2023年6月改訂（第16版）

日本標準商品分類番号
872129

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

不整脈治療剤

劇薬、処方箋医薬品

ピルシカイニド塩酸塩水和物注

サンリズム®注射液50

SUNRYTHM® INJECTION

剤形	注射剤
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品（注意―医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1アンプル中（5mL）中にピルシカイニド塩酸塩水和物（日局）50mgを含有
一般名	和名：ピルシカイニド塩酸塩水和物（JAN） 洋名：Pilsicainide Hydrochloride Hydrate（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：2000年1月18日 薬価基準収載年月日：2000年4月14日 販売開始年月日：2000年4月17日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：第一三共株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	第一三共株式会社　製品情報センター TEL：0120-189-132　FAX：03-6225-1922 医療関係者向けホームページ https://www.medicalcommunity.jp

本IFは2021年8月改訂（第1版）の電子添文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。
専用アプリ「添文ナビ」でGS1バーコードを読み取ることで、最新の電子添文等を閲覧できます。

(01)14987081437952

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（http://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、「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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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 を利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 1
(1) 承認条件 1
(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 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 5
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（物理化学的変化） 6
9. 溶出性 6
10. 容器・包装 7
(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 7
(2) 包　装 7
(3) 予備容量 7
(4) 容器の材質 7
11. 別途提供される資材類 7
12. その他 7

V.　治療に関する項目 8
1. 効能又は効果 8
2. 効能又は効果に関連する注意 8
3. 用法及び用量 8
(1) 用法及び用量の解説 8
(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠 8
4. 用法及び用量に関連する注意 8
5. 臨床成績 9
(1) 臨床データパッケージ 9
(2) 臨床薬理試験 9
(3) 用量反応探索試験 9
(4) 検証的試験 9
1) 有効性検証試験 9
2) 安全性試験 10
(5) 患者・病態別試験 10
(6) 治療的使用 11
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 11
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 11
(7) その他 11

VI. 薬効薬理に関する項目 12
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 12
2. 薬理作用 12
(1) 作用部位・作用機序 12
(2) 薬効を裏付ける試験成績 12
(3) 作用発現時間・持続時間 13

VII. 薬物動態に関する項目 14
1. 血中濃度の推移 14
(1) 治療上有効な血中濃度 14
(2) 臨床試験で確認された血中濃度 14
(3) 中毒域 14
(4) 食事・併用薬の影響 14
2. 薬物速度論的パラメータ 15
(1) 解析方法 15
(2) 吸収速度定数 15
(3) 消失速度定数 15

(4) クリアランス 15
(5) 分布容積 15
(6) その他 15
3. 母集団（ポピュレーション）解析 15
(1) 解析方法 15
(2) パラメータ変動要因 15
4. 吸　収 15
5. 分　布 15
(1) 血液－脳関門通過性 15
(2) 血液－胎盤関門通過性 15
(3) 乳汁への移行性 15
(4) 髄液への移行性 15
(5) その他の組織への移行性 16
(6) 血漿蛋白結合率 16
6. 代　謝 16
(1) 代謝部位及び代謝経路 16
(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率 16
(3) 初回通過効果の有無及びその割合 16
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率 16
7. 排　泄 17
8. トランスポーターに関する情報 17
9. 透析等による除去率 17
10. 特定の背景を有する患者 17
11. その他 17

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 18
1. 警告内容とその理由 18
2. 禁忌内容とその理由 18
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 18
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 18
5. 重要な基本的注意とその理由 18
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 20
(1) 合併症・既往歴等のある患者 20
(2) 腎機能障害患者 21
(3) 肝機能障害患者 21
(4) 生殖能を有する者 21
(5) 妊婦 21
(6) 授乳婦 22
(7) 小児等 22
(8) 高齢者 22
7. 相互作用 23
(1) 併用禁忌とその理由 23
(2) 併用注意とその理由 23
8. 副作用 25
(1) 重大な副作用と初期症状 25
(2) その他の副作用 25
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 29
10. 過量投与 29
11. 適用上の注意 30
12. その他の注意 30
(1) 臨床使用に基づく情報 30
(2) 非臨床試験に基づく情報 30

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 31
1. 薬理試験 31
(1) 薬効薬理試験 31
(2) 安全性薬理試験 31
(3) その他の薬理試験 31
2. 毒性試験 32
(1) 単回投与毒性試験 32
(2) 反復投与毒性試験 32
(3) 遺伝毒性試験 33
(4) がん原性試験 33
(5) 生殖発生毒性試験 33
(6) 局所刺激性試験 33
(7) その他の特殊毒性 33

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 34
1. 規制区分 34
2. 有効期間 34
3. 包装状態での貯法 34
4. 取扱い上の注意 34
5. 患者向け資材 34
6. 同一成分・同効薬 34
7. 国際誕生年月日 34
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 34
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 34
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 34
11. 再審査期間 34
12. 投薬期間制限に関する情報 35
13. 各種コード 35
14. 保険給付上の注意 35

Ⅺ. 文　　献 36
1. 引用文献 36
2. その他の参考文献 37

Ⅻ. 参考資料 38
1. 主な外国での発売状況 38
2. 海外における臨床支援情報 38

XIII. 備　　考 39
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 39
(1) 粉砕 39
(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 39
2. その他の関連資料 40

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ピルシカイニド塩酸塩水和物は、1981 年福岡大学の宮野らとサントリー株式会社医薬事業部（現 第一三共株式会社）が植物アルカロイドの部分構造であるピロリチジン骨格にキシリジン誘導体を結合させて創製した、Vaughan Williams らによる抗不整脈薬分類のクラス Ic に属する抗不整脈薬で、心筋の Na チャンネル抑制作用により抗不整脈作用を示す。ピルシカイニド塩酸塩水和物は経口剤（カプセル製剤）として、1991 年 3 月に「下記の状態で他の抗不整脈薬が使用できないか、又は無効の場合　頻脈性不整脈（心室性）」を効能又は効果として承認された。さらに 1993 年 1 月に「下記の状態で他の抗不整脈薬が使用できないか、又は無効の場合　頻脈性不整脈」とする効能追加（上室性頻脈性不整脈）が承認された。経口剤については、1998 年 3 月、薬事法第 14 条第 2 項各号のいずれにも該当しないとの再審査結果を得た。

本剤は経口剤の開発時より各種頻脈性不整脈に対し他剤無効例にも有効性を示し、 かつ心機能の抑制が弱いことが示唆された。このことから、 速やかな発作停止を必要とする各種頻脈性不整脈に対して即効性が期待できると考えられ、1990 年 4 月よりピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤の開発が進められた。2000 年 1 月に本邦唯一の「スローキネティクス特性を有するピュアな Na チャンネル遮断薬」の注射剤として「緊急治療を要する頻脈性不整脈（上室性及び心室性）」を効能又は効果として承認された。なお注射剤については 2010 年 3 月に薬事法第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しないとの再審査結果を得た。

2. 製品の治療学的特性

(1) 本邦唯一の「スローキネティクス特性を有するピュアな Na チャンネル遮断薬」（Sicilian Gambit による抗不整脈薬の分類）の注射剤である [1)]。

(2) 緊急治療を要する頻脈性不整脈（上室性及び心室性）に対し、高い有効性を示す（「**Ⅴ.治療に関する項目**」参照）。

(3) 発作性心房細動、発作性上室性頻拍、心室頻拍に対し、高い停止効果を示し、速やかに自覚症状を改善する。

(4) 重大な副作用として心室細動、心室頻拍（Torsades de pointes を含む）、洞停止、完全房室ブロック、失神、心不全、急性腎障害があらわれることがある（「**Ⅷ.安全性（使用上の注意等）に関する項目**」参照）。

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

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	タイトル、参照先等
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	

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

サンリズム®注射液 50

(2)洋　名

SUNRYTHM® INJECTION 50

(3)名称の由来

サントリー株式会社で開発された抗不整脈薬で「Suntory」の「Sun」と拍動を意味する「rhythm」から「SUNRYTHM（サンリズム）」と命名した。

2. 一般名

(1)和　名（命名法）

ピルシカイニド塩酸塩水和物（JAN）

(2)洋　名（命名法）

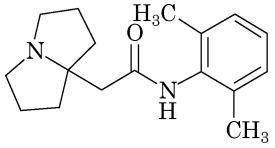
Pilsicainide Hydrochloride Hydrate（JAN）

pilsicainide（INN）

(3)ステム

プロカインアミド及びリドカイン系のクラスⅠ抗不整脈薬：-cain-

3. 構造式又は示性式



・HCl・½H_2O

4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{17}H_{24}N_2O$・HCl・$^1/_2H_2O$

分子量：317.85

5. 化学名（命名法）又は本質

N-(2,6-Dimethylphenyl)tetrahydro-1*H*-pyrrolizin-7a(5*H*)-ylacetamide monohydrochloride hemihydrate（IUPAC 命名法による）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

SUN1165i

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1)外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2)溶解性

酢酸（100）に極めて溶けやすく、水、メタノール又はエタノール（99.5）に溶けやすい。

0.1mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3)吸湿性

吸湿性は認められない。

(4)融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：210.5～213.5℃（あらかじめ浴液を 160℃に加熱しておく）

(5)酸塩基解離定数

pKa：10.1～10.3（滴定法）

(6)分配係数

1.73（pH7.00、クロロホルム／緩衝液）

(7)その他の主な示性値

pH：本品 1.0g を水 50mL に溶かした液の pH は 5.3～6.1 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

		保存条件	保存期間	保 存 形 態	結　　果
長期保存試験		室温	64 ヵ月	ポリエチレン袋／ファイバー缶 a)	変化なし
苛酷試験	固体状態	50℃	12 ヵ月	ポリエチレン袋／ファイバー缶	変化なし
		60℃	6 ヵ月		変化なし
		40℃/75%RH	6 ヵ月	無色透明ガラス瓶（開栓）	変化なし
		室内散光 b)	12 ヵ月	無色透明ガラスシャーレ	変化なし
		太 陽 光 c)	6 ヵ月		変化なし

注 a）原体をポリエチレン袋に封入し、フタ付ファイバー缶に入れ保存した。
b）蛍光灯下（500lx）
c）直射日光のあたる南窓側に放置

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：日局「ピルシカイニド塩酸塩水和物」による

定　量　法：日局「ピルシカイニド塩酸塩水和物」による

Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤　形

(1)剤形の区別

注射剤

(2)製剤の外観及び性状

販売名	性状
サンリズム 注射液 50	無色澄明の液

(3)識別コード

該当しない

(4)製剤の物性

pH：4.8～6.5

浸透圧比（生理食塩液対比）：約 1

(5)その他

注射剤の容器中の特殊な気体：なし

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	有効成分	添加剤
	1 アンプル中	
サンリズム 注射液 50	ピルシカイニド塩酸塩水和物（日局） 50mg/5mL	D-ソルビトール　200mg

(2)電解質等の濃度

Cl^- 0.16mEq

(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

5. 混入する可能性のある夾雑物

混入する可能性のある夾雑物は、合成原料由来の副生成物であるピルシカイニド塩酸塩水和物のホルミル体 *N*-(2-formyl-6-methylphenyl)-8-pyrrolizidinylacetamide である。

6. 製剤の各種条件下における安定性

試験名		保存条件		保存期間	保存形態	試験結果
		温度	光			
苛酷試験	温度	60℃		3ヵ月	無色ガラスアンプル（紙箱）	pH が僅かに低下したが、外観、浸透圧比、及び含量に変化はなく、分解物も認められなかった。
	光	25℃	蛍光灯（1,000lx）	8週	無色ガラスアンプル	変化なし
			遮光*（対照）	8週	無色ガラスアンプル	変化なし
長期保存試験		25℃		36ヵ月	無色ガラスアンプル（紙箱）	変化なし
加速試験		40℃		6ヵ月	無色ガラスアンプル（紙箱）	変化なし

＊アルミ箔で包み遮光した。

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（物理化学的変化）

配合薬剤の剤形に合わせ本品との配合量を個別に設定し、室温保存における pH 及び外観変化（肉眼的）を配合直後及び 1、3、6、24 時間後に測定、観察するとともに、含量（残存率）を配合直後、6、24 時間後に測定した。

その結果、セルシン注との配合において配合直後から配合液の白濁が認められた。その白濁は、本品との混合によりセルシン注に添加されている溶解補助剤（プロピレングリコール、無水エタノール）が希釈され、水に難溶である主薬成分（ジアゼパム）が析出したものと推定され配合不可と判断した。

なお、その他に試験した配合薬剤では、特に問題となる変化は認められなかった（「**Ⅻ.2.その他の参考資料**」参照）。

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

該当しない

(2)包　装

5mL　10 アンプル

(3)予備容量

該当資料なし

(4)容器の材質

アンプル：ガラス（無色）

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

緊急治療を要する頻脈性不整脈（上室性及び心室性）

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

〈期外収縮〉

通常、成人には 1 回 0.075mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 0.75mg/kg）を必要に応じて日本薬局方生理食塩液又は 5%ブドウ糖注射液などで希釈し、血圧ならびに心電図監視下に 10 分間で徐々に静注する。なお、年齢、症状に応じて適宜減量する。

〈頻拍〉

通常、成人には 1 回 0.1mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 1.0mg/kg）を必要に応じて日本薬局方生理食塩液又は 5%ブドウ糖注射液などで希釈し、血圧ならびに心電図監視下に 10 分間で徐々に静注する。なお、年齢、症状に応じて適宜減量する。

(2)用法及び用量の設定経緯・根拠

4. 用法及び用量に関連する注意

> 7. 用法及び用量に関連する注意
>
> 7.1 本剤を急速に静注した場合には、血中濃度が急激に上昇するので、本剤の投与に際しては投与時間を厳守すること。
>
> 7.2 本剤の投与により効果を認めたものの、その後再発した場合には、初回用量がピルシカイニド塩酸塩水和物としての最大用量 0.75mg/kg（期外収縮）あるいは 1.0mg/kg（頻拍）の半量以下の場合を除き、再投与は行わないこと。なお、再投与する際は 1 日総投与量としてピルシカイニド塩酸塩水和物の 1 回最大用量を超えないこと。

解説：

本剤が急速に静注された場合や、過量に投与された場合には心室内伝導抑制作用が強く発現し、QRS 幅が過度に増大してリエントリー性心室頻拍を惹起するなど新たな副作用発現のリスクが生じることが予想される。そこで、注射用抗不整脈薬の使用目的を踏まえ、本剤の投与時間及び本剤有効例における再投与に関する適切な情報提供を行うため設定した。

7.1 投与時間

本剤を短時間に投与した場合、血中濃度は急激に上昇し、副作用が発現しやすくなる可能性が考えられる。

7.2 再投与

再投与症例における有効性を保証するためには、初回投与量で得られる血中濃度を下回らない投与量を設定しなければならない。本剤の再投与による血中濃度の推移は容易に予測が可能で、初回用量が 1 回の最大用量の半量以下であれば、初回と同量を再投与した場合に得られる血中濃度は、初回投与時以上かつ 1 回の最大用量の血中濃度を超えないと考えられる。従って、再投与する場合には 1 日総投与量で規定することとした。

5. 臨床成績 [2~11]

(1)臨床データパッケージ

該当しない

(2)臨床薬理試験 [2]

健康成人 12 例（のべ 24 人）を対象に、本剤 0.125、0.25、0.50、0.75mg/kg を 10 分間で静脈内投与した結果、いずれの用量においても血圧、脈拍数、呼吸数、体温、臨床検査値及び心エコー図に異常所見や変動は認められず、また副作用も認められなかった。

注）本剤の承認されている用量は、期外収縮に対して 1 回 0.075mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 0.75mg/kg）、頻拍に対して 1 回 0.1mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 1.0mg/kg）である。

(3)用量反応探索試験 [3,4]

上室性及び心室性期外収縮患者 15 例ならびに発作性上室性頻拍、発作性心房細動･粗動患者 51 例を対象に、本剤 0.25、0.50、0.75、1.0mg/kg の各用量を 10 分間で静脈内投与した。その結果、期外収縮では 0.50mg/kg 群、0.75mg/kg 群とも良好な成績を示した。用量依存的に PQ 時間の延長が認められたが、QRS 幅、QTc に有意な変化は見られなかった。

注）本剤の承認されている用量は、期外収縮に対して 1 回 0.075mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 0.75mg/kg）、頻拍に対して 1 回 0.1mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 1.0mg/kg）である。

(4)検証的試験

1) 有効性検証試験

①無作為化並行用量反応試験 [5,6,7]

各種頻脈性不整脈に対する本剤の有効性及び安全性の用量反応関係から臨床用量を決定するために、用量設定試験が実施された。

a. 心室性期外収縮を対象とした用量検討のための二重盲検比較試験 [5]

心室性期外収縮患者 95 例を対象とし、本剤 0.25、0.50、0.75mg/kg の各用量を 10 分間で静脈内投与する二重盲検群間比較試験により用量の検討が行われた。その結果、0.50mg/kg 群と 0.75mg/kg 群との間に用量反応性が認められた。また、期外収縮の抑制効果、停止効果の持続性のいずれにおいても 0.75mg/kg 群が 0.25mg/kg 群、0.50mg/kg 群に比較して良好な成績を示した。

b. 発作性上室性頻拍を対象とした用量検討のための二重盲検比較試験 [6]

発作性上室性頻拍患者 62 例を対象とし、本剤 0.50、1.0mg/kg の各用量を 10 分間で静脈内投与する二重盲検群間比較試験により用量の検討が行われた。その結果、0.50mg/kg 群に比較して 1.0mg/kg 群は良好な成績を示した。

c. 発作性心房細動･粗動、発作性心室頻拍及び発作性上室性頻拍を対象とした後期第Ⅱ相試験（非盲検試験）[7]

発作性心房細動･粗動を中心に、発作性心室頻拍及び発作性上室性頻拍を併せた計 89 例を対象に、本剤 1.0mg/kg を 10 分間で静脈内投与した場合の有効性と安全性の検討が非盲検法により行われた。その結果、いずれの不整脈に対しても良好な成績を示した。

注）本剤の承認されている用量は、期外収縮に対して 1 回 0.075mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 0.75mg/kg）、頻拍に対して 1 回 0.1mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 1.0mg/kg）である。

以上、各種不整脈に対する有効性、安全性の検討の結果、臨床用法及び用量として期外収縮に対しては本剤 0.75mg/kg、また頻拍症に対しては 1.0mg/kg のそれぞれ 10 分間静脈内投与法が妥当であると判断された。なお、1.0mg/kg を超えて投与すると心電図の変化等から副作用の発現の危険性が増大すると推測されたため、1.0mg/kg が上限の用量であると考えられた。

②比較試験 [8,9,10]

各種頻脈性不整脈に対する本剤の有効性及び安全性を客観的に評価するために二重盲検比較試験が実施された。

＜国内第Ⅲ相試験＞

a. 心室性期外収縮を対象とした二重盲検比較試験 [8]

心室性期外収縮患者 149 例に対し、本剤 0.75mg/kg の有効性及び安全性をジソピラミド 1.5mg/kg を対照とし、両群とも 10 分間で静脈内投与する二重盲検比較試験により検討した。その結果、全般改善度の改善率（「中等度改善」以上）は本剤 76.6%（59／77 例）、ジソピラミド 70.8%（51／72 例）で、本剤はジソピラミドと同等の効果を有することが確認された。また、安全性についても差は認められなかった。本剤投与群における副作用発現率は 3.9%（3／77 例）であった。心電図パラメータについては、本剤群では PQ 時間の延長が、ジソピラミド群では QTc の増大が他群に比し大きかった。

b. 発作性上室性頻拍を対象とした二重盲検比較試験 [9]

発作性上室性頻拍患者に対し、本剤 1.0mg/kg の 10 分間静脈内投与法における有効性（有効性解析対象症例 53 例）及び安全性（安全性解析対象症例 55 例）をプラセボ（生理食塩液）を対照とした二重盲検比較試験により検討した。その結果、全般改善度の改善率（「中等度改善」以上）は本剤 89.3%（25／28 例）、プラセボ 20.0%（5／25 例）と両群間に有意差を認め、良好な頻拍停止効果が確認された。一方、安全性については、両群間に差は認められなかった。本剤投与群における副作用発現率は 3.6%（1／28 例）であった。

c. 発作性心房細動･粗動を対象とした二重盲検比較試験 [10]

発作性心房細動･粗動患者に対し、本剤 1.0mg/kg の 10 分間静脈内投与法における有効性（有効性解析対象症例 74 例）及び安全性（安全性解析対象症例 78 例）をプラセボ（生理食塩液）を対照とした二重盲検比較試験により検討した。その結果、全般改善度の改善率（「中等度改善」以上）は本剤 45.0%（18／40 例）、プラセボ 2.9%（1／34 例）と両群間に有意差を認め、良好な頻拍停止効果が確認された。一方、安全性については、両群間に差は認められなかった。本剤投与群における副作用発現率は 4.9%（2／41 例）であった。

以上より、心室性期外収縮、発作性上室性頻拍、発作性心房細動・粗動の各不整脈を対象とした二重盲検比較試験において、本剤の有用性が確認された。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5)患者・病態別試験

該当資料なし

＜参考＞

開心術中・術後の頻脈性不整脈に対する有効性及び安全性の検討 [11]

開心術中又は術後一週間以内にあらわれた緊急治療を要する頻脈性不整脈患者 16 例を対象に､本剤 1.0mg/kg の 10 分間静脈内投与法における有効性及び安全性を非盲検試験により検討した。その結果、術部位別の有効性に差は認めず、臨床上特に問題とされる症例も認められなかったことから、循環動態が障害されている開心術中や術後の頻脈性不整脈に対して臨床的に有用であることが示唆された。

(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

使用成績調査

副作用は、安全性解析対象 1,359 例のうち、73 例（5.4%）92 件に認められ、そのうち心室性頻脈、洞停止などの重篤な副作用は 32 例（2.4%）36 件であった。

75 歳以上の後期高齢者 355 例での副作用は、29 例（8.2%）36 件に認められ、非後期高齢者の副作用 44 例（4.4%）56 件と比較して有意に高かった。また、重点調査項目として心拍数・心リズム障害に影響を及ぼす要因を検討したところ、基礎心疾患を有する群、投与速度が速い群（頻拍）などでの心拍数・心リズム障害の発現率は、有意に高かった。

有効性については、有効性解析対象症例 1,238 例のうち、同日中に反復投与された 41 例を除いた 1,197 例を検討したところ、有効率は 51.4%（615／1,197 例）であった。

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

心室性期外収縮、上室性期外収縮、発作性上室性頻拍、発作性心房細動・粗動、発作性心室頻拍を対象とした臨床試験の概要は次表のとおりである。

疾患名	対象症例	全般改善度	
		著明改善	中等度改善以上
心室性期外収縮	184	100（54.3%）	127（69.0%）
上室性期外収縮	1	1	1
発作性上室性頻拍	130	94（72.3%）	95（73.1%）
発作性心房細動･粗動	120	37（30.8%）	50（41.7%）
発作性心室頻拍	10	9（90.0%）	9（90.0%）

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

Vaughan Williams らの分類のクラス I に属する化合物

キニジン硫酸塩水和物、ジソピラミド、プロカインアミド塩酸塩、シベンゾリンコハク酸塩、ピルメノール塩酸塩水和物、アプリンジン塩酸塩、メキシレチン塩酸塩、リドカイン、フレカイニド酢酸塩、プロパフェノン塩酸塩

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

ピルシカイニド塩酸塩水和物は、Vaughan Williams らの分類のクラス Ic に属する不整脈治療剤で、Na チャンネル抑制作用により抗不整脈作用を示す。Sicilian Gambit の提唱する薬剤分類（日本版）において、本剤は Na チャンネルを選択的に抑制し、K、Ca チャンネルならびにα、β及びムスカリン受容体などには影響を与えないものとして位置づけられる。

(1)作用部位・作用機序

本剤は心筋細胞の Na チャンネル抑制作用により、細胞膜の活動電位の最大脱分極速度（$\dot{V}max$）を抑制し、刺激伝導速度を抑制することにより抗不整脈作用を示す。

(2)薬効を裏付ける試験成績

1) 実験的不整脈に対する作用

①冠動脈二段結紮心室性不整脈に対する作用 [12,13,14]

イヌにおいて、冠動脈結紮 24 時間後に誘発された心室性不整脈に対し抗不整脈作用を示した。

②アコニチン、ウアバイン及びアドレナリン誘発不整脈に対する作用 [12,15]

イヌにおいてアコニチン誘発心房性不整脈、 ウアバイン誘発心室性不整脈及びアドレナリン誘発心室性不整脈を抑制した。

③冠動脈閉塞中及び再灌流中に発生する心室性不整脈に対する作用 [16]

麻酔開胸犬において冠動脈閉塞中及び再灌流によって誘発された心室性不整脈（期外収縮、 頻脈及び細動）の発生率を低下させた。

④イヌ迷走神経刺激心房細動モデルに対する作用 [17,18,19]

イヌにおいて迷走神経刺激下に誘発された心房細動に対し、本剤は 90～100%の停止率を示した。

2) 電気生理学的作用

①最大脱分極速度に対する作用 [20]

モルモット乳頭筋において、静止膜電位にほとんど影響を与えることなく、最大脱分極速度（$\dot{V}max$）を用量依存的に抑制した（*ex vivo*）。

②活動電位持続時間及び有効不応期に対する作用 [20]

モルモット乳頭筋の活動電位持続時間（APD）及び有効不応期（ERP）に影響を与えなかった（*ex vivo*）。

③心室細動の発生閾値に対する作用 [16]

イヌにおいて電気刺激による心室細動の発生閾値を上昇させた。

④遅延後脱分極及び誘発自動能に対する作用 [21]

イヌのプルキンエ線維でアセチルストロファンチジンで誘発される遅延後脱分極及び誘発自動能を抑制した（*ex vivo*）。

⑤Ca 電流及び K 電流に対する作用[22~24]

ウサギ心房筋単一細胞の Ca 電流、遅延整流 K 電流、内向き整流 K 電流ならびに一過性外向き電流に対し、影響を与えなかった[22,23]。

モルモットの単一心房筋細胞においてアセチルコリンで惹起される K チャネル電流に対する抑制作用はフレカイニド、ジソピラミド、キニジンと比べて弱かった（*in vitro*）[24]。

⑥心電図に対する作用[14]

イヌにおいて心電図の PQ の延長及び QRS 幅の増大作用を有するが QTc の延長作用はジソピラミドと比べて弱かった。

3) 臨床電気生理学的作用[25,26]

発作性上室性頻拍患者に本剤 0.5～1.0mg/kg を、また心室頻拍患者に本剤 0.25～1.0mg/kg を 10 分間で単回静脈内投与した場合、洞周期（SCL）を短縮させ[25,26]、房室結節内伝導（AH）時間[25,26]、順行性房室結節機能的有効不応期（AVNFRP）[25]を延長させた。また、頻拍誘発試験において発作性上室性頻拍及び心室頻拍の誘発抑制効果が認められた[25,26]。

注）本剤の承認されている用量は、期外収縮に対して 1 回 0.075mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 0.75mg/kg）、頻拍に対して 1 回 0.1mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 1.0mg/kg）である。

4) 心機能に対する作用[25,26]

発作性上室性頻拍患者に本剤 0.5～1.0mg/kg を単回静脈内投与した場合、肺動脈楔入圧は有意に増加したが正常範囲内の変化であった（投与前値 7mmHg、投与終了時 10mmHg）[25,26]。また心室頻拍患者に 0.25～1.0mg/kg を単回静脈内投与した場合、心拍数及び肺動脈楔入圧が有意に増加した（心拍数；投与前値 71 回/分、投与終了時 76 回/分、肺動脈楔入圧；投与前値 14mmHg、投与終了時 18mmHg）[26]。

注）本剤の承認されている用量は、期外収縮に対して 1 回 0.075mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 0.75mg/kg）、頻拍に対して 1 回 0.1mL/kg（ピルシカイニド塩酸塩水和物として 1.0mg/kg）である。

5) 発作性心房細動･粗動の発作停止機序[27]

発作性心房細動･粗動患者に本剤 1.0mg/kg を 10 分又は 20 分間で静脈内投与した結果、発作の停止した症例は 54.5%（6/11）であった。本剤投与により、心房電位周期の延長が認められ、発作停止例において心房電位周期のばらつきが小さくなっていることから、本剤の発作性心房細動に対する発作停止機序として、複数のリエントリー回路の同調化が示唆された。

(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

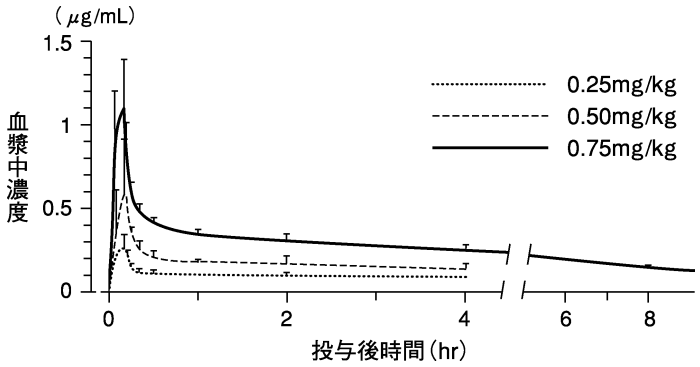
(1)治療上有効な血中濃度

最小有効血漿中濃度：約 0.2μg/mL [28,29]

(2)臨床試験で確認された血中濃度

健康成人男性 18 例にピルシカイニド塩酸塩水和物 0.25、0.50 及び 0.75mg/kg を 10 分間かけて単回静脈内投与した場合、血漿中濃度の推移は下図のとおりであった [2]。

ピルシカイニド塩酸塩水和物単回静脈内投与時の血漿中濃度の推移



ピルシカイニド塩酸塩水和物単回静脈内投与における薬動力学的パラメータ

投与量 (mg/kg)	n	Cmax 注1) (μg/mL)	$t_{1/2\alpha}$ 注2) (min)	$t_{1/2\beta}$ 注3) (hr)	AUC 注4) (μg・hr/mL)
0.25	6	0.28±0.06	1.99±0.68*	4.34±1.98*	0.73±0.33*
0.50	6	0.65±0.28	3.95±1.54	5.74±0.85	1.71±0.27
0.75	6	1.10±0.30	1.82±1.01	4.37±0.48	2.88±0.36

（平均±SD）

1) Cmax：最高血漿中濃度

2) $t_{1/2\alpha}$：α相（分布相）の消失半減期

3) $t_{1/2\beta}$：β相（消失相）の消失半減期

4) AUC：血漿中濃度時間曲線下面積

＊：n=5

注）本剤の承認用量は 1 回 0.75mg/kg 又は 1.0mg/kg である。

＜参考＞

ヒトの 1.0mg/kg 投与時（10 分間かけて投与）の血漿中濃度は 1.74±0.85μg/mL であり、ラットにおける 1.0mg/kg 反復投与時（無毒性量）のラット血漿中濃度 3.12±0.60μg/mL のほぼ 1/2 であった。

(3)中毒域

該当資料なし

(4)食事・併用薬の影響

「Ⅷ.7.相互作用」参照

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

該当しない

(3)消失速度定数

健康成人に 0.75mg/kg を 10 分間かけて単回静脈内投与した場合

消失速度定数（Kel）：1.32±0.54/hr

(4)クリアランス

健康成人に 0.75mg/kg を 10 分間かけて単回静脈内投与した場合

全身クリアランス（CLtot）：3.76±0.36mL/min/kg

(5)分布容積

健康成人に 0.75mg/kg を 10 分間かけて単回静脈内投与した場合

定常状態の分布容積（Vdss）：1.3±0.1L/kg

(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

該当しない

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

「Ⅶ.5.(5)その他の組織への移行性」参照

(3)乳汁への移行性

「Ⅶ.5.(5)その他の組織への移行性」参照

(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

＜動物データ＞

ラットに^{14}C-ピルシカイニド塩酸塩水和物を静脈内投与した場合、下表のように投与後15分で主として肝臓、腎臓に血漿中濃度のそれぞれ約 20 倍、15 倍の放射能が検出され、心臓に血漿中濃度の約 2 倍、脳への分布は血漿中よりも低濃度であった。また 7 日間及び 14 日間反復静脈内投与した結果、ピルシカイニド及びその代謝物の組織への蓄積性及び残留性は見られなかった[30]。

	放射能濃度（^{14}C-ピルシカイニド eq./mL あるいは g）					
	単回 静脈投与					14 日間 反復静脈投与
投与後時間	15 分	1 時間	3 時間	12 時間	24 時間	168 時間
血　漿	0.75±0.04	0.44±0.02	0.27±0.01	0.04±0.00	0.01±0.00	－
脳	0.29±0.03	0.14±0.01	0.12±0.07	0.01±0.00	－	－
心　臓	1.76±0.10	0.49±0.02	0.27±0.01	0.06±0.00	0.02±0.00	0.01
肝　臓	15.99±1.00	7.11±0.38	3.66±0.16	1.23±0.04	0.66±0.02	0.32±0.03
腎　臓	12.58±0.72	3.16±0.14	1.84±0.08	0.49±0.03	0.32±0.03	0.09±0.01

－：検出限界以下

また、胎児及び乳汁中に血漿中濃度とほぼ同程度かあるいはそれ以上の濃度の放射能が検出された[31,32]。

(6)血漿蛋白結合率

ヒト血漿蛋白結合率は、1.0μg/mL 以下の濃度で約 35%と一定であったが、50μg/mL では約 20%に低下した。また、ヒト血漿での結合はα_1-酸性糖蛋白との結合によるものと推察された(*in vitro*)[33]。

＜参考：ピルシカイニド塩酸塩水和物経口剤での成績＞

健康成人にピルシカイニド塩酸塩水和物 50mg を経口投与した場合の血漿蛋白結合率は約 35%（35.4±8.6%）であった[34]。

6. 代　謝

(1)代謝部位及び代謝経路

健康成人では本剤は代謝されにくい。また、ヒト肝ミクロゾームを用いて、動物で認められた代謝物 2-ヒドロキシメチル体及び 3-ヒドロキシ体を測定した結果、いずれの生成も認められなかった。

(2)代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

経口投与時に検出された代謝物 2-ヒドロキシメチル体の生成に関与するヒト肝チトクローム P450 分子種を検討したところ、CYP2D6 により上記代謝物の生成が僅かに認められた[35]。

(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

＜動物データ＞

イヌ冠動脈二段結紮不整脈に対する 2-ヒドロキシメチル体の抗不整脈作用強度はピルシカイニド塩酸塩水和物の 1/8 であった[12]。

7. 排　泄

(1)排泄部位及び経路

主として腎臓

(2)排泄率

健康成人男性にピルシカイニド塩酸塩水和物 0.125、0.25、0.50 及び 0.75mg/kg を単回静脈内投与した場合に、いずれの投与量においても 24 時間以内に 90%以上が未変化体として尿中に排泄された[2)]。

注）本剤の承認用量は 1 回 0.75mg/kg 又は 1.0mg/kg である。

8. トランスポーターに関する情報

トランスポーターを発現させた細胞を用いた *in vitro* 試験において、P-gp（P-glycoprotein）及び OCT2（organic cation transporter 2）を阻害したことが報告されている[36)]（「**Ⅷ.7.(2)併用注意とその理由**」参照）。

9. 透析等による除去率

血液透析

＜参考：ピルシカイニド塩酸塩水和物経口剤での成績＞

経口剤での除去率は 4 時間後で 25%との報告がある[37)]。

10.特定の背景を有する患者

＜参考：ピルシカイニド塩酸塩水和物経口剤の腎障害患者での体内動態＞

本剤は腎排泄型の薬剤であり、経口剤においては腎機能障害患者、腎機能が低下している高齢者では内因性クレアチニンクリアランス（CLcr）の低下に伴い半減期が延長することが報告されている[38)]。

ピルシカイニド塩酸塩水和物 50mg 単回経口投与時における腎機能障害患者での薬物動態パラメータ

腎機能 CLcr (mL/min)	例数	Tmax (hr)	Cmax (μg/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	Vd (L/kg)	CLtot (mL/min)
CLcr≧80	6	3.1±0.6	0.41±0.08	3.4±0.2	1.48±0.19	280.0±37.5
80＞CLcr≧50	10	2.7±0.8	0.46±0.03	5.7±0.3	1.46±0.11	182.8±11.8
50＞CLcr≧20	8	3.1±0.8	0.51±0.05	9.3±1.1	1.70±0.15	123.4±19.3
20＞CLcr	8	3.8±0.7	0.63±0.05	23.7±2.0	1.46±0.11	38.8±4.6

（平均±SE）

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）

2.1 うっ血性心不全のある患者［不整脈（心室頻拍、心室細動等）の誘発又は増悪、陰性変力作用による心不全の悪化を来すおそれが高い。］

2.2 高度の房室ブロック、高度の洞房ブロックのある患者［刺激伝導抑制作用により、これらの障害を更に悪化させるおそれがある。］［9.1.3 参照］

解説：

2.1 本剤の経口剤及び他の抗不整脈剤に共通する注意事項である。
うっ血性心不全の患者は一般的に重篤な基礎心疾患を有していることが多く、本剤の心室内伝導抑制作用が強く発現し、リエントリー性等の不整脈（心室頻拍、心室細動等）の誘発又は増悪を来すおそれがある。また、一般に抗不整脈薬の陰性変力作用により、心不全の悪化を来すおそれがあるので本剤の投与を避けること。

2.2 本剤の経口剤及び他の抗不整脈薬に共通する注意事項である。
本剤の刺激伝導抑制作用により高度の房室ブロック、高度の洞房ブロックの悪化を来すおそれがあるので本剤の投与を避けること。

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

「Ⅴ.4.用法及び用量に関連する注意」参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 本剤の投与に際しては、必ず心電図、脈拍、血圧等の連続監視を行うこと。PQ の延長、QRS 幅の増大、QT の延長、徐脈、血圧低下等の異常所見が認められた場合には、直ちに投与を中止すること。

8.2 発作性頻拍では投与中に不整脈が消失した場合は、患者の状態を観察しながら投与を終了すること。

8.3 本剤が有効であり、かつ経口投与が可能となった後は速やかに経口投与に切り替えること。

8.4 本剤の効果の発現が認められない場合は、他の治療方法に切り替えること。

8.5 本剤投与後に他の抗不整脈薬の追加投与が必要な場合には、作用が増強する可能性があるので十分注意して投与すること。本剤投与後、心電図に変化が認められる間は特に注意して投与すること。［10.2 参照］

8.6 本剤で Brugada 症候群に特徴的な心電図変化（右脚ブロック及び右側胸部誘導（V_1～V_3）の ST 上昇）の顕在化、又はそれに伴う心室細動、心室頻拍、心室性期外収縮を発現させたとの報告があるので注意すること。

解説：

8.1 本剤の経口剤及び他の抗不整脈薬に共通する注意事項である。
本剤は用量依存的に PQ の延長、QRS 幅の増大が認められるので、心電図の連続監視を行い異常所見が認められた場合には、直ちに投与を中止すること。

8.2 発作性頻拍の消失後も継続して投与すると副作用が発現する可能性が高くなるので、心電図等で消失が確認された場合には、速やかに投与を終了すること。

8.3 本剤は緊急治療を要する場合にのみ使用することとし、不整脈症状回復後は経口投与に切り替えること。注射剤から本剤の経口剤への変更については、両剤の血中濃度の推移から以下のシミュレーション結果が得られている。
本剤静注後、本剤の経口剤の通常量（50mg）を投与する場合、経口剤単回投与による最高血中濃度は投与約 1 時間後に 0.36μg/mL（空腹投与時）であるため、静注 1 回の最大用量の血中濃度 1.74μg/mL（1.0mg/kg、10 分間投与時）以上に上昇しないと考えられる。従って、本剤が有効でありかつ必要があると判断された場合には、可能な限り早期に本剤の経口剤による治療に切り替えること。
なお、期外収縮の治療においては有効血中濃度の維持が必要であり、本剤の期外収縮抑制作用の最小有効血中濃度は約 0.2μg/mL との報告がある。シミュレーションの結果、本剤の 0.75mg/kg 投与終了 4 時間後までに経口剤の通常量（50mg）を投与することで、約 0.2μg/mL 以上の血中濃度が維持され、期外収縮抑制を持続させることができると考えられる。

8.5 本剤は、その電気生理学的特徴から心電図において PQ の延長作用などが認められる。
本剤が無効な症例に他の抗不整脈薬の追加投与を行う場合、作用の増強の可能性があることから注意して投与する必要がある。特に本剤投与後心電図に変化が認められる間は十分注意すること。
なお、臨床成績から、期外収縮では約 1 時間（0.75mg/kg、10 分間投与）まで、頻拍では約 2 時間（1.0mg/kg、10 分間投与）まで心電図上の作用の持続が推測されている。

8.6 Brugada 症候群は現時点では広義の特発性心室細動に含まれる症候群と考えられ、その特徴は、特異的な心電図所見「（右脚ブロック）＋右側胸部誘導（V1～V3）における ST 上昇」を認めるサブグループに位置付けされる。
注）特発性心室細動：
心室細動を来す患者の多くは心筋梗塞、心筋症等の重篤な基礎心疾患を有することが明らかとなっているが、近年、特発性心室細動という理学的所見・臨床検査所見上明らかな異常を認めない群で心室細動を生じる患者群が報告されている。

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

9.1.1 基礎心疾患（心筋梗塞、弁膜症、心筋症等）のある患者

心不全を来すおそれのある患者では、心室頻拍、心室細動等が発現するおそれが高い。

9.1.2 心不全の既往のある患者

心不全を来すおそれがある。

9.1.3 刺激伝導障害（房室ブロック、洞房ブロック、脚ブロック等）のある患者（高度の房室ブロック、高度の洞房ブロックのある患者を除く）

刺激伝導抑制作用により、これらの障害を更に悪化させるおそれがある。［2.2 参照］

9.1.4 著明な洞性徐脈のある患者

高度の徐脈、洞停止を来すおそれがある。

9.1.5 血清カリウム低下のある患者

催不整脈作用が発現するおそれがある。

9.1.6 遺伝性果糖不耐症の患者

本剤の添加剤 D-ソルビトールが体内で代謝されて生成した果糖が正常に代謝されず、低血糖、肝不全、腎不全等が誘発されるおそれがある。

9.1.7 他の抗不整脈薬を併用している患者

慎重に観察しながら投与すること。［10.2 参照］

9.1.8 恒久的ペースメーカー使用中あるいは一時的ペーシング中の患者

異常が認められた場合には直ちに投与を中止すること。本剤は心臓ペーシング閾値を上昇させる可能性がある。

解説：

9.1.1～9.1.4

本剤の経口剤及び他の抗不整脈薬に共通する注意事項である。

これらの患者では新たな不整脈の誘発あるいは病態を悪化させる可能性がある。従って、このような患者に投与を開始した場合は、頻回に患者の状態を観察し、必ず心電図、脈拍、血圧等の連続監視を行い、PQ の延長、QRS 幅の増大、QT の延長、徐脈、血圧低下等の異常所見が認められた場合には、直ちに投与を中止すること。

9.1.5 本剤の経口剤及び他の抗不整脈薬に共通する注意事項である。

一般に、血清カリウム値が低下している状態では、心電図上 QT の延長等がみられ、重篤な不整脈に発展するおそれがある。

特に、サイアザイド系利尿薬やフロセミドを投与されている患者においては、これら利尿薬の投与を中止し、低下していた血清カリウム値が正常値に回復してから、本剤の投与を開始するなど慎重に投与すること。

9.1.6 2017 年 10 月に欧州において「医薬品添加剤の表示及び Package leaflet（PL）に関するガイドライン」が改訂されたことを受け、ソルビトール又は果糖を有効成分として含有する静注製剤では、遺伝性果糖不耐症患者を禁忌にしているが、添加剤として含有する静注製剤についても遺伝性果糖不耐症患者に関する注意喚起が必要であるため設定した。

9.1.7 「Ⅷ.7.(2)併用注意とその理由」参照

9.1.8 本剤の経口剤に共通する注意事項である。本剤を含む各種抗不整脈薬が心臓ペーシング閾値を上昇させたとの報告があったことから設定している。

(2)腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者 本剤は腎臓からの排泄により体内から消失する薬剤であり、血中濃度が高くなりやすく、また高い血中濃度が持続するおそれがある。［16.6.1 参照］

解説：

本剤は腎臓からの排泄により体内から消失する薬剤であり、腎機能障害のある患者では血中濃度が高くなりやすく、また、高い血中濃度が持続するおそれがある。腎機能障害患者に投与する場合は慎重に投与し、投与を開始した場合は、頻回に患者の状態を観察し、必ず心電図、脈拍、血圧等の連続監視を行い、PQ の延長、QRS 幅の増大、QT の延長、徐脈、血圧低下等の異常所見が認められた場合には、直ちに投与を中止すること。

なお、本剤の経口剤における臨床成績より、腎機能障害患者や高齢者などの腎機能低下症例で、血中濃度半減期（$t_{1/2}$）が腎機能の正常な患者の 4～5 倍以上に延長することが認められている。

（「**Ⅶ.10.特定の背景を有する患者**」参照）

(3)肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者 9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者 AST、ALT、LDH 等の上昇が報告されている。

解説：

一般的に薬剤に共通する注意事項である。

承認前の主な肝機能検査値の異常変動として、AST（GOT）上昇 0.7%（3 例）、ALT（GPT）上昇 1.3%（6 例）、及び LDH 上昇 0.9%（4 例）が報告されている。

なお、ヒトにおいて本剤は肝臓での代謝をほとんど受けないものと考えられている。

(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。動物実験（ラット）で胎児に移行することが報告されている。

解説：

妊婦等を対象とした臨床的検討は行われておらず、安全性は確立されていないので、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、慎重に投与すること。

また、動物実験において、催奇形性等は認められていないが、^{14}C 標識ピルシカイニド塩酸塩水和物によるラットでの実験で、胎児（経口投与及び静脈内投与における実験）及び母乳中（静脈内投与における実験）への放射能の移行が認められている（「**Ⅶ.5.(5)その他の組織への移行性**」参照）。

(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。動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている。

解説：

「Ⅷ.6.(5)妊婦」参照

(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。

解説：

本剤は小児を対象とした臨床試験は実施していない。

注射剤の承認迄の調査で、1 例において副作用が発現している。下記に概要を示す。

＜症 例 報 告＞ 10 歳代　女性
＜体　　重＞ 53kg
＜対 象 疾 患＞ 発作性上室性頻拍
＜本剤投与量＞ 0.5mg/kg
＜副　作　用＞ 心拍数上昇に伴う胸痛
＜経　　過＞ 本剤静注初期、心拍数が 191/分から 174/分まで次第に低下してきたが、投与中 7～8 分時より次第に心拍数増加傾向を示し、212/分まで上昇。徐々に胸痛出現。本剤終了後も軽快せず、ペーシングにより頻拍の停止とともに胸痛は消失。

(8)高齢者

9.8 高齢者 肝・腎機能が低下していることが多く、また体重が少ない傾向があるなど副作用が発現しやすい。

解説：

一般に、高齢者では腎機能等の生理機能が低下していることが多いとされている。「Ⅷ.6.(2)腎機能障害患者」参照

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
リファンピシン	本剤の作用を減弱させることがある。	リファンピシンによりチトクローム P450 の産生が誘導され、本剤の代謝速度が促進し、血中濃度が低下する可能性が考えられている。
カルシウム拮抗薬 ベラパミル β-受容体遮断薬 プロプラノロール ジギタリス製剤 ジゴキシン 硝酸･亜硝酸エステル系薬剤 ニトログリセリン ［8.5、9.1.7 参照］	動物実験（イヌ）において、本剤の作用が増強される可能性が報告されている。	機序は明らかではないが、作用増強の可能性が考えられている。
セチリジン	両剤の血中濃度が上昇し、本剤の副作用が発現するおそれがある。	腎でのトランスポーターを介した排泄が競合するためと考えられている。

解説：

リファンピシン

当該相互作用は、以下の症例報告をもとに注意喚起することになったものである。本剤は 90%以上が未変化体で排泄されることが確認されている[2)]。また、ヒト肝チトクローム P450 分子種の研究によると、CYP2D6 が代謝に関与していたが、代謝物は僅かであった。

一方、リファンピシンは、CYP2C9、CYP2C19、CYP3A4 を誘導することが一般的に知られている。

従って、チトクローム P450 分子種による直接的な接点はないと考えられる。しかしながら、以下のような臨床症例が報告されており関連性を否定できないため、注意を喚起している。

＜症例報告＞

56 歳、男性。結核性胸膜炎にてリファンピシン 450mg/日、エタンブトール 1.0g/日、イソニアジド 0.4g/日の併用療法中、慢性心房細動に対し直流除細動を施行し、洞調律後にピルシカイニド塩酸塩水和物 150mg/日を投与したが慢性心房細動再発。

14 日後の本剤の血中濃度（投与 90 分後）は 0.05μg/mL 以下（治療域 0.2～0.9μg/mL）となっていたため、本剤の投与を中止した。

その後､胸膜炎は著明に改善し､リファンピシンの投与を終了した｡ワーファリン投与下に直流除細動を施行し、洞調律後に本剤を再開した。

以後 6 ヵ月間以上洞調律は維持され、血中濃度は 0.33～0.54μg/mL と治療域に入り、コントロール不良であったトロンボテストも改善した[39)]。

	併用時	単独時
ピルシカイニド塩酸塩水和物血中濃度（μg/mL）	0.05 以下	0.33～0.54
血中濃度減少率（%）	84.8～90.7%	－

カルシウム拮抗薬、β-受容体遮断薬、ジギタリス製剤、硝酸・亜硝酸エステル系薬剤

臨床的な機序は明らかにされていないが、動物実験で、他剤（ベラパミル、プロプラノロール、ジゴキシン、ニトログリセリン）と併用した場合、本剤の作用（刺激伝導抑制、心機能抑制）を増強する可能性が報告されている。単独投与ではベラパミル、プロプラノロールは心機能に対し抑制的に働き、ジゴキシンは心筋収縮力を増強すること、また、本剤は心機能に対して抑制的に作用することが知られている。また、麻酔開胸イヌにおいて、本剤を静脈内投与すると、プロプラノロール、ベラパミル、又はジゴキシンと併用した場合、心電図上で QRS 幅の増大を増強することが報告されている。ニトログリセリンと併用した場合、PQ 間隔の延長をおこすことが報告されている。

セチリジン

本剤とセチリジン塩酸塩との併用にて、両剤の血中濃度が上昇し、本剤の副作用が発現したとの文献報告があることから記載した[36)]。

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 **心室細動**（頻度不明）、**心室頻拍**（Torsades de pointes を含む）（頻度不明）、**洞停止**（頻度不明）、**完全房室ブロック**（頻度不明）、**失神**（頻度不明）、**心不全**（頻度不明）

ショック、心停止に至る場合もあるので、心電図の連続監視等を行うこと。

11.1.2 **急性腎障害**（頻度不明）

ショック等による急性腎障害があらわれることがある。

解説：

カプセル剤において収集された副作用の検討結果を踏まえ、注射剤の「重大な副作用」にも同様に記載した。

(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
循環器	QRS 幅の増大、徐脈、心室性期外収縮、胸部不快感、胸痛、血圧低下	上室性期外収縮、QT 延長、上室性頻拍、房室ブロック、心房粗動
消化器	口渇、悪心	嘔吐
精神神経系	ふわふわ感	
血液	白血球数減少、白血球数増加、好酸球増加、リンパ球減少、リンパ球増加	
肝臓	AST 上昇、ALT 上昇、LDH 上昇	
過敏症	発疹	
腎臓	BUN 上昇、尿蛋白陽性	クレアチニン上昇
その他	全身倦怠感、CK 上昇	

項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

時　　期	承認時迄の状況	使用成績調査の累計	合　計
調査施設数	96	141	221
調査症例数	550	1359	1909
副作用等の発現症例数	16	73	89
副作用等の発現件数	21	92	113
副作用等の発現症例率	2.91	5.37	4.66
副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例（件数）率　（％）		
神経系障害	0　(0.00)	2　(0.15)	2　(0.10)
味覚減退	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
失神	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
心臓障害	3　(0.55)	48　(3.53)	51　(2.67)
心房粗動	0　(0.00)	9　(0.66)	9　(0.47)
房室ブロック	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
第一度房室ブロック	0　(0.00)	3　(0.22)	3　(0.16)
徐脈	2　(0.36)	3　(0.22)	5　(0.26)
脚ブロック	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
右脚ブロック	0　(0.00)	6　(0.44)	6　(0.31)
洞停止	0　(0.00)	12　(0.88)	12　(0.63)
洞性徐脈	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
上室性期外収縮	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
上室性頻脈	0　(0.00)	2　(0.15)	2　(0.10)
心室性不整脈	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
心室性期外収縮	0　(0.00)	3　(0.22)	3　(0.16)
心室細動	0　(0.00)	5　(0.37)	5　(0.26)
心室性頻脈	0　(0.00)	6　(0.44)	6　(0.31)
血管障害	1　(0.18)	2　(0.15)	3　(0.16)
低血圧	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
ショック	0　(0.00)	2　(0.15)	2　(0.10)
胃腸障害	1　(0.18)	2　(0.15)	3　(0.16)
悪心	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
嘔吐	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
口の感覚鈍麻	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
皮膚及び皮下組織障害	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
発疹	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
腎及び尿路障害	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
腎機能障害	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)

（前表に続く）

時　　期	承認時迄の状況	使用成績調査の累計	合　計
副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例（件数）率　（ % ）		
全身障害及び投与局所様態	7　(1.27)	0　(0.00)	7　(0.37)
胸部不快感	2　(0.36)	0　(0.00)	2　(0.10)
胸痛	2　(0.36)	0　(0.00)	2　(0.10)
異常感	2　(0.36)	0　(0.00)	2　(0.10)
倦怠感	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
口渇	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
臨床検査	6　(1.09)	27　(1.99)	33　(1.73)
アラニン・アミノトランスフェラーゼ増加	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
血中クレアチニン増加	0　(0.00)	2　(0.15)	2　(0.10)
血圧低下	0　(0.00)	6　(0.44)	6　(0.31)
血中尿素増加	0　(0.00)	3　(0.22)	3　(0.16)
心拍出量低下	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
心電図 QRS 延長	5　(0.91)	10　(0.74)	15　(0.79)
心電図 QT 延長	0　(0.00)	3　(0.22)	3　(0.16)
心電図 ST 部分上昇	0　(0.00)	3　(0.22)	3　(0.16)
心拍数減少	0　(0.00)	1　(0.07)	1　(0.05)
白血球数減少	1　(0.18)	0　(0.00)	1　(0.05)
QRS 軸異常	1　(0.18)	1　(0.07)	2　(0.10)

臨床検査値異常（承認時までの臨床試験）

臨床検査値異常	
臨床検査実施症例数	479 例
臨床検査値異常発現例数	22 例
臨床検査値異常発現件数	34 件
臨床検査値異常発現症例率	4.59%

検査項目			件数/検査実施例数(%)
血液学的検査	赤血球数		0/472（0.00）
	ヘモグロビン		0/472（0.00）
	ヘマトクリット		0/472（0.00）
	白血球数増加		2/473（0.42）
	白血球数減少		1/473（0.21）
	白血球分画	好中球	0/414（0.00）
		桿状核球	0/219（0.00）
		分節核球減少	1/228（0.44）
		好塩基球	0/407（0.00）
		好酸球増加	3/412（0.73）
		リンパ球増加	1/429（0.23）
		リンパ球減少	1/429（0.23）
		単球増加	1/429（0.23）
	血小板数		0/455（0.00）
血液生化学的検査	AST（GOT）上昇		3/465（0.65）
	ALT（GPT）上昇		6/467（1.28）
	γ-GTP 上昇		1/438（0.23）
	A/-P		0/439（0.00）
	LDH 上昇		4/452（0.88）
	総ビリルビン		0/452（0.00）
	総蛋白減少		1/458（0.22）
	アルブミン		0/433（0.00）
	総コレステロール		0/424（0.00）
	BUN 上昇		2/467（0.43）
	クレアチニン		0/464（0.00）
	CK（CPK）上昇		3/412（0.73）
	Na		0/461（0.00）
	K		0/460（0.00）
	Cl		0/458（0.00）
尿検査	蛋白陽性		3/338（0.89）
	糖陽性		1/338（0.30）
	ウロビリノーゲン		0/336（0.00）

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

（承認時までの臨床試験）

背景因子		安全性評価例数	副作用発現 例数	副作用発現 (%)
性別	男	334	9	2.7
	女	216	7	3.2
年齢（歳）	19 以下	18	2	11.1
	20～29	43	2	4.7
	30～39	35	0	0
	40～49	91	3	3.3
	50～59	128	4	3.1
	60～69	135	1	0.7
	70～79	88	3	3.4
	80 以上	12	1	8.3
	65 未満	378	11	2.9
	65 以上	172	5	2.9
体重	40kg 未満	9	1	11.1
	40～50kg 未満	94	4	4.3
	50～60kg 未満	184	6	3.3
	60～70kg 未満	167	3	1.8
	70～80kg 未満	74	2	2.7
	80kg 以上	22	0	0
外来・入院	外来	160	3	1.9
	入院	390	13	3.3
NYHA 機能分類*	Ⅰ	466	15	3.2
	Ⅱ	59	1	1.7
	Ⅲ	9	0	0
	Ⅳ	2	0	0

背景因子			安全性評価例数	副作用発現 例数	副作用発現 (%)
合併症	他の不整脈	なし	419	9	2.1
		あり	131	7	5.3
	心血管系（重複集計）	なし	329	7	2.1
		心筋梗塞	23	3	13.0
		狭心症	30	2	6.7
		心筋症	24	3	12.5
		先天性心疾患	5	0	0
		高血圧症	123	2	1.6
		その他	73	2	2.7
	非心血管系（重複集計）	なし	384	11	2.9
		糖尿病	37	2	5.4
		肝疾患	39	0	0
		腎疾患	10	0	0
		甲状腺機能亢進	6	0	0
		その他	99	3	3.0
既往歴		なし	383	10	2.6
		あり	167	6	3.6
前治療薬		なし	333	8	2.4
		あり	217	8	3.7
併用薬	心血管系	なし	405	10	2.5
		あり	145	6	4.1
	非心血管系	なし	443	11	2.5
		あり	107	5	4.7

＊New York Heart Association の旧心機能分類

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 [40,41]

13. 過量投与

13.1 症状

過量投与又は高度の腎機能障害により、本剤の血中濃度が上昇した場合、刺激伝導障害（著明な QRS 幅の増大等）、心停止、心不全、心室細動、心室頻拍（Torsades de pointes を含む）、洞停止、徐脈、ショック、失神、血圧低下等の循環器障害、構語障害等の精神・神経障害を引き起こすことがある。

13.2 処置

直ちに本剤の投与を中止し、体外ペーシングや直流除細動を考慮する等適切な対症療法を行うこと。なお、本剤の血液透析による除去率は最大約 30%と報告されている。

解説：

「Ⅴ.4.用法及び用量に関連する注意」参照

国内において報告された本剤との関連性が否定できない心停止、心不全、ショックのうち、ピルジカイニドの血中濃度が上昇した結果発現したことが疑われる報告が集積されている。

投与に際しては、心電図、脈拍、血圧等を観察し、異常が認められた場合には直ちに投与を中止する。また、必要に応じ、体外ペーシングや直流除細動等の対症療法を検討する。

11.適用上の注意

設定されていない

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」参照

(2)安全性薬理試験 [42～45]

分　類	動物種	投与量（mg/kg）	経路	実験結果（作用・症状等）
中枢神経系 [42]	イヌ	50～100（高用量）以上	経口	自発運動抑制
	ラット		経口	自発運動抑制
	マウス		経口	自発運動抑制痙攣作用
循環器系 [43]	イヌ（麻酔）	0.3～1.0	静注	ほとんど影響なし
		3～6（高用量）	静注	用量依存的な血圧低下、心拍数の減少
呼吸器系 [43]	イヌ（麻酔）	3～6（高用量）	静注	血圧低下に伴い呼吸数増加
運動機能系 [44]	マウス	29～42（高用量）	経口	筋弛緩作用
		42～72（高用量）	経口	協調運動障害
自律神経系 [44,45]	イヌ	0.1	静注	アドレナリン受容体遮断作用なし
	マウス	50、100（高用量）	経口	弱い抗コリン作用 （摘出回腸及び摘出膀胱で実験）
	モルモット	50、100（高用量）	経口	弱い抗コリン作用 （摘出回腸及び摘出膀胱で実験） 弱い抗ヒスタミン作用 （摘出回腸及び摘出気管で実験）
消化器系 [44,45]	ラット	100（高用量）	経口	胃排泄能、胃運動、胃液分泌抑制 （腸管輸送能には影響なし）
	マウス		経口	腸管輸送能には影響なし

(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 [46,47]

動物種	投与量 (mg/kg)	投与経路	性	例数	LD_{50} (mg/kg)	所見（症状等）
ラット [46]	15.0～22.0	静脈内	雄	6	18	投与直後より自発運動の低下、伏臥、呼吸数の低下、間代性痙攣、正向反射の消失 生存例：30 分以内に症状が回復 死亡例：投与後 10 分以内に死亡 （15.0mg/kg 以上より認められた）
			雌	6	20	
イヌ [47]	6.0～30.0	静脈内	雄	12	18	嘔吐様動作、嘔吐、自発運動低下、四肢筋緊張度低下、振戦等 死亡例のみ呼吸数の低下、正向反射の消失も認められた 心電図：P 波消失、S 波下降、心室頻拍、心室細動、心室粗動 生存例：4 時間以内に症状が回復 心電図は投与後 2 時間以内に回復 死亡例：投与後 10 分以内に死亡 （9.0mg/kg 以上より認められ、死因は急性の循環障害によるものと考えられた）
			雌	11	18	

(2)反復投与毒性試験 [48,49]

動物種	投与量 (mg/kg)	投与経路	性	例数	死亡 (例)	所見（症状等）	無毒性量 (mg/kg)
ラット [48]	1	静脈内 （1 日 1 回）	雄	15	0	異常なし	1
			雌	15	0	異常なし	
	3		雄	23	0	異常なし	
			雌	23	1	25 日目投与直後、死亡	
	9		雄	23	2	呼吸数の増加、自発運動の低下 （投与第 4 週以降は症状の程度減弱） 死亡例：6、8 日目投与直後、死亡 （死因は急性の循環障害によるものと考えられた）	
			雌	23	1	呼吸数の増加、自発運動の低下 （投与第 4 週以降は症状の程度減弱） 死亡例：25 日目投与直後、死亡 （死因は急性の循環障害によるものと考えられた）	
イヌ [49]	1.5	静脈内 （1 日 1 回）	雄	3	0	異常なし	3
			雌	3	0	異常なし	
	3		雄	5	0	異常なし	
			雌	5	0	異常なし	
	6		雄	5	1	15 日目投与直後、横臥、痙攣の後死亡 （死因は急性の循環障害によるものと考えられた）	
			雌	5	0	異常なし	

(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

1) 妊娠前及び妊娠初期投与試験 [50]

動物種	投与量 (mg/kg)	投与経路	所見（症状等）	無毒性量 (mg/kg)
ラット [50]	1、2、4	静脈内 （1 日 1 回）	・雄の 4mg/kg で投与直後に呼吸数の増加及び自発運動の低下（その他の影響なし） ・参考）4mg/kg で胎児の骨化遅延の発現率の上昇が認められた	2（親動物） 2（胎児）

参考）安田峯生：毒性試験講座 11 発生毒性（谷村　孝編集、地人書館）、p62-72(1992)

2) 器官形成期投与試験 [50,51]

動物種	投与量 (mg/kg)	投与経路	所見（症状等）	無毒性量 (mg/kg)
ラット [50]	2、4、8	静脈内 （1 日 1 回）	・母動物の 8mg/kg で投与直後に呼吸数の増加 （その他の影響なし）	4（母動物） 8（胎児） 8（出生児）
ウサギ [51]	1、2、4		・母動物の 4mg/kg で投与直後に不規則性呼吸及び自発運動の低下 （その他の影響なし） ・母動物の 4mg/kg で 1 例が投与 6 日目の投与直後に痙攣を起こして死亡	2（母動物） 4（胎児）

3) 周産期及び授乳期投与試験 [50]

動物種	投与量 (mg/kg)	投与経路	所見（症状等）	無毒性量 (mg/kg)
ラット [50]	1、2、4	静脈内 （1 日 1 回）	・いずれの投与量でも影響なし	4（母動物） 4（出生児）

(6)局所刺激性試験 [52]

動物種	濃　度 (mg/mL)	投与経路	所見（症状等）	無毒性濃度 (mg/mL)
ウサギ [52]	3、6、12	血管内	・血管に対する刺激性なし	12
		筋　肉	・筋肉に対し、12mg/mL の濃度で軽度の筋線維の変性、壊死	6

(7)その他の特殊毒性

抗原性試験

抗原性は認められなかった。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製　　剤：劇薬、処方箋医薬品：注意―医師等の処方箋により使用すること

有効成分：劇薬

2. 有効期間

3 年（安定性試験結果に基づく）

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：無し　　くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品、一物二名称の製品はない。

7. 国際誕生年月日

1991 年 3 月 29 日（日本）

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

製造販売承認年月日：2000 年 1 月 18 日

承認番号：21200AMZ00021

薬価基準収載年月日：2000 年 4 月 14 日

販 売 開 始 年 月 日：2000 年 4 月 17 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

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

再審査結果公表年月日：2010 年 3 月 24 日

内容：薬事法第 14 条第 2 項第 3 号のイからハまでのいずれにも該当しない

11.再審査期間

6 年（2000 年 1 月 18 日～2006 年 1 月 17 日：終了）

12.投薬期間制限に関する情報

該当しない

13.各種コード

販売名	HOT（13 桁）番号	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）	レセプト電算処理システム用コード
サンリズム注射液 50	1124019020101	2129408A1020	2129408A1020	640443003

14.保険給付上の注意

該当しない

XI. 文　　献

1. 引用文献

1) 小川　聡ほか：心電図 1997;17(2):191-197
2) 中島光好、金丸光隆：臨床医薬 1998;14(1):47-61
3) 飯沼宏之ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):621-638
4) 飯沼宏之ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):639-659
5) 井上　博ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):661-678
6) 新　博次ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):679-698
7) 新　博次ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):699-718
8) 加藤和三ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):719-745
9) 加藤和三ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):747-768
10) 加藤和三ほか：臨床医薬（1999 年改訂）1998;14(4):769-790
11) 光野正孝ほか：臨床医薬 1998;14(3):517-532
12) 日高寿範ほか：応用薬理 1989;37(4):359-372
13) Aisaka K, et al.：Arzneimittelforschung 1985;35(8):1239-1245（PMID：4074441）
14) 日高寿範ほか：日本薬理学雑誌 2000;115(5):295-308
15) 日高寿範ほか：基礎と臨床 1992;26(13):4927-4931
16) Hidaka T and Ishihara T：応用薬理 1988;36(6):439-447
17) Hayashi H, et al.：J Cardiovasc Pharmacol 1998;31(1):101-107（PMID：9456284）
18) 神吉秀明ほか：心電図 1998;18(3):315-323
19) Iwasa A, et al.：Eur J Pharmacol 1998;356(1):31-40（PMID：9761421）
20) Hattori Y, et al.：J Cardiovasc Pharmacol 1986;8(5):998-1002（PMID：2429102）
21) Inomata N and Ishihara T：Eur J Pharmacol 1988;145(3):313-322（PMID：2450764）
22) Yamashita T, et al.：Jpn Heart J 1998;39(3):389-397（PMID：9711190）
23) Wu B, et al.：Cardiovasc Res 1992;26(11):1095-1101（PMID：1291087）
24) Inomata N, et al.：Br J Pharmacol. 1991;104(4):1007-1011（PMID：1810589）
25) 新　博次ほか：臨床医薬 1998;14(1):63-74
26) 庄田守男ほか：臨床医薬 1998;14(1):75-88
27) 諸江一男ほか：臨床医薬 1998;14(5):841-852
28) 小西與承ほか：臨床医薬 1998;14(1):107-121
29) 横田充弘ほか：Ther Res 1989;10(5):2135-2147
30) 林　敏郎ほか：基礎と臨床 1989;23(6):2197-2229
31) 小森谷和美ほか：応用薬理 2003;65(5/6):89-95
32) 金井　靖ほか：基礎と臨床 1989;23(6):2231-2238
33) 社内資料：ヒト血漿蛋白結合率（2000 年 1 月 18 日承認、申請資料概要へ.2.3.3）
34) Shiga T, et al.：Clin Pharmacol Ther 2000;67(3):222-228（PMID：10741624）
35) 藤谷朝通ほか：薬物動態 1997;12(Suppl.):255
36) Tsuruoka S, et al.：Clin Pharmacol Ther 2006;79(4):389-396（PMID：16580907）
37) 箕輪　久ほか：臨床透析 1996;12(9):1341-1344
38) 高畠利一ほか：薬理と治療 1989;17(7):3195-3205

39) 大貫雅弘ほか：呼吸と循環 1996;44(8):865-868
40) 神田東人ほか：呼吸と循環 1997;45(2):197-200
41) 浜田暁子、吉見謙一：日本救急医学会雑誌 1995;6(5):599
42) Hirotsu I, et al.：Arzneimittelforschung 1988;38(10):1398-1409（PMID：3196380）
43) Aisaka K, et al.：Arzneimittelforschung 1988;38(10):1417-1425（PMID：3196382）
44) Hirotsu I, et al.：Arzneimittelforschung 1988;38(10):1410-1417（PMID：3196381）
45) 弘津一郎ほか：応用薬理 1989;37(4):373-394
46) 杉山和志、山森　芬：応用薬理 1991;42(5):457-460
47) 吉岡　修、佐藤文夫：応用薬理 1991;42(5):461-468
48) 藤谷朝通ほか：応用薬理 1997;54(1):1-11
49) 藤谷朝通ほか：応用薬理 1997;54(1):13-20
50) 藤谷朝通ほか：応用薬理 1997;54(1):21-34
51) 中本　真ほか：応用薬理 1997;54(1):35-39
52) 藤谷朝通ほか：応用薬理 1997;54(1):41-44

2. その他の参考文献

第十八改正日本薬局方解説書 2021, 廣川書店
日本病院薬剤師会編：重大な副作用回避のための服薬指導情報集 1（薬業時報社　H9.7.20）

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

外国では発売していない

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報

該当しない

小児等に関する記載

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)粉砕

該当しない

(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

サンリズム注射液 50 配合変化表

本品と下記の市販注射液又は輸液を配合した結果、セルシン注との配合において配合直後から配合液が白濁し、その後も外観変化が認められたが、24 時間まで pH、ピルシカイニド塩酸塩水和物含量に変化は認められなかった。白濁は、本品との混合によりセルシン注に添加されている溶解補助剤（プロピレングリコール、無水エタノール）が希釈され、水に難溶である主薬成分（ジアゼパム）が析出したものと推定され、配合不可と判断された。

（実験方法）

配合薬剤の剤形に合わせ、本品との配合方法は以下のように設定し、室温保存において pH 及び外観変化（肉眼的）は配合直後、1、3、6、24 時間後に観察した。また、含量（残存率）は配合直後、6、24 時間後に測定した。

ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤の配合変化試験成績〈注射剤〉

（実験実施期間：1996.6～1997.5、1984.10～1997.2：配合薬剤の名称等は試験実施当時の名称）

品　名	配合量	品名／時間／項目	ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤（50mg/5mL/1 ｱﾝﾌﾟﾙ）保存条件：室温				
（メーカー名）			配合直後	1 時間	3 時間	6 時間	24 時間
ヘパリンナトリウム注	1 万 U/10mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	6.31	6.30	6.26	6.28	6.25
（三菱ウェルファーマ）		残存率(%)	100	＼	＼	100.1	101.4
ジゴシン注	0.25mg/1mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.47	5.50	5.45	5.46	5.40
（中外製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	99.8	100.7
ネオフィリン注	250mg/10mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	8.99	9.02	9.02	8.99	9.02
（エーザイ）		残存率(%)	100	＼	＼	100.3	99.0
ｳﾛｷﾅｰｾﾞ 6 万-ﾐﾄﾞﾘ	6 万 U[1)]	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	7.05	7.06	7.05	7.05	7.07
（三菱ウェルファーマ）		残存率(%)	100	＼	＼	100.8	99.9
プロタノール-L 注	1mg/5mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	3.92	3.95	3.94	3.95	3.90
（日研化学）		残存率(%)	100	＼	＼	99.3	100.5
イノバン注	100mg/5mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.27	4.24	4.12	4.06	3.62
（協和醗酵工業）		残存率(%)	100	＼	＼	98.6	98.4
ドブトレックス注射液	100mg/5mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	3.11	3.14	3.16	3.13	3.07
（塩野義製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	102.1	99.7
ノルアドリナリン	1mg/1mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	3.14	3.16	3.17	3.18	3.13
（三共）		残存率(%)	100	＼	＼	98.8	99.2

＼：測定せず　　－：変化なし

品　名	配合量	品名／時間／項目	ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤（50mg/5mL/1ｱﾝﾌﾟﾙ）保存条件：室温				
（メーカー名）			配合直後	1 時間	3 時間	6 時間	24 時間
アドナ（AC-17）注射液	25mg/5mL	外観	橙色澄明	—	—	—	—
		pH	5.79	5.79	5.76	5.77	5.77
（田辺製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	101.3	100.3
ラシックス注	20mg/2mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	8.07	8.02	7.94	7.86	7.70
（ｱﾍﾞﾝﾃｨｽﾌｧｰﾏ）		残存率(%)	100	＼	＼	101.5	99.3
ソルダクトン	100mg[2]	外観	ごくうすい茶色澄明	—	—	—	—
		pH	8.68	8.68	8.67	8.67	8.67
（ファルマシア）		残存率(%)	100	＼	＼	100.5	99.5
キシロカイン静注	100mg/5mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	6.17	6.14	6.15	6.17	6.16
（藤沢薬品工業）		残存率(%)	100	＼	＼	99.1	98.8
メキシチール注	125mg/5mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.55	5.55	5.58	5.61	5.61
（日本ﾍﾞｰﾘﾝｶﾞｰｲﾝｹﾞﾙﾊｲﾑ）		残存率(%)	100	＼	＼	101.2	101.5
ニトロール注	5mg/10mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.78	4.76	4.75	4.77	4.77
（エーザイ）		残存率(%)	100	＼	＼	99.6	99.7
ミリスロール注	5mg/10mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.37	5.36	5.39	5.41	5.37
（日本化薬）		残存率(%)	100	＼	＼	101.2	99.5
ロヒプノール注	2mg/1mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.40	4.41	4.43	4.41	4.43
（ロシュ）		残存率(%)	100	＼	＼	100.3	100.1
ドルミカム注	10mg/2mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	3.55	3.42	3.43	3.43	3.44
（山之内製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.6	101.4
セルシン注	10mg/2mL	外観	白濁[3]	ごくうすい黄緑の微濁[3]	沈殿を認めた[4]	沈殿を認めた[4]	沈殿を認めた[4]
		pH	5.64	5.64	5.64	5.64	5.63
（武田薬品工業）		残存率(%)	100	＼	＼	102.1	102.7
ルネトロン注	0.5mg/1mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	6.89	6.88	6.88	6.86	6.87
（三共）		残存率(%)	100	＼	＼	100.5	99.6
セファメジン注	1g[5]	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.12	5.19	5.29	5.37	5.52
（藤沢薬品工業）		残存率(%)	100	＼	＼	96.3	98.0
ペントシリン注射用	1g[6]	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.60	5.57	5.49	5.40	5.10
（三共）※		残存率(%)	100	＼	＼	100.7	101.9

＼：測定せず　－：変化なし

1）生理食塩液 10mL で溶解した。
2）注射用水 10mL で溶解した。
3）明るい黄の油状様物が容器壁に付着した。
4）明るい黄の油状様物が容器壁に付着した。また、容器壁に膜が張ったように黄みの白の付着物が存在し、液は無色澄明であった。
5）生理食塩液 100mL で溶解した。
6）注射用水 4mL で溶解した。

※2003 年 4 月より大正富山医薬品（株）へ移管

ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤の配合変化試験成績〈輸液 1〉

品　名 （メーカー名）	配合量	品名 時間 項目	ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤（50mg/5mL/1ｱﾝﾌﾟﾙ） 保存条件：室温				
			配合直後	1 時間	3 時間	6 時間	24 時間
マンニット T （テルモ）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.79	4.74	4.77	4.75	4.80
		残存率(%)	100	＼	＼	100.0	100.6
マンニット T （テルモ）	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	5.11	＼	＼	5.30	5.34
		残存率(%)	100	＼	＼	99.5	100.4
リンゲル液 （大塚製薬）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	6.24	6.19	6.20	6.18	6.22
		残存率(%)	100	＼	＼	99.3	100.1
リンゲル液 （大塚製薬）	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	5.74	＼	＼	5.81	5.83
		残存率(%)	100	＼	＼	100.1	99.8
ラクテック注 （大塚製薬）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	6.62	6.61	6.60	6.60	6.60
		残存率(%)	100	＼	＼	100.1	100.4
ラクテック注 （大塚製薬）	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	6.21	＼	＼	6.28	6.31
		残存率(%)	100	＼	＼	99.3	99.3
ﾊﾙﾄﾏﾝ液 pH:8-ﾐﾄﾞﾘ （三菱ウェルファーマ）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	7.84	7.84	7.83	7.82	7.81
		残存率(%)	100	＼	＼	99.9	100.7
ﾊﾙﾄﾏﾝ液 pH:8-ﾐﾄﾞﾘ （三菱ウェルファーマ）	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	6.33	＼	＼	6.35	6.37
		残存率(%)	100	＼	＼	100.9	100.3
フィジオゾール 3 号 （三菱ウェルファーマ）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.53	4.54	4.53	4.51	4.53
		残存率(%)	100	＼	＼	99.8	100.5
フィジオゾール 3 号 （三菱ウェルファーマ）	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	4.66	＼	＼	4.66	4.67
		残存率(%)	100	＼	＼	101.2	98.9

＼：測定せず　－：変化なし

品　名 （メーカー名）	配合量	品名 時間 項目	ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤（50mg/5mL/1ｱﾝﾌﾟﾙ） 保存条件：室温				
			配合直後	1 時間	3 時間	6 時間	24 時間
EL3 号	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.48	5.48	5.46	5.46	5.48
（味の素ファルマ）		残存率(%)	100	＼	＼	99.4	100.0
EL3 号	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	5.34	＼	＼	5.38	5.36
（味の素ファルマ）		残存率(%)	100	＼	＼	99.4	98.2
KN 補液 3B	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.34	5.34	5.35	5.33	5.35
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	99.8	100.6
ソリタ T2 号	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.90	4.90	4.91	4.88	4.90
（清水製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.6	100.7
ソリタ T2 号	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	4.80	＼	＼	4.85	4.84
（清水製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	96.6	99.6
生理食塩液	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.52	5.51	5.51	5.52	5.51
（扶桑薬品）		残存率(%)	100	＼	＼	99.7	99.9
生理食塩液	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	5.64	＼	＼	5.67	5.67
（扶桑薬品）		残存率(%)	100	＼	＼	100.5	98.6
大塚糖液 5%	500mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	4.47	＼	＼	4.50	4.54
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	98.3	101.2
大塚糖液 5%	5mL	外観	無色澄明	＼	＼	—	—
		pH	5.40	＼	＼	5.49	5.48
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	103.3	103.2

＼：測定せず　　－：変化なし

ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤の配合変化試験成績〈輸液 2〉

品　名 （メーカー名）	配合量	品名 時間 項目	ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤（50mg/5mL/1ｱﾝﾌﾟﾙ） 保存条件：室温				
			配合直後	1 時間	3 時間	6 時間	24 時間
ﾌﾟﾛﾃｱﾐﾝ 12 注射液	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.93	5.94	5.96	5.98	5.94
（田辺製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.2	99.0
ラクテック D 注	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.88	4.89	4.89	4.87	4.88
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.2	98.3
ポタコール R	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.90	4.89	4.90	4.89	4.89
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.5	98.9
KN 補液 3A 号	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.44	5.43	5.43	5.44	5.43
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.2	99.0
ソリターT1 号	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.14	5.13	5.13	5.13	5.13
（武田薬品工業）		残存率(%)	100	＼	＼	99.8	98.4
ソリターT3 号	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.14	5.14	5.14	5.13	5.14
（武田薬品工業）		残存率(%)	100	＼	＼	100.1	99.5
低分子ﾃﾞｷｽﾄﾗﾝ L 注	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.42	5.42	5.42	5.42	5.43
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.6	99.2
グリセオール注	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	3.97	3.99	3.99	3.99	4.00
（中外製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.3	99.0
トリパレン 1 号	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.65	4.66	4.66	4.66	4.67
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.2	99.2
トリパレン 2 号	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.60	4.61	4.61	4.61	4.60
（大塚製薬）		残存率(%)	100	＼	＼	100.2	99.6

＼：測定せず　　－：変化なし

品　名 （メーカー名）	配合量	品名 時間 項目	ピルシカイニド塩酸塩水和物注射剤（50mg/5mL/1ｱﾝﾌﾟﾙ） 保存条件：室温				
			配合直後	1 時間	3 時間	6 時間	24 時間
モリプロン F （ｱﾍﾞﾝﾃｨｽﾌｧｰﾏ）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	5.91	5.93	5.93	5.92	5.93
		残存率(%)	100	＼	＼	99.6	99.0
ハイカリック液-1 号 （テルモ）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.50	4.50	4.50	4.50	4.50
		残存率(%)	100	＼	＼	100.7	98.9
ハイカリック液-2 号 （テルモ）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	4.45	4.46	4.47	4.46	4.46
		残存率(%)	100	＼	＼	100.3	99.3
ハイカリック液-3 号 （テルモ）	500mL	外観	無色澄明	—	—	—	—
		pH	3.92	3.93	3.94	3.94	3.92
		残存率(%)	100	＼	＼	100.9	100.6

＼：測定せず　－：変化なし

〔文献請求先及び問い合わせ先〕
第一三共株式会社　製品情報センター
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1
TEL:0120-189-132

SRI8IF0116
2023 年 6 月改訂