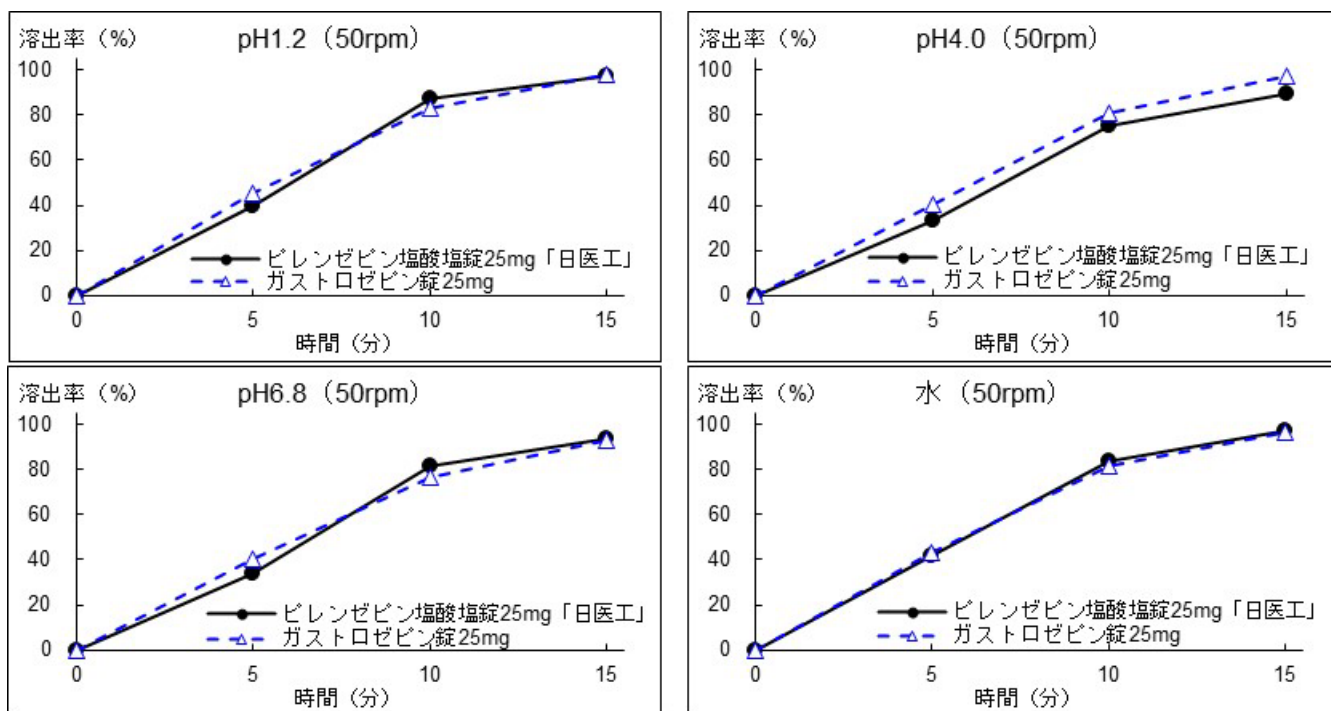
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤と比較した結果、全ての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



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

該当なし

(2) 包装

100錠 [10錠×10; PTP]

1000錠 [10錠×100; PTP]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 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

ピロー包装：ポリプロピレンフィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 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

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

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

該当資料なし

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、ピレンゼピン塩酸塩錠 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³⁾。

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、副作用は口渇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、ピレンゼピン塩酸塩錠 100mg/日を8週間投与により、本剤の有用性が認められた⁴⁾。

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、副作用は口渇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、ピレンゼピン塩酸塩錠 75mg/日を 2 週間投与により、本剤の有用性が認められた⁵⁾。

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、副作用は口渇 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) 治療的使用

該当資料なし

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

該当しない

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

硫酸アトロピン、ベンゾジアゼピン系化合物

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

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⁶⁾。

(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性

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）⁷⁾。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）⁸⁾。

18.3 胃液分泌抑制作用

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）^{7)、9)-11)}。

18.4 抗ガストリン作用

肉エキス投与による血中ガストリン値の上昇を抑制する（イヌ）⁹⁾。

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）¹²⁾⁻¹⁴⁾。

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）¹⁵⁾。

18.6 各種実験潰瘍に対する効果

18.6.1 シェイ、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）^{9)、10)、16)-17)}。

18.6.2 熱灼潰瘍と熱灼-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）^{16)、18)、19)}。

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）^{15)、16)}。

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）²²⁾。

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²³⁾。

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²⁴⁾。

(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²⁵⁾。

16.1.2 生物学的同等性試験

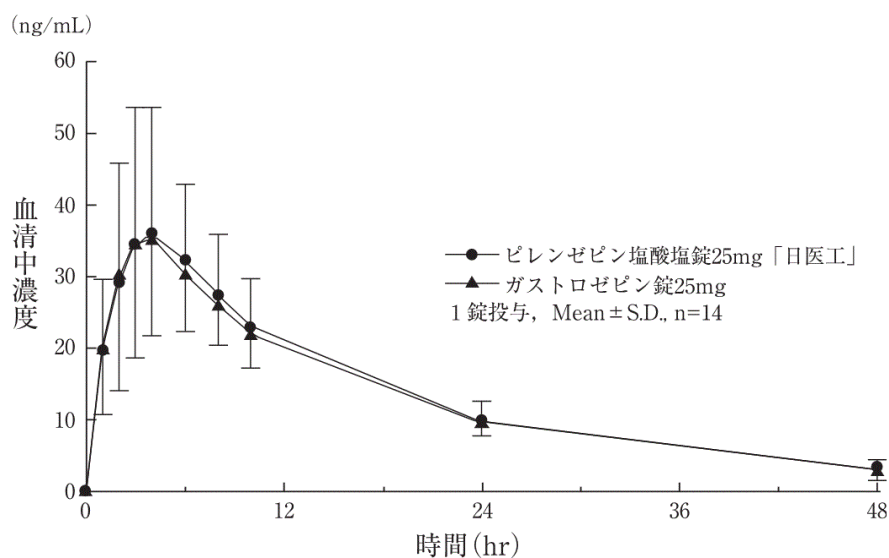
生物学的同等性に関する試験基準（薬審第 718 号昭和 55 年 5 月 30 日）

ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg 「日医工」とガストロゼピン錠 25mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ピレンゼピン塩酸塩無水物として 25mg）を健康成人男子に絶食時単回経口投与して血清中ピレンゼピン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（Cmax、AUC）について分散分析に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²⁶⁾。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	Cmax (ng/mL)	AUC (ng・hr/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg 「日医工」	39.86±18.52	666.34±207.48	4.21±1.53	13.91±1.86
ガストロゼピン錠 25mg	37.62±14.29	645.52±150.80	4.07±1.77	14.21±2.08

(1 錠投与、Mean±S.D.、n=14)



血清中濃度並びに AUC、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²⁷⁾（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

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

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²⁸⁾（外国人データ）。

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) 妊婦」の項参照）

(3) 乳汁への移行性

（「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照）

(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

16.3.1 組織移行

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（ラット）、中枢神経系及び胎児内にはほとんど移行せず（ラット、マウス）、乳汁中へは移行した（ラット）²⁹⁾⁻³¹⁾。

(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²⁸⁾（外国人データ）。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

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²⁸⁾ (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

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²⁵⁾。

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 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

眼圧を上昇させることがある。

（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

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	口渇、便秘、下痢、悪心・嘔吐	歯肉痛、膨満感
過敏症	発疹	
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、嗝声、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渇、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

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

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

製 剤	ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工」	なし
有効成分	ピレンゼピン塩酸塩水和物	劇薬*

*：1個中ピレンゼピンとして25mg以下を含有する内用剤及びピレンゼピンとして10%以下を含有する内用剤は除かれる。

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. 取扱い上の注意点

20.取扱い上の注意

開封後は遮光して保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「サワイ」

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

履歴	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
販売 開始	ピレンゼット錠	1989年 8月7日	0100AMZ00406000	1990年 7月13日	1990年 7月13日
販売名 変更	ピレンゼピン塩酸塩 錠 25mg「日医工」	2007年 9月27日	21900AMX01651000	2007年 12月21日	2007年 12月21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	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 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「日医工」	2329005F1014	2329005F1219	112729414	620006085

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) 日医工株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 日医工株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 3) 三好秋馬 他 : 内科宝函. 1980 ; 27 : 33-48
- 4) 増田正典 他 : 薬理と治療. 1980 ; 8 : 2307-2325
- 5) 三好秋馬 他 : Therapeutic Research. 1985 ; 2 : 883-905
- 6) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021 ; C4481-C4484
- 7) Jennewein H. M. : Die Behandlung des Ulcus pepticum mit Pirenzepin. 1979 : 41-48
- 8) Hammer R., et al. : Nature. 1980 ; 283 : 90-92 [PMID: 7350532]
- 9) 松尾裕 他 : 基礎と臨床. 1977 ; 11 : 897-909
- 10) Kitagawa H., et al. : Arzneimittelforschung. 1978 ; 28 : 2122-2127 [PMID: 582916]
- 11) Leitold M., et al. : Therapiewoche. 1977 ; 27 : 1517-1531
- 12) 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
- 13) 岩崎仁 他 : 診療と新薬. 1983 ; 20 : 973-980
- 14) 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
- 15) 小林礼子 他 : 臨牀と研究. 1984 ; 61 : 149-153
- 16) 岡部進 他 : 応用薬理. 1978 ; 15 : 1235-1240
- 17) 岡部進 他 : 基礎と臨床. 1980 ; 14 : 1880-1883
- 18) Leitold M., et al. : Therapiewoche. 1977 ; 27 : 1532-1548
- 19) Inatomi N., et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1979 ; 29 : 486-488 [PMID: 537265]
- 20) Takeda F., et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1985 ; 38 : 337-346 [PMID: 3865005]
- 21) 神尾弘 他 : 薬理と治療. 1985 ; 13 : 3325-3331
- 22) 岸本真也 他 : 薬理と治療. 1985 ; 13 : 2791-2795
- 23) 須山哲次 他 : 基礎と臨床. 1980 ; 14 : 792-800
- 24) 竜田正晴 他 : 臨牀と研究. 1980 ; 57 : 3103-3111
- 25) 大橋一郎 他 : 臨床薬理. 1980 ; 11 : 153-159
- 26) 社内資料 : 生物学的同等性試験
- 27) Matzek K. M., et al. : Int. J. Pharm. 1986 ; 28 : 151-155
- 28) Hammer R., et al. : Therapiewoche. 1977 ; 27 : 1575-1593
- 29) 朝倉誠 他 : 薬理と治療. 1986 ; 14 : 1277-1284
- 30) Hammer R., et al. : Therapiewoche. 1977 ; 27 : 1567-1574
- 31) Kobayashi S., et al. : Arzneimittelforschung. 1981 ; 31 : 679-690 [PMID: 6894697]

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

なし

2. 海外における臨床支援情報

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) 粉砕

ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工」

粉砕物の安定性を室内散光下の保存条件で検討した結果、含量は4週後規格外であった。

● 粉砕物 室内散光下 [開放]

試験項目 <規格>	保存期間		
	開始時	2週	4週
含量 (%) ※ <93.0~107.0%>	99.1	94.6	92.8

※：表示量に対する含有率 (%)

規格外：太字

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工」

1) 試験方法

[崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体1個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約55℃の温湯20mLを吸い取った。ディスペンサーに蓋をして5分間放置後、ディスペンサーを手で15往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に5分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体1個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

[通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約3分の2を水平にし、注入端をその約30cm上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ピレンゼピン塩酸塩錠 25mg「日医工」	5分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

2. その他の関連資料

該当資料なし