

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

滴剤型緩下剤・大腸検査前処置用下剤
ピコスルファートナトリウム水和物液
ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」
Picosulfate Na Oral Solution

剤 形	液剤
製 剤 の 規 制 区 分	なし
規 格 ・ 含 量	1mL 中：ピコスルファートナトリウム水和物 7.5mg（0.75%）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・販売開始 年月日	製造販売承認：2018 年 7 月 9 日 薬価基準収載：2022 年 5 月 25 日 販 売 開 始：1988 年 7 月 15 日
開 発 ・ 製 造 販 売（輸 入）・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元：日医工岐阜工場株式会社 発 売 元：日医工株式会社 販 売：武田薬品工業株式会社
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 2024 年 1 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に審査・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	12
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ...	12
2. 製品の治療学的特性	1	2. 薬理作用	12
3. 製品の製剤学的特性	1	VII. 薬物動態に関する項目	13
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	13
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.....	2	3. 母集団（ポピュレーション）解析	13
II. 名称に関する項目	3	4. 吸収	13
1. 販売名	3	5. 分布	13
2. 一般名	3	6. 代謝	14
3. 構造式又は示性式.....	3	7. 排泄	14
4. 分子式及び分子量.....	3	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	3	9. 透析等による除去率.....	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	10. 特定の背景を有する患者	14
III. 有効成分に関する項目	4	11. その他	14
1. 物理化学的性質	4	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	4	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	4	2. 禁忌内容とその理由	15
IV. 製剤に関する項目	5	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	15
1. 剤形.....	5	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.....	5	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	16
4. 力価.....	5	7. 相互作用	17
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	5	8. 副作用.....	17
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	17
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）	7	11. 適用上の注意.....	18
9. 溶出性	8	12. その他の注意	18
10. 容器・包装	8	IX. 非臨床試験に関する項目	19
11. 別途提供される資材類	8	1. 薬理試験	19
12. その他	8	2. 毒性試験	19
V. 治療に関する項目	9	X. 管理的事項に関する項目	20
1. 効能又は効果	9	1. 規制区分	20
2. 効能又は効果に関連する注意.....	9	2. 有効期間	20
3. 用法及び用量	9	3. 包装状態での貯法	20
4. 用法及び用量に関連する注意.....	9	4. 取扱い上の注意点	20
5. 臨床成績	9	5. 患者向け資材	20

略 語 表

略語	略語内容
LD ₅₀	半数致死量
ED ₅₀	50%有効量
S.D.	標準偏差

6. 同一成分・同効薬.....	20
7. 国際誕生年月日	20
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	20
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.....	20
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	21
11. 再審査期間	21
12. 投薬期間制限に関する情報	21
13. 各種コード	21
14. 保険給付上の注意	21
X I. 文献.....	22
1. 引用文献	22
2. その他の参考文献.....	22
X II. 参考資料.....	23
1. 主な外国での発売状況.....	23
2. 海外における臨床支援情報	23
X III. 備考.....	24
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たったの参考情報.....	24
2. その他の関連資料.....	24

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、ピコスルファートナトリウム水和物を有効成分とする滴剤型緩下剤・大腸検査前処置用下剤である。

「チャルドール液」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験を実施し、1987年10月20日に承認を取得し、1988年7月15日に販売を開始した。（薬発第698号（昭和55年5月30日）に基づき承認申請）

「チャルドール液」は、1991年9月4日付で「手術前における腸管内容物の排除」、2003年2月4日付で「大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除」の効能又は効果、用法及び用量が追加された。

医療事故防止のため、以下の販売名変更を行った。

承認年月日	販売名	旧販売名
2008年3月13日	チャルドール内用液 0.75%	チャルドール液
2018年7月9日	ピコスルファート Na 内用液 0.75%「武田テバ」	チャルドール内用液 0.75%

ピコスルファート Na 内用液 0.75%「武田テバ」は、2022年5月1日、日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「NIG」に変更し、2022年5月25日に薬価収載され、日医工株式会社が販売することとなった。

2. 製品の治療学的特性

- （1）本剤は、ピコスルファートナトリウム水和物を有効成分とする滴剤型緩下剤・大腸検査前処置用下剤である。
- （2）重大な副作用として、大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除に用いた場合、腸閉塞、腸管穿孔、虚血性大腸炎が報告されている。（「Ⅷ. 8.（1）重大な副作用と初期症状」の項参照）

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料、 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 作成されている資料	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 Na 内用液 0.75% 「NIG」

(2) 洋名

Picosulfate Na Oral Solution

(3) 名称の由来

一般名より

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)

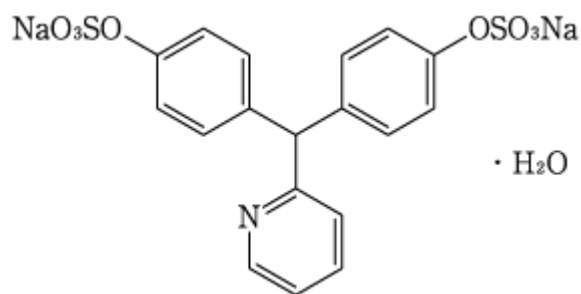
Sodium Picosulfate Hydrate (JAN)

(3) ステム (stem)

不明

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：C₁₈H₁₃NNa₂O₈S₂ · H₂O

分子量：499.42

5. 化学名 (命名法) 又は本質

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

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

白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。

(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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(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

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

本品1.0gを水20mLに溶かした液のpHは7.4～9.4である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は、光により徐々に着色する。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

(1) 確認試験法

1) 呈色反応

本品に1-クロロ-2,4-ジニトロベンゼンを加えて加熱融解する。冷後、水酸化カリウム・エタノール試液を加えるとき、液は橙赤色を呈する。

2) 沈殿反応

本品に希塩酸を加え煮沸し、冷後、塩化バリウム試液を加えるとき、白色の沈殿を生じる。

3) 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。

4) 赤外吸収スペクトル測定法

臭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。

5) 定性反応

本品の水溶液はナトリウム塩の定性反応を呈する。

(2) 定量法

電位差滴定法

本品にメタノール及び酢酸を加え、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

液剤

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」
色・剤形	無色～微黄色の澄明な液
pH	5.0～7.5

(3) 識別コード

該当しない

(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	ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」
有効成分	1mL 中：ピコスルファートナトリウム水和物 7.5mg (0.75%)
添加剤	D-ソルビトール液、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、pH 調節剤

(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

◇ピコスルファート Na 内用液 0.75%「NIG」 加速試験 40℃・75%RH [ポリエチレン製容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット番号	保存期間			
		開始時	2 ヶ月	4 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜無色～微黄色の澄明な液＞	3NOM 4NOM 5NOM	適合	適合	適合	適合
pH ＜5.0～7.5＞	3NOM 4NOM 5NOM	7.04±0.02 ^{※2}	7.04±0.01 ^{※2}	7.04±0.02 ^{※2}	7.05±0.01 ^{※2}
比重 ＜1.148～1.168＞	3NOM 4NOM 5NOM	1.157±0.001 ^{※2}	1.156±0.001 ^{※2}	1.157±0.001 ^{※2}	1.157±0.001 ^{※2}
純度試験 ＜比較液より濃くない＞	3NOM 4NOM 5NOM	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ^{※1} ＜95～105%＞	3NOM 4NOM 5NOM	99.4±0.3 ^{※2}	99.6±0.2 ^{※2}	99.7±0.7 ^{※2}	99.7±0.2 ^{※2}

※1：表示量に対する含有率 (%)

※2：平均値±標準偏差 (S.D.)

(2) 曝光下の安定性

◇ピコスルファート Na 内用液 0.75%「NIG」 曝光量 60 万 Lx・hr [ポリエチレン製容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx・hr
性状 ＜無色～微黄色の澄明な液＞	665908	無色澄明の液	無色澄明の液
含量 (%) ^{※1} ＜95～105%＞	665908	101.3±0.4 ^{※2}	101.8±0.2 ^{※2}

※1：表示量に対する含有率 (%)

※2：平均値±標準偏差 (S.D.)

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）²⁾

本項の情報に関する注意

本項は、本剤の物理化学的安定性に関する情報であり、他剤と配合して使用した際の有効性・安全性についての評価は実施していない。また、配合した他剤の物理化学的安定性については検討していない。本剤を他剤と配合して使用する際には、各薬剤の添付文書を確認し、判断すること。

配合変化試験

＜ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」＞

1) 2 剤配合変化試験

ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」（製造番号 1EOK）1mL とガスコンドロップ内用液 2%（消化管内ガス駆除剤）4mL を配合した液につき試験を行った。

保存条件：室温及び冷所（5℃）

試験項目：外観、臭い、味、pH、定量

試験項目	保存条件	配合前	測定時間					
			配合直後	6 時間後	24 時間後	36 時間後	3 日後	7 日後
外観	室温	白濁液	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	冷所			変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
臭い	室温	芳香	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	冷所			変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
味	室温	甘味	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
	冷所			変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
pH	室温	6.25	6.26	6.26	6.26	6.26	6.26	6.24
	冷所			6.26	6.26	6.26	6.26	6.24
定量(%) ※1	室温	100	100	101.0	100.8	101.0	98.3	91.4
	冷所			100.0	101.0	100.3	99.5	99.4

※1：配合直後のピコスルファートナトリウム水和物の定量値を 100% とした残存率（%）

2) 飲料または造影剤との配合変化試験

ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」（製造番号 6EDJ）と各種飲料または造影剤（硫酸バリウム）を配合した液につき試験を行った。

保存条件：室内散光下

試料液：1.0mL/100mL（ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」/配合液）

試験項目：外観、臭い、味、pH、残存率

配合液	配合液の pH	測定時間	試験項目		
			外観・臭い・味	pH	残存率
水	pH7.22	配合直後	変化なし	7.25	100.0
		1 時間	変化なし	7.24	100.2
コーヒー	pH5.34	配合直後	変化なし	5.33	100.0
		1 時間	変化なし	5.35	102.1
紅茶	pH5.17	配合直後	変化なし	5.23	100.0
		1 時間	変化なし	5.23	100.7
オレンジジュース	pH3.01	配合直後	変化なし	3.01	100.0
		1 時間	変化なし	3.01	100.5
アップルジュース	pH3.10	配合直後	変化なし	3.08	100.0
		1 時間	変化なし	3.09	101.9
牛乳	pH6.62	配合直後	変化なし	6.62	100.0
		1 時間	変化なし	6.62	98.3
造影剤 （硫酸バリウム）	pH5.74	配合直後	変化なし	5.76	100.0
		1 時間	変化なし	5.77	99.4

9. 溶出性

該当しない

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

目には入れないこと

(2) 包装

10mL×10

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ボトル：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当記載事項なし

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、手術前における腸管内容物の排除、大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除

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、成人に対して1日1回10～15滴（0.67～1.0mL）を経口投与する。

小児に対しては、1日1回、次の基準で経口投与する。

用量\年齢	6ヵ月以下	7～12ヵ月	1～3才	4～6才	7～15才
滴数 (mL)	2 (0.13)	3 (0.20)	6 (0.40)	7 (0.46)	10 (0.67)

〈術後排便補助〉

通常、成人に対して1日1回10～15滴（0.67～1.0mL）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、成人に対して6～15滴（0.40～1.0mL）を経口投与する。

〈手術前における腸管内容物の排除〉

通常、成人に対して14滴（0.93mL）を経口投与する。

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

通常、成人に対して検査予定時間の10～15時間前に20mLを経口投与する。

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

1) 有効性検証試験³⁾

＜ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」＞

手術前における腸管内容物の排除について国内 2 施設で臨床試験を実施し、有効性評価症例 50 例に対する有効率は「有効」以上 46.0% (23/50)、「やや有効」以上 66.0% (33/50) であった。

① 便通状態及び腹部症状

手術前日の夕食 1 時間前に、ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」(1mL 中にピコスルファートナトリウム水和物 7.5mg を含有) 14 滴をコップ一杯の水またはぬるま湯に滴下して服用させた時の便通状態及び腹部症状は以下のとおりである。

i. 便通状態

排便あり	排便なし	合計
33 (66.0%)	17 (34.0%)	50

評価項目		症例数	割合 (%)	評価項目		症例数	割合 (%)
排便回数	1 回	18	54.5	排便の量	多かった	10	30.3
	2 回	12	36.4		変わらない	15	45.5
	3 回	3	9.1		少なかった	8	24.2
便の性状	兔糞状便	1	3.0	自覚症状	とてもすっきり	5	15.2
	硬便	1	3.0		すっきりした	16	48.5
	普通便	19	57.6		すっきりしない	12	36.4
	軟便	9	27.3		激しい便意	0	0.0
	下痢	3	9.1	残便感	なし	22	66.7
					あり	11	33.3

ii. 効果発現時間

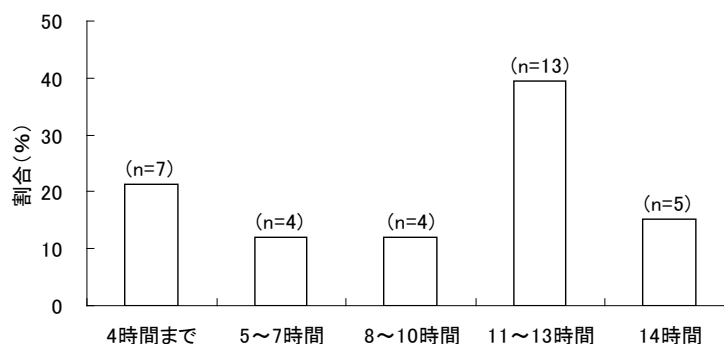


図 1 効果発現時間 (対象：排便のあった 33 例)

iii. 一般腹部症状

	症状なし	軽度	中等度	高度	合計
腹痛	38 (76.0%)	7 (14.0%)	4 (8.0%)	1 (2.0%)	50
腹鳴	36 (72.0%)	9 (18.0%)	5 (10.0%)	0	50
腹部膨満感	39 (78.0%)	5 (10.0%)	6 (12.0%)	0	50
悪心・嘔吐	48 (96.0%)	2 (4.0%)	0	0	50

②有効性評価

著効	有効	やや有効	無効	合計
6 (12.0%)	17 (34.0%)	10 (20.0%)	17 (34.0%)	50
23 (46.0%)				
33 (66.0%)				

著効：排便があり残便感もなく、気分がとてもすっきりしたもの

有効：排便があり残便感もなく、気分がすっきりしたもの

やや有効：排便はあったが残便感があり、気分もすっきりしないもの

無効：排便がなかったもの

③安全性評価

安全性検討症例 54 例中副作用が報告されたのは 2 例 (3.7%) であり、その内訳は腹鳴、腹痛各 1 例であった。

性別	年齢	症状 (重症度)	因果関係	コメント
女	29	腹鳴 (高度)	あり	次第に症状軽減、処置なし
女	23	腹痛 (高度)	多分あり	処置せず、まもなく軽快した

④有用性評価

有効性評価、副作用の有無及び一般腹部症状の発現・程度を総合的に判断し、担当医が次の 4 段階で判定した。

極めて有用	有用	やや有用	無用	合計
4 (8.0%)	16 (32.0%)	13 (26.0%)	17 (34.0%)	50
20 (40.0%)				
33 (66.0%)				

2) 安全性試験

(「V. 5. (4). 1」有効性検証試験」の項参照)

(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

滴剤型緩下剤・大腸検査前処置用下剤

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

ピコスルファートナトリウム水和物は、胃、小腸ではほとんど作用せず、大腸細菌叢由来の酵素アリルスルファターゼにより加水分解され、活性型のジフェノール体となる^{4)、5)} (ラット)。ジフェノール体は、腸管粘膜への以下の作用により瀉下作用を示す。

- ・腸管蠕動運動の亢進作用⁶⁾ (ラット)
- ・水分吸収阻害作用⁷⁾ (ラット)

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 瀉下効果⁸⁾

ラットに経口投与したとき、センノシド、酢酸ビソキサチンより低用量で確実な瀉下効果を示した。また、本剤はセンノシドより最適用量の幅が広いことが認められた。

薬物	ED ₅₀ 値
ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」	3.76 (2.10～6.71) mg/kg
センノシド	11.61 (9.39～14.35) mg/kg

2) 硫酸バリウム排泄促進作用⁸⁾

ラットに経口投与したとき、低用量で強力な硫酸バリウム排泄促進作用を示し、その効力はセンノシドの約 5 倍、酢酸ビソキサチンの約 3 倍であった。

薬物	用量 (mg/kg)	例数	排泄時間 (分) 平均±標準誤差
無処置対照	—	10	428.5± 6.8
ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」	5	10	260.1±8.6***
	10	10	223.0±6.4***
	25	10	181.2±5.1***
センノシド	25	10	263.6±14.3***
	50	10	248.9±15.4***

*** : p<0.001 (対無処置対照)

(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

経口投与後、胃、小腸ではほとんど吸収されない⁹⁾。

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

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^{10)、11)}。

(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ル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^{9)、10)、12)}。

(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

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^{10)、12)}。

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¹⁰⁾。

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）

〈効能共通〉

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

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

2.3 腸管に閉塞のある患者又はその疑いのある患者〔腸管蠕動運動の亢進により腸管の閉塞による症状が増悪し、腸管穿孔に至るおそれがある。〕

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

〈手術前における腸管内容物の排除〉

8.1 必要に応じて浣腸を併用すること。

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

8.2 腸管蠕動運動の亢進により腸管内圧の上昇を来し、虚血性大腸炎を生じることがある。また、腸管に狭窄のある患者では、腸閉塞を生じて腸管穿孔に至るおそれがあるので、投与に際しては次の点を留意すること。〔11.1.1、11.1.2 参照〕

8.2.1 患者の日常の排便状況を確認し、本剤投与前日あるいは投与前に通常程度の排便があったことを確認してから投与すること。

8.2.2 本剤投与後に腹痛等の異常が認められた場合には、腹部の診察や画像検査（単純 X 線、超音波、CT 等）を行い、適切な処置を行うこと。

8.3 自宅で行う際には、副作用があらわれた場合に対応が困難なことがあるので、ひとりでの服用は避けるよう指導すること。

8.4 水を十分に摂取させること。

（解説）

8.1 患者の疾患や排便状況等により、必要に応じて浣腸を併用すること。

8.2 重大な副作用（虚血性大腸炎、腸閉塞、腸管穿孔）を回避するための共通の注意事項として記載した。患者の日常排便の確認は腸管の閉塞や狭窄、重度な便秘の有無等を把握する上で重要であり、本剤投与前日あるいは投与前に通常程度の排便があったことを確認してから投与する必要がある。また、ピコスルファート Na 内用液製剤を大腸検査前処置を目的として投与し「腸閉塞」「腸管穿孔」を生じた症例において、初期症状として腹痛が発現しており、虚血性大腸炎の初期症状としても腹痛がある。また、これらの症例において腹痛のほか嘔吐を発現していることも多く、これらの症状が現れた場合には、腹部の診察や画像検査（単純 X 線、超音波、CT 等）を行い、速やかな対応、処置が必要である。

8.3 ピコスルファート Na 内用液製剤を大腸検査前処置に用いる場合には、検査前日に自宅で投与することが多いため、自宅で服用した際、重篤な副作用が発現したときに適切な対応ができるよう、自宅での服用に関する注意書きを記載した。

8.4 ピコスルファート Na 内用液製剤を大腸検査前処置として投与した後は、水様の便が頻回に出るので、脱水症状を予防するため、また、下剤の効果を高めるため水分を十分摂取させることが必要である。

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

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

9.1.1 腸管狭窄及び重度な便秘の患者

腸管蠕動運動の亢進により虚血性大腸炎又は腸閉塞を生じることがある。また、腸閉塞を生じた場合には腸管穿孔に至るおそれがある。

9.1.2 腸管憩室のある患者

腸管蠕動運動の亢進により病態が増悪するおそれがある。

(解説)

9.1.1 腸管狭窄及び重度な便秘の患者に大腸検査前処置としてピコスルファート Na 内用液製剤が投与された症例において「虚血性大腸炎」が報告されている。また、腸管狭窄のあった患者に大腸検査前処置としてピコスルファート Na 内用液製剤が投与された症例において、腸閉塞を生じた症例及び、腸閉塞から腸管穿孔に至った症例が報告されている。このように、腸管狭窄のある患者や排便コントロールが十分なされていない重度な便秘の患者に、大腸検査前処置を目的に高用量のピコスルファート Na 内用液製剤が投与された場合、腸管蠕動運動の亢進により虚血性大腸炎や腸閉塞を生じるおそれがあること、腸閉塞を生じた場合には腸管穿孔に至るおそれがあることから設定した。

9.1.2 腸管憩室のある患者に本剤を大腸検査前処置に用いた場合、腸管蠕動運動の亢進により病態が悪化する可能性が考えられるため設定した。

(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

11.1 重大な副作用

〈大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除〉

11.1.1 腸閉塞、腸管穿孔（いずれも頻度不明）

腸管に狭窄のある患者において腸閉塞を生じ、腸管穿孔に至るおそれがあるので、観察を十分に行い、腹痛等の異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。[8.2 参照]

11.1.2 虚血性大腸炎（頻度不明）

[8.2 参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	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
精神神経系		めまい ^{注2)} 、一過性の意識消失 ^{注2)}

注 1) 副作用の頻度は承認時までの臨床試験及び使用成績調査を含む。

注 2) 大腸検査前処置に用いた場合、排便や腹痛による血管迷走神経反射に伴い症状があらわれることがある。

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

設定されていない

11. 適用上の注意

14.適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

眼科用（点眼）として使用しないこと。

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⁸⁾

動物種	性	用量 (g/kg)	例数	投与後死亡動物数				計	LD ₅₀ 値 (g・kg) (95%信頼限界)
				0 日		1 日 2 日～7 日			
				1hr	3hr 6hr				
マウス	雄	10.0	10					0/10	14.7 (13.4～16.2)
		12.0	10		1			1/10	
		14.4	10	3	1		1	5/10	
		17.3	10	5	2		1	8/10	
		20.7	10	8	2			10/10	
	雌	10.0	10					0/10	15.8 (14.3～17.4)
		12.0	10		1			1/10	
		14.4	10		2	1		3/10	
		17.3	10	5	1	1		7/10	
		20.7	10	7	2			9/10	
ラット	雄	5.0	10					0/10	11.5 (9.5～14.0)
		7.0	10			1		1/10	
		9.8	10	2	1			3/10	
		13.7	10	5	2			7/10	
		19.2	10	8	2			10/10	
	雌	5.0	10					0/10	12.7 (10.5～15.3)
		7.0	10					0/10	
		9.8	10		2			2/10	
		13.7	10		3	1	2	6/10	
		19.2	10	8	2			10/10	

(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	ピコスルファート Na 内用液 0.75% 「NIG」	なし
有効成分	ピコスルファートナトリウム水和物	なし

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

外箱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：有（「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照）

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ラキソベロン内用液 0.75%

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	チャルドール液	1987 年 10 月 20 日	16200AMZ01468000	1988 年 7 月 15 日	1988 年 7 月 15 日
販売名 変更	チャルドール内用液 0.75%	2008 年 3 月 13 日	22000AMX00762000	2008 年 6 月 20 日	2008 年 6 月 20 日
販売名 変更	ピコスルファート Na 内 用液 0.75% 「武田テバ」	2018 年 7 月 9 日	23000AMX00536000	2018 年 12 月 14 日	2018 年 12 月 14 日
承継	ピコスルファート Na 内 用液 0.75% 「NIG」	2018 年 7 月 9 日	23000AMX00536000	2022 年 5 月 25 日	2022 年 5 月 25 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

＜効能又は効果、用法及び用量追加＞

追加年月日：1991 年 9 月 4 日

販売名：チャルドール液

内容：「手術前における腸管内容物の排除」の追加

＜効能又は効果、用法及び用量追加＞

追加年月日：2003 年 2 月 4 日

販売名：チャルドール液

内容：「大腸検査（X 線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除」の追加

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
ピコスルファート Na 内用液 0.75%「NIG」	2359005S1356	2359005S1356	104908408	620490808

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) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：配合変化試験
- 3) 社内資料：臨床試験
- 4) 鶴見介登ほか：応用薬理. 1977 ; 14 (4) : 549-55.
- 5) Jauch R, et al. : Arzneimittel-Forsch. 1975 ; 25 (11) : 1796-800. (PMID: 1243088)
- 6) Pala G, et al. : Arch Int Pharmacodyn. 1966 ; 164 (2) : 356-69.
- 7) Forth W, et al. : Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol. 1972 ; 274 (1) : 46-53. (PMID: 4262724)
- 8) 社内資料：薬効薬理試験
- 9) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店 ; 2021 : C-4263-66.
- 10) Jauch R, et al. : Arzneimittel-Forsch. 1977 ; 27 (5) : 1045-50. (PMID: 577869)
- 11) 大沼規男ほか：医薬品研究. 1977 ; 8 (4) : 485-90.
- 12) 大沼規男ほか：医薬品研究. 1977 ; 8 (4) : 474-84.

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

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

該当しない

2. その他の関連資料

○患者指導箋（製品同梱）

表

ピコスルファートNa内用液0.75%「NIG」を服用される方へ

このお薬は下剤です。目には入れないこと。

○このお薬は、1日1回寝る前にコップ半分くらいの水に滴下して服用してください。

1日1回 滴

○右の図のように容器の胴部分をゆっくりと押して、1滴ずつ滴下してください。



裏

○医師・薬剤師に指示された滴数を服用してください。
ただし、便が硬過ぎたり軟らか過ぎる場合には、2滴ずつ（小児の場合は1滴ずつ）増減して、自分に適した量を服用してください。

○通常、基準の滴数は次の通りです。

用量	年齢	6か月以下	7～12か月	1～3才	4～6才	7～15才	成人
滴数		2	3	6	7	10	10～15

PQ054101
①

 **日医工株式会社**

2022年5月作成
N202200025

○大腸検査を受けられる方へ

大腸検査を受ける前に 大腸検査ができる便の状態をチェック！

大腸検査を受ける前に

大腸検査ができる便の状態をチェック!

大腸検査を受けるためには、検査前日または検査当日にお薬を飲んでいただき、大腸をきれいにする必要があります。正確な診断をするためには、検査前に便の状態をきちんとチェックすることが重要です。

便の状態はこのように変化していきます。よく観察しましょう。

No Good...
この状態では大腸検査ができません。

まだまだ便が残っています。 まだまだ便が残っています。

More!
あともう少し!

色が薄く、にごっています。 固形物が残っています。

OK!!
これで準備ができました!

固形物がなく、黄色透明です。 ほとんど無色透明です。

