

# 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 2008 に準拠して作成

鎮痙剤

**ブスコパン<sup>®</sup>錠 10mg****Buscopan<sup>®</sup>**

ブチルスコポラミン臭化物製剤

®＝登録商標

剤形	糖衣錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中 ブチルスコポラミン臭化物 10mg 含有
一般名	和名：ブチルスコポラミン臭化物 洋名：Scopolamine Butylbromide
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 発売年月日	2008年9月5日 2008年12月19日 1956年2月1日
開発・製造販売・ 提携・販売会社名	製造販売：サノフィ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	サノフィ株式会社 医薬品関連：くすり相談室(平日9:00～17:00) TEL:0120-109-905 FAX:(03)6301-3010 医療関係者向け製品情報サイト:サノフィ e-MR <a href="http://e-mr.sanofi.co.jp/">http://e-mr.sanofi.co.jp/</a>

本 IF は 2019 年 7 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

## IF 利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな IF 記載要領が策定された。

### 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の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薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

#### [IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師を

はじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

- ⑤「IF 記載要領 2008」により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」と略す）は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008 年 9 月)

# 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・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販 売 名	2
(1) 和 名	2
(2) 洋 名	2
(3) 名称の由来	2
2. 一 般 名	2
(1) 和 名 (命名法)	2
(2) 洋 名 (命名法)	2
(3) ステム	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化 学 名 (命名法)	2
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
(1) 外観・性状	3
(2) 溶 解 性	3
(3) 吸 湿 性	3
(4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点	3
(5) 酸塩基解離定数	3
(6) 分配係数	3
(7) その他の主な示性値	3
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	4
4. 有効成分の定量法	4

<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>
1. 剤形.....	5
(1) 剤形の区別, 規格及び性状.....	5
(2) 製剤の物性.....	5
(3) 識別コード.....	5
(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等.....	5
2. 製剤の組成.....	5
(1) 有効成分 (活性成分) の含量.....	5
(2) 添加物.....	5
(3) その他.....	5
3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意.....	6
4. 製剤の各種条件下における安定性.....	6
5. 調製法及び溶解後の安定性.....	6
6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化).....	6
7. 溶出性.....	6
8. 生物学的試験法.....	6
9. 製剤中の有効成分の確認試験法.....	7
10. 製剤中の有効成分の定量法.....	7
11. 力価.....	8
12. 混入する可能性のある夾雑物.....	8
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報.....	8
14. その他.....	8
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>9</b>
1. 効能又は効果.....	9
2. 用法及び用量.....	9
3. 臨床成績.....	9
(1) 臨床データパッケージ (2009 年 4 月以降承認品目).....	9
(2) 臨床効果.....	9
(3) 臨床薬理試験: 忍容性試験.....	9
(4) 探索的試験: 用量反応探索試験.....	10
(5) 検証的試験.....	10
(6) 治療的使用.....	10
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>11</b>
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群.....	11
2. 薬理作用.....	11
(1) 作用部位・作用機序.....	11
(2) 薬効を裏付ける試験成績.....	11
(3) 作用発現時間・持続時間.....	17

<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>18</b>
1. 血中濃度の推移・測定法 .....	18
(1) 治療上有効な血中濃度 .....	18
(2) 最高血中濃度到達時間 .....	18
(3) 臨床試験で確認された血中濃度 .....	18
(4) 中毒域 .....	18
(5) 食事・併用薬の影響 .....	18
(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因 .....	18
2. 薬物速度論的パラメータ .....	18
(1) コンパートメントモデル .....	18
(2) 吸収速度定数 .....	18
(3) バイオアベイラビリティ .....	18
(4) 消失速度定数 .....	18
(5) クリアランス .....	19
(6) 分布容積 .....	19
(7) 血漿蛋白結合率 .....	19
3. 吸　　収 .....	19
4. 分　　布 .....	19
(1) 血液－脳関門通過性 .....	19
(2) 血液－胎盤関門通過性 .....	19
(3) 乳汁への移行性 .....	19
(4) 髄液への移行性 .....	19
(5) その他の組織への移行性 .....	19
5. 代　　謝 .....	20
(1) 代謝部位及び代謝経路 .....	20
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種 .....	20
(3) 初回通過効果の有無及びその割合 .....	20
(4) 代謝物の活性の有無及び比率 .....	20
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ .....	20
6. 排　　泄 .....	20
(1) 排泄部位及び経路 .....	20
(2) 排　泄　率 .....	20
(3) 排泄速度 .....	20
7. 透析等による除去率 .....	20

<b>Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>21</b>
1. 警告内容とその理由 .....	21
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	21
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	22
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	22
5. 慎重投与内容とその理由 .....	22
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	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 .....	23
(1) 副作用の概要 .....	23
(2) 重大な副作用と初期症状 .....	23
(3) その他の副作用 .....	23
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧 .....	24
(5) 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 .....	24
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法 .....	24
9. 高齢者への投与 .....	24
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....	24
11. 小児等への投与 .....	24
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	25
13. 過量投与 .....	25
14. 適用上の注意 .....	25
15. その他の注意 .....	25
16. その他 .....	25
<b>Ⅸ. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>26</b>
1. 薬理試験 .....	26
(1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照） .....	26
(2) 副次的薬理試験 .....	26
(3) 安全性薬理試験 .....	26
(4) その他の薬理試験 .....	26
2. 毒性試験 .....	26
(1) 単回投与毒性試験 .....	26
(2) 反復投与毒性試験 .....	26
(3) 生殖発生毒性試験 .....	27
(4) その他の特殊毒性 .....	27

<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>28</b>
1. 規制区分.....	28
2. 有効期間又は使用期限.....	28
3. 貯法・保存条件.....	28
4. 薬剤取扱い上の注意点.....	28
(1) 薬局での取り扱いについて.....	28
(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）.....	28
5. 承認条件等.....	28
6. 包装.....	28
7. 容器の材質.....	28
8. 同一成分・同効薬.....	29
9. 国際誕生年月日.....	29
10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	29
11. 薬価基準収載年月日.....	29
12. 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.....	29
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容.....	30
14. 再審査期間.....	30
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	30
16. 各種コード.....	30
17. 保険給付上の注意.....	30
<b>XI. 文 献</b> .....	<b>31</b>
1. 引用文献.....	31
2. その他の参考文献.....	31
<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>32</b>
1. 主な外国での発売状況.....	32
2. 海外における臨床支援情報.....	32
<b>XIII. 備 考</b> .....	<b>33</b>
その他の関連資料.....	33

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ブチルスコポラミン臭化物は、ドイツのベーリンガーインゲルハイム社において、1940年代後半に合成・開発された鎮痙剤である。アトロピンの臨床上の特性を改善し、さらに耐薬性のある鎮痙剤を探すために、アトロピンを出発点とせず、類似アルカロイドのスコポラミンを土台に第4級アンモニウム化合物の系統的探索研究を行った。国内においては、1955年3月に輸入承認を受け（田辺製薬（株）承認番号：阪薬第2974号）、日本ベーリンガーインゲルハイム（株）は1982年4月に輸入承認をうけた（承認番号：(57AM 輸) 第71号）。1976年4月にブチルスコポラミン臭化物の第8次医薬品再評価結果が通知された。また、2003年11月に、薬事法第14条第2項各号（承認拒否理由）のいずれにも該当しないとの品質再評価結果を得た。

その後、「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）による事故防止対策の観点から名称変更品（ブスコパン錠10mg）が新たに承認され、2008年12月に薬価基準に収載された。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤はアトロピンとは異なり、副交感神経によって支配されている腹部中空臓器の壁内神経節に作用し、神経刺激伝達を抑制して、胃腸管、胆道、泌尿器及び女性生殖器の痙攣を緩解する。

## II. 名称に関する項目

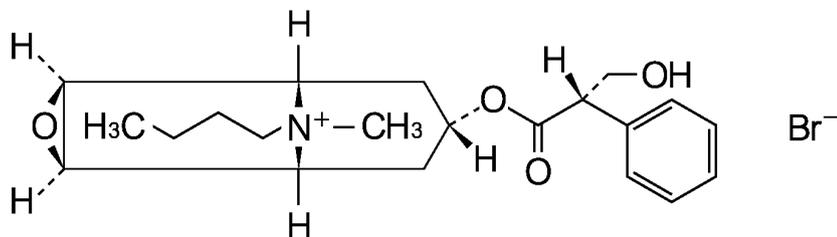
### 1. 販売名

- (1) 和名            ブスコパン® 錠 10mg
- (2) 洋名            Buscopan® Tablets 10mg
- (3) 名称の由来      化学名の N-butylscopolamine に由来したもの

### 2. 一般名

- (1) 和名 (命名法)    ブチルスコポラミン臭化物 (JAN)
- (2) 洋名 (命名法)    Scopolamine Butylbromide (JAN)
- (3) ステム            不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

C<sub>21</sub>H<sub>30</sub>BrNO<sub>4</sub> : 440.37

### 5. 化学名 (命名法)

(英名) (1*S*, 2*S*, 4*R*, 5*R*, 7*S*)-9-Butyl-7-[(2*S*)-3-hydroxy-2-phenylpropanoyloxy]-9-methyl-3-oxa-9-azoniatricyclo[3.3.1.0<sup>2,4</sup>]nonane bromide (IUPAC)

(日本名) (1*S*, 2*S*, 4*R*, 5*R*, 7*S*)-9-ブチル-7-[(2*S*)-3-ヒドロキシ-2-フェニルプロパノイルオキシ]-9-メチル-3-オキサ-9-アゾニアトリシクロ[3.3.1.0<sup>2,4</sup>]ノン ブロミド

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

- (1) 慣用名    なし
- (2) 別名      臭化ブチルスコポラミン, 臭化ブチルヒヨスチン, Hyoscine-N-butylbromide
- (3) 略号      なし
- (4) 記号番号    SKF-1637

### 7. CAS 登録番号

149-64-4

## 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

溶媒名	溶解性
水	極めて溶けやすい
酢酸 (100)	溶けやすい
エタノール (95)	やや溶けやすい
メタノール	やや溶けにくい
無水酢酸	溶けにくい
ジエチルエーテル	ほとんど溶けない

## (3) 吸湿性

該当資料なし

## (4) 融点 (分解点) , 沸点, 凝固点

融点 : 約 140℃ (分解)

## (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

## (6) 分配係数

該当資料なし

## (7) その他の主な示性値

旋光性 : 左旋性を示す。

$[\alpha]_D^{20}$  :  $-18.0 \sim -20.0^\circ$

(乾燥後, 1g, 水, 10mL, 100mm)

pH : 水溶液 (1→10) は 5.5~6.5 である。

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 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
室温	4 年間	褐色気密 容器	変化なく、安定であった
45°C	4 ヶ月間		
45°C, 80%RH			

#### 3. 有効成分の確認試験法

- (1) 本品 1mg に発煙硝酸 3~4 滴を加え、水浴上で蒸発乾固する。冷後、残留物を N,N-ジメチルホルムアミド 1mL に溶かし、テトラエチルアンモニウムヒドロキシド試液 6 滴を加えるとき、液は赤紫色を呈する。
- (2) 紫外可視吸光度測定法：本品の水溶液（1→1000）につき、吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法：本品を乾燥し、臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。
- (4) 臭化物の定性反応：本品の水溶液（1→20）は臭化物の定性反応を呈する。

#### 4. 有効成分の定量法

電位差滴定法：本品を乾燥し、その約 0.8g を精密に量り、酢酸（100）40mL 及び無水酢酸 30mL を加えて溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する。同様の方法で空試験を行い、補正する。

0.1mol/L 過塩素酸 1mL=44.04mg  $C_{21}H_{30}BrNO_4$

## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

(1) 剤形の区別, 規格及び性状

販売名	剤形・色調	規格	直径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (g)	表面	裏面	側面
ブスコパン錠 10mg	白色の 糖衣錠	1錠中 ブチルス コポラミン臭化 物を 10mg 含有	7.0	3.8	0.15			

(2) 製剤の物性

崩壊試験

「日局：一般試験法の崩壊試験法 (2)：適当なコーティング剤で剤皮を施した錠剤」の試験を行うとき、これに適合する。

(3) 識別コード

販売名	薬剤本体		包装資材 (PTP シート)	
	識別コード	表示部位	表	裏
ブスコパン錠 10mg		表面	Buscopan ブスコパン 10mg BS	ブスコパン 10mg sa

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等  
該当しない

## 2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

1錠中 ブチルスコポラミン臭化物を 10mg 含有

(2) 添加物

乳糖水和物, トウモロコシデンプン, ステアリン酸マグネシウム, 酒石酸, 白糖, タルク, アラビアゴム末, 酸化チタン, マクロゴール 6000, カルナウバロウ, サラシミツロウ, 白色セラック, ラウリル硫酸ナトリウム

(3) その他

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

##### 3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意

該当しない

##### 4. 製剤の各種条件下における安定性

保存条件		保存形態	結 果
室 温（室内散光下）		PTP*包装	3年6ヶ月は諸試験において変化を認めなかった。
温度	40℃	ヒートシール及び褐色びん（密栓）	3ヶ月は性状，含量に変化を認めなかった。
湿度	25℃，75%R.H.	ヒートシール及び無色びん（開栓）	3ヶ月は性状，含量に変化を認めなかった。
光	キセノンランプ照射下（20，40，60時間：60時間照射は太陽光線照射30日に相当）	ヒートシール及び無色びん（密栓）	性状，含量において変化を認めなかった。

\* PTP：ポリ塩化ビニル及びポリ塩化ビニリデンの複合シート，アルミ箔

##### 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

##### 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

##### 7. 溶出性

日局一般試験法，溶出試験法パドル法

試験液： 水 900mL

回転数： 毎分 50 回転

定量法： 液体クロマトグラフ法

規格値： 120 分間の溶出率が 80%以上

##### 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 本品を粉末とし、表示量に従いブチルスコポラミン臭化物 0.1g に対応する量を取り、水 100mL を加えて振り混ぜた後、必要ならば遠心分離し、ろ過する。ろ液 1mL を水浴上で蒸発乾固した後、残留物に発煙硝酸 3~4 滴を加え、再び水浴上で蒸発乾固し、冷後、残留物に N,N-ジメチルホルムアミド 1mL を加えて溶かし、テトラエチルアンモニウムヒドロキシド試液 6 滴を加えるとき、液は赤紫色~紫色を呈する。
- (2) 紫外可視吸光度測定法：本品を粉末とし、表示量に従いブチルスコポラミン臭化物 0.1g に対応する量を取り、0.2mol/L 塩酸試液 100mL を加え、振り混ぜた後、ろ過する。ろ液につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 249~253nm, 255~259nm 及び 261~265nm に吸収の極大を示す。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

## 液体クロマトグラフ法

本品 20 個を取り、水 300mL を加え、時々振り混ぜながら超音波を用いて粒子を小さく分散させた後、水を加えて正確に 500mL とする。この液を遠心分離し、上澄液をメンブランフィルター（孔径 0.5  $\mu$ m 以下）でろ過する。初めのろ液約 3mL を除き、次のろ液 5mL を正確に量り、内標準溶液 3mL を正確に加え、試料溶液とする。別にブチルスコポラミン臭化物標準品を 105°C で 4 時間乾燥し、その約 0.02g を精密に量り、水に溶かし、正確に 50mL とする。この液 5mL を正確に量り、内標準溶液 3mL を正確に加え、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 20  $\mu$ L につき、次の条件で液体クロマトグラフ法により試験を行い、内標準物質のピーク面積に対するブチルスコポラミン臭化物のピーク面積の比  $Q_1$  及び  $Q_5$  を求める。

$$\begin{aligned} & \text{ブチルスコポラミン臭化物 (C}_{21}\text{H}_{30}\text{BrNO}_4\text{) の量 (mg)} \\ & = \text{ブチルスコポラミン臭化物標準品の量 (mg)} \times \frac{Q_1}{Q_5} \times 10 \end{aligned}$$

内標準溶液：パラオキシ安息香酸ブチルのメタノール溶液（1→5000）

## 操作条件

- 検出器：紫外吸光光度計（測定波長：220nm）
- カラム：内径約 4mm，長さ約 15cm のステンレス管に 5  $\mu$ m の液体クロマトグラフ用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。
- カラム温度：40°C 付近の一定温度
- 移動相：ラウリル硫酸ナトリウム 1.0g に水 350mL 及びメタノール 650mL を加えて溶かし、リン酸で pH3 に調整する。
- 流量：ブチルスコポラミンの保持時間が約 8 分になるように調整する。
- カラムの選定：標準溶液 20  $\mu$ L につき、上記の条件で操作するとき、内標準物質、ブチルスコポラミンの順に溶出し、それぞれのピークが完全に分離するものを用いる。

#### IV. 製剤に関する項目

---

##### 11. カ 価

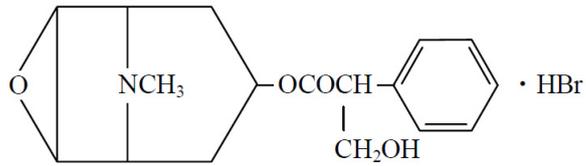
該当しない

##### 12. 混入する可能性のある夾雑物

類縁物質としてスコポラミン臭化水素酸塩の混在が予想される。

(1*S*, 2*S*, 4*R*, 5*R*, 7*S*)-9-Methyl-3-oxa-9-azatricyclo[3.3.1.0<sup>2,4</sup>]non-7-yl

(2*S*)-3-hydroxy-2-phenylpropanoate monohydrobromide



##### 13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

##### 14. そ の 他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

下記疾患における痙攣並びに運動機能亢進

胃・十二指腸潰瘍，食道痙攣，幽門痙攣，胃炎，腸炎，腸疝痛，痙攣性便秘，機能的下痢，胆のう・胆管炎，胆石症，胆道ジスキネジー，胆のう切除後の後遺症，尿路結石症，膀胱炎，月経困難症

### 2. 用法及び用量

通常成人には1回1～2錠（ブチルスコポラミン臭化物として10～20mg）を1日3～5回経口投与する。

なお，年齢，症状により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

該当しない

#### (2) 臨床効果

国内で実施された臨床試験54報の成績より，用法及び用量別の症例数ならびに有効例数が判明した470例のうち，1日量30～100mgを投与された群（頓用を除く）における有効率は327/416（78.6%）であり，承認された効能・効果に対する本剤の臨床効果が認められた。

投与疾患別有効率の内訳（経口投与）

投与対象	有効例数/ 効果判定例数	有効率
胃腸管の痙攣並びに運動機能亢進	276/351	78.6%
胆管の痙攣並びに運動機能障害	31/42	73.8%
尿路の痙攣	7/7	100.0%
女性性器の痙攣性状態	13/16	81.3%
合計	327/416	78.6%

（再評価申請資料）

注）本剤の承認された用法・用量

通常成人には1回1～2錠（ブチルスコポラミン臭化物として10～20mg）を1日3～5回経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減する。

#### (3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

---

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

腹痛を主訴とする消化性潰瘍患者 45 例においてブチルスコポラミン臭化物錠（20mg×3 回/日，7 日間）と Methylscopolammonium methylsulfate 錠（2mg×3 回/日，7 日間）との二重盲検試験の結果，鎮痛効果における有効率は，ブチルスコポラミン臭化物錠 18/22 例（81.8%），Methylscopolammonium methylsulfate 錠 19/23 例（82.6%）と，いずれも消化性潰瘍に有効であり，ほとんど差異は認められなかった。著効例はブチルスコポラミン臭化物錠 17/22 例（77.3%），Methylscopolammonium methylsulfate 錠 12/23 例（52.2%）でブチルスコポラミン臭化物錠がやや優っていた。<sup>1)</sup>

1) 吉田 完 ほか：臨床と研究 48：1522，1971

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当資料なし

## 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

アトロピン硫酸塩水和物

スコポラミン系化合物

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### ・ 作用部位

副交感神経支配の腹部中空臓器の壁内神経節

##### ・ 作用機序

副交感神経支配の腹部中空臓器の壁内神経節に作用し、神経刺激伝達を抑制して胃腸管、胆道、泌尿器及び女性生殖器の痙攣を緩解する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 動物での試験

##### ① 鎮痙作用

本薬及びアトロピン  $10^{-6}$ M は摘出腸管におけるピロカルピン誘発収縮をほぼ同程度に抑制した (モルモット)<sup>2)</sup>。

##### ② 消化管運動抑制作用

本薬及びアトロピン 0.1mg/kg 静脈内投与は空腸の自動運動を同程度に抑制した (バルーン法) (イヌ)<sup>2)</sup>。

VI. 薬効薬理に関する項目

③ 胃液分泌抑制作用

皮下投与により、基礎及び刺激時の胃液分泌量、酸分泌量、ペプシン分泌量を抑制した（ラット）<sup>3)</sup>。

胃液分泌に対する作用（ラット）

刺 激	薬 剤	胃液分泌 (ml)	塩酸分泌量 (mEq)	ペプシン (単位)
無 刺 激	対照	1.3	0.0256	436
	アトロピン	1.0	0.0263	不変
	ブチルスコポラミン臭化物	1.0	0.0166 <sup>*)</sup>	403
ヒスタミン 10mg/kg, s. c.	対照	3.8	0.1	1500
	アトロピン	2.3	0.08	782
	ブチルスコポラミン臭化物	1.5	0.007 <sup>*, +)</sup>	476
インシュリン 4E/kg, s. c.	対照	3.5	0.19	1315
	アトロピン	1.2 <sup>*)</sup>	0.05 <sup>*)</sup>	363 <sup>*)</sup>
	ブチルスコポラミン臭化物	0.5 <sup>*)</sup>	0.01 <sup>*, +)</sup>	184 <sup>*)</sup>
テトラペプチド 37.5E/kg, s. c.	対照	3.7	0.1	1736
	アトロピン	0.9 <sup>*)</sup>	0.04 <sup>*)</sup>	139 <sup>*)</sup>
	ブチルスコポラミン臭化物	0.3 <sup>*)</sup>	0.002 <sup>*, +)</sup>	134 <sup>*)</sup>

薬剤投与後6時間の値, n=10, 平均値

<sup>\*)</sup> 有意差あり (対 対照), <sup>+)</sup> 有意差あり (対 アトロピン), t-検定  
ブチルスコポラミン臭化物 200mg/kg, s. c., アトロピン 5mg/kg, s. c.

④ 膀胱内圧上昇抑制作用

静脈内投与により、カルバミルコリンによる膀胱内圧の上昇（ウサギ）<sup>4)</sup>ならびに電気刺激による膀胱収縮を抑制した（イヌ）<sup>5)</sup>。

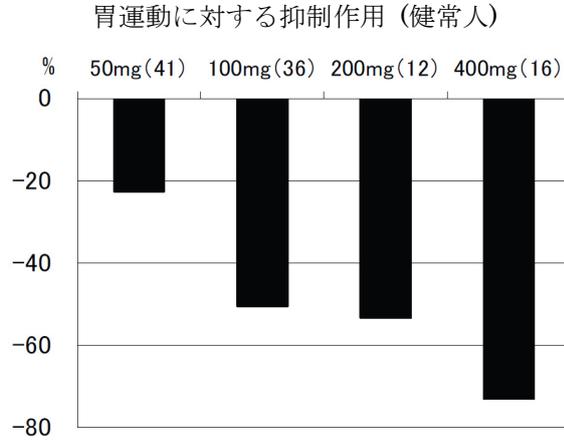
電気刺激によるイヌの膀胱収縮に対する抑制作用 (ED<sub>50</sub>, mg/kg)

薬 剤	静脈内投与	腸 間 膜 静脈内投与	十二指腸 静脈内投与
アトロピン硫酸塩水和物	0.01	0.05	4.5
ブチルスコポラミン臭化物	0.07	0.14	4.7

2) 臨床薬理

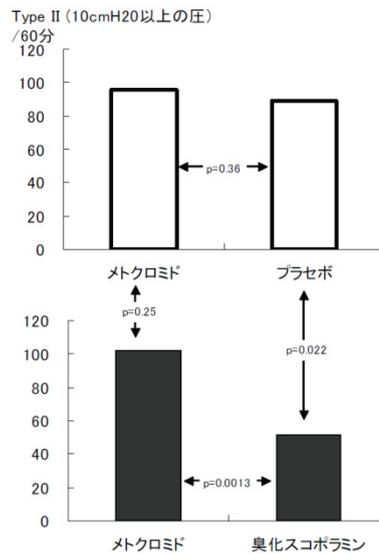
① 消化管運動抑制作用（外国人のデータ）

健康成人に胃，十二指腸内投与すると胃，小腸における自動運動及びメトクロプラミド投与による運動亢進を抑制した（バルーン法）<sup>6,7)</sup>。



プラセボに対する Type II 波（約 0.5 分まで持続する 5~10cmH<sub>2</sub>O 以上の圧を示す収縮）に対する抑制率 経胃的にプラセボあるいはブチルスコポラミン臭化物を投与（ ）：例数

メトクロプラミド刺激による十二指腸運動増大に対する作用（健康人）



メトクロプラミド（20mg），プラセボ及びブチルスコポラミン臭化物（12.5mg）は十二指腸内に投与

n=18, 交叉二重盲検法

VI. 薬効薬理に関する項目

② 胃液分泌抑制作用

(参考) ヒトに胃内、皮下及び静脈内投与すると、基礎及び刺激時の胃液分泌量、酸分泌量、ペプシン分泌量を抑制した<sup>8)</sup>。

Katsch-Kalk 法による胃液検査 (胃内投与)

時間 (分)	対 照				アトロピン硫酸塩水和物 (1mg)				ブチルスコポラミン臭化物 (30mg)			
	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量
前 15	65	81	54	3240	51	81	51	3200	52	86	58	3200
Katsch-Kalk 試験液 300ml 注入					Katsch-Kalk 試験液 +アトロピン硫酸塩水和物				Katsch-Kalk 試験液 +ブチルスコポラミン臭化物			
15	10	43	22		10	41	15		20	44	18	
30	12	66	36	2800	5	50	22	1600	12	60	29	2900
45	13	82	60		5	65	30		9	72	50	
60	12	98	65	3900	5	72	42	1900	10	85	52	3200
75	10	94	65		4	74	47		10	88	60	
90	11	90	62	3700	6	75	55	2500	12	92	64	3400
105	11	91	65		8	81	57		11	90	66	
120	12	91	70		7	86	67		10	90	70	
135	11	89	64		9	83	61		8	86	58	
150	10	86	58		15	80	54		8	82	52	
165	10	85	55	3900	18	83	57	4100	12	83	54	3900
180	10	85	52		25	82	60		20	77	56	

n=1, Katsch-Kalk 法 : カフェイン 0.3g を水 300ml に溶かし、1 滴のメチレンブルーを加え、約 15 分間隔で 15ml づつ胃液採取。

Katsch-Kalk 法による胃液検査 (静脈内投与)

時間 (分)	対 照				ブチルスコポラミン臭化物 (30mg)			
	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量
前 15	45	86	48	3200	40	80	46	3200
Katsch-Kalk 試験液 300ml 注入					Katsch-Kalk 試験液 300ml 注入			
15	25	42	20		28	40	20	
30	18	61	29	3000	21	65	30	2900
					ブチルスコポラミン臭化物 30mg, i. v.			
45	21	85	45		14	54	27	
60	20	96	61	3900	6	44	19	1280
75	15	90	58		5	43	18	
90	17	89	61	4700	5	45	20	1280
105	17	86	58		5	47	20	
120	15	77	48		6	46	30	
135	17	70	58		8	55	41	
150	16	82	52		9	64	48	
165	13	79	53	3900	16	72	57	4100
180	13	86	55		21	68	51	

n=1, Katsch-Kalk 法

## ヒスタミン刺激時の胃液検査（皮下投与）

時間 (分)	対 照				ブチルスコポラミン臭化物 (30mg)			
	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量
前 15	55	72	52	3800	54	76	54	3800
Katsch-Kalk 試験液 300ml 注入					Katsch-Kalk 試験液 300ml 注入			
15	30	39	23		27	43	25	
	ヒスタミン 0.5mg s. c.				ヒスタミン 0.5mg s. c.			
30	28	61	37	2600	25	57	35	2500
45	30	91	71		26	94	65	
					ブチルスコポラミン臭化物 30mg s. c.			
60	20	101	84	3200	15	97	68	2900
75	24	116	89		10	91	52	
90	19	112	82	3400	9	88	47	2100
105	15	107	77		10	72	44	
120	15	103	70		10	74	49	
135	15	99	80		8	72	41	
150	14	104	76		10	75	49	
165	17	109	77	3600	14	84	51	2800
180	15	94	63		11	68	53	

n=1, Katsch-Kalk 法

## インシュリン刺激時の胃液検査（静脈内投与）

時間 (分)	対 照				ブチルスコポラミン臭化物 (30mg)			
	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量	胃液量 (ml)	総酸度	遊 離 塩酸度	ペプシン 量
前 15	55	78	48	3100	68	82	47	3100
Katsch-Kalk 試験液 300ml 注入					Katsch-Kalk 試験液 300ml 注入			
15	30	33	22	1800	24	42	25	1600
	インシュリン 15 単位 s. c.				インシュリン 15 単位 s. c.			
30	20	42	25		22	48	31	
45	20	82	62		24	88	65	
60	23	105	81	4900	20	87	41	3100
					ブチルスコポラミン臭化物 30mg, i. v.			
75	20	107	78		5	68	25	
90	20	100	75	5600	7	71	23	2900
105	18	110	82		5	65	25	
120	22	106	78		8	70	35	
135	15	96	80		4	75	27	
150	12	98	72	4200	5	67	18	2300
165	15	90	72		5	63	20	
180	10	92	86		5	63	29	

n=1, Katsch-Kalk 法

VI. 薬効薬理に関する項目

③ 膵液（十二指腸液）分泌抑制作用

(参考) ヒトに静脈内投与すると、インシュリン及びグルタミン酸ソーダの十二指腸液分泌量を抑制した<sup>8)</sup>。なお、塩酸及びヒスタミン刺激時の十二指腸液分泌量、ジアスターゼ量には影響しなかった。

インシュリン刺激時の膵液（十二指腸液）分泌に対する作用（静脈内投与）

時間 (分)	対 照		ブチルスコポラミン臭化物 (30mg)	
	分泌量 (ml)	ジアスターゼ量 (単位)	分泌量 (ml)	ジアスターゼ量 (単位)
前 30	3.5	3600	3.5	3600
前 15	1.0	4100	1.1	4200
インシュリン 15 単位 s. c.			インシュリン 15 単位 s. c.	
15	1.5	3800	1.5	3700
30	2.0		1.8	
45	1.8		1.9	
60	7.0		6.8	
75	9.0	3000	8.7	3100
90	11.2		12.0	
105	12.5		12.5	
120	10.4	3000	11.2	1200
135	11.5		4.1	
150	10.5		2.5	
165	12.5		2.7	
180	10.0		2.0	

n=1

グルタミン酸ソーダ刺激時の膵液（十二指腸液）分泌に対する作用（静脈内投与）

時間 (分)	対 照		ブチルスコポラミン臭化物 (30mg)	
	分泌量 (ml)	ジアスターゼ量 (単位)	分泌量 (ml)	ジアスターゼ量 (単位)
前 45	2.6	4000	2.9	4000
前 30	1.7		1.4	
前 15	1.1		0.9	
グルタミン酸ソーダ 5g/50ml 水 i. v.			グルタミン酸ソーダ 5g/50ml 水 i. v.	
15	1.0	4600	0.8	4800
30	1.6		1.5	
45	1.5		1.0	
60	4.2		3.6	
75	7.9	3000	8.6	3200
90	12.0		10.6	
105	16.1		14.5	
120	9.1	3200	8.9	3000
135	8.9		6.5	
150	10.5		2.7	
165	9.0		2.6	
180	11.5		3.5	
195	9.8	3500	2.8	3000
210	9.2		2.7	

n=1

④ 胆のう収縮抑制作用（外国人のデータ）

健康成人に 10mg あるいは 30mg 静脈内投与すると、卵黄反射による胆のう収縮を抑制することが X 線撮影により認められた<sup>9,10)</sup>。

⑤ 膀胱内圧上昇抑制作用（外国人のデータ）

健康成人に 10mg 静脈内投与すると、カルバミルコリンによる膀胱内圧の上昇を抑制し、緊張を低下させた<sup>4)</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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

2 時間<sup>11)</sup> (参考：外国人のデータ 1 回 500mg 経口投与時, 健康成人)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

1%未満<sup>11-14)</sup> (参考：外国人のデータ)

(4) 消失速度定数

該当資料なし

## (5) クリアランス

静脈内投与後の全身クリアランス値は、1.2L/分であり、腎クリアランス値はその約1/2である<sup>11-14)</sup> (参考：外国人のデータ)。

## (6) 分布容積

静脈内投与後の分布容積 (V<sub>dss</sub>) は、128 Lである (参考：外国人のデータ 1回100 mg 静脈内投与時、健康成人<sup>11)</sup>)。

## (7) 血漿蛋白結合率

血漿蛋白結合率は低い<sup>12,15)</sup> (参考：外国人のデータ)。

## 3. 吸 収

本剤は第4級アンモニウム誘導体であるため、極性が高く、経口又は経直腸投与後ごく一部 (それぞれ8%, 3%) が吸収される<sup>16)</sup> (参考：外国人のデータ)。

## 4. 分 布

## (1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし (ヒト)

(参考：動物のデータ)

中枢神経系へはほとんど移行しない<sup>15)</sup> (ラット)。

## (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

(参考：動物のデータ)

消化管、胆嚢、胆管、肝臓、腎臓に分布<sup>15,17,18)</sup> (ラット)。

## 5. 代 謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

尿中に認められる主代謝物のムスカリン受容体との親和性は低い<sup>12, 19)</sup>。

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排 泄

### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

### (2) 排 泄 率

該当資料なし

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 透析等による除去率

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

## 1. 警告内容とその理由

該当しない

## 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

## 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

## (1) 出血性大腸炎の患者

[腸管出血性大腸菌（O157 等）や赤痢菌等の重篤な細菌性下痢患者では、症状の悪化、治療期間の延長をきたすおそれがある。]

## (2) 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。]

## (3) 前立腺肥大による排尿障害のある患者

[更に尿を出にくくすることがある。]

## (4) 重篤な心疾患のある患者

[心拍数を増加させ、症状を悪化させるおそれがある。]

## (5) 麻痺性イレウスの患者

[消化管運動を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。]

## (6) 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者

## 〔理由〕

## (1) 腸管出血性大腸菌（O157 等）や赤痢菌等の重篤な細菌性下痢患者では、症状の悪化、治療期間の延長をきたすおそれがある。

機序：抗コリン剤は腸管運動を抑制することにより排泄を遅らせ、腸管内での菌の増殖を容易にし、毒素の腸管内貯留を助長する可能性がある。

## (2) 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。

機序：抗コリン剤は毛様体筋を弛緩させて散瞳を生じ、前房水の流出を妨げる可能性がある。

## (3) 更に尿を出にくくすることがある。

機序：抗コリン剤は、排尿時の膀胱壁筋収縮を阻害する可能性がある。

## (4) 心拍数を増加させ、症状を悪化させるおそれがある。

機序：抗コリン剤は、心拍数を増加させる可能性がある。

## (5) 消化管運動を抑制し、症状を悪化させるおそれがある。

機序：抗コリン剤は消化管運動を抑制するため、消化管運動が麻痺する可能性がある。

## 【原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）】

## 細菌性下痢患者

[治療期間の延長をきたすおそれがある。]

## 〔理由〕

治療期間の延長をきたすおそれがある。

機序：抗コリン剤は腸管運動を抑制することにより排泄を遅らせ、腸管内での菌の増殖を容易にする可能性がある。

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

- |  |
|--|
| <p>(1) 前立腺肥大のある患者<br/>[尿を出にくくすることがある。]</p> <p>(2) うっ血性心不全のある患者<br/>[心拍数を増加させ、症状を悪化させるおそれがある。]</p> <p>(3) 不整脈のある患者<br/>[心拍数を増加させ、症状を悪化させるおそれがある。]</p> <p>(4) 潰瘍性大腸炎の患者<br/>[中毒性巨大結腸を起こすおそれがある。]</p> <p>(5) 甲状腺機能亢進症の患者<br/>[心拍数を増加させ、症状を悪化させるおそれがある。]</p> <p>(6) 高温環境にある患者<br/>[汗腺分泌を抑制し、体温調節を障害するおそれがある。]</p> <p>(7) 開放隅角緑内障の患者<br/>[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。]</p> |
|--|

[理由]

- (1) 尿を出にくくすることがある。  
機序：抗コリン剤は、排尿時の膀胱壁筋収縮を阻害する可能性がある。
- (2) (3) (5) 心拍数を増加させ、症状を悪化させるおそれがある。  
機序：抗コリン剤は、心拍数を増加させる可能性がある。
- (4) 中毒性巨大結腸を起こすおそれがある。  
機序：抗コリン剤は消化管運動を抑制するため、中毒性巨大結腸をおこすおそれがある。
- (6) 汗腺分泌を抑制し、体温調節を障害するおそれがある。  
機序：抗コリン剤は汗腺分泌を抑制する可能性がある。特に小児において体温調節がうまく行かないことがある。
- (7) 開放隅角緑内障に本剤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ため。

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

**重要な基本的注意**

目の調節障害等を起こすことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないように注意すること。

## 7. 相互作用

## (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

## (2) 併用注意とその理由

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
抗コリン作用を有する薬剤 三環系抗うつ剤 フェノチアジン系薬剤 モノアミン酸化酵素阻害剤 抗ヒスタミン剤等	抗コリン作用（口渇，便秘， 眼の調節障害等）が増強す ることがある。	併用により本剤の作用が増 強されることがある。
ドパミン拮抗剤 メトクロプラミド等	相互に消化管における作用 を減弱するおそれがある。	本剤は消化管運動を抑制す るため，ドパミン拮抗剤の 消化管運動亢進作用と拮抗 する。

## 8. 副作用

## (1) 副作用の概要

調査症例 767 例（再評価結果）中副作用が報告されたのは 152 例（19.82%）であった。  
 主な副作用は口渇 72 件（9.4%），便秘 34 件（4.4%），眼の調節障害 13 件（1.7%），心悸亢進  
 11 件（1.4%），鼓腸 5 件（0.65%）等であった。  
 また，臨床検査値においては特に一定の傾向を示す変動は認められていない。

## (2) 重大な副作用と初期症状

**ショック，アナフィラキシー様症状（頻度不明）：**  
 ショック，アナフィラキシー様症状（悪心・嘔吐，悪寒，皮膚蒼白，血圧低下，呼吸困難，気管  
 支攣縮，浮腫，血管浮腫等）があらわれることがあるので，観察を十分に行い，異常が認められ  
 た場合には投与を中止し，適切な処置を行うこと。

## (3) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には，症状に応じて適切な処置を行うこと。

	5%以上	0.1～5%未満	頻度不明
眼		調節障害	散瞳，閉塞隅角緑内障
消化器	口渇	腹部膨満感，鼓腸，便秘	
泌尿器		排尿障害	
精神神経系		頭痛，頭重感	
循環器		心悸亢進	
過敏症 <sup>注)</sup>		発疹	蕁麻疹，紅斑，そう痒症

注) このような症状があらわれた場合には，投与を中止すること。

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

（観察例数 767 例，経口投与）

副作用	発現件数	発現率 (%)
口 渇	72	9.4
便 秘	34	4.4
眼 の 調 節 障 害	13	1.7
心 悸 亢 進	11	1.4
鼓 腸	5	0.65
膨 満 感	3	0.39
頭 重 感	2	0.26
頭 痛	2	0.26
悪 心	2	0.26
発 疹	2	0.26
尿 閉	2	0.26
め ま い	1	0.13
睡 気	1	0.13
嘔 吐	1	0.13
硬 便	1	0.13
咽 喉 灼 熱 感	1	0.13
手 足 の し び れ	1	0.13

（再評価申請資料）

### (5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には，本剤を投与しないこと。

（2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）（21 ページ）参照）

## 9. 高齢者への投与

一般に高齢者では前立腺肥大を伴っている場合が多いので慎重に投与すること。

## 10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には，治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

## 11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

特に一定の傾向を示す変動は認められていない。

13. 過量投与

(1) 症状

過量投与した場合、口渇、眼の調節障害、せん妄、心悸亢進、血圧上昇等を引き起こす可能性がある。

(2) 処置

心血管系の症状が発現した場合は標準的な処置、呼吸麻痺の場合は挿管や人工呼吸、尿閉の場合は導尿を必要に応じて考慮すること。緑内障の場合は、眼科医などの適切な治療を受けること。

また、必要に応じ、副交感神経興奮薬の投与および適切な支持療法を行うこと。

14. 適用上の注意

薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。

[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない

## 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) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

ブチルスコポラミン臭化物とアトロピンの作用を、動物を用いて有効量で比較すると、ブチルスコポラミン臭化物は唾液分泌（ネコ<sup>2)</sup>）に対してはアトロピンの 1/50、心臓（イヌ<sup>2)</sup>）に対しては 1/30、眼（マウス<sup>2)</sup>）に対しては 1/500 の作用であることが認められている。

(4) 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

LD<sub>50</sub> (mg/kg)<sup>2)</sup>

	経口	皮下	静脈内
マウス	3,000	304	20

(2) 反復投与毒性試験

1) ラットに 0（コントロール）、10、500 及び 2000mg/kg を 28 日間経口投与したが、10 及び 500mg/kg 群に変化はなかった。

しかし、2000mg/kg 群に活動性及び胃腸管機能の抑制が認められ、又雄 4 匹と雌 7 匹が死亡した<sup>20)</sup>。

2) イヌに 5、10mg/kg を 7 日間静脈内投与したが、血液学的検査、血清生化学的検査、骨髄所見、尿検査値に異常は認められなかった<sup>21)</sup>。

3) ラットに 0（コントロール）、20、65、及び 200mg/kg を 26 週間経口投与したが症状、体重増加、摂水量、摂餌量、血液学的検査、血清生化学検査、尿検査、病理検査に変化は認められなかった<sup>22)</sup>。したがってラットの最大無作用量は 200mg/kg と推定した<sup>23)</sup>。

(3) 生殖発生毒性試験

胎児試験, 遺伝子変異性

胎児 (ラット, ウサギ) に及ぼす影響を試験したが, 薬物に起因すると考えられる異常所見及び催奇形作用は認められなかった<sup>24, 25)</sup>。

(4) 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 : 該当しない

有効成分 : 毒薬

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限 : 3年 (安定性試験の結果に基づく)

### 3. 貯法・保存条件

貯法 : 気密容器

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱いについて

本剤は苦味を有するために糖衣を施してあり、粉剤投与は推奨できない。

また、粉碎した後の安定性についても検討していない。

#### (2) 薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)

「VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 14」参照

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

100錠 (10錠×10) PTP

1000錠 (10錠×100) PTP

### 7. 容器の材質

PTPシート : ポリ塩化ビニルフィルム+アルミ箔

(PTPシート10枚単位で、ポリプロピレンフィルムによりバインド)

## 8. 同一成分・同効薬

## (1) 同一成分

ブスコパン注射液

## (2) 同効薬

アトロピン硫酸塩水和物, チメピジウム臭化物水和物, ブトロピウム臭化物 他

## 9. 国際誕生年月日

該当資料なし

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

	製造販売承認年月日	承認番号
ブスコパン錠 10mg	2008年9月5日	22000AMX02009000
参考：(旧製品) ブスコパン錠 (日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社)	1982年4月20日	(57AM輸) 第71号
参考：(旧製品) ブスコパン錠 (田辺製薬株式会社)	1955年3月17日	阪薬 2974号

\* 「ブスコパン錠 10mg」は、旧製品「ブスコパン錠」より販売名変更

## 11. 薬価基準収載年月日

	薬価基準収載年月日
ブスコパン錠 10mg	2008年12月19日
参考：(旧製品) ブスコパン錠	1955年9月1日

\* 「ブスコパン錠 10mg」は、旧製品「ブスコパン錠」より販売名変更

## 12. 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

13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容を参照

X. 管理的事項に関する項目

13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

○ 第8次再評価結果通知年月日：1976年4月28日

	再評価前	再評価後
効能又は効果	<p><b>胃腸管の痙攣ならびに運動機能亢進</b> 胃潰瘍，十二指腸潰瘍，胃炎，十二指腸炎，噴門痙攣，食道痙攣，腸疝痛，痙攣性便秘，幽門痙攣，臍部疝痛，胃切除後の急速排泄，空腸潰瘍，手術後の悪心・嘔吐，諸種の型の吃逆，痙攣性疼痛と炎症性疼痛との鑑別診断，蛔虫症による痙攣，蠕動亢進を主因とする下痢</p> <p><b>胆管の痙攣ならびに運動障害</b> 胆嚢炎，胆管炎，胆石症，胆石疝痛，胆嚢剥除後の症候群</p> <p><b>尿路の痙攣</b> 尿路結石，膀胱裏急後重，膀胱痛，器具挿入後の尿道ならびに膀胱痙攣</p> <p><b>女性性器の痙攣性状態</b> 分娩時の子宮下部弛緩遷延，不全流産の治療補助，月経困難症</p>	<p>下記疾患における痙攣並びに運動機能亢進 胃・十二指腸潰瘍，食道痙攣，幽門痙攣，胃炎，腸炎，腸疝痛，痙攣性便秘，機能的性下痢，胆のう・胆管炎，胆石症，胆道ジスキネジー，胆のう切除後の後遺症，尿路結石症，膀胱炎，月経困難症</p>
用法及び用量*	通常1回1～2錠を1日3～5回投与する。	通常成人には1回1～2錠（ブチルスコポラミン臭化物として10～20mg）を1日3～5回経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減する。

\*成人

○ 医療医薬品再評価結果（平成15年度その3）（品質再評価）通知年月日：2003年11月21日

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による投与期間の制限には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT 番号	厚生労働省薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード
ブスコパン錠 10mg	101797703	1242002F1330	620008704

17. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文 献

## 1. 引用文献

- 1) 吉田 完 他 : 臨床と研究 48(6) : 1522-1525, 1971 [BUC0001]
- 2) Wick H. : Arch Exp Pathol Pharmacol 213 : 485-500, 1951 [BUC0002]
- 3) Lick R. F., et al : Z Gastroenterol 5 : 275-281, 1967 [BUC0003]
- 4) Brosig W. : Z Urol Nephrol 46 : 456-466, 1953 [BUC0004]
- 5) Bauer R., et al : J Pharm Pharmacol 21 : 706-707, 1969 [BUC0005]
- 6) Schmid E., et al : Arzneimittelforschung 18 : 1449-1453, 1968 [BUC0006]
- 7) Schmid E., et al : Arzneimittelforschung 19 : 998-999, 1969 [BUC0007]
- 8) 梅野喬連 : 日本医科大学雑誌 26(12) : 1290-1295, 1959 [BUC0008]
- 9) Reinecke H. : Klin Wochenschr 31 : 465-469, 1953 [BUC0009]
- 10) Schnayder K., et al : Klin Med 9 : 74-79, 1954 [BUC0010]
- 11) 社内資料 : 薬物動態 (外国人データ) [BUC-01]
- 12) 社内資料 : 薬物動態 (外国人データ) [BUC-02]
- 13) 社内資料 : 薬物動態 (外国人データ) [BUC-03]
- 14) 社内資料 : 薬物動態 (外国人データ) [BUC-04]
- 15) 社内資料 : 薬物動態 (ラット) [BUC-05]
- 16) 社内資料 : 薬物動態 (外国人データ) [BUC-06]
- 17) 社内資料 : 薬物動態 (ラット) [BUC-07]
- 18) 社内資料 : 薬物動態 (ラット) [BUC-08]
- 19) 社内資料 : 薬物動態 (ラット) [BUC-09]
- 20) 社内資料 : 亜急性毒性試験 (ラット) [BUC-10]
- 21) 社内資料 : 急性毒性試験 (ラット、マウス)・亜急性毒性 (イヌ、サル) [BUC-11]
- 22) 社内資料 : 慢性毒性試験 (ラット) [BUC-12]
- 23) 社内資料 : 慢性毒性試験 (ラット) [BUC-13]
- 24) 社内資料 : 生殖発生毒性試験 (ラット) [BUC-14]
- 25) 社内資料 : 生殖発生毒性試験 (ウサギ) [BUC-15]

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

本邦における効能又は効果，用法及び用量は以下のとおりであり，外国での承認状況とは異なる。

#### 効能又は効果

下記疾患における痙攣並びに運動機能亢進

胃・十二指腸潰瘍，食道痙攣，幽門痙攣，胃炎，腸炎，腸疝痛，痙攣性便秘，機能性下痢，胆のう・胆管炎，胆石症，胆道ジスキネジー，胆のう切除後の後遺症，尿路結石症，膀胱炎，月経困難症

#### 用法及び用量

通常成人には1回1～2錠（ブチルスコポラミン臭化物として10～20mg）を1日3～5回経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減する。

#### 外国における発売状況

国名 イギリス

販売名 Buscopan Tablets

剤型・含量 糖衣錠 1錠中 ブチルスコポラミン臭化物 10mg 含有

効能・効果 尿生殖管又は消化管の痙攣の緩和，及び過敏性腸症候群の症状の緩和。

用法・用量 成人：1回2錠1日4回。

過敏性腸症候群の症状緩和には1回1錠1日3回から開始することが推奨され，必要であれば1回2錠1日4回まで増量可。

小児（6～12歳）：1回1錠1日3回。

国名 カナダ

販売名 Buscopan Tablets

剤型・含量 糖衣錠 1錠中 ブチルスコポラミン臭化物 10mg 含有

効能・効果 消化器系及び泌尿生殖器系の平滑筋の痙攣緩和。

用法・用量 成人：1日1～2錠（最大1日6錠まで）。

持続性の疾患で反復投与が必要な場合には，1回1錠を1日3～5回投与することが推奨される。

錠剤は上記の他，欧州・アジア・中南米諸国を含む世界102カ国で販売されている。（2006年現在）なお，スペインならびに中南米の販売国の一部においては，Buscapinaの名称で販売されている。

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備 考

その他の関連資料

該当資料なし

