

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のI F記載要領(1998年9月)に準拠して作成

胃酸分泌抑制剤

劇薬、指定医薬品、処方せん医薬品

ピレンゼール[®]
静注用10mg

PILENZEL

注射用ピレンゼピン塩酸塩

剤形	注射剤(添付溶解液付)
規格・含量	1管中： ピレンゼピン塩酸塩水和物……………10.4mg (無水物として10mg)
一般名	和名：ピレンゼピン塩酸塩水和物(塩酸ピレンゼピン) 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3月1日 薬価基準収載年月日：2007年12月21日 発売年月日：1999年7月9日
開発・製造・輸入・発売・提携・販売会社名	製造販売元：テバ製薬株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

本I Fは2007年12月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

IF 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、IF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IF記載要領が策定された。

2. IFとは

IF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IFの記載事項とはならない。

3. IFの様式・作成・発行

規格はA4判、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。IFは日病薬が策定した「IF記載要領」に従って記載するが、本IF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「IF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IFが改訂・発行される。

4. IFの利用にあたって

IF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IFの内容を充実させ、IF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、非臨床成績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IF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

1 . 概要に関する項目	1	8 . 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
1 - 1 . 開発の経緯	1	8 - 1 . 警告内容とその理由	17
1 - 2 . 製品の特徴及び有用性	1	8 - 2 . 禁忌内容とその理由	17
2 . 名称に関する項目	2	8 - 3 . 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	17
2 - 1 . 販売名	2	8 - 4 . 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	17
2 - 2 . 一般名	2	8 - 5 . 慎重投与内容とその理由	17
2 - 3 . 構造式又は示性式	2	8 - 6 . 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17
2 - 4 . 分子式及び分子量	2	8 - 7 . 相互作用	17
2 - 5 . 化学名（命名法）	2	8 - 8 . 副作用	17
2 - 6 . 慣用名、別名、略号、記号番号	2	8 - 9 . 高齢者への投与	18
2 - 7 . CAS登録番号	2	8 - 10 . 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18
3 . 有効成分に関する項目	3	8 - 11 . 小児等への投与	18
3 - 1 . 有効成分の規制区分	3	8 - 12 . 臨床検査結果に及ぼす影響	18
3 - 2 . 物理化学的性質	3	8 - 13 . 過量投与	18
3 - 3 . 有効成分の各種条件下における安定性	3	8 - 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）	18
3 - 4 . 有効成分の確認試験法	3	8 - 15 . その他の注意	18
3 - 5 . 有効成分の定量法	3	8 - 16 . その他	19
4 . 製剤に関する項目	4	9 . 非臨床試験に関する項目	20
4 - 1 . 剤形	4	9 - 1 . 一般薬理	20
4 - 2 . 製剤の組成	4	9 - 2 . 毒性	20
4 - 3 . 注射剤の調製法	4	10 . 取扱い上の注意等に関する項目	21
4 - 4 . 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	10 - 1 . 有効期間又は使用期限	21
4 - 5 . 製剤の各種条件下における安定性	4	10 - 2 . 貯法・保存条件	21
4 - 6 . 溶解後の安定性	5	10 - 3 . 薬剤取扱い上の注意点	21
4 - 7 . 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	10 - 4 . 承認条件	21
4 - 8 . 電解質の濃度	7	10 - 5 . 包装	21
4 - 9 . 混入する可能性のある夾雑物	7	10 - 6 . 同一成分・同効薬	21
4 - 10 . 生物学的試験法	7	10 - 7 . 国際誕生年月日	21
4 - 11 . 製剤中の有効成分の確認試験法	8	10 - 8 . 製造販売承認年月日及び承認番号	21
4 - 12 . 製剤中の有効成分の定量法	8	10 - 9 . 薬価基準収載年月日	21
4 - 13 . 力価	8	10 - 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	21
4 - 14 . その他	8	10 - 11 . 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
5 . 治療に関する項目	9	10 - 12 . 再審査期間	21
5 - 1 . 効能又は効果	9	10 - 13 . 長期投与の可否	21
5 - 2 . 用法及び用量	9	10 - 14 . 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	22
5 - 3 . 臨床成績	9	10 - 15 . 保険給付上の注意	22
6 . 薬効薬理に関する項目	10	11 . 文献	23
6 - 1 . 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10	11 - 1 . 引用文献	23
6 - 2 . 薬理作用 ⁷⁾	10	11 - 2 . その他の参考文献	23
7 . 薬物動態に関する項目	15	12 . 参考資料	24
7 - 1 . 血中濃度の推移・測定法	15	12 - 1 . 主な外国での発売状況	24
7 - 2 . 薬物速度論的パラメータ	15	13 . 備考	25
7 - 3 . 吸収	15	13 - 1 . その他の関連資料	25
7 - 4 . 分布	15		
7 - 5 . 代謝	16		
7 - 6 . 排泄	16		
7 - 7 . 透析等による除去率	16		

1 . 概要に関する項目

1 - 1 . 開発の経緯

1 - 2 . 製品の特徴及び有用性

1. ピレンゼピン塩酸塩水和物は胃粘膜のムスカリン受容体に選択的に作用し、胃液分泌を著明に抑制するとともに、胃粘膜血流を改善し、抗胃炎・抗潰瘍作用を示すものと考えられている。
2. 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。

2 . 名称に関する項目

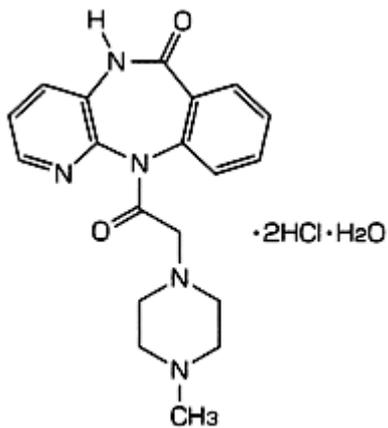
2 - 1 . 販売名

和名
ピレンゼール静注用 10 mg
洋名
PILENZEL
名称の由来
特になし

2 - 2 . 一般名

和名 (命名法)
ピレンゼピン塩酸塩水和物 (塩酸ピレンゼピン)
洋名 (命名法)
Pirenzepine hydrochloride hydrate

2 - 3 . 構造式又は示性式



2 - 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

2 - 5 . 化学名 (命名法)

11-[(4-methylpiperazin-1-yl)acetyl]-5,11-dihydro-6H-pyrido[2,3-*b*][1,4]
benzodiazepin-6-one dihydrochloride monohydrate

2 - 6 . 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

2 - 7 . CAS 登録番号

29868-97-1 (無水物)

3 . 有効成分に関する項目

3 - 1 . 有効成分の規制区分

劇薬、指定医薬品

3 - 2 . 物理化学的性質

外観・性状

白色～微黄色の結晶性の粉末で、光によって徐々に着色する。

溶解性

溶 媒	溶解性 (1gを溶かすに要する溶媒量)
水	1mL以上 10mL未満
ギ酸	1mL以上 10mL未満
メタノール	100mL以上 1000mL未満
エタノール (99.5)	1000mL以上 10000mL未満

溶解度¹⁾: pH1.2 : 10mg/mL 以上
pH4.0 : 10mg/mL 以上
pH6.8 : 10mg/mL 以上
水 : 10mg/mL 以上

吸湿性

該当資料なし

融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点 : 約 245 (分解)

酸塩基解離定数¹⁾

pKa₁ : 1.8 (25)

pKa₂ : 7.9 (25)

分配係数

該当資料なし

その他の主な示性値

本品 1g を水 10mL に溶かした液の pH は 1.0 ~ 2.0 である。

3 - 3 . 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3 - 4 . 有効成分の確認試験法

(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) 塩化物の定性反応

3 - 5 . 有効成分の定量法

電位差滴定法

4 . 製剤に関する項目

4 - 1 . 剤形

剤形の区別、規格及び性状

販売名	剤形の区別	規 格	性 状
ピレンゼール 静注用 10 mg	凍結乾燥注射剤	1管中 ピレンゼピン塩酸 塩水和物を10.4mg(無水物 として10mg)含有	主薬：白色の粉末又は塊 添付溶解液：無色澄明の液

溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

販売名	pH	浸透圧比
ピレンゼール 静注用 10 mg	本品 1 管を添付溶解液 2mL に溶かした液	
	6.5 ~ 7.5	0.9 ~ 1.1 (日局生理食塩液に対する比)

酸価、ヨウ素価等

該当資料なし

注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素

4 - 2 . 製剤の組成

有効成分（活性成分）の含量

1管中 ピレンゼピン塩酸塩水和物を10.4mg（無水物として10mg）含有

添加物

D-マンニトール 20mg

pH 調整剤

添付溶解液の組成及び容量

1 管(2mL)中 リン酸水素ナトリウム水和物、等張化剤、pH 調整剤

4 - 3 . 注射剤の調製法

本剤(凍結乾燥注射剤)を添付溶解液にて溶解する。

4 - 4 . 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4 - 5 . 製剤の各種条件下における安定性²⁾

加速試験

保存条件	包装形態	測定時期	測定項目	測定結果
40 ± 1	ガラスアンプル (褐色透明)	0, 2, 4, 6 箇月	性状 pH 不溶性異物検査 定量	いずれの試験項目に おいても試験開始時 と比較して 6 箇月ま でほとんど変化を認 めなかった。

4 - 6 . 溶解後の安定性³⁾

添付溶解液中(10mg/2mL)での安定性試験

試験液	保存条件	溶解後の時間(hr)				
		測定項目	0	3	6	24
添付 溶解液	25 室内散乱光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	7.00	7.00	6.98	6.95
		浸透圧比	1.02	1.00	-	1.03
		定量 ^{注1)} (%)	100	97.8	99.6	99.4

注1) 0時間の定量値を100とした。

各輸液中での安定性試験(添付溶解液2mLで溶解後、各輸液に混合)

配合輸液	保存条件	溶解後の時間(hr)				
		測定項目	0	3	6	24
生理食塩液 (10mg/500mL)	25 室内散乱光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	5.95	6.04	5.93	6.01
		定量 ^{注1)} (%)	100	99.3	98.8	99.6
注射用水 (10mg/500mL)	25 室内散乱光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	6.10	6.18	5.89	6.02
		定量 ^{注1)} (%)	100	98.6	97.4	98.2
5%ブドウ糖 注射液 (10mg/500mL)	25 室内散乱光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	4.70	4.69	4.86	4.98
		定量 ^{注1)} (%)	100	101.9	99.9	99.9

注1) 0時間の定量値を100とした。

4 - 7 . 他剤との配合変化(物理化学的变化)^{4)~6)}

pH変動試験

試験材料	規格pH	試料 pH	(A)0.1N HCl (B)0.1N NaOH (mL)	最終pH または 変化点pH	移動 指数	変化 所見
ヒドレキール 静注用10mg	6.5~7.5	6.91	(A) 10	1.30	5.61	なし
			(B) 10	12.48	5.57	なし

各輸液中での配合試験結果（保存条件：室温，500 lux 室内散乱光）

配合輸液			薬剤 使用量 (アンプル)	外観 / pH / 含量 (%) 注2)			
商品名	成分名	容量		配合後の時間			
			配合直後	3時間	6時間	24時間	
生食MP	生理食塩液	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.56	5.52	5.54	5.54
				100	99.6	99.4	100.2
糖注MP5%	5%ブドウ糖注射液	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.13	4.89	4.87	4.85
				100	99.0	98.7	99.5
ソリタ-T3号	維持液	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.11	5.11	5.12	5.10
				100	100.2	100.1	100.0
ラクテック注	乳酸リンゲル液	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				6.62	6.63	6.64	6.66
				100	100.1	100.0	100.3
ハイカリック液-1号	高カロリー輸液用基本液	700mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				4.42	4.43	4.43	4.45
				100	100.5	99.7	100.5
3%ESポリタミン注射液	高カロリー輸液用総合アミノ酸製剤	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.67	5.66	5.70	5.71
				100	100.1	98.2	99.1
アミノフリード	糖・電解質・アミノ酸液	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				6.73	6.69	6.67	6.57
				100	100.5	100.9	100.6
マルトース10 250mL	二糖類・糖質補給剤	250mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				4.72	4.68	4.67	4.67
				100	101.2	101.7	102.5
マルトース10 500mL	二糖類・糖質補給剤	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				4.57	4.34	4.41	4.39
				100	97.7	97.5	97.0
フィジオ35	電解質輸液（維持液）	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.00	5.00	4.99	5.00
				100	99.7	99.6	99.6
アクチット注	血液代用剤	500mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.38	5.37	5.36	5.37
				100	99.9	100.0	99.7
ユニカリックL	高カロリー輸液用糖・アミノ酸・電解質液	2000mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				4.30	4.28	4.29	4.28
				100	100.8	102.6	102.7
ユニカリックN	高カロリー輸液用糖・アミノ酸・電解質液	2000mL	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				4.31	4.31	4.30	4.32
				100	101.7	102.1	103.3

配合輸液			薬剤 使用量 (アンプル)	外観 / pH / 含量 (%) 注2)			
商品名	使用分類	容量		配合後の時間			
			配合直後	3時間	6時間	24時間	
フルカリ ック1号	高カロリー輸 液用 総合ビタ ミン・糖・アミ ノ酸・電解質液	903mL	1	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明
				5.06	5.05	5.05	5.06
				100	100.1	99.8	100.0
フルカリ ック2号	高カロリー輸 液用 総合ビタ ミン・糖・アミ ノ酸・電解質液	1003mL	1	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明
				5.31	5.30	5.28	5.26
				100	100.4	100.1	97.7

注2) 配合直後の残存率を100とした。

製剤との配合試験

ピレンゼール静注用10mg1アンプルと各製剤1バイアルを生理食塩液100mLに注入した場合の配合変化試験結果(保存条件:25℃, 500lux 室内散乱光)

配合製剤		薬剤 使用量 (アンプル)	外観 / pH / ピレンゼール塩酸塩水和物含量 (%) 注2)			
商品名	容量 (バイアル)		配合後の時間			
		配合直後	3時間	6時間	24時間	
カルベニン 点滴用0.5g	1	1	淡黄色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明	黄色澄明
			6.76	6.66	6.45	5.88
			100	100.8	100.9	102.4
セファメジン 注射用1g	1	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
			5.19	5.17	5.42	5.63
			100	101.0	98.6	101.2
タイペラシリン 注射用1g	1	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
			5.47	5.32	5.31	4.97
			100	98.9	98.8	98.4
ユナシン-S 静注用1.5g	1	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
			8.90	8.64	8.56	8.16
			100	99.7	99.4	99.0
セフォセフ 静注用1g	1	1	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
			6.00	5.91	5.87	5.70
			100	98.6	99.0	99.0

注2) 配合直後の残存率を100とした。

4 - 8 . 電解質の濃度
該当資料なし

4 - 9 . 混入する可能性のある夾雑物
該当資料なし

4 - 10 . 生物学的試験法
該当しない

- 4 - 11. 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殿反応
 - (2)紫外可視吸光度測定法
 - (3)薄層クロマトグラフィー

- 4 - 12. 製剤中の有効成分の定量法
 - 紫外可視吸光度測定法

- 4 - 13. 力価
 - 該当しない

- 4 - 13. 容器の材質
 - 主薬：褐色透明のガラスアンプル
 - 添付溶解液：無色透明のガラスアンプル

- 4 - 14. その他
 - 特になし

5 . 治療に関する項目

5 - 1 . 効能又は効果

上部消化管出血（消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、急性胃粘膜病変による）、手術侵襲ストレスによる胃液分泌亢進の抑制、麻酔前投薬

5 - 2 . 用法及び用量

上部消化管出血

通常成人にはピレンゼピン塩酸塩無水物として 1 回 20mg（本剤 2 管）を添付溶解液（4mL）にて溶解し、1 日 3 回緩徐に静脈内に注射するか輸液に混合し点滴静脈内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

手術侵襲ストレスによる胃液分泌亢進の抑制

通常成人にはピレンゼピン塩酸塩無水物として 1 回 20mg（本剤 2 管）を添付溶解液（4mL）にて溶解し、1 日 2 回緩徐に静脈内に注射するか輸液に混合し点滴静脈内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

麻酔前投薬

通常成人にはピレンゼピン塩酸塩無水物として 10mg（本剤 1 管）を添付溶解液（2mL）にて溶解し、1 回緩徐に静脈内に注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

5 - 3 . 臨床成績

臨床効果

該当資料なし

臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

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

治療的使用

1)使用成績調査・特定使用成績調査・製造販売後臨床試験

該当しない

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

6 . 薬効薬理に関する項目

6 - 1 . 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ヒスタミン H₂ 受容体拮抗薬 (シメチジン、ラニチジン塩酸塩、ファモチジン)
 選択的ムスカリン受容体拮抗薬 (臭化チキジウム)
 抗ガストリン薬 (プログルミド) 等

6 - 2 . 薬理作用⁷⁾

作用部位・作用機序

ピレンゼピン塩酸塩水和物は胃粘膜のムスカリン受容体に選択的に作用し、胃液分泌を著明に抑制するとともに、胃粘膜血流を改善し、抗胃炎・抗潰瘍作用を示すものと考えられている。

薬効を裏付ける試験成績

1. 胃液分泌抑制作用

ピレンゼピン塩酸塩水和物 (10 ~ 100mg/kg, i.d.) は、ラットにおいて、胃液、胃酸及びペプシンの基礎分泌抑制作用を示した。また、ヒスタミン及びテトラガストリン誘発胃液・胃酸分泌に対しても抑制作用を示した (10 ~ 300mg/kg, i.d.)。

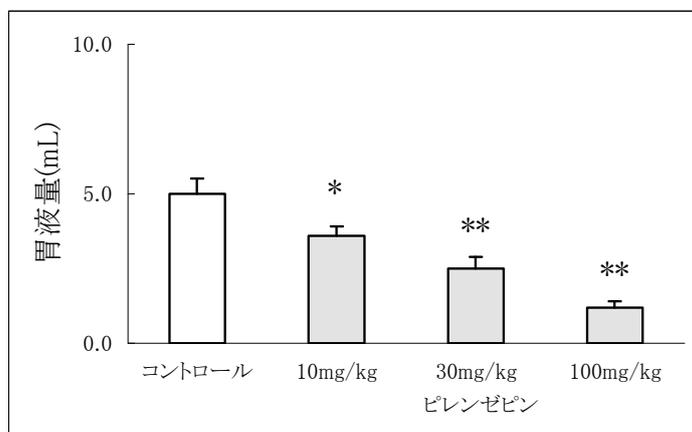
表 1 基礎分泌に対する作用

薬物	投与量 (mg/kg, i.d.)	例数	胃液量 (mL)	酸排出量 (μ Eq/hr)	ペプシン排出量 (mg tyrosine/hr)
コントロール	-	8	5.0 \pm 0.5	89.6 \pm 13.3	19.6 \pm 2.2
ピレンゼピン	10	8	3.6 \pm 0.3* (28.0)	60.1 \pm 9.0 (32.9)	17.1 \pm 1.6 (12.7)
	30	8	2.5 \pm 0.4** (50.0)	33.8 \pm 6.5** (62.2)	10.2 \pm 1.3** (48.5)
	100	8	1.2 \pm 0.2** (76.0)	9.9 \pm 2.1** (89.0)	4.4 \pm 1.1** (78.1)
	ED ₅₀ (95% C.L.)		28.9 (10.9-76.6)	18.7 (8.5-41.2)	35.7 (17.4-73.1)

数値は平均 \pm 標準誤差で表した。

() : コントロール群に対する抑制率 (%)

*, **: P < 0.05, 0.01 vs コントロール (Student-*t* 又は Cochran-Cox 検定)



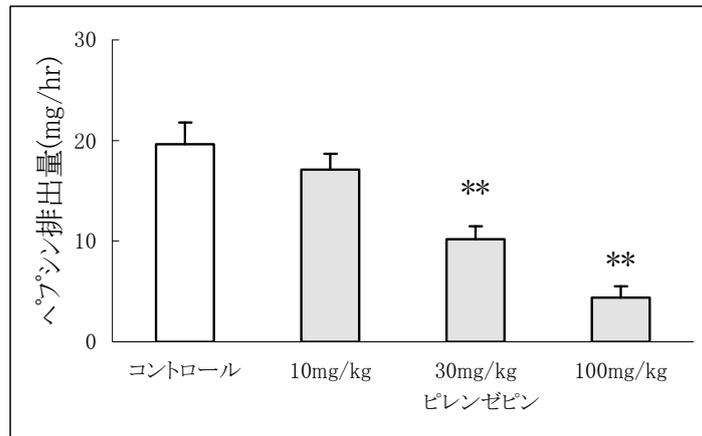
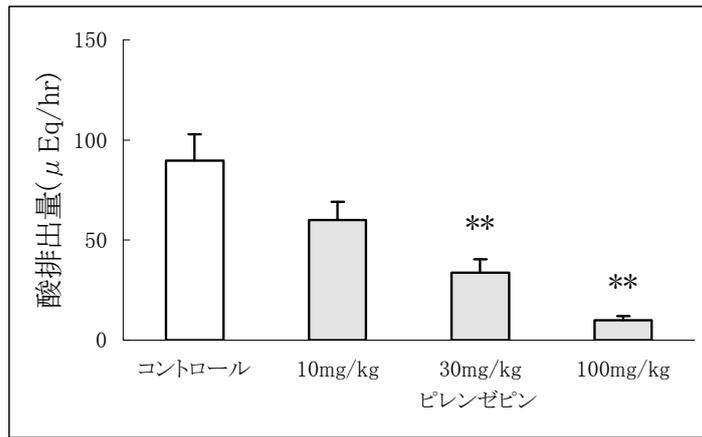


表 2 ヒスタミン刺激胃液分泌に対する作用

薬物	投与量 (mg/kg, i.d.)	例数	胃液量 (mL)	酸排出量 (μ Eq/hr)
コントロール	-	5	6.1 \pm 0.7	160.0 \pm 14.1
ピレンゼピン	30	5	4.3 \pm 0.7 (29.5)	105.0 \pm 21.7 (34.4)
	100	5	3.0 \pm 0.3 ^{**} (50.8)	73.9 \pm 13.0 ^{**} (53.8)
	300	5	2.4 \pm 0.4 ^{**} (60.7)	48.4 \pm 8.1 ^{**} (69.8)
	ED ₅₀ (95% C.L.)			121.3 (18.2-806.4)

数値は平均 \pm 標準誤差で表した。

() : コントロール群に対する抑制率(%)

** : P<0.01vs コントロール (Student-*t* 又は Cochran-Cox 検定)

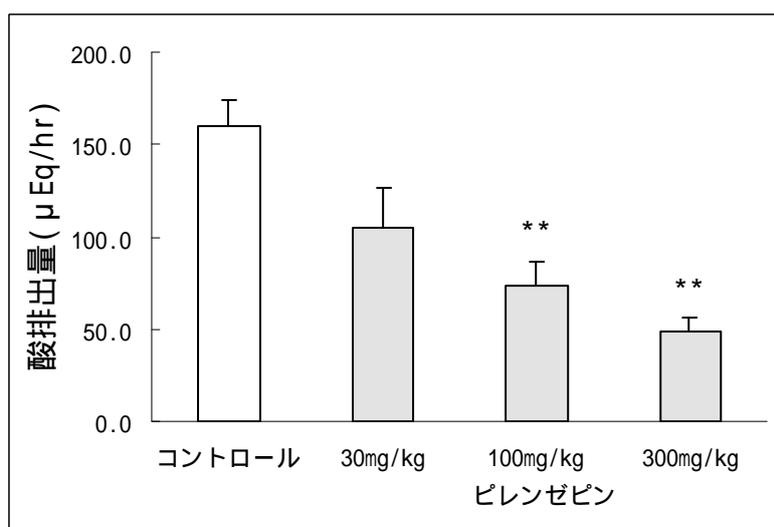
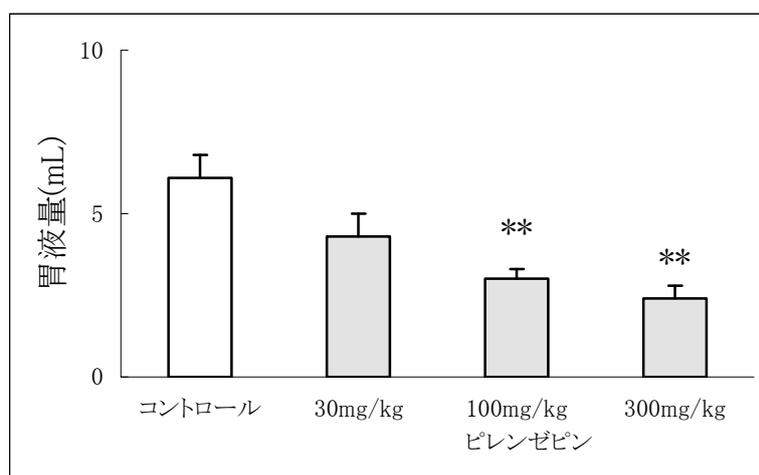


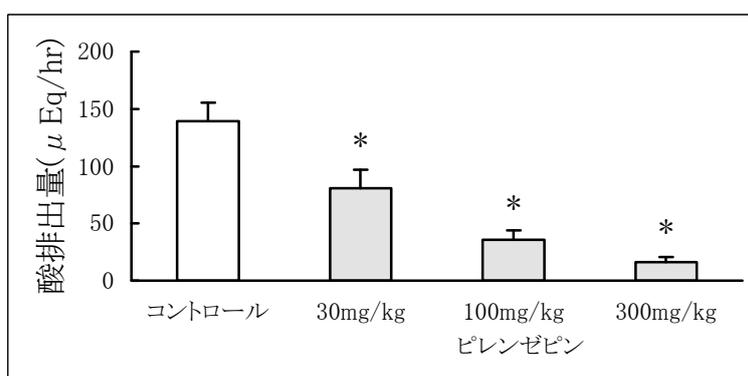
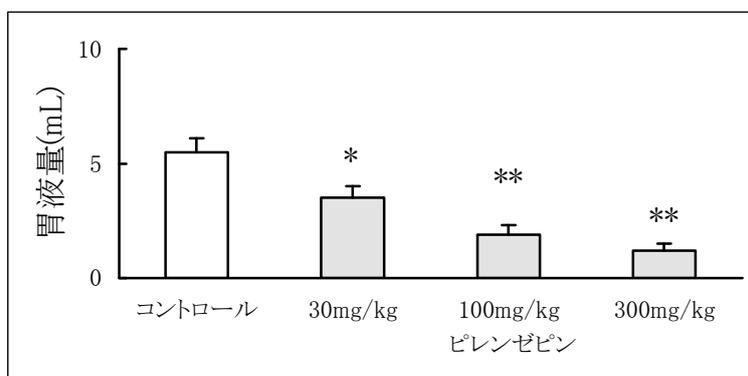
表 3 ガストリン刺激胃液分泌に対する作用

薬物	投与量 (mg/kg, i.d.)	例数	胃液量 (mL)	酸排出量 (μ Eq/hr)
コントロール	-	5	5.5 \pm 0.6	139.4 \pm 15.8
ピレンゼピン	30	5	3.5 \pm 0.5* (36.4)	81.0 \pm 15.8* (41.9)
	100	5	1.9 \pm 0.4** (65.5)	35.5 \pm 8.4** (74.5)
	300	5	1.2 \pm 0.3** (78.2)	16.3 \pm 4.3** (88.3)
	ED ₅₀ (95% C.L.)		54.7 (13.7-218.8)	39.5 (12.4-126.4)

数値は平均 \pm 標準誤差で表した。

() : コントロール群に対する抑制率 (%)

* , ** : P < 0.05 , 0.01 vs コントロール (Student-*t* 又は Cochran-Cox 検定)



2. 抗ガストリン作用

ピレンゼピン塩酸塩水和物 (0.1mg/kg, i.v.) は、イヌの肉エキス刺激による血中ガストリン値上昇に対し抑制作用を示した。

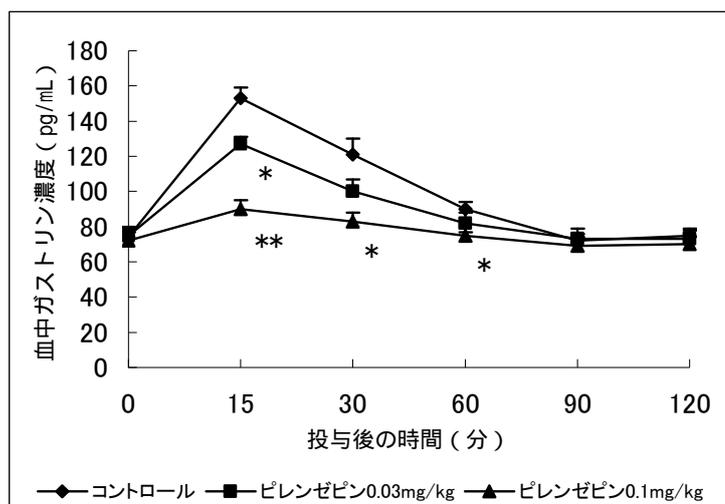
表 1 血中ガストリン上昇に対する作用

薬物	投与量 (mg/kg, i.v.)	例数	血中ガストリン濃度 (pg/mL)					
			肉エキスの投与後の時間 (分)					
			0	15	30	60	90	120
コントロール	-	3	74 ± 6	153 ± 6	121 ± 9	90 ± 4	72 ± 4	75 ± 3
ピレンゼピン	0.03	3	75 ± 4 (-1.4)	127 ± 4* (17.0)	100 ± 7 (17.4)	82 ± 6 (8.9)	73 ± 6 (-1.4)	73 ± 6 (2.7)
	0.10	3	72 ± 5 (2.7)	90 ± 5** (41.5)	83 ± 5* (31.4)	75 ± 2* (16.7)	69 ± 5 (4.2)	70 ± 4 (6.7)

数値は平均 ± 標準誤差で表した。

() : 各時間のコントロール群に対する抑制率 (%)

*, ** : P < 0.05, 0.01 vs コントロール (Student-*t* 又は Cochran-Cox 検定)



7 . 薬物動態に関する項目

7 - 1 . 血中濃度の推移・測定法

治療上有効な血中濃度

該当資料なし

最高血中濃度到達時間

該当資料なし

通常用量での血中濃度

該当資料なし

中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

7 - 2 . 薬物速度論的パラメータ

治療上有効な血中濃度

該当資料なし

最高血中濃度到達時間

該当資料なし

通常用量での血中濃度

該当資料なし

中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

7 - 3 . 吸収

該当資料なし

7 - 4 . 分布

血液 - 脳関門通過性

該当資料なし

胎児への移行性

該当資料なし

乳汁中への移行性

該当資料なし

髄液への移行性

該当資料なし

その他の組織への移行性

該当資料なし

7 - 5 .代謝

代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

代謝に關与する酵素（CYP450等）の分子種

該当資料なし

初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

7 - 6 .排泄

排泄部位

該当資料なし

排泄率

該当資料なし

排泄速度

該当資料なし

7 - 7 .透析等による除去率

腹膜透析

該当資料なし

血液透析

該当資料なし

直接血液灌流

該当資料なし

8 . 安全性（使用上の注意等）に関する項目

8 - 1 . 警告内容とその理由

該当記載事項なし

8 - 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

8 - 3 . 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当記載事項なし

8 - 4 . 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当記載事項なし

8 - 5 . 慎重投与内容とその理由

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]

8 - 6 . 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

(1)「手術侵襲ストレスによる胃液分泌亢進の抑制」については、大なる手術侵襲（全身麻酔を要する手術、長時間に及ぶ手術又は重篤な合併症をもつ患者での手術）により、術後にストレス潰瘍が発症する可能性が考えられる場合に限り使用すること。
(2)本剤の使用に当たっては、病状及び手術の程度に応じ治療上必要最小限の使用にとどめること。また、治療に当たっては経過を十分に観察し、本剤で効果がみられない場合には、他の療法に切りかえること。
(3)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。

8 - 7 . 相互作用

併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

併用注意とその理由

該当記載事項なし

8 - 8 . 副作用

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（頻度不明）と初期症状

(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
循環器	頻脈
消化器	口渇、悪心、嘔吐、下痢
過敏症 ^{注3)}	痒痒、発疹
泌尿器	排尿困難
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、AI-P、LDH、ビリルビン値の上昇
その他	去痰困難、霧視、複視、眼の調節異常、倦怠感

注3)発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

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

薬物アレルギーに対する注意及び試験法

8-2、8-8 1)(2)及び2)「過敏症」の項参照

8-9.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。

8-10.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]

8-11.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。

8-12.臨床検査結果に及ぼす影響

該当記載事項なし

8-13.過量投与

該当記載事項なし

8-14.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)

アンプルカット時:アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭してから、ヤスリを用いしないで、アンプル頭部のマークの反対方向に折ること。

8-15.その他の注意

該当記載事項なし

8 - 16. その他
該当記載事項なし

9 . 非臨床試験に関する項目

9 - 1 . 一般薬理

該当資料なし

9 - 2 . 毒性

単回投与毒性試験

該当資料なし

反復投与毒性試験

該当資料なし

生殖発生毒性試験

該当資料なし

その他の特殊毒性

該当資料なし

10. 取扱い上の注意等に関する項目

10 - 1. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

10 - 2. 貯法・保存条件

しゃ光保存

10 - 3. 薬剤取扱い上の注意点

規制区分：劇薬、指定医薬品、処方せん医薬品

(注意 - 医師等の処方せんにより使用すること)

取扱い上の注意：

安定性試験結果の概要²⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、6ヶ月)の結果、ピレンゼール静注用10mgは通常の市場流通下において安定であることが推測された。

10 - 4. 承認条件

該当しない

10 - 5. 包装

10管 50管

10 - 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ガストロゼピン錠(日本ベーリンガー)

同効薬：シメチジン製剤、ラニチジン塩酸塩製剤、ファモチジン製剤、臭化チキジウム製剤、プログルミド製剤

10 - 7. 国際誕生年月日

該当しない

10 - 8. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2007年3月1日

承認番号：21900AMX00194000

10 - 9. 薬価基準収載年月日

2007年12月21日

10 - 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

10 - 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

10 - 12. 再審査期間

該当しない

10 - 13. 長期投与の可否

該当しない

10 - 14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード
2329402D1055

10 - 15. 保険給付上の注意
特になし

11. 文献

11 - 1. 引用文献

- 1) 日本公定書協会編：“医療用医薬品 品質情報集 No.6”，2000
- 2) テバ製薬(株)社内資料（安定性試験）
- 3) テバ製薬(株)社内資料（溶解後の安定性試験）
- 4) テバ製薬(株)社内資料（pH変動試験）
- 5) テバ製薬(株)社内資料（配合変化試験：輸液）
- 6) テバ製薬(株)社内資料（配合変化試験：製剤）
- 7) テバ製薬(株)社内資料（薬効薬理試験）

11 - 2. その他の参考文献

特になし

12. 参考資料

- 12 - 1. 主な外国での発売状況
該当しない

13. 備考

- 13 - 1. その他の関連資料
特になし