

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 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

鎮痙・流早産防止剤

ピペリドレート塩酸塩錠

ダクチラン錠 50mg
DACTIRAN Tablets 50mg

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	劇薬
規格・含量	1 錠中にピペリドレート塩酸塩 50mg 含有
一般名	和名：ピペリドレート塩酸塩（JAN） 洋名：Piperidolate Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007 年 9 月 28 日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2007 年 12 月 21 日（販売名変更による） 販売開始年月日：1967 年 9 月 1 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：杏林製薬株式会社 技術提携：PCAS/SELOC France
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	杏林製薬株式会社 くすり情報センター TEL 0120-409341 受付時間：9:00～17:30（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.kyorin-pharm.co.jp/prodinfo/

本 I F は 2024 年 5 月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。

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。



(01)14987060006650



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、I F 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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはP D F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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I F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I F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、「I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMD A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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMD A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「X II. 参考資料」、「X III. 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

I F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。I F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I F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、I F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

1. 開発の経緯 1
2. 製品の治療学的特性 1
3. 製品の製剤学的特性 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 2
 - (1)承認条件 2
 - (2)流通・使用上の制限事項 2
6. RMPの概要 2

II. 名称に関する項目 3

1. 販売名 3
 - (1)和名 3
 - (2)洋名 3
 - (3)名称の由来 3
2. 一般名 3
 - (1)和名(命名法) 3
 - (2)洋名(命名法) 3
 - (3)ステム(stem) 3
3. 構造式又は示性式 3
4. 分子式及び分子量 3
5. 化学名(命名法)又は本質 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 3

III. 有効成分に関する項目 4

1. 物理化学的性質 4
 - (1)外観・性状 4
 - (2)溶解性 4
 - (3)吸湿性 4
 - (4)融点(分解点)、沸点、凝固点 4
 - (5)酸塩基解離定数 4
 - (6)分配係数 4
 - (7)その他の主な示性値 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 4
3. 有効成分の確認試験法、定量法 4

IV. 製剤に関する項目 5

1. 剤形 5
 - (1)剤形の区別 5
 - (2)製剤の外観及び性状 5
 - (3)識別コード 5
 - (4)製剤の物性 5
 - (5)その他 5
2. 製剤の組成 5
 - (1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤 5
 - (2)電解質等の濃度 5
 - (3)熱量 5
3. 添付溶解液の組成及び容量 5
4. 力価 5

5. 混入する可能性のある夾雑物 6
6. 製剤の各種条件下における安定性 6
7. 調製法及び溶解後の安定性 6
8. 他剤との配合変化(物理化学的变化) 6
9. 溶出性 6
10. 容器・包装 6
 - (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 6
 - (2)包装 6
 - (3)予備容量 6
 - (4)容器の材質 6
11. 別途提供される資材類 6
12. その他 6

V. 治療に関する項目 7

1. 効能又は効果 7
2. 効能又は効果に関連する注意 7
3. 用法及び用量 7
 - (1)用法及び用量の解説 7
 - (2)用法及び用量の設定経緯・根拠 7
4. 用法及び用量に関連する注意 7
5. 臨床成績 7
 - (1)臨床データパッケージ 7
 - (2)臨床薬理試験 7
 - (3)用量反応探索試験 7
 - (4)検証的試験 8
 - (5)患者・病態別試験 8
 - (6)治療的使用 8
 - (7)その他 8

VI. 薬効薬理に関する項目 9

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 9
2. 薬理作用 9
 - (1)作用部位・作用機序 9
 - (2)薬効を裏付ける試験成績 9
 - (3)作用発現時間・持続時間 9

VII. 薬物動態に関する項目 10

1. 血中濃度の推移 10
 - (1)治療上有効な血中濃度 10
 - (2)臨床試験で確認された血中濃度 10
 - (3)中毒域 10
 - (4)食事・併用薬の影響 10
2. 薬物速度論的パラメータ 10
 - (1)解析方法 10
 - (2)吸収速度定数 10
 - (3)消失速度定数 10
 - (4)クリアランス 10
 - (5)分布容積 10
 - (6)その他 10
3. 母集団(ポピュレーション)解析 11

(1)解析方法	11
(2)パラメータ変動要因	11
4. 吸収.....	11
5. 分布.....	11
(1)血液－脳関門通過性	11
(2)血液－胎盤関門通過性.....	11
(3)乳汁への移行性.....	11
(4)髄液への移行性.....	11
(5)その他の組織への移行性	11
(6)血漿蛋白結合率.....	11
6. 代謝.....	12
(1)代謝部位及び代謝経路.....	12
(2)代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、 寄与率.....	12
(3)初回通過効果の有無及びその割合	12
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	12
7. 排泄.....	12
8. トランスポーターに関する情報	12
9. 透析等による除去率	12
10. 特定の背景を有する患者.....	12
11. その他.....	12

VII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目13

1. 警告内容とその理由	13
2. 禁忌内容とその理由	13
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由.....	13
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由.....	13
5. 重要な基本的注意とその理由.....	13
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14
(1)合併症・既往歴等のある患者	14
(2)腎機能障害患者.....	14
(3)肝機能障害患者.....	14
(4)生殖能を有する者.....	14
(5)妊婦.....	14
(6)授乳婦	14
(7)小児等	15
(8)高齢者	15
7. 相互作用	15
(1)併用禁忌とその理由	15
(2)併用注意とその理由	15
8. 副作用	15
(1)重大な副作用と初期症状	15
(2)その他の副作用.....	15
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
10. 過量投与	16
11. 適用上の注意	16
12. その他の注意.....	16
(1)臨床使用に基づく情報.....	16
(2)非臨床試験に基づく情報	16

IX. 非臨床試験に関する項目 17

1. 薬理試験.....	17
(1)薬効薬理試験	17
(2)安全性薬理試験.....	17
(3)その他の薬理試験	17
2. 毒性試験.....	17
(1)単回投与毒性試験	17
(2)反復投与毒性試験	17
(3)遺伝毒性試験	17
(4)がん原性試験	17
(5)生殖発生毒性試験	17
(6)局所刺激性試験	17
(7)その他の特殊毒性	17

X. 管理的事項に関する項目 18

1. 規制区分.....	18
2. 有効期間.....	18
3. 包装状態での貯法	18
4. 取扱い上の注意.....	18
5. 患者向け資材	18
6. 同一成分・同効薬	18
7. 国際誕生年月日	18
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	18
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.....	19
14. 保険給付上の注意.....	19

XI. 文献 20

1. 引用文献	20
2. その他の参考文献	20

XII. 参考資料..... 21

1. 主な外国での発売状況.....	21
2. 海外における臨床支援情報.....	21

XIII. 備考..... 22

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.....	22
(1)粉碎.....	22
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過 性.....	22
2. その他の関連資料	22

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ピペリドレート塩酸塩は米国レークサイド社によって開発された薬剤である。

本剤は消化管平滑筋に特異的、選択的に作用し、痙攣を緩解させる作用と子宮体部の筋攣縮を緩和する反面、子宮頸管に対して収縮作用を持つ薬剤である。

本邦では杏林製薬（株）が消化管平滑筋に対する作用を基にダクチラン錠として「下記疾患における痙攣性疼痛（胃・十二指腸潰瘍、胃炎、腸炎、胆石症、胆のう炎、胆道ジスキネジー）」の効能・効果で発売し、キッセイ薬品工業（株）が子宮に対する作用を基にダクチル OB として「切迫流・早産における諸症状の改善」の効能・効果で発売した。

その後再評価（1979 年 7 月 16 日）で両剤の「効能・効果」が合算され、ダクチラン錠の効能・効果に「切迫流・早産における諸症状の改善」が追加された。

「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について（平成 16 年 6 月 2 日付 薬食発 060209 号）」に基づき、2007 年 4 月「ダクチラン錠 50mg」販売名変更を申請し、承認・販売に至った。

2021 年 6 月に製造販売中止を案内し、2022 年 3 月 31 日に経過措置期間を満了した。

2. 製品の治療学的特性

1) 効能及び効果は、胃・十二指腸潰瘍、胃炎、腸炎、胆石症、胆のう炎、胆道ジスキネジーにおける痙攣性疼痛と切迫流・早産における諸症状の改善である。

（「V. 1. 効能及び効果」の項参照）

2) 重大な副作用として肝機能障害、黄疸が注意喚起されている。

（「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

白色のフィルムコーティング錠である。

（「IV. 1. 剤形」の項参照）

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
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

(2024 年 5 月 7 日時点)

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

ダクチラン錠 50mg

(2) 洋名

DACTIRAN Tablets 50mg

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

ピペリドレート塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名(命名法)

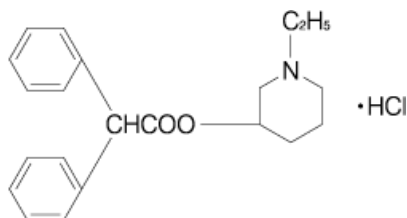
Piperidolate Hydrochloride (JAN)

Piperidolate (r-INN)

(3) ステム(stem)

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: C₂₁H₂₅NO₂·HCl

分子量: 359.89

5. 化学名(命名法)又は本質

N-Ethyl-3-piperidyl-diphenylacetate hydrochloride

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末で、においはない。

(2) 溶解性

本品は酢酸（100）又はクロロホルムに溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすく、水にやや溶けにくく、無水酢酸に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

温度 40℃、湿度 80%で、12 箇月でも水分の増加を認めない。（乾燥減量 0.5%以下）

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：194～198℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa：7.25

(6) 分配係数

クロロホルム／水系において水相に分配しなかった。（pH7～11、24℃）

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

ピペリドレート塩酸塩原末を、(a)室温 24 箇月、(b)温度 30℃、湿度 90%、3 箇月、(c)温度 45℃、3 箇月、(d)直射日光下、3 箇月の条件で保存し、安定性を調べた。

試験項目は(1)外観、(2)溶状、(3)pH、(4)融点、(5)乾燥減量、(6)紫外外部吸収スペクトル、(7)赤外吸収スペクトル、(8)薄層クロマトグラフィー、(9)非水滴定による定量である。

(a)室温、(b)温度 30℃、湿度 90%、(c)温度 45℃の条件では何ら変化は認められなかった。

(d)直射日光下では、1 箇月後に外観変化がみられ、粉末の表面が淡黄色となり、時間の経過とともに着色が強くなった。溶状も外観の変化にともなって着色が認められた。

pH は 2～3 箇月後に少し低下した。その他の融点、乾燥減量、紫外外部及び赤外吸収スペクトル、薄層クロマトグラフィー、定量分析の結果からは経時変化が認められなかった。

以上より、ピペリドレート塩酸塩原末は遮光下で保存すれば安定であることが認められた。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

1) 確認試験法

日本薬局方外医薬品規格 ピペリドレート塩酸塩 確認試験法による。

2) 定量法

日本薬局方外医薬品規格 ピペリドレート塩酸塩 定量法による。

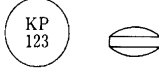
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	ダクチラン錠 50mg	
外形		
	直径	厚さ
	8.2mm	3.9mm
質量	約 200mg	
色調	白色	

(3) 識別コード

KP-123

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(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	ダクチラン錠 50mg
有効成分	ピペリドレート塩酸塩
含量	1 錠中にピペリドレート塩酸塩を 50mg 含有
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、ポビドン、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール 6000、酸化チタン、シリコーン樹脂

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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

IV. 製剤に関する項目

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

ピペリドレート塩酸塩錠剤を、(a)室温 12 箇月、(b)温度 40℃、湿度 80%、6 箇月、(c)温度 40℃、6 箇月、(d)光線照射 3,500～4,500 ルクス、6 箇月の条件で保存し、安定性を調べた。

試験項目は(1)外観、(2)崩壊試験、(3)吸光度法による定量である。

外観の観察では、(a)～(d)の条件下で変化は認められなかった。

もろさと崩壊度についても、(a)～(d)の条件下で変化は認められなかった。

また定量についてはピペリドレート塩酸塩の含量はいずれの条件でも低下しなかった。

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)

該当しない

9. 溶出性

本製剤の溶出挙動は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められた規格に適合していることが確認されている。

日本薬局方外医薬品規格 ピペリドレート塩酸塩錠 溶出試験による。

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

該当しない

(2) 包装

500 錠 [10 錠 (PTP) × 50]

(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、アルミ箔

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

○下記疾患における痙攣性疼痛

胃・十二指腸潰瘍、胃炎、腸炎、胆石症、胆のう炎、胆道ジスキネジー

○切迫流・早産における諸症状の改善

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

6. 用法及び用量

ピペリドレート塩酸塩として、通常成人1日150～200mgを3～4回に分割経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(1) 用法及び用量の解説

該当資料なし

(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

該当しない

(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

V. 治療に関する項目

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

切迫流・早産における諸症状の改善

国内二重盲検比較試験

無月経と子宮筋の攣縮に起因する周期的な下腹部緊満感、下腹部痛ならびに不正出血等を主訴とし、臨床的に切迫流早産と診断された患者を対象に、ピペリドレート塩酸塩錠200mg/日（1回50mgを1日4回）投与群66例とプラセボ投与群66例の二重盲検比較試験を行った。

全般改善度を、著明改善、中等度改善、軽度改善、不変、悪化の5段階区分にて評価した結果、投与7日後における全般改善度において、ピペリドレート塩酸塩投与群はプラセボ投与群に対し、有意な結果を示した（ $P<0.02$ ）。投与7日後の改善率は、ピペリドレート塩酸塩投与群では中等度改善以上が73.7%、軽度改善以上が89.5%、プラセボ投与群では中等度改善以上が51.7%、軽度改善以上が70.7%であった。

副作用の発現割合は、ピペリドレート塩酸塩投与群が4.5%（3/66例）、プラセボ投与群が1.5%（1/66例）であった。ピペリドレート塩酸塩投与群に認められた副作用は、下痢、便秘、嘔吐各1.5%（1/66例）であった¹⁾。

2) 安全性試験

切迫流・早産における諸症状の改善

国内臨床試験

切迫早産の症状を有する患者11例に、ピペリドレート塩酸塩錠を1日400mg^{注)}を5日から最長90日間経口投与した臨床試験を実施した。

その結果、11例中9例に効果を認めた。副作用は認められなかった²⁾。

(5) 患者・病態別試験

胃・十二指腸潰瘍、胃炎、腸炎、胆石症、胆のう炎、胆道ジスキネジーにおける痙攣性疼痛

国内臨床試験

腹痛を主訴とした消化器疾患と診断された患者126例に、ピペリドレート塩酸塩錠を1日6～8錠（3～4回分割投与）^{注)}、4週間経口投与した臨床試験を実施した。

総合評価判定を著効、有効、やや有効、無効、悪化の5段階区分にて評価した結果、主な疾患別総合評価判定は、胃潰瘍では43例中、著効15例（34.9%）、有効16例（37.2%）、やや有効9例（20.9%）、無効3例（7.0%）で、やや有効以上の有効率は93.0%であった。十二指腸潰瘍では37例中、著効11例（29.7%）、有効17例（45.9%）、やや有効8例（21.6%）、無効1例（2.7%）で、やや有効以上の有効率は97.3%であった。急性および慢性胃炎では24例中、著効1例（4.2%）、有効17例（70.8%）、やや有効4例（16.7%）、無効2例（8.3%）で、やや有効以上の有効率は91.7%であった。胆道疾患では7例中、著効1例（14.3%）、有効2例（28.6%）、やや有効3例（42.9%）、無効1例（14.3%）で、やや有効以上の有効率は85.7%であった。副作用の発現割合は1.6%（2/126例）であった。認められた副作用は、便秘（2例）であった³⁾。

注) 本剤の承認されている用法及び用量は「ピペリドレート塩酸塩として、通常成人1日150～200mgを3～4回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。」である。

(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

アトロピン、スコポラミン等の副交感神経節後神経末端遮断薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

副交感神経節後神経末端において、アトロピン様の遮断効果をもつ。また、各種実験より自律神経系を介さず平滑筋細胞に直接作用して筋収縮を抑制することも示唆された^{4) ~7)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 腸管平滑筋に対する作用

ピペリドレート塩酸塩はラット、マウス、モルモットの回腸による *in vitro* の実験にて、アセチルコリン、ヒスタミン、バリウムイオン、経壁刺激における収縮を非特異的に抑制した⁵⁾。

2) Oddi 筋に対する作用

イヌにおいてピペリドレート塩酸塩はネオスチグミンによる、Oddi括約筋、十二指腸及び尿管の収縮を抑制し、この抑制作用はパパペリンに比し持続性が認められた⁶⁾。

3) 胃運動亢進抑制作用

ラットによるカルバコール誘発胃運動及び水浸拘束ストレス時の胃運動亢進を抑制した⁷⁾。

4) 妊娠ラット子宮（妊娠前期・後期）、ヒト子宮に対する作用

妊娠後期のラット子宮平滑筋での、アセチルコリン、オキシトシン、バリウムイオンによる収縮を強く抑制し⁵⁾、一方ウサギ子宮頸管に対する作用は弱かった¹⁾ (*in vitro*)。また、ヒト（分娩後24～48時間経過）において子宮内バルーン挿入法によりオキシトシンによる収縮を抑制することが認められた¹⁾。

(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

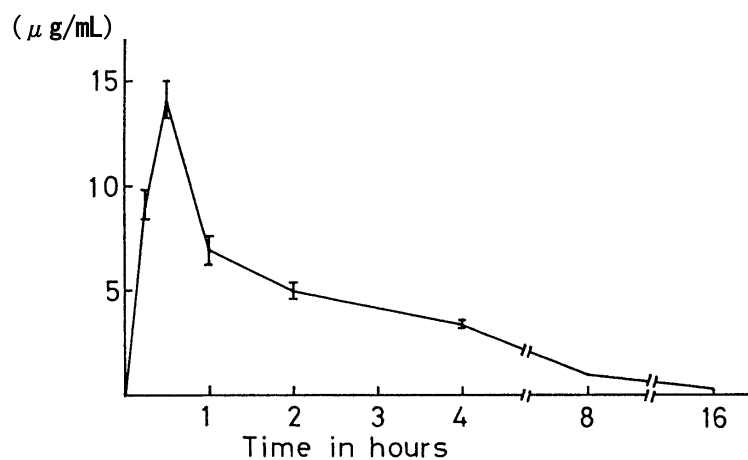
該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

ヒトでの該当資料なし

[参考]

Wistar 系ラットに ^{14}C -ピペリドレート塩酸塩 10mg/kg を経口投与した結果、十二指腸より速やかに吸収され、血漿中濃度は投与後 30 分で最大 ($14\mu\text{g/mL}$) となり、半減期は約 3 時間であった⁸⁾。



(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

該当しない

(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

ヒトでの該当資料なし

[参考]

幽門静脈カニューレラットの十二指腸にピペリドレート塩酸塩 12.5mg を単回注入した際の血漿中に移行した薬物濃度を測定した結果、投与後 0～5 分で $250 \mu\text{g/mL}$ の一過性高値を示し、以後は $100\sim 120 \mu\text{g/mL}$ の濃度で吸収が持続した。60 分間の累積吸収率は約 34%に達した⁸⁾。

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

該当資料なし

(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

ヒトでの該当資料なし

[参考]

Wistar 系雄性ラットに、 ^{14}C -ピペリドレート塩酸塩 10mg/kg を単回経口投与し、血漿中濃度が定常状態に達した投与 1 時間後から 16 時間後までの組織内濃度を測定した結果、投与 1 時間後では肝臓が $12 \mu\text{g/g}$ と最も高く、次いで脾臓が $9 \mu\text{g/g}$ を示したが、他の組織はいずれも血中濃度と同等またはそれより低値であった。卵巣、子宮はほぼ血中濃度と等しく、胸腺、腎臓、心臓の順に低値を示し、脳、肺では極めて低濃度であった。投与 8 時間後には血液、肝臓、腎臓を除き大部分の組織の放射能は消失し、16 時間後にはいずれの組織の残留放射能も極めてわずかであった⁸⁾。

(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

該当資料なし

(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

ヒトでの該当資料なし

[参考]

Wistar 系雄性ラットに、¹⁴C-ピペリドレート塩酸塩 10mg/kg を単回経口投与し、尿、糞および胆汁を採取し放射能濃度を測定した結果、投与後 72 時間で約 70%が尿、糞中より回収され、尿、糞排泄比は約 2:1 であった。尿中排泄の大部分は 24 時間に終了していた。胆汁排泄は 6 時間で約 35%に達した⁸⁾。

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

該当しない

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）

- 2.1 閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕
- 2.2 前立腺肥大による排尿障害のある患者〔症状が増悪するおそれがある。〕
- 2.3 重篤な心疾患のある患者〔症状が増悪するおそれがある。〕
- 2.4 麻痺性イレウスの患者〔症状が増悪するおそれがある。〕
- 2.5 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者

〔解説〕

- 2.1：閉塞隅角緑内障の患者については、厚生労働省医薬・生活衛生局医薬安全対策課長通知（令和元年 6 月 18 日付）に基づき、使用上の注意を改訂した。

平成 31 年 3 月 24 日付で、公益財団法人日本眼科学会から『抗コリン作用を有する薬剤の添付文書における禁忌「緑内障」等の改訂に係る要望書』が厚生労働省に提出されたことを受け、令和元年度第 3 回薬事・食品衛生審議会薬事分科会医薬品等安全対策部会安全対策調査会において審議がなされた。その結果、「開放隅角緑内障」と「閉塞隅角緑内障」に大別される「緑内障」のうち、抗コリン作用により安全性の懸念が生じうるのは「閉塞隅角緑内障」のみと考えられることから、〔禁忌〕の項の「緑内障」を「閉塞隅角緑内障」に変更することが適切と判断された。また、「開放隅角緑内障」の患者に抗コリン薬を投与した場合における急性緑内障発作のリスクを完全には否定できないことから、新たに〔慎重投与〕の項に「開放隅角緑内障の患者」を追記することが適切と判断され、使用上の注意の改訂に関する通知が発出された。

この通知に基づき、〔禁忌〕とされている「緑内障」を「閉塞隅角緑内障」に変更した。（2019 年 9 月 2 日）

- 2.5：発疹等の過敏症があらわれた場合には投与を中止すること。

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

散瞳、めまい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. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 開放隅角緑内障の患者

抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。

9.1.2 前立腺肥大のある患者（排尿障害のある患者を除く）

排尿困難を起こすおそれがある。

9.1.3 うっ血性心不全のある患者

症状が増悪するおそれがある。

9.1.4 不整脈のある患者

症状が増悪するおそれがある。

9.1.5 潰瘍性大腸炎の患者

中毒性巨大結腸があらわれることがある。

9.1.6 甲状腺機能亢進症の患者

症状が増悪するおそれがある。

9.1.7 高温環境にある患者

発汗抑制により体温上昇が起こるおそれがある。

[解説]

9.1.1：開放隅角緑内障の患者については、厚生労働省医薬・生活衛生局医薬安全対策課長通知（令和元年6月18日付）に基づき、使用上の注意を改訂した。

平成31年3月24日付で、公益財団法人日本眼科学会から『抗コリン作用を有する薬剤の添付文書における禁忌「緑内障」等の改訂に係る要望書』が厚生労働省に提出されたことを受け、令和元年度第3回薬事・食品衛生審議会薬事分科会医薬品等安全対策部会安全対策調査会において審議がなされた。その結果、「開放隅角緑内障」と「閉塞隅角緑内障」に大別される「緑内障」のうち、抗コリン作用により安全性の懸念が生じうるのは「閉塞隅角緑内障」のみと考えられることから、[禁忌]の項の「緑内障」を「閉塞隅角緑内障」に変更することが適切と判断された。また、「開放隅角緑内障」の患者に抗コリン薬を投与した場合における急性緑内障発作のリスクを完全には否定できないことから、新たに[慎重投与]の項に「開放隅角緑内障の患者」を追記することが適切と判断され、使用上の注意の改訂に関する通知が発出された。この通知に基づき、[慎重投与]の項に新たに「開放隅角緑内障の患者」を追記することとした。（2019年9月2日）

電子添文の新記載要領に伴い、「慎重投与」から「9. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項へ、移行した。（2024年1月）

(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

設定されていない

(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。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(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

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。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

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
三環系抗うつ剤 イミプラミン 等 フェノチアジン系薬剤 クロルプロマジン 等 モノアミン酸化酵素阻害剤 抗ヒスタミン剤 ジフェンヒドラミン 等	抗コリン作用に基づく副作用が あらわれるおそれがある。	本剤の作用が増強される ことがある。

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 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

AST、ALT の著しい上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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

	頻度不明
眼	散瞳
消化器	口渇、悪心・嘔吐、食欲不振、腹部膨満感、便秘
肝 臓	AST、ALT、 γ -GTP、総ビリルビンの上昇
泌尿器	排尿障害
精神神経系	めまい
循環器	動悸
過敏症	発疹
その他	けん怠感、脱力感

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

単回投与毒性試験⁶⁾

	LD ₅₀ (mg/kg)	
	経口	静注
マウス	1040	26

(Miller and Jainter 法)

(2) 反復投与毒性試験

1) マウス (1 群各 10 匹) にピペリドレート塩酸塩 200mg/kg を 7 日間経口投与した結果、すべてのマウスは順調に成長し、毒性徴候を示さず、主要臓器の肉眼的・病理組織学的所見でも異常は認められず、血液像、骨髄像でも対照との差は認められなかった⁶⁾。

2) Wistar 系ラット (1 群雌雄各 15 匹) にピペリドレート塩酸塩 150、300、450、600mg/kg を 100 日間強制経口投与した。150、300、450mg/kg 投与群では何ら異常は認められなかった。600mg/kg では肝異常が雌 50%、雄 30%に、腎異常が雌 30%、雄 10%に認められた。その他、体重増加の抑制、BSP 排泄の軽度の遅延などが認められた。この結果、連続投与による中毒発生の最小限界量は、ラットでは 600mg/kg と推察された⁹⁾。

(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

HoltzmanSD 系雌ラット (1 群 20 匹) にピペリドレート塩酸塩 100mg/kg を妊娠 5～12 日間経口投与し、妊娠 19～20 日目に解剖し、生存胎児、死亡胎児、吸収胚の数、外表奇形、骨格異常について検討したが、対照群との間に有意差は認められなかった¹⁰⁾。

(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：ダクチラン錠 50mg 劇薬
有 効 成 分：ピペリドレート塩酸塩 劇薬

2. 有効期間

5 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：なし

6. 同一成分・同効薬

同 一 成 分 薬：先発医薬品名；ダクチル錠 50mg（キッセイ薬品工業）
同 効 薬：ブチルスコポラミン臭化物（ブスコパン錠 10mg、サノフィ）、N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩（ダイピン®錠 1mg、アルフレッサファーマ）、ブトロピウム臭化物（コリオパン®カプセル 5mg／錠 10mg／顆粒 2%、エーザイ） 等

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

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
旧販売名 ダクチラン錠	1967 年 4 月 7 日	(42A)2644	1969 年 1 月 1 日	1967 年 9 月 1 日
ダクチラン錠 50mg	2007 年 9 月 28 日	21900AMX01733000	2007 年 12 月 21 日	—

本剤は「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について（平成 16 年 6 月 2 日付 薬食発第 0602009 号）」に基づき、販売名を変更した。

また、本剤は 2021 年 6 月に製造販売中止を案内し、2022 年 3 月 31 日に経過措置期間を満了した。

X. 管理的事項に関する項目

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

再評価公表日：1979年7月16日（その16）

内 容：「効能・効果」の一部追加　〔切迫流・早産における諸症状の改善〕

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
ダクチラン錠 50mg	1249004F1098	1249004F1098	101877601	620006022

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) 下平和夫 :第 14 回日本産科婦人科学会総会. 1959 :31-36
- 2) 金子栄蔵, 他. :臨床と研究. 1982 ;59(1) :301-307
- 3) 中嶋晃, 他. :産婦人科治療. 1975 ;31(1) :101-115
- 4) Long J.P. et al. :J. Am. Pharm. Assoc. 1954 ;43(10) :616-619 (PMID:13211403)
- 5) 小澤光, 他. :日本薬理学雑誌. 1974 ;70(5) :659-671
- 6) Chen, J.Y.P. et al. :J. Pharmacol. Exp. Ther. 1952 ;104(3) : 269-276 (PMID:14908895)
- 7) 天木正春, 他. :応用薬理. 1982 ;24(4) :561-569
- 8) 山本勝彦, 他. :応用薬理. 1974 ;8(8) :1115-1122
- 9) 石原敬隆, Crapinon 錠の生物学的基礎試験に就て、そのⅡ. Ⅲ. 毒性試験、胎仔試験(社内資料)
- 10) Brehm C.A., Teratogenic Study in Rats(社内資料)

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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

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

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

なし

製造販売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区大手町一丁目3番7号