



014112

※※2017年8月改訂（第10版、提携先変更に伴う改訂）

※2016年10月改訂



014112

日本標準商品分類番号	872359
------------	--------

滴剤型緩下剤・大腸検査前処置用下剤  
**ラキソベロン®内用液0.75%**  
 ピコスルファートナトリウム水和物製剤  
**Laxoberon® Solution 0.75%**

承認番号	22100AMX01299000
薬価収載	2009年9月
販売開始	1980年4月
効能追加	2010年3月
再審査結果	1999年3月

【貯法】 遮光した気密容器にて室温保存

【使用期限】 製造後3年（外箱に表示）

## 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- 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。]
- 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- 腸管に閉塞のある患者又はその疑いのある患者（**大腸検査前処置に用いる場合**）  
[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。]

## 【組成・性状】

販売名	ラキソベロン内用液0.75%	
剤形	液剤	
有効成分	名称	ピコスルファートナトリウム水和物
	含量	7.5mg/mL
添加物	パラオキシ安息香酸メチル 水酸化ナトリウム D-ソルビトール 塩酸	
色調・性状	無色～微黄色の澄明な、わずかに粘性のある液体で、においはなく、味は甘い	
pH	5.0～7.5	

## 【効能・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

## 【用法・用量】

- 各種便秘症の場合、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。

年齢 用量	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)

- 術後排便補助の場合、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）投与後の排便促進の場合、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の場合、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の場合、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。

## 【使用上の注意】

## 1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

## ＜大腸検査前処置に用いる場合＞

- 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。]
- 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。]
- 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

## 2. 重要な基本的注意

- 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。（「重大な副作用」の項参照）
  - 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。
  - 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。
- 自宅で本剤を用いて**大腸検査前処置**を行う際には、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。
- 本剤を**大腸検査前処置**に用いる場合は、**水を十分に摂取**させること。
- 本剤を手術前における腸管内容物の排除に使用する場合は、必要に応じて浣腸を併用すること。

## 3. 副作用

## 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

ラキソベロン液の承認時及び使用成績調査における安全性評価対象7,561例中92例（1.2%）に112件の副作用が認められ、主なものは腹痛57件（0.8%）、腹鳴15件（0.2%）、悪心・嘔吐12件（0.2%）等の消化器症状であった。また、副作用とされた臨床検査値の変動はなかった。（使用成績調査終了時）

ラキソベロン錠の承認時における安全性評価対象85例において、副作用は認められなかった。また、副作用とされた臨床検査値の変動はなかった。

## 大腸検査（X線・内視鏡）前処置における腸管内容物の排除

承認時及びその後の使用成績調査における安全性評価対象1,920例中97例（5.1%）に120件の副作用が認められ、主なものは腹痛50件（2.6%）、腹部膨満感26件（1.4%）、悪心17件（0.9%）等の消化器症状であった。（再審査終了時）

## (1) 重大な副作用

- 腸閉塞、腸管穿孔（頻度不明）：大腸検査前処置に用いた場合、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。（「重要な基本的注意」の項参照）
- 虚血性大腸炎（頻度不明）：大腸検査前処置に用いた場合、虚血性大腸炎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適切な処置を行うこと。（「重要な基本的注意」の項参照）

## (2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には投与を中止する等、適切な処置を行うこと。

種類	頻度	頻度不明	0.1～5%未満
消化器		腹部不快感	腹痛、悪心、嘔吐、腹鳴、腹部膨満感、下痢等
皮膚		蕁麻疹、発疹等	
肝臓		AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇等	
精神神経系		めまい <sup>注)</sup> 、一過性の意識消失 <sup>注)</sup>	

注) 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。

## 4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

## 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、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。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

## 6. 適用上の注意

投与経路：眼科用（点眼）として使用しないこと。

## 【薬物動態】

### (参考)

#### 1. 分布

<sup>14</sup>C-ピコスルファートナトリウム水和物 5 mg/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<sup>1),2)</sup>。

#### 2. 代謝

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<sup>1),3)</sup>。

#### 3. 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<sup>1),3)</sup>。

ラットに<sup>14</sup>C-ピコスルファートナトリウム水和物 5 mg/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<sup>1)</sup>。

## 【臨床成績】

### 臨床効果

国内延べ81施設で実施された二重盲検試験を含む臨床試験の効果判定症例1,679例における有効率は次のとおりであった<sup>4)~7)</sup>。

疾患名	有効率 (%)	有効以上
各種便秘症		83.4% (750/899)
術後排便補助		87.7% (57/65)
造影剤排泄促進		94.8% (489/516)
大腸検査前処置		77.4% (154/199)

## 【薬効薬理】

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(ラット)<sup>8),9)</sup>。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。

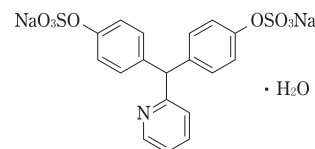
- 腸管蠕動運動の亢進作用 (ラット)<sup>10)</sup>
- 水分吸収阻害作用 (ラット)<sup>11)</sup>

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ピコスルファートナトリウム水和物  
(Sodium Picosulfate Hydrate)

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

化学構造式：



分子式：C<sub>18</sub>H<sub>13</sub>NNa<sub>2</sub>O<sub>8</sub>S<sub>2</sub> · H<sub>2</sub>O

分子量：499.42

性状：白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。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。光により徐々に着色する。

## 【包装】

10mL×10 (定量滴下型遮光気密容器入り)

10mL×12 (ユニットドーズ容器アルミ包装入り)

100mL (褐色ガラス瓶入り)

100mL包装(褐色ガラス瓶入り)には、目盛付きスポイト(定量滴下型容器の滴数換算目盛及びmL表示)を添付している。

## 【主要文献】

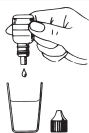
- 1) Jauch, R. et al. : *Arzneim.-Forsch.*, 27(5)1045, 1977
- 2) 大沼規男ほか：医薬品研究, 8(4)485, 1977
- 3) 大沼規男ほか：医薬品研究, 8(4)474, 1977
- 4) 川井啓市ほか：新薬と臨牀, 26(4)593, 1977
- 5) 国分義行ほか：小児科診療, 40(4)490, 1977
- 6) 笹川 力ほか：Therapeutic Research, 11(9)3207, 1990
- 7) 笹川 力ほか：Therapeutic Research, 11(9)3217, 1990
- 8) 鶴見介登ほか：応用薬理, 14(4)549, 1977
- 9) Jauch, R. et al. : *Arzneim.-Forsch.*, 25(11)1796, 1975
- 10) Pala, G. et al. : *Arch. Int. Pharmacodyn.*, 164(2)356, 1966
- 11) Forth, W. et al. : *Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol.*, 274(1)46, 1972

## ※【文献請求先】

帝人ファーマ株式会社 メディカル情報グループ  
〒100-8585 東京都千代田区霞が関3丁目2番1号  
フリーダイヤル 0120-189-315

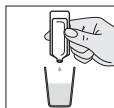
### <定量滴下型容器の使用方法>

通常は、適量の水などを入れた容器に、  
図の如く瓶の胴をゆっくり押し、1滴  
ずつ滴下して下さい。



### <10mLユニットドーズ容器の使用方法>

- ①アルミ包装から容器を取りだして下さい。
- ②図のように立てたまま、ゆっくり上部の  
ノズル部を回転させて開封して下さい。
- ③開封したら、逆さにして容器の胴を軽く  
押し、コップに用意した適量の水に、本  
剤を溶かして服用して下さい。（本容器  
から直接服用しないで下さい。）
- ④開封後は速やかに服用して下さい。なお、  
誤用を避けるために、残液は使用しない  
で下さい。
- ⑤本容器の1滴は、定量滴下型容器の1滴の  
量と一致しません。



### <100mL瓶用スポイトの使用方法>

- 100mL包装（褐色ガラス瓶入り）に添付しているスポイ  
トの1滴の量は、定量滴下型容器の1滴の量と一致しな  
いので、スポイトの目盛でご使用下さい。
- スポイトの目盛は、定量滴下型容器の5～50滴を5滴毎  
に示した滴数目盛及び1、2、3mLのmL目盛の両方で  
表示しています。

製造販売元

帝人ファーマ株式会社

東京都千代田区霞が関3丁目2番1号

※※提携: **SANOFI** 

