

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(1998年9月)に準拠して作成

胃炎・消化性潰瘍治療剤

指定医薬品

錠 25mg

《ピレンゼピン塩酸塩水和物錠》

PIN

剤形	錠剤（割線入り素錠）
規格・含量	1錠中にピレンゼピン塩酸塩水和物を25mg（無水物として）含有する。
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 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2007年 2月 2日 薬価基準収載年月日：2007年 6月15日 発売年月日：1992年 8月10日
開発・製造販売・提携・ 販売会社名	製造販売元：辰巳化学株式会社
担当者の連絡先 ・電話番号・FAX 番号	

本IFは2007年10月改訂(第5版)の添付文書の記載に基づき作成した。

I F 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

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I Fと略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとI F記載要領が策定された。

2. I Fとは

I Fは「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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薬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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。

3. I Fの様式・作成・発行

規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。I Fは日病薬が策定した「I F記載要領」に従って記載するが、本I F記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「I F記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはI Fが改訂・発行される。

4. I Fの利用にあたって

I F策定の原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてI Fの内容を充実させ、I Fの利用性を高めておく必要がある。

MRへのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段にI F作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお、適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

I. 概要に関する項目	1
II. 名称に関する項目	2
III. 有効成分に関する項目	3
IV. 製剤に関する項目	4
V. 治療に関する項目	8
VI. 薬効薬理に関する項目	9
VII. 薬物動態に関する項目	10
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
IX. 非臨床試験に関する項目	17
X. 取扱い上の注意等に関する項目	18
X I. 文献	19
X II. 参考資料	19
X III. 備考	19

I．概要に関する項目

1．開発の経緯

ピレンゼピン塩酸塩水和物は、胃炎・消化性潰瘍治療剤であり、本邦では1981年に上市されている。

ピン錠は、辰巳化学株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬発第698号（1980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、1990年6月に承認を得て、1992年8月発売に至った。

2007年に医療事故防止のためピン錠25mgと販売名変更を経て現在に至っている。

2．製品の特徴及び有用性

○本剤はピレンゼピン塩酸塩水和物を有効成分とする白色～微黄白色割線入り素錠である。

○重大な副作用として無顆粒球症、アナフィラキシー様症状があらわれることがある。

Ⅱ．名称に関する項目

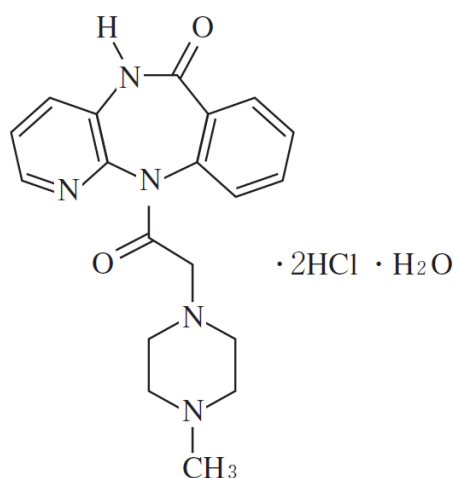
1. 販売名

- (1) 和名：ピン錠25mg
- (2) 洋名：PIN Tablets 25mg
- (3) 名称の由来：なし

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. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₉H₂₁N₅O₂·2HCl·H₂O

分子量：442.34

5. 化学名

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

なし

7. CAS登録番号

29868-97-1 (無水物)

28797-61-7 (Pirenzepine)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分

劇薬、指定医薬品

2. 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。

3. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

4. 有効成分の確認試験法

日局「ピレンゼピン塩酸塩水和物」の確認試験法による。

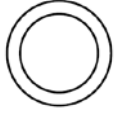
5. 有効成分の定量法

日局「ピレンゼピン塩酸塩水和物」の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別及び性状

	外 形			色 調 剤 形	識別 コード
	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)		
ピン錠25mg	 7.1	 2.4	 120	白色～微黄白色 素錠 (割線入り)	Tu-PN 025

(2) 製剤の物性

(3) 識別コード

	本体	包装材料
ピン錠25mg	Tu-PN 025	Tu PN-025

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当しない

(5) 酸価、ヨウ素価等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1錠中にピレンゼピン塩酸塩水和物を25mg（無水物として）含有する。

(2) 添加物

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、セルロース、ポビドン、クロスカルメロースナトリウム、二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当資料なし

4. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、ピン錠25mg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。

試験条件：40℃、相対湿度75%、6ヵ月、PTP包装

	規格	試験開始時	2ヵ月後	4ヵ月後	6ヵ月後
性状	白色～微黄白色 の素錠	白色割線入り 素錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	(1)～(3)	適	適	適	適
崩壊試験	日局一般試験法 の崩壊試験法	適	適	適	適
定量 (%)	表示量の 93～107% を含む	99.3	99.4	99.2	98.9

(n=9)

(1) ライネッケ塩試液による沈澱反応：淡赤色沈澱を生じる

(2) 吸収極大：波長278～282nmに吸収の極大を示す

(3) TLC：試料溶液及び標準溶液から得られたスポットのRf値は等しい

試験条件：40℃、相対湿度75%、6ヵ月、ポリエチレン袋包装

	規格	試験開始時	2ヵ月後	4ヵ月後	6ヵ月後
性状	白色～微黄白色の素錠	白色割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	(1)～(3)	適	適	適	適
崩壊試験	日局一般試験法の崩壊試験法	適	適	適	適
定量 (%)	表示量の93～107%を含む	99.3	99.0	99.8	99.5

(n=9)

- (1) ライネッケ塩試液による沈澱反応：淡赤色沈澱を生じる
- (2) 吸収極大：波長278～282nmに吸収の極大を示す
- (3) TLC：試料溶液及び標準溶液から得られたスポットのRf値は等しい

5. 調製法及び溶解後の安定性

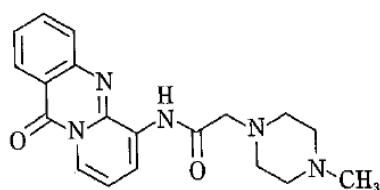
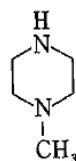
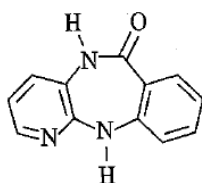
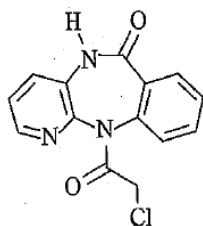
該当資料なし

6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当資料なし

7. 混入する可能性のある夾雑物

混入が予想される類縁物質として以下のものが日本薬局方医薬品各条で規定されている。



8. 溶出試験²⁾

【溶出挙動における類似性】

(「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について：平成10年7月15日付 医薬発第634号」)

試験方法 : 日本薬局方 (JP13) 一般試験法溶出試験法第2法(パドル法)

試験条件

試験液量 : 900 mL

温度 : 37 °C ± 0.5 °C

試験液 : pH1.2 = 日本薬局方 (JP13) 崩壊試験の第1液

pH4.0 = 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 (0.05mol/L)

pH6.8 = 日本薬局方試薬・試液のリン酸塩緩衝液 (1→2)

水 = 日本薬局方精製水

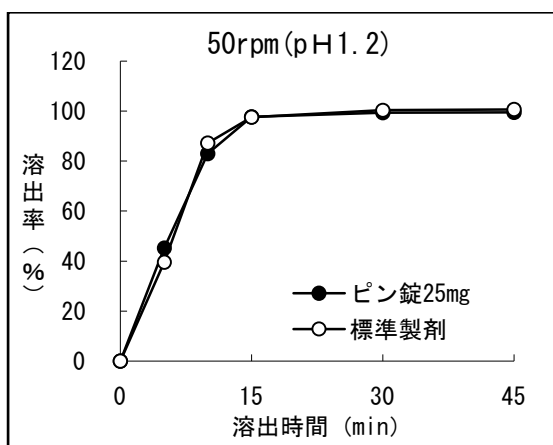
回転数 : 50rpm(pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)

標準製剤の平均溶出率が85%を越えた時点で試験を終了することができる。

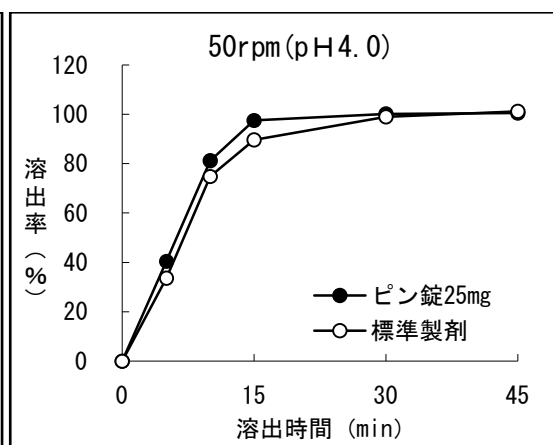
判定基準

pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

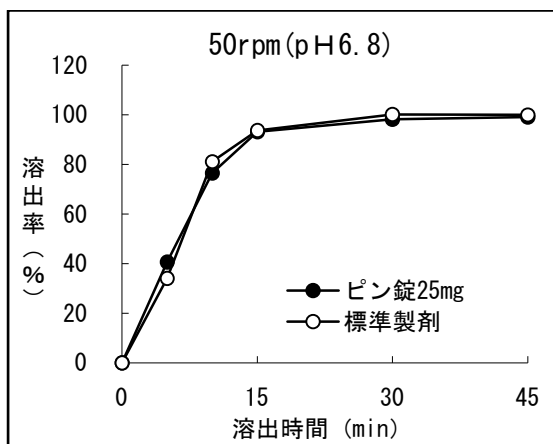
試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。



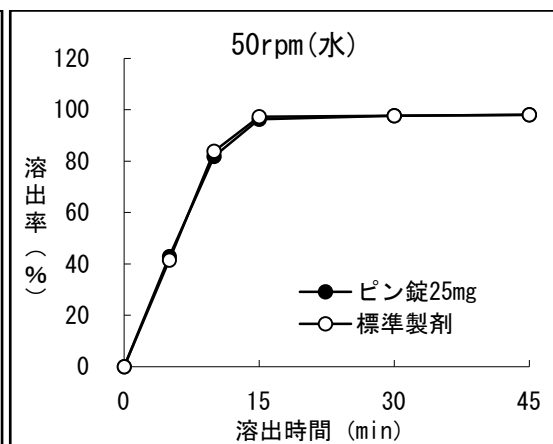
n = 6



n = 6



n = 6



n = 6

表 溶出挙動における類似性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				標準製剤 (錠剤、25mg)	ピン錠25mg	判定
方法	回転数	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%	
パドル法	50rpm	pH1.2	15分	97.6	97.7	範囲内
		pH4.0	15分	89.6	97.6	範囲内
		pH6.8	15分	93.6	93.2	範囲内
		水	15分	97.3	96.4	範囲内

(n=6)

判定基準：pH1.2、pH4.0、pH6.8及び水において、いずれも標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出し、試験製剤も15分以内に平均85%以上溶出する。

【公的溶出規格への適合】

ピン錠25mgは、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) ライネッケ塩試液による沈澱反応
- (2) 紫外可視吸収スペクトル
- (3) 薄層クロマトグラフィー

11. 製剤中の有効成分の定量法

吸光度測定法

12. 力価

該当しない

13. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔
バラ包装：ポリエチレン袋、金属缶

14. その他

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. 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。

3. 臨床成績

（1）臨床効果

該当資料なし

（2）臨床薬理試験：忍容性試験

1）単回投与試験

該当資料なし

2）反復投与試験

該当資料なし

（3）探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

（4）検証的試験

1）無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2）比較試験

該当資料なし

3）安全性試験

該当資料なし

4）患者・病態別試験

該当資料なし

（5）治療的使用

1）使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

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試験の概要

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

シメチジン、ファモチジン、ゲファルナート など

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序³⁾

副交感神経節、ヒスタミン産生細胞及び壁細胞に存在するムスカリン性M₁アセチルコリン受容体の特異的に遮断することで、胃酸分泌を抑制する。

胃粘膜血行動態を改善する作用や胃粘液量を増加させる作用、ストレス負荷時の胃粘膜中プロスタグランジン量の減少を抑制する作用など、防御因子を増強する作用も有する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間⁴⁾

	T _{max} (hr)
ピン錠25mg	4. 21 ± 1. 53

(Mean ± S. D. , n = 14)

(3) 通常用量での血中濃度⁴⁾

【生物学的同等性試験】

ピレンゼピン塩酸塩水和物製剤であるピン錠25mgの医薬品製造販売承認申請を行うに当たり、標準製剤又はピン錠25mgを健康成人男子に単回経口投与し、血清中のピレンゼピン塩酸塩水和物濃度を測定して、薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。

・試験デザイン

生物学的同等性に関する試験基準(薬審第718号 1980年5月30日)に準じ、非盲検下における2剤2期クロスオーバー法を用いる。

はじめの入院期間を第Ⅰ期とし、2回目の入院期間を第Ⅱ期とする。なお、第Ⅰ期と第Ⅱ期の間の休薬期間は12日間とする。

・投与条件

被験者に対して12時間の絶食下において、1錠中にピレンゼピン塩酸塩水和物を無水物として25mg含有するピン錠25mg 1錠又は標準製剤1錠を150mLの水とともに経口投与する。投与後4時間までは、絶食かつ、安静にさせる。

・採血時点

第Ⅰ期及び第Ⅱ期ともに投与前、1, 2, 3, 4, 6, 8, 10, 24及び48時間後の10時点とする。採血量は1回につき7mLとする。

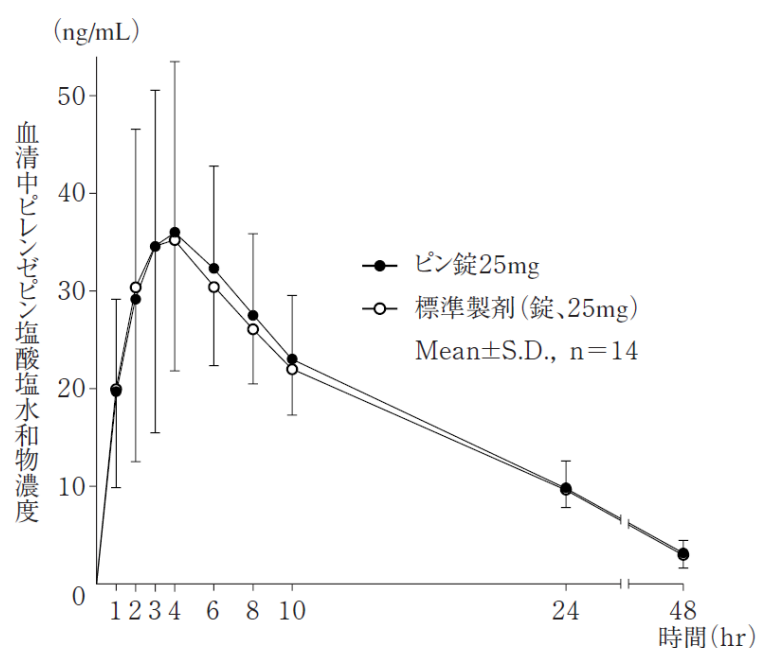
・分析法：HPLC法

<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→48hr} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ピン錠25mg	666.34± 207.48	39.86±18.52	4.21±1.53	13.91±1.86
標準製剤 (錠剤、25mg)	645.52± 150.80	37.62±14.29	4.07±1.77	14.21±2.08

(Mean±S. D., n=14)

得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について95%信頼区間法にて統計解析を行った結果、±20%の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



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。

(4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 吸収速度定数
該当資料なし
- (2) バイオアベイラビリティ
VII. 1. (3)参照
- (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) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

- (1) 血液－脳関門通過性
該当資料なし
- (2) 胎児への移行性
該当資料なし
- (3) 乳汁中への移行性
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
該当資料なし

5. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
該当資料なし
- (2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種
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比率
該当資料なし
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
該当資料なし

6. 排泄

- (1) 排泄部位
該当資料なし
- (2) 排泄率
該当資料なし
- (3) 排泄速度
該当資料なし

7. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由

【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・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
1) 前立腺肥大のある患者〔排尿困難を起こすことがある。〕
2) 緑内障の患者〔眼圧を上昇させることがある。〕

6. 重要な基本的注意事項とその理由及び処置方法

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。

7. 相互作用

（1）併用禁忌とその理由

該当しない

（2）併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

（1）副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用と初期症状

(1) 重大な副作用（頻度不明）

- 1) 無顆粒球症：このような副作用があらわれるとの報告があるので、患者の状態に十分注意し、このような症状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) アナフィラキシー様症状：アナフィラキシー様症状（発疹、蕁麻疹等）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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

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、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
消 化 器	口渇、便秘、下痢、悪心・嘔吐、歯肉痛、膨満感
過 敏 症 ^{注)}	発疹
泌 尿 器	排尿困難、残尿感
肝 臓	AST (GOT)、ALT (GPT) 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) 発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常

該当資料なし

(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

1. 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

2. その他の副作用

過敏症^{注)} : 発疹

注) 発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

9. 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。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 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。]

(2) 授乳婦に投与するときは授乳させないように注意すること。[動物で乳汁への移行が認められている。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

(1) 症状 : 過量投与した場合、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。

(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。

14. 適用上及び薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)

薬剤交付時 : 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報告されている。)

15. その他の注意
該当しない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理

該当資料なし

2. 毒性

(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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 取扱い上の注意等に関する項目

1. 有効期限又は使用期限

使用期限：外装に表示（3年）

2. 貯法・保存条件

気密容器、遮光保存

3. 薬剤取扱い上の注意点

該当しない

4. 承認条件

該当しない

5. 包装

PTP包装：100錠、1, 200錠

バラ包装：1, 200錠

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ガストロゼピン錠

同 効 薬：シメチジン、ファモチジン、ゲファルナート など

7. 国際誕生年月日

8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2007年2月2日

承認番号：21900AMX00090000

9. 薬価基準収載年月日

2007年6月15日

(1992年7月10日 -旧販売名- ピン錠)

10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

11. 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

12. 再審査期間

該当しない

13. 長期投与の可否

本剤は厚生労働省告示第97号（平成20年3月19日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

2329005F1200

15. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 辰巳化学株式会社 社内資料（安定性試験）
- 2) 辰巳化学株式会社 社内資料（溶出試験）
- 3) 第十五改正 日本薬局方解説書
- 4) 辰巳化学株式会社 社内資料（生物学的同等性試験）

2. その他の参考文献

なし

X II . 参 考 資 料

1. 主な外国での発売状況

X III . 備 考

その他の関連資料

なし



〒921-8164 金沢市久安3丁目406番地
電話 (076) 247-1231 代表