

# 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

日本薬局方 **ピルシカイニド塩酸塩カプセル**  
**ピルシカイニド塩酸塩カプセル25mg〔CH〕**  
**ピルシカイニド塩酸塩カプセル50mg〔CH〕**  
Pilsicainide Hydrochloride Capsules

劇薬  
処方箋医薬品<sup>注)</sup>

剤形	硬カプセル剤
製剤の規制区分	劇薬 処方箋医薬品 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	カプセル 25mg： 1カプセル中 日局 ピルシカイニド塩酸塩水和物 25mg を含有 カプセル 50mg： 1カプセル中 日局 ピルシカイニド塩酸塩水和物 50mg を含有
一般名	和名：ピルシカイニド塩酸塩水和物 洋名：Pilsicainide Hydrochloride Hydrate
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：2015年1月23日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2015年6月19日（販売名変更による） 販売開始年月日：2005年7月8日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： <a href="https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/">https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/</a>

本 IF は 2024 年 3 月改訂の添付文書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。

(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、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て、「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、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

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	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	7
1. 開発の経緯	1	9. 溶出性	7
2. 製品の治療学的特性	1	10. 容器・包装	12
3. 製品の製剤学的特性	1	(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	12
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	12
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	12
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	12
(2)流通・使用上の制限事項	1	11. 別途提供される資材類	12
6. RMPの概要	1	12. その他	12
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	13
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	13
(1)和名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	13
(2)洋名	2	3. 用法及び用量	13
(3)名称の由来	2	(1)用法及び用量の解説	13
2. 一般名	2	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	13
(1)和名（命名法）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	13
(2)洋名（命名法）	2	5. 臨床成績	13
(3)ステム（stem）	2	(1)臨床データパッケージ	13
3. 構造式又は示性式	2	(2)臨床薬理試験	13
4. 分子式及び分子量	2	(3)用量反応探索試験	13
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(4)検証的試験	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1)有効性検証試験	14
7. 1)安全性試験	14	2)安全性試験	14
8. 2)患者・病態別試験	14	(5)患者・病態別試験	14
9. 3)治療的使用	14	(6)治療的使用	14
10. 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	14	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	14
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	14	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	14
12. (7)その他	14	(7)その他	14
III. 有効成分に関する項目	3	VI. 薬効薬理に関する項目	15
1. 物理化学的性質	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15
(1)外観・性状	3	2. 薬理作用	15
(2)溶解性	3	(1)作用部位・作用機序	15
(3)吸湿性	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	15
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(3)作用発現時間・持続時間	16
(5)酸塩基解離定数	3	VII. 薬物動態に関する項目	17
(6)分配係数	3	1. 血中濃度の推移	17
(7)その他の主な示性値	3	(1)治療上有効な血中濃度	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(2)臨床試験で確認された血中濃度	17
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	(3)中毒域	18
4. (4)食事・併用薬の影響	18	(4)食事・併用薬の影響	18
IV. 製剤に関する項目	4	2. 薬物速度論的パラメータ	18
1. 剤形	4	(1)解析方法	18
(1)剤形の区別	4	(2)吸収速度定数	18
(2)製剤の外観及び性状	4	(3)消失速度定数	19
(3)識別コード	4		
(4)製剤の物性	4		
(5)その他	4		
2. 製剤の組成	4		
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	4		
(2)電解質等の濃度	4		
(3)熱量	4		
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	5		
7. 調製法及び溶解後の安定性	7		

(4)クリアランス	19	(1)臨床使用に基づく情報	26
(5)分布容積	19	(2)非臨床試験に基づく情報	26
(6)その他	19		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	19	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	27
(1)解析方法	19	1. 薬理試験	27
(2)パラメータ変動要因	19	(1)薬効薬理試験	27
4. 吸収	19	(2)安全性薬理試験	27
5. 分布	19	(3)その他の薬理試験	27
(1)血液－脳関門通過性	19	2. 毒性試験	27
(2)血液－胎盤関門通過性	19	(1)単回投与毒性試験	27
(3)乳汁への移行性	19	(2)反復投与毒性試験	27
(4)髄液への移行性	19	(3)遺伝毒性試験	27
(5)その他の組織への移行性	19	(4)がん原性試験	27
(6)血漿蛋白結合率	19	(5)生殖発生毒性試験	27
6. 代謝	20	(6)局所刺激性試験	27
(1)代謝部位及び代謝経路	20	(7)その他の特殊毒性	27
(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	20	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	28
(3)初回通過効果の有無及びその割合	20	1. 規制区分	28
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	20	2. 有効期間	28
7. 排泄	20	3. 包装状態での貯法	28
8. トランスポーターに関する情報	20	4. 取扱い上の注意	28
9. 透析等による除去率	20	5. 患者向け資材	28
10. 特定の背景を有する患者	20	6. 同一成分・同効薬	28
11. その他	21	7. 国際誕生年月日	28
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	22	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	28
1. 警告内容とその理由	22	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	28
2. 禁忌内容とその理由	22	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	28
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	22	11. 再審査期間	29
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	22	12. 投薬期間制限に関する情報	29
5. 重要な基本的注意とその理由	22	13. 各種コード	29
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	22	14. 保険給付上の注意	29
(1)合併症・既往歴等のある患者	22	<b>X I. 文献</b>	30
(2)腎機能障害患者	23	1. 引用文献	30
(3)肝機能障害患者	23	2. その他の参考文献	30
(4)生殖能を有する者	23	<b>X II. 参考資料</b>	31
(5)妊婦	23	1. 主な外国での発売状況	31
(6)授乳婦	23	2. 海外における臨床支援情報	31
(7)小児等	24	<b>X III. 備考</b>	32
(8)高齢者	24	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	32
7. 相互作用	24	(1)粉碎	32
(1)併用禁忌とその理由	24	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	34
(2)併用注意とその理由	24	2. その他の関連資料	34
8. 副作用	24		
(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	25		
10. 過量投与	25		
11. 適用上の注意	26		
12. その他の注意	26		

## 略語表

略語	略語内容
AUC	血漿中濃度－時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC <sub>0-24</sub>	投与 24 時間後までの AUC (AUC from zero to 24 hours)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
BUN	血中尿素窒素 (Blood urea nitrogen)
CL <sub>tot</sub>	全身クリアランス (Total body clearance)
C <sub>max</sub>	最高血漿中濃度 (Maximum plasma concentration)
CK	クレアチンキナーゼ (Creatine kinase)
CYP	チトクローム P450 (Cytochrome P450)
$\gamma$ -GTP	$\gamma$ -グルタミルトランスぺプチターゼ ( $\gamma$ -Glutamyl transpeptidase)
kel	消失速度定数 (Elimination rate constant)
LD <sub>50</sub>	50%致死量 (Median lethal dose)
LDH	乳酸脱水素酵素 (Lactate dehydrogenase)
RH	相対湿度 (Relative humidity)
S.D.	標準偏差 (Standard deviation)
S.E.	標準誤差 (Standard error)
T <sub>1/2</sub>	消失半減期 (Elimination half-life)
T <sub>max</sub>	最高血漿中濃度到達時間 (Time to maximum plasma concentration)
V <sub>d</sub>	分布容積 (Volume of distribution)

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

本剤は、ピルシカイニド塩酸塩水和物を有効成分とする不整脈治療剤である。

長生堂製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、医薬発第 481 号（平成 11 年 4 月 8 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、リズムサット®カプセル 50mg の販売名で 2003 年 3 月に、リズムサット®カプセル 25mg の販売名で 2005 年 2 月にそれぞれ承認を得て、2005 年 7 月発売に至った。

その後、2015 年 1 月にピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」及びピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」へそれぞれ販売名を変更した。

## 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、不整脈治療剤で、他の抗不整脈薬が使用できないか、又は無効の場合の頻脈性不整脈に対し効果が認められている。（〔V.1.効能又は効果〕の項参照）
- (2) 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、肝機能障害があらわれることがある。（〔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

特になし

## 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
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

ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」

ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」

#### (2) 洋名

Pilsicainide Hydrochloride Capsules 25mg “CH”

Pilsicainide Hydrochloride Capsules 50mg “CH”

#### (3) 名称の由来

一般的名称+剤形+含量+「CH」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号) に基づく〕

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

ピルシカイニド塩酸塩水和物

#### (2) 洋名 (命名法)

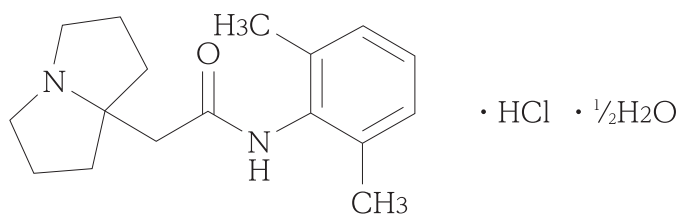
Pilsicainide Hydrochloride Hydrate (JAN)

Pilsicainide (INN)

#### (3) ステム (stem)

プロカインアミド系およ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



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>17</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O · HCl · 1/2H<sub>2</sub>O

分子量：317.85

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

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

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

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

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。

溶解度（24.6℃）<sup>1)</sup> : pH1.2 : 499mg/mL、pH4.0 : 558mg/mL  
pH6.8 : 512mg/mL、水 : 514mg/mL

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (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<sup>1)</sup>

pKa : 10.2（滴定法）

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (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

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### 有効成分の確認試験法

日局「ピルシカイニド塩酸塩水和物」の確認試験による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）
- (3) 塩化物の定性反応（2）

##### 有効成分の定量法

日局「ピルシカイニド塩酸塩水和物」の定量法による。

電位差滴定法（0.1mol/L 過塩素酸による滴定）

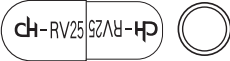
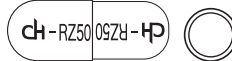
## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

〔1. (2) 製剤の外観及び性状〕の項参照

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg「CH」	ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg「CH」
色調・剤形	キャップ部淡青色不透明、ボディー部 白色不透明の硬カプセル剤	キャップ部青色不透明、ボディー部 白色不透明の硬カプセル剤
外形		
カプセル号数	4	4
重量	210mg	220mg

#### (3) 識別コード

カプセル 25mg

錠剤本体、PTP シート：ch-RV25

カプセル 50mg

錠剤本体、PTP シート：ch-RZ50

#### (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

有効成分（活性成分）の含量

カプセル 25mg：

1 カプセル中 日局 ピルシカイニド塩酸塩水和物 25mg 含有

カプセル 50mg：

1 カプセル中 日局 ピルシカイニド塩酸塩水和物 50mg 含有

添加剤

カプセル 25mg	カプセル 50mg
乳糖水和物、バレイショデンブン、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム、青色 1 号、酸化チタン、ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチン	

#### (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

### 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

#### (1) 加速試験

カプセル 25mg<sup>2)</sup>

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP 包装	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	質量偏差試験	適合	—	—	適合
	定量試験	99.9%	100.0%	100.4%	99.7%
	純度試験	開始時から 6 ヶ月後までほとんど変化を認めず			
	溶出試験	99.3%	98.3%	99.1%	98.9%

カプセル 50mg<sup>3)</sup>

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP 包装	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	質量偏差試験	適合	適合	適合	適合
	崩壊試験	適合	適合	適合	適合
	定量試験	100.5%	100.4%	100.1%	100.1%
	純度試験	開始時から 6 ヶ月後までほとんど変化を認めず			
	溶出試験	96.2%	96.9%	96.1%	95.6%

(2) 長期安定性試験

カプセル 25mg<sup>4)</sup>

長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3年
最終包装製品 (PTP包装)	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	質量偏差試験	適合	適合
	溶出試験	103.0%	103.3%
	定量試験	101.7%	102.7%

カプセル 50mg<sup>5)</sup>

長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3年
最終包装製品 (PTP包装)	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	質量偏差試験	適合	適合
	溶出試験	102.4%	102.1%
	定量試験	99.5%	101.9%

(3) 無包装状態での安定性試験

カプセル 25mg<sup>6)</sup>

保存条件	保存期間	結果
温度（40℃、遮光・気密容器）	3ヵ月	変化なし（◎）
湿度（30℃、75%RH、遮光・開放）	3ヵ月	変化なし（◎）
光（120万 lux・hr、気密容器）	50日	変化なし（◎）

カプセル 50mg<sup>7)</sup>

保存条件	保存期間	結果
温度（40℃、遮光・気密容器）	3ヵ月	変化なし（◎）
湿度（30℃、75%RH、遮光・開放）	3ヵ月	変化なし（◎）
光（120万 lux・hr、気密容器）	50日	変化なし（◎）

試験項目：外観、含量、崩壊性、溶出性

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」（平成 11 年 8 月 20 日（社）日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会）の評価分類基準（下記）に準じる。

◎：すべての測定項目において変化を認めなかった。

（外観：変化をほとんど認めない。含量：3%未満の低下。崩壊性・溶出性：規格値内。）

○：いずれかの測定項目で「規格内」の変化を認めた。

（外観：わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：3%以上の低下で、規格値内。）

△：いずれかの測定項目で「規格外」の変化を認めた。

（外観：形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している。含量：規格値外。崩壊性・溶出性：規格値外。）

## 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）

該当資料なし

## 9. 溶出性

### (1) 溶出規格

カプセル 25mg

日本薬局方医薬品各条 ピルシカイニド塩酸塩カプセル溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条 件：回転数 50rpm

試験液 水

結 果：30 分間 85%以上

カプセル 50mg

日本薬局方医薬品各条 ピルシカイニド塩酸塩カプセル溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条 件：回転数 50rpm

試験液 水

結 果：30 分間 85%以上

### (2) 品質再評価における溶出試験結果

カプセル 50mg<sup>8)</sup>

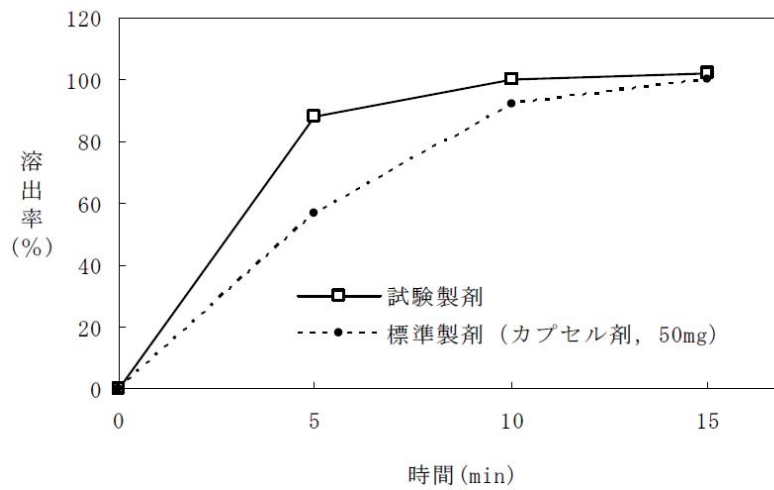
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）」に従い、サンリズムカプセル 50mg を標準製剤として溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH4.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm

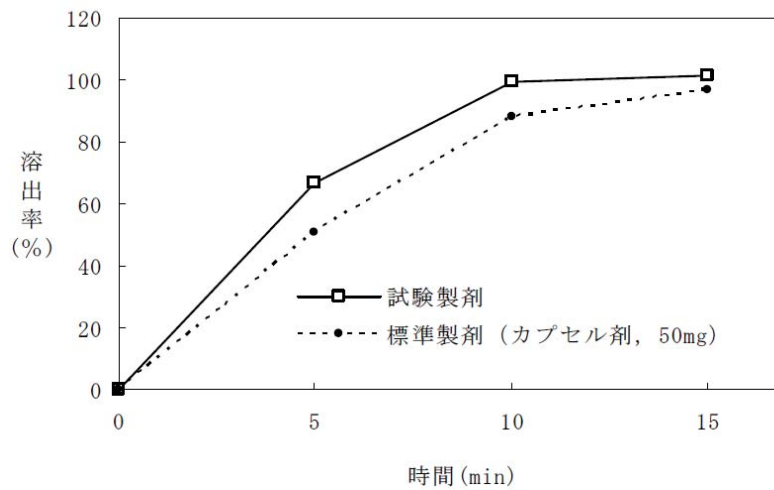
[判定基準]

①～④：試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。又は、15分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

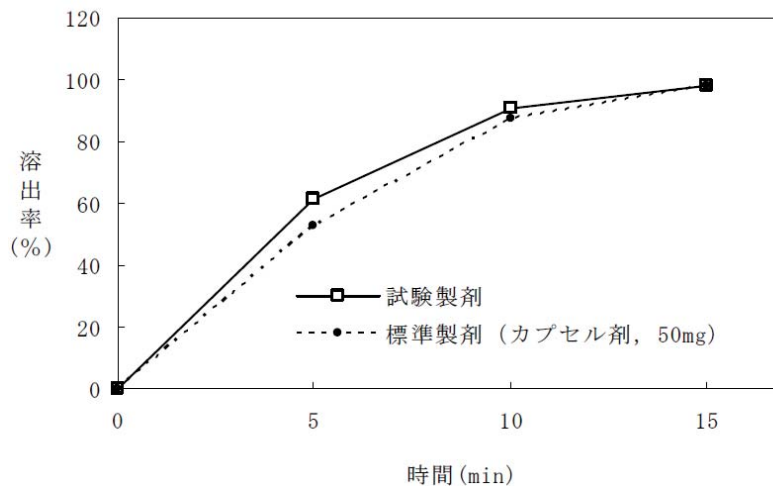
①pH1.2、50rpm



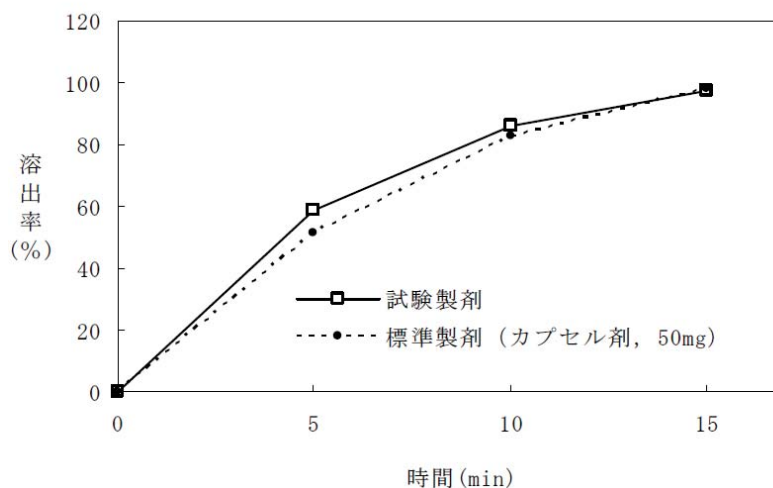
②pH4.0、50rpm



③pH6.8、50rpm



④水、50rpm



(3) 生物学的同等性試験における溶出試験結果

カプセル 25mg<sup>9)</sup>

「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 12 年 2 月 14 日医薬審第 64 号）」に従い、ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg「CH」を標準製剤として溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH5.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH5.0/100rpm

[判定基準]

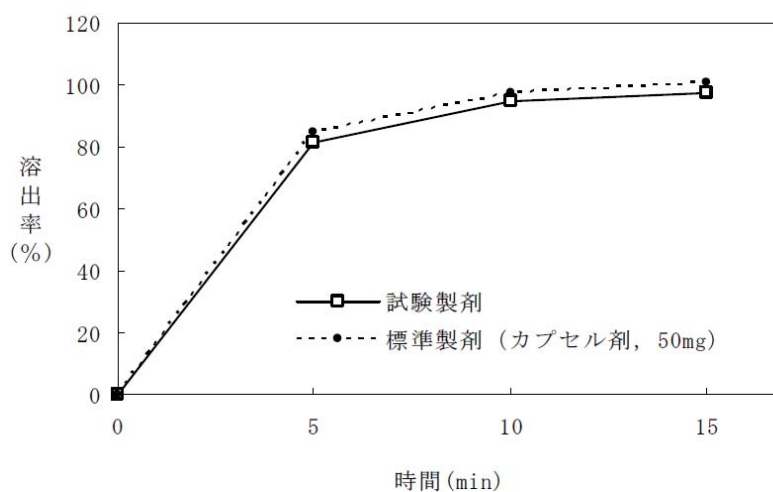
a) 平均溶出率

①～⑤：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にある。

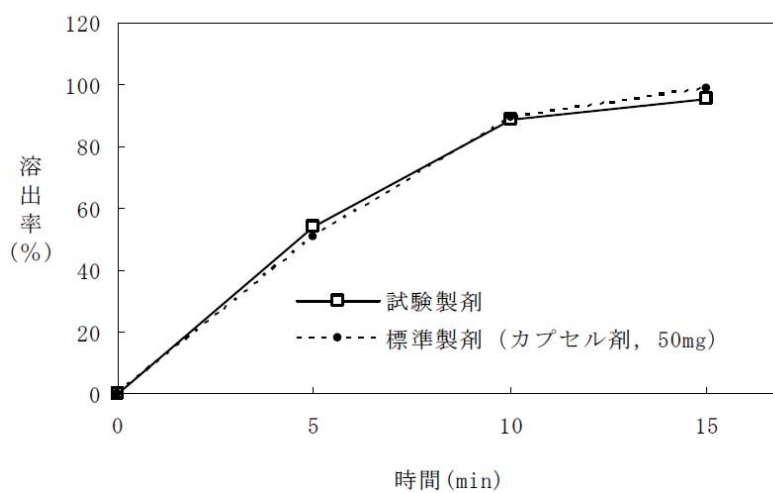
b) 個々の溶出率

①～⑤：最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが12個中1個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがない。

①pH1.2、50rpm

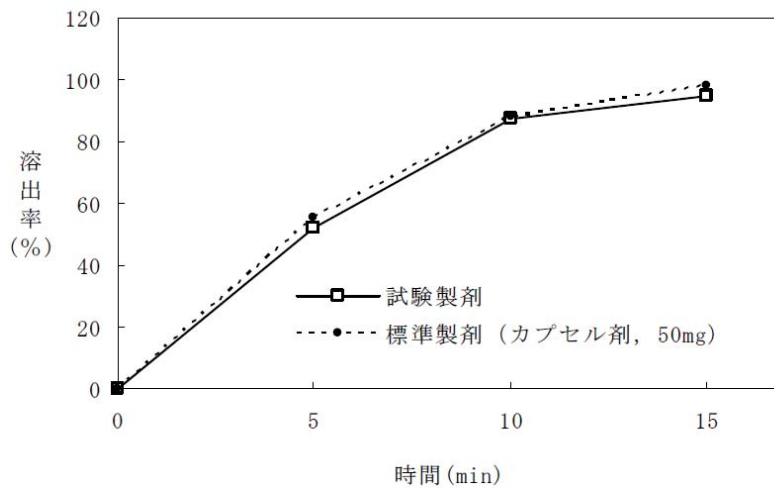


②pH5.0、50rpm

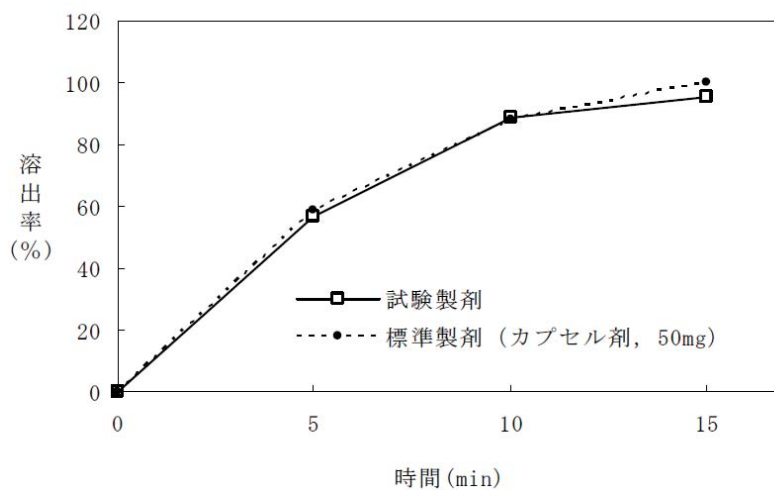




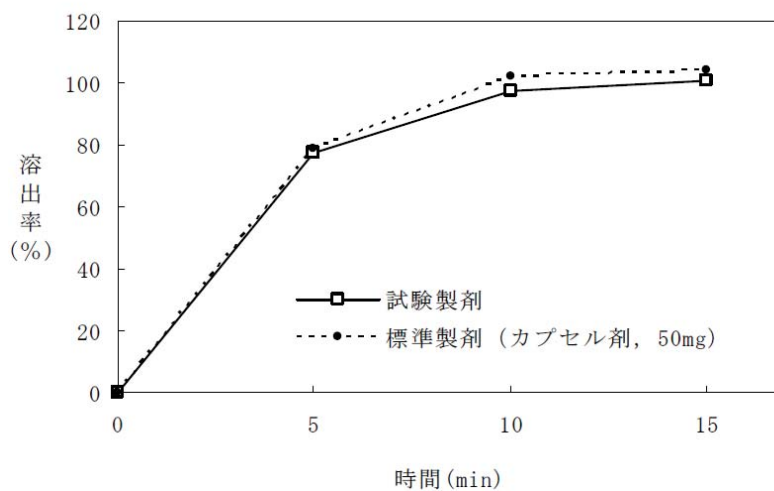
③pH6.8、50rpm



④水、50rpm



⑤pH5.0、100rpm



## 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

### 22. 包装

〈ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」〉

100 カプセル [10 カプセル (PTP) ×10]

〈ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」〉

100 カプセル [10 カプセル (PTP) ×10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

カプセル 25mg

PTP (ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔)、紙箱

カプセル 50mg

PTP (ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔)、紙箱

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

### 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

#### 6. 用法及び用量

通常、成人にはピルシカイニド塩酸塩水和物として、1日150mgを3回に分けて経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、重症又は効果不十分な場合には、1日225mgまで増量できる。

#### (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

#### 7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 透析を必要とする腎不全患者では、1日25mgから投与を開始するなど、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。[9.2.1 参照]

7.2 高齢者では、1回25mgから投与を開始するなど、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。[9.8 参照]

### 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

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

###### 17.1.1 国内臨床試験

心室性期外収縮を対象とした二重盲検比較試験において、ピルシカイニド塩酸塩水和物 150mg 投与群 88 例、ジソピラミド 300mg 投与群 87 例での全般改善度は、それぞれ著名改善が 51.4% (37/72 例)、33.8% (26/77 例)、中等度改善以上が 70.8% (51/72 例)、54.5% (42/77 例) であった。副作用発現率はピルシカイニド塩酸塩水和物投与群で 8.1% (7/86 例) であり、主なものは口渇、めまい等であった<sup>10)</sup>。

###### 17.1.2 国内第Ⅲ相試験

上室性期外収縮を対象とした二重盲検比較試験において、ピルシカイニド塩酸塩水和物 150mg 投与群 41 例、ジソピラミド 300mg 投与群 39 例での全般改善度は、それぞれ著名改善が 41.9% (13/31 例)、26.7% (8/30 例)、中等度改善以上が 67.7% (21/31 例)、46.7% (14/30 例) であった。副作用発現率はピルシカイニド塩酸塩水和物投与群で 5.1% (2/39 例) で、頭のふらつき感、胸部不快感であった<sup>11)</sup>。

##### 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

##### (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

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ジソピラミド、プロパフェノン塩酸塩、フレカイニド酢酸塩等

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

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<sup>12)</sup>。Sicilian Gambitの提唱する薬剤分類（日本版）において、ピルシカイニド塩酸塩水和物はNaチャンネルを選択的に抑制し、K、Caチャンネル並びに $\alpha$ 、 $\beta$ 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<sup>13)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 臨床電気生理学的作用

発作性上室性頻拍の患者にピルシカイニド塩酸塩水和物150mg又は200mgを単回経口投与した場合、洞房伝導（SA）時間、房室結節内伝導（AH）時間、心室内伝導（HV）時間を延長させた。また、右室の有効不応期を延長させた<sup>14)</sup>。

##### 18.3 心機能に対する作用

発作性上室性頻拍の患者にピルシカイニド塩酸塩水和物150mg又は200mgを単回経口投与した場合、心拍数及び平均肺動脈圧は有意に増加し、一回拍出係数は有意に減少したがいずれも正常範囲内であった<sup>14)</sup>。

##### 18.4 実験的不整脈に対する作用

18.4.1 イヌの冠動脈二段結紮による実験的不整脈を抑制した<sup>15,16)</sup>。

18.4.2 イヌのアコニチン、ウアバイン及びアドレナリンによって誘発された実験的不整脈を抑制した<sup>16,17)</sup>。

18.4.3 イヌの冠動脈閉塞中及び再灌流中に発生する心室性不整脈を抑制した<sup>18)</sup>。

##### 18.5 電気生理学的作用

###### 18.5.1 最大脱分極速度に対する作用

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（Vmax）を用量依存的に抑制した<sup>19)</sup>。

###### 18.5.2 活動電位持続時間及び有効不応期に対する作用

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<sup>19)</sup>。

###### 18.5.3 心室細動の発生閾値に対する作用

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<sup>18)</sup>。

###### 18.5.4 遅延後脱分極及び誘発自動能に対する作用

イヌのプルキンエ線維において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<sup>20)</sup>。

(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

##### 16.1.1 単回投与

健康成人男性 18 例にピルシカイニド塩酸塩水和物 25mg、50mg 及び 100mg<sup>注)</sup>を空腹時単回経口投与したとき、消化管からの吸収は良好であった<sup>21)</sup>。

ピルシカイニド塩酸塩水和物単回経口投与時の薬物動態パラメータ (空腹時)

投与量 (mg)	例数	Tmax (hr)	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	$t_{1/2}$ (hr)	AUC ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )
25	2	1.61 $\pm$ 0.01	0.150 $\pm$ 0.002	4.4 $\pm$ 0.39	1.278 $\pm$ 0.080
50	8	1.22 $\pm$ 0.18	0.356 $\pm$ 0.027	4.8 $\pm$ 0.34	2.975 $\pm$ 0.112
100	8	1.06 $\pm$ 0.18	0.650 $\pm$ 0.029	4.9 $\pm$ 0.37	5.238 $\pm$ 0.307

(平均 $\pm$ SE)

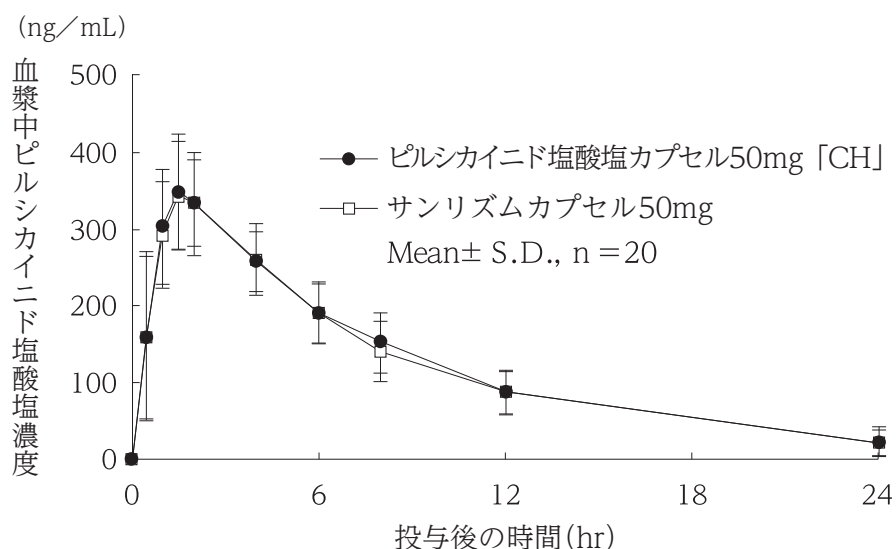
なお、ピルシカイニド塩酸塩水和物の有効血漿中濃度は 0.2 ~ 0.9  $\mu\text{g}/\text{mL}$  と報告されている<sup>22, 23)</sup>。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、1 日 150 ~ 225mg を 3 回に分けて投与である。

### 生物学的同等性試験

#### カプセル 50mg

ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」とサンリズムカプセル 50mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 カプセル (ピルシカイニド塩酸塩水和物として 50mg) 健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中ピルシカイニド塩酸塩濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log (0.80) \sim \log (1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>24)</sup>。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-24</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg「CH」	3011.4±649.7	368.4±71.0	1.6±0.4	6.0±1.6
サンリズムカプセル 50mg	2964.0±619.8	362.7±67.9	1.7±0.3	6.0±1.6

(Mean±S.D., n=20)

血漿中濃度並びに 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。

### カプセル 25mg

ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg「CH」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 12 年 2 月 14 日医薬審第 64 号）」に基づき、ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg「CH」を標準製剤としたとき、溶出挙動に基づき生物学的に同等とみなされた<sup>9)</sup>。

### (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〕の項参照

## 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

該当資料なし



(3) 消失速度定数

カプセル 50mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 (1 カプセル、n=20)

$k_{el}$  ( $hr^{-1}$ ) :  $0.12618 \pm 0.04934$

(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

該当資料なし

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

〔VIII.6. (5) 妊婦〕の項参照

(3) 乳汁への移行性

〔VIII.6. (6) 授乳婦〕の項参照

(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

16.3.1 組織移行

ラットに  $^{14}C$ -ピルシカイニド塩酸塩水和物を経口投与したとき、主に十二指腸から吸収され、主として肝臓、腎臓に分布し、脳への分布は少なかった<sup>25)</sup>。

また、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とき、胎児及び乳汁中には母体の血漿中濃度とほぼ同程度かあるいはそれ以上の移行が認められた<sup>26)</sup>。

(6) 血漿蛋白結合率

16.3.2 蛋白結合率

ヒト血漿蛋白結合率は、 $1.0 \mu g/mL$  以下の濃度で約 35%と一定であったが、 $50 \mu g/mL$  では約 20%に低下した<sup>27)</sup> (*in vitro*)。

## 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

#### 16.4 代謝

健康成人ではピルシカイニド塩酸塩水和物は代謝されにくい。

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<sup>28)</sup>。

### (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

#### 18.6 活性代謝物の抗不整脈作用

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約 1/4 ~ 1/10 であった<sup>15)</sup>。

## 7. 排泄

#### 16.5 排泄

健康成人男性 18 例にピルシカイニド塩酸塩水和物 25mg、50mg 及び 100mg<sup>注)</sup>を空腹時単回経口投与したとき、24 時間以内に 75 ~ 86%が未変化体として尿中に排泄された。また 50mg、100mg 投与群においては、24 時間以内に 4.5 ~ 6.5%が代謝物 2-ヒドロキシメチル体として尿中に排泄された<sup>21)</sup>。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、1 日 150 ~ 225mg を 3 回に分けて投与である。

## 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

〔VIII.10.過量投与〕の項参照

## 10. 特定の背景を有する患者

#### 16.6.1 腎機能障害患者

ピルシカイニド塩酸塩水和物は腎排泄型の薬剤であり、次のように腎機能障害患者、腎機能が低下している高齢者では半減期が延長する。したがって内因性クレアチニンクリアランス (CLcr) を指標とした障害の程度に応じて、投与間隔をあげるかあるいは症例によって投与量を減じるなど、用法及び用量に十分注意する必要がある<sup>29)</sup>。[9.2 参照]

50 ≤ CLcr : 半減期は腎機能正常例とほぼ同じ。

20 ≤ CLcr < 50 : 半減期は腎機能正常例に比し約 2 倍に延長する。

CLcr < 20 : 半減期は腎機能正常例に比し約 5 倍に延長する。

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の薬物動態パラメータ

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

(平均 $\pm$ 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〕

### 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〕を参照すること

### 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、頻回に患者の状態を観察し、心電図、脈拍、血圧、心胸比を定期的に調べる。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、直ちに減量又は投与を中止すること。

8.2 1 日用量 150mg を超えて投与する場合は副作用発現の可能性が増大するので注意すること。

8.3 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（ $V_1 \sim V_3$ ）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。

8.4 めまい等があらわれることがあるので、自動車の運転等、危険を伴う機械の操作に従事する際には注意するよう患者に十分に説明すること。

### 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

##### 9.1 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、少量から開始するなど投与量に十分注意するとともに、頻回に心電図検査を実施すること。また、開始後 1 ～ 2 週間は入院させること。心室頻拍、心室細動等が発現するおそれが高い。なお、心筋梗塞発症後の無症候性あるいは軽度の症状を伴う患者の場合は、治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。〔15.1 参照〕

### 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 他の抗不整脈薬を併用している患者

少量から開始するなど投与量に十分注意するとともに、頻回に心電図検査を実施すること。[10.2 参照]

### 9.1.7 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

ペースメーカー使用中の患者に投与する場合は適当な間隔でペーシング閾値を測定すること。また、異常が認められた場合には直ちに減量又は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。

## (2) 腎機能障害患者

### 9.2 腎機能障害患者

投与量を減量するか、投与間隔をあけて使用すること。また、頻回に心電図検査を実施すること。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しやすい。[16.6.1 参照]

#### 9.2.1 透析を必要とする腎不全患者

[7.1、13.2 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。

## (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）で静脈内投与した場合、胎児に移行することが報告されている。

## (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。

## (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

入院させて本剤の投与を開始することが望ましい。少量から開始するなど投与量に十分注意するとともに、頻回に心電図検査を実施すること。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。[7.2 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 [9.1.6 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したとの報告がある。	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。

## 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、頻回な心電図検査、胸部 X 線検査等を実施すること。

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。

11.1.3 肝機能障害（頻度不明）

AST、ALT、 $\gamma$ -GTP の上昇等を伴う肝機能障害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

	0.1～5%未満	頻度不明
循環器	QRS 幅の増大、QT 延長、房室ブロック、洞房ブロック、胸部不快感、動悸、心室性期外収縮、上室性期外収縮、心房細動、上室性頻拍	胸痛、徐脈、心房粗動、血圧低下
消化器	胃痛、悪心、嘔吐、口渇、下痢、腹部不快感	便秘、食欲不振
精神神経系	めまい、頭痛、眠気	振戦、不眠、しびれ
血液	好酸球増加、リンパ球減少	白血球数減少、血小板数減少
肝臓	AST 上昇、ALT 上昇、LDH 上昇	
過敏症	発疹、蕁麻疹	そう痒感
腎臓		BUN 上昇、クレアチニン上昇、尿蛋白陽性
泌尿器		排尿困難
その他	全身倦怠感、CK 上昇、脱力感	熱感

## 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

### 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。[9.2.1 参照]

## 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

#### 15.1 臨床使用に基づく情報

外国で心筋梗塞発症後の無症候性あるいは軽度の症状を伴う心室性期外収縮の患者を対象とした比較試験において、本剤と類似の Na チャンネル阻害作用を有する薬剤を投与した群で、プラセボ投与群に比べ、死亡率が有意に増加したとの報告がある<sup>30)</sup>。[9.1.1 参照]

### (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<sup>31)</sup>

LD<sub>50</sub> 値 (mg/kg)

動物	性別	経口	腹腔内	静注
マウス	♂	175	85	17
ラット	♂	255	105	18
イヌ	♂♀	約53	—	—

### (2) 反復投与毒性試験<sup>31)</sup>

亜急性毒性：イヌへの最大無影響量（強制経口）10mg/kg/日（13週）主な所見として多重増加抑制、自発運動低下が見られた。

慢性毒性：イヌへの最大無影響量（強制経口）15mg/kg/日（52週）主な所見なし。

### (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

該当資料なし

### (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

(1) 製剤：劇薬、処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

(2) 有効成分：劇薬

### 2. 有効期間

3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：有り
- ・くすりのしおり：有り

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：サンリズム®カプセル 25mg、サンリズム®カプセル 50mg、サンリズム®注射液 50  
同効薬：ジソピラミド、プロパフェノン塩酸塩、フレカイニド酢酸塩等

### 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
ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」	2015年1月23日 (販売名変更による)	22700AMX00087000	2015年6月19日 (販売名変更による)	2005年7月8日
ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」	2015年1月23日 (販売名変更による)	22700AMX00088000	2015年6月19日 (販売名変更による)	2005年7月8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

該当しない

#### 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 コード
ピルシカイニド塩酸塩 カプセル 25mg 「CH」	2129008M1016	2129008M1156	116938604	621693804
ピルシカイニド塩酸塩 カプセル 50mg 「CH」	2129008M2012	2129008M2160	116939304	621693904

#### 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) 医療用医薬品品質情報集 (オレンジブック) No.20 (平成 16 年 6 月版、厚生労働省医薬食品局)
- 2) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」の加速試験)
- 3) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」の加速試験)
- 4) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」の長期保存試験)
- 5) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」の長期保存試験)
- 6) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」の無包装状態での安定性試験)
- 7) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」の無包装状態での安定性試験)
- 8) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」の溶出試験)
- 9) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」の生物学的同等性試験 (溶出試験))
- 10) 新谷博一ほか：循環器科 1989 ; 26 (2) : 216-232
- 11) 新谷博一ほか：循環器科 1989 ; 26 (2) : 201-215
- 12) 第十八改正日本薬局方解説書. 2021 : C4471-4474
- 13) 加藤貴雄 : J Nippon Med Sch. 2002 ; 69 (1) : 7-12
- 14) 井野 威ほか：臨床薬理 1989 ; 20 (4) : 677-685
- 15) 日高寿範ほか：応用薬理 1989 ; 37 (4) : 359-372
- 16) Aisaka K, et al. : Arzneimittelforschung 1985 ; 35 (II) (8) : 1239-1245
- 17) 日高寿範ほか：基礎と臨床 1992 ; 26 (13) : 4927-4931
- 18) 日高寿範ほか：応用薬理 1988 ; 36 (6) : 439-447
- 19) Hattori Y, et al. : J Cardiovasc Pharmacol. 1986 ; 8 (5) : 998-1002
- 20) Inomata N, et al. : Eur J Pharmacol. 1988 ; 145 (3) : 313-322
- 21) 中島光好ほか：臨床医薬 1989 ; 5 (4) : 661-678
- 22) 清水賢巳ほか：薬理と治療 1994 ; 22 (8) : 3717-3725
- 23) 横田充弘ほか：Ther Res. 1989 ; 10 (5) : 2135-2147
- 24) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」の生物学的同等性試験)
- 25) 林 敏郎ほか：基礎と臨床 1989 ; 23 (6) : 2197-2229
- 26) 小森谷和美ほか：応用薬理 2003 ; 65 (5/6) : 89-95
- 27) ヒト血漿蛋白結合率 (サンリズム注射液 50 2000 年 1 月 18 日承認、申請資料概要へ.2.3.3)
- 28) 藤谷朝通ほか：薬物動態 1997 ; 12 (S) : 255
- 29) 高畠利一ほか：薬理と治療 1989 ; 17 (7) : 3195-3205
- 30) CAST investigators : N Engl J Med. 1989 ; 321 (6) : 406-412
- 31) 厚生省薬務局推薦：規制医薬品事典 (第 5 版)、薬業時報社

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## 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

該当資料なし

## 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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### (1) 粉砕

##### 脱カプセル後の安定性

##### 1. 保存条件

温度に対する安定性試験：40±2°C/60±5%RH、30日〔遮光・気密容器〕

湿度に対する安定性試験：25±2°C/75±5%RH、30日〔遮光・開放〕

光に対する安定性試験：120万lx・hr〔シャーレ+ラップ〕※

※1000lx/hr 25±2°C/60±5%RH

##### 2. 試験項目

性状、定量試験

##### 3. 試験結果

カプセル 25mg

試験項目		性状	定量試験 (%) (残存率 (%))
製剤の規格 (参考) (脱カプセル前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	99.2 (100.0)
①温度	15日	変化なし	98.4 (99.2)
	30日	変化なし	99.4 (100.2)
②湿度	15日	変化なし	98.2 (99.0)
	30日	変化なし	97.7 (98.5)
③光	30万lx・hr	変化なし	98.7 (99.5)
	60万lx・hr	変化なし	97.1 (97.9)
	120万lx・hr	変化なし	99.4 (100.2)

(1) キャップ部淡青色不透明、ボディー部白色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色の粉末で、においはなく、味は苦い。

(2) 表示量の 95.0 ~ 105.0%

カプセル 50mg

試験項目		性状	定量試験 (%) (残存率 (%))
製剤の規格 (参考) (脱カプセル前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	98.6 (100.0)
①温度	15 日	変化なし	99.0 (100.4)
	30 日	変化なし	98.3 (99.7)
②湿度	15 日	変化なし	98.3 (99.7)
	30 日	変化なし	98.7 (100.1)
③光	30 万 lx・hr	変化なし	98.3 (99.7)
	60 万 lx・hr	変化なし	98.1 (99.5)
	120 万 lx・hr	変化なし	98.4 (99.8)

(1) キャップ部青色不透明、ボディー部白色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色の粉末で、においはなく、味は苦い。

(2) 表示量の 95.0 ~ 105.0%

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### 1. 試験方法

#### 崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内にカプセル剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、カプセル剤を開封し充填薬をディスペンサー内に入れてから、上記と同様の操作を行う。

#### 通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2 ～ 3mL/秒の速度で注入し、チューブ (8Fr.) の通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。

### 2. 試験結果

#### 崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」	5 分以内に崩壊・懸濁した。
ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

#### 通過性試験結果

品目名	通過性
ピルシカイニド塩酸塩カプセル 25mg 「CH」	8Fr.のチューブを通過した。
ピルシカイニド塩酸塩カプセル 50mg 「CH」	8Fr.のチューブを通過した。

## 2. その他の関連資料

該当資料なし



*Memo*

*Memo*

*Memo*

