

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

尿失禁・頻尿治療剤
日本薬局方プロピベリン塩酸塩錠
プロピベリン塩酸塩錠 10mg「YD」
プロピベリン塩酸塩錠 20mg「YD」
PROPIVERINE HYDROCHLORIDE TABLETS

剤形	フィルムコーティング錠	
製剤の規制区分	該当しない	
規格・含量	錠 10 mg:1錠中、プロピベリン塩酸塩 10mg 含有 錠 20 mg:1錠中、プロピベリン塩酸塩 20mg 含有	
一般名	和名:プロピベリン塩酸塩(JAN) 洋名:Propiverine Hydrochloride(JAN)	
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 発売年月日	製造販売承認年月日	2013 年 2 月 15 日
	薬価基準収載年月日	2013 年 6 月 21 日
	発売年月日	2005 年 7 月
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元:株式会社 陽進堂	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	株式会社陽進堂 お客様相談室 0120-647-734 医療関係者向けホームページ https://www.yoshindo.co.jp	

本 IF は 2023 年 10 月作成(第 1 版)の電子文書の記載に基づき作成した。最新の情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <https://www.pmda.go.jp/> にてご確認下さい。

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、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（<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に審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「I F記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたI Fは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。I Fの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、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PMD Aの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「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	V Ⅲ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	19
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	19
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	19
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	19
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	19
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	19
6. RMP の概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	19
II. 名称に関する項目	2	7. 相互作用	21
1. 販売名	2	8. 副作用	21
2. 一般名	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
3. 構造式又は示性式	2	10. 過量投与	22
4. 分子式及び分子量	2	11. 適用上の注意	23
5. 化学名（命名法）	2	12. その他の注意	23
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	I X. 非臨床試験に関する項目	24
III. 有効成分に関する項目	3	1. 薬理試験	24
1. 物理化学的性質	3	2. 毒性試験	24
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	X. 管理的事項に関する項目	25
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 規制区分	25
I V. 製剤に関する項目	4	2. 有効期間	25
1. 剤形	4	3. 包装状態での貯法	25
2. 製剤の組成	4	4. 取扱い上の注意	25
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	5. 患者向け資材	25
4. 力価	5	6. 同一成分・同効薬	25
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	7. 国際誕生年月日	25
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	8. 製造販売承認年月及び承認番号、薬価収載年月日、販売開始年月日	25
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	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容用	25
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	26
9. 溶出性	6	11. 再審査期間	26
10. 容器・包装	8	12. 投薬期間制限に関する情報	26
11. 別途提供される資材類	9	13. 各種コード	26
12. その他	9	14. 保険給付上の注意	26
V. 治療に関する項目	10	X I. 文献	27
1. 効能又は効果	10	1. 引用文献	27
2. 効能又は効果に関連する使用上の注意	10	2. その他の参考文献	27
3. 用法及び用量	10	X II. 参考資料	28
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意	10	1. 主な外国での発売状況	28
5. 臨床試験	10	2. 海外における臨床支援情報	28
V I. 薬効薬理に関する項目	14	X III. 備考	29
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	14	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	29
2. 薬理作用	14	2. その他の資料	29
V II. 薬物動態に関する項目	15		
1. 血中濃度の推移	15		
2. 薬物速度論的パラメータ	16		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	17		
4. 吸収	17		
5. 分布	17		
6. 代謝	18		
7. 排泄	18		
8. トランスポーターに関する情報	18		
9. 透析等による除去率	18		
10. 特定の背景を有する患者	18		
11. その他	18		

略 語 集

なし（個別に各項目において解説する）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

プロピペリン塩酸塩は抗コリン作用およびカルシウム拮抗作用により、膀胱平滑筋の異常収縮を抑制し、膀胱容量を増加させる尿失禁・頻尿治療剤である。

プロピペ錠 10mg 及びプロピペ錠 20mg は株式会社陽進堂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、平成 17 年 3 月に承認を得て、平成 17 年 7 月発売に至った。

平成 25 年 2 月に一般的名称を基本とした販売名変更品「プロピペリン塩酸塩錠 10mg「YD」」及び「プロピペリン塩酸塩錠 20mg「YD」」の承認取得後、平成 25 年 6 月の発売を経て現在に至っている。

2. 製品の治療学的特性

重大な副作用として、急性緑内障発作、尿閉、麻痺性イレウス、幻覚・せん妄、腎機能障害、横紋筋融解症、血小板減少、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、QT 延長、心室性頻拍、肝機能障害、黄疸が報告されている。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意）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
RMP	無
追加のリスク最小化活動としている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

(2023 年 10 月時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名

(1) 和名

プロピペリン塩酸塩錠 10mg 「YD」 プロピペリン塩酸塩錠 20mg 「YD」

(2) 洋名

PROPIVERINE HYDROCHLORIDE TABLETS

(3) 名称の由来

成分名＋剤形＋含量＋屋号

2．一般名

(1) 和名（命名法）

プロピペリン塩酸塩（JAN）

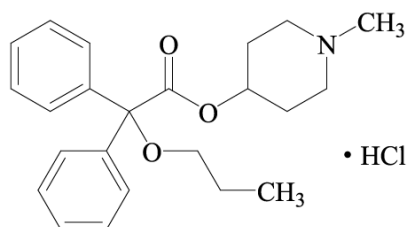
(2) 洋名（命名法）

Propiverine Hydrochloride（JAN）

(3) ステム

パパペリン作用を持つ鎮けい薬：-verine

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：C₂₃H₂₉NO₃・HCl 分子量：403.94

5．化学名（命名法）

1-Methylpiperidin-4-yl 2,2-diphenyl-2-propoxyacetate monohydrochloride (IUPAC)

6．慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水又はエタノール（99.5）にやや溶けやすい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

確認試験

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定（塩化カリウム錠剤法）

(3) 硝酸銀試液による沈殿反応（白色）

定量法

液体クロマトグラフィー

I V. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観および性状

販売名		プロピペリン塩酸塩錠 10mg「YD」	プロピペリン塩酸塩錠 20mg「YD」
性状		白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
直径/厚さ/重量		約 6mm/約 3.2 mm/100mg	約 7.1 mm/約 3 mm/125mg
形状	表面		
	裏面		
	側面		

(3) 識別コード

プロピペリン錠 10mg 「YD」：YD364

プロピペリン錠 20mg 「YD」：YD365

(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

	プロピペリン塩酸塩錠 10mg 「YD」	プロピペリン塩酸塩錠 20mg 「YD」
1 錠中の有効成分	プロピペリン塩酸塩 10mg	プロピペリン塩酸塩 20mg
添加剤	乳糖水和物、セルロース、ヒドロキシプロピルスターチ、カルメロース Ca、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸 Mg、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ	乳糖水和物、セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルスターチ、ステアリン酸 Mg、ヒプロメロース、マクロゴール、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ

(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²⁰⁾

＜加速試験＞

プロピペリン塩酸塩錠 10mg「YD」

試験項目	PTP包装	
	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95～105)	99.9	101.2

試験項目	バラ包装	
	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95～105)	99.5	99.8

プロピペリン塩酸塩錠 20mg「YD」

試験項目	PTP包装	
	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95～105)	100	100

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

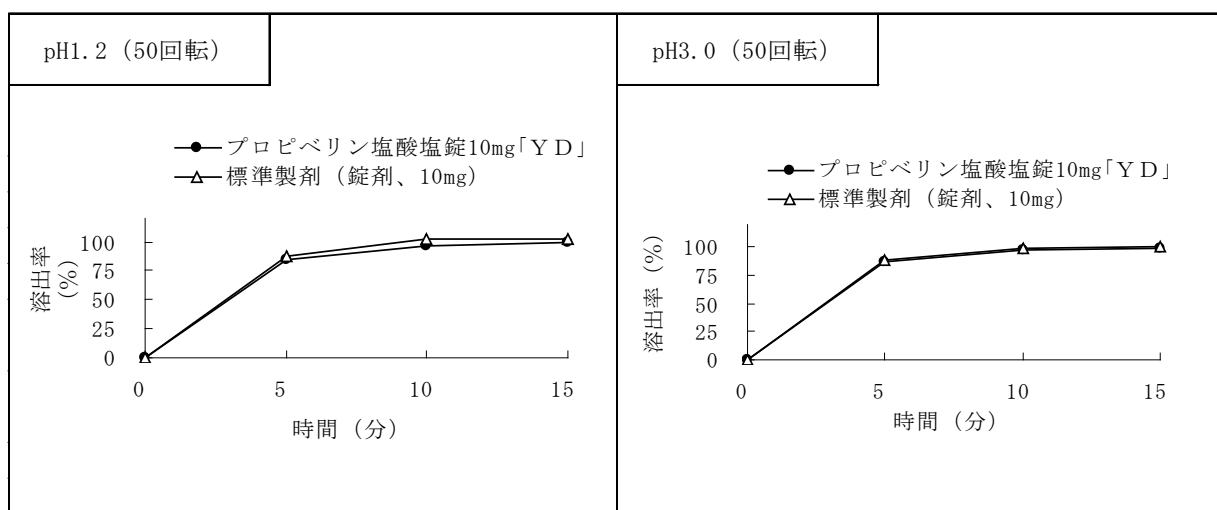
9. 溶出性^{4)、5)}

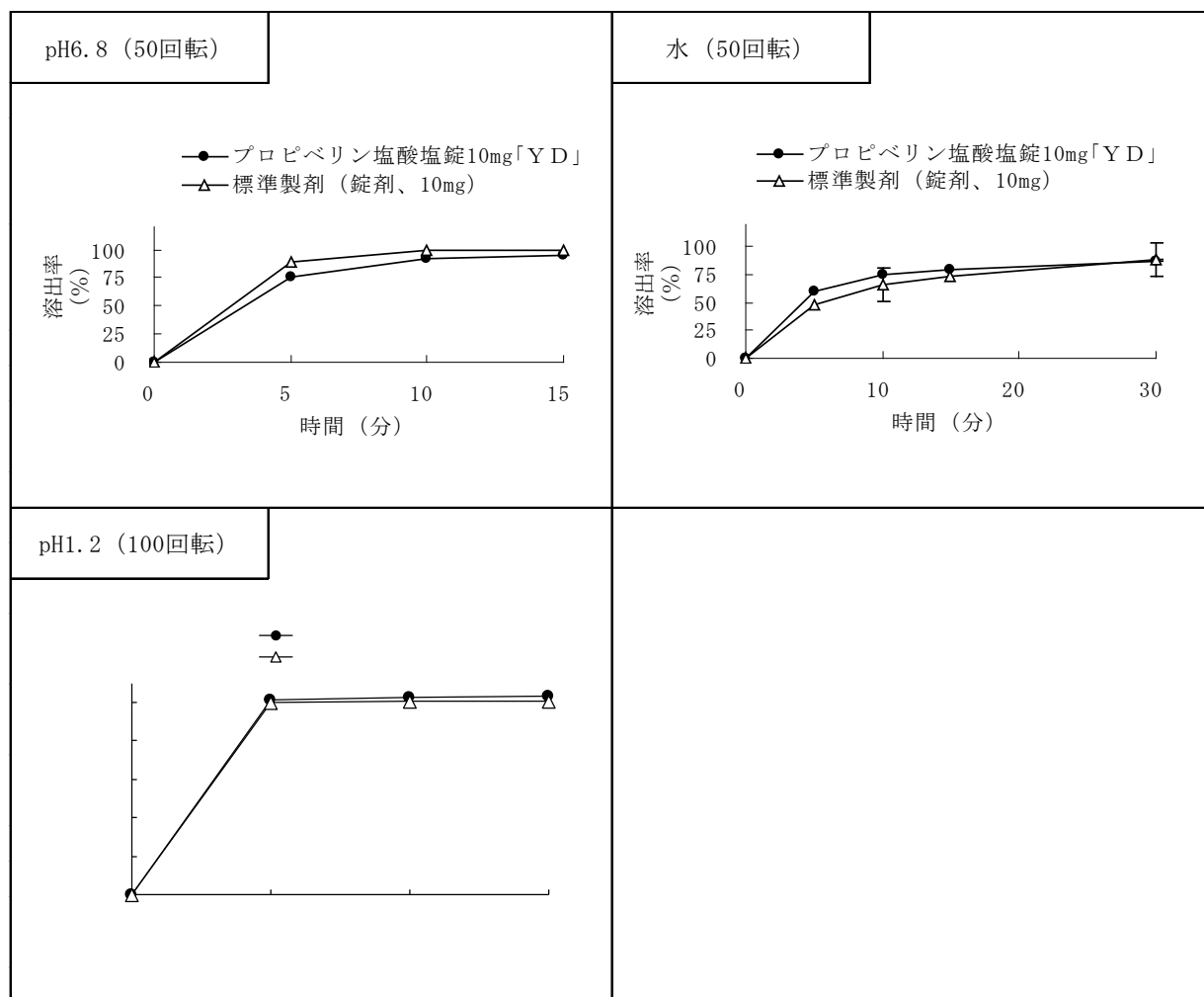
プロピペリン塩酸塩錠 10mg「YD」

装置	パドル法	温度	37±0.5℃
試験液量	900mL	回転数	50 回転・100 回転
試験液	pH1.2 - 日本薬局方溶出試験第1液 pH3.0 - 薄めた McIlvaine 緩衝液 pH6.8 - 日本薬局方溶出試験第2液 水		
ガイドライン	後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン		
判定基準	pH1.2、pH3.0、pH6.8		
	標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合、試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。		
	水		
	標準製剤が15分～30分に平均85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近の適当な2時点において、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。		

平均溶出率における判定結果

装置 (回転数)	試験液	ポイント	平均溶出率	
			標準製剤	試験製剤
パドル法 (50 回転)	pH1.2	15 分	102.4%	99.3%
	pH3.0	15 分	99.9%	98.6%
	pH6.8	15 分	99.0%	95.4%
	水	10 分	65.5%	75.0%
		30 分	88.9%	87.1%
パドル法 (100 回転)	pH1.2	15 分	100.6%	102.9%



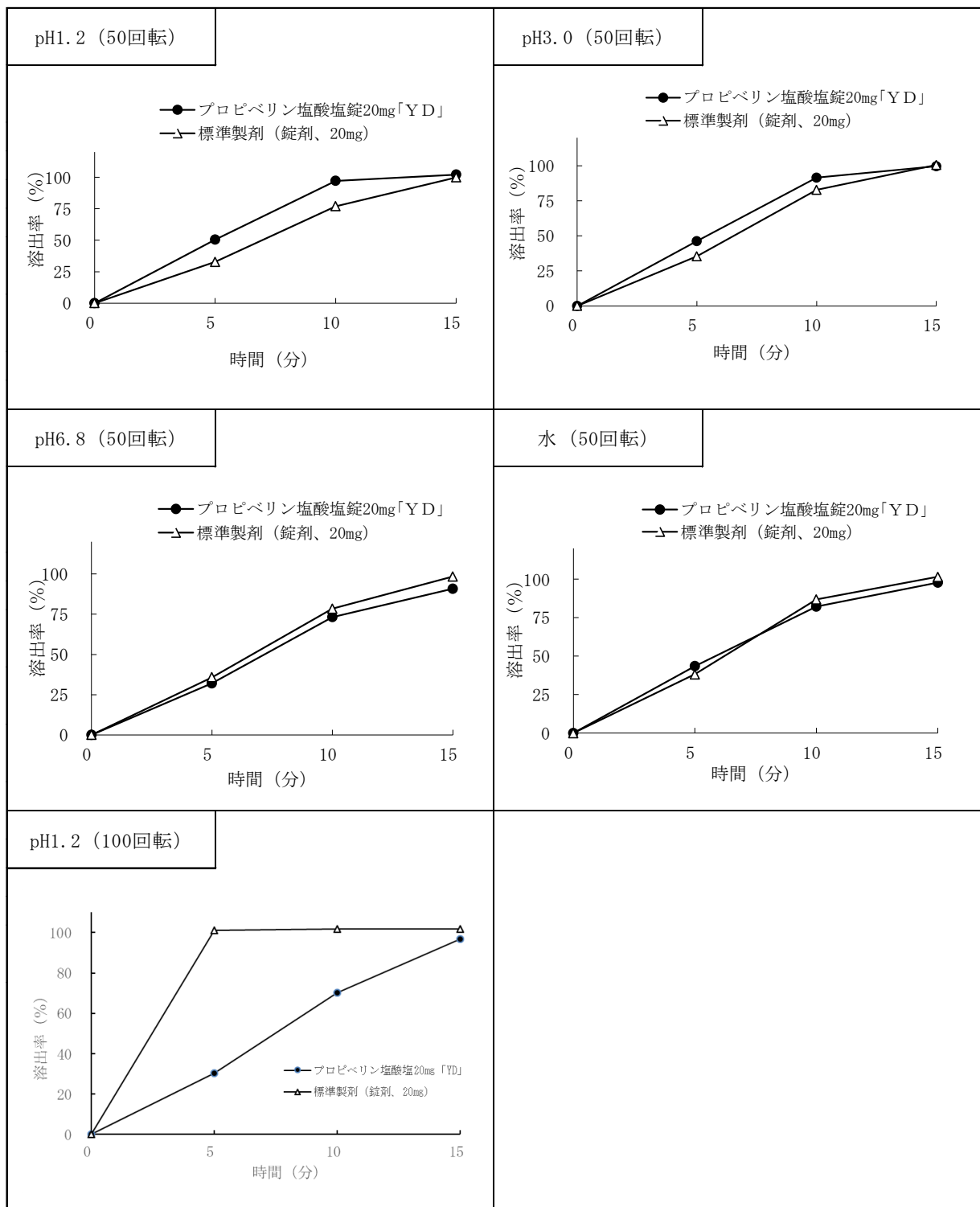


プロピペリン塩酸塩錠 20mg「YD」

装置	パドル法	温度	37±0.5℃
試験液量	900mL	回転数	50 回転・100 回転
試験液	pH1.2 - 日本薬局方溶出試験第1液 pH3.0 - 薄めた McIlvaine 緩衝液 pH6.8 - 日本薬局方溶出試験第2液 水		
ガイドライン	後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン		
判定基準	pH1.2、pH3.0、pH6.8、水		
	標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合、試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。		

平均溶出率における判定結果

装置 (回転数)	試験液	ポイント	平均溶出率	
			標準製剤	試験製剤
パドル法 (50 回転)	pH1.2	15 分	88.0%	95.1%
	pH3.0	15 分	95.5%	95.0%
	pH6.8	15 分	91.9%	94.5%
	水	15 分	97.9%	92.4%
パドル法 (100 回転)	pH1.2	15 分	96.9%	101.9%



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

	プロピペリン塩酸塩 10mg「YD」	プロピペリン塩酸塩錠 20 mg「YD」
PTP	100 錠	100 錠
バラ	500 錠 (アルミ袋)	－

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

	プロピペリン塩酸塩 10mg「YD」	プロピペリン塩酸塩錠 20 mg「YD」
PTP	アルミニウム箔、ポリ塩化ビニルフィルム	
バラ	アルミニウム・ポリエチレン・ポリエチレンテレフタレートラミネート袋	－

1 1. 別途提供される資材類

該当資料なし

1 2. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- 下記疾患又は状態における頻尿、尿失禁
- 神経因性膀胱、神経性頻尿、不安定膀胱、膀胱刺激状態
(慢性膀胱炎、慢性前立腺炎)
- 過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁

2. 効能又は効果に関連する使用上の注意

- 5.1 本剤を適用する際、十分な問診により臨床症状を確認するとともに、類似の症状を呈する疾患（尿路感染症、尿路結石、膀胱癌や前立腺癌等の下部尿路における新生物等）があることに留意し、尿検査等により除外診断を実施すること。なお、必要に応じて専門的な検査も考慮すること。
- 5.2 下部尿路閉塞疾患（前立腺肥大症等）を合併している患者では、それに対する治療を優先させること。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

通常、成人にはプロピペリン塩酸塩として 20mg を 1 日 1 回食後経口投与する。年齢、症状により適宜増減するが、効果不十分の場合は、20mg を 1 日 2 回まで増量できる。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当記載なし

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意

7. 用法及び用量に関連する注意

20mg を 1 日 1 回投与で効果不十分であり、かつ安全性に問題がない場合に増量を検討すること。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

16.1 血中濃度

健康成人男子にプロピペリン塩酸塩 20mg を経口投与し、血漿中の未変化体及び代謝物を測定した²⁾。

16.1.1 単回投与

単回投与における未変化体とその主代謝物である 1-メチル-4-ピペリジルジフェニルプロポキシ酢酸 *N*-オキシド（プロピペリン塩酸塩の *N*-オキシド体であり、以下 M-1 と略す。）及び 1-メチル-4-ピペリジルベンジル酸 *N*-オキシド（M-1 の脱プロピル体であり、以下 M-2 と略す。）の薬物動態パラメータは以下のとおりであった²⁾。

	Tmax (hr)	Cmax (ng/mL)	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	t _{1/2} (hr)
未変化体	1.67±0.52	52.42±17.32	559.97±167.17	14.78±3.12※ ¹
M-1	1.04±0.40	682.41±151.02	5540.65±1349.29	9.60±1.12
M-2	1.69±0.48	9.50±2.23	117.88±23.33	10.07±1.95※ ²

(平均値±標準偏差、n=16、ただし※¹：n=15、※²：n=5)

16.1.2 反復投与

1 日 1 回、7 日間反復投与における未変化体の血漿中濃度は 4 日目まで漸次上昇し、以降 4～7 日の投与期間中はほぼ一定した値を示し、投与終了後の半減期は約 25 時間であった。一方、主代謝物である M-1 の血漿中濃度は未変化体同様の推移を示し、投与終了後の半減期は約 14 時間であった³⁾。

(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 有効性及び安全性に関する試験

〈下記疾患又は状態における頻尿、尿失禁

神経因性膀胱、神経性頻尿、不安定膀胱、膀胱刺激状態（慢性膀胱炎、慢性前立腺炎）〉

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

頻尿・尿失禁を主訴とした神経因性膀胱及び不安定膀胱患者を対象としたプラセボ対照二重盲検比較試験において、プロピペリン塩酸塩 20mg 又はプラセボを 1 日 1 回経口投与した結果、プロピペリン塩酸塩の全般改善度評価可能症例は 64 例で、改善率（有効以上）は 51.6%（33/64 例）で優越性が検証された（U-test：p<0.01、 χ^2 -test：p<0.01）。

プロピペリン塩酸塩の副作用評価可能症例は 65 例であり、副作用発現率は 6.2%（4/65 例）であった。主な副作用は口渇 3.1%（2/65 例）であった⁷⁾。さらに頻尿を主訴とした神経性頻尿及び刺激膀胱患者を対象としたフラボキサート塩酸塩対照二重盲検比較試験において、プロピペリン塩酸塩 20mg を 1 日 1 回経口投与又はフラボキサート塩酸塩 1 日 600mg を毎食後 3 回投与した結果、プロピペリン塩酸塩の全般改善度評価可能

症例は 96 例で、改善率（有効以上）は 45.8%（44/96 例）で優越性が検証された（U-test： $p < 0.05$ 、 χ^2 -test： $p < 0.05$ ）。

プロピペリン塩酸塩の副作用評価可能症例は 100 例であり、副作用発現率は 25%（25/100 例）であった。主な副作用は口渇 15%（15/100 例）、排尿困難 4%（4/100 例）、腹痛 3%（3/100 例）、頭痛 2%（2/100 例）であった⁸⁾。

〈過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁〉

17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験

過活動膀胱患者を対象にプロピペリン塩酸塩 20mg を 1 日 1 回経口投与した無作為化二重盲検並行群間比較試験（投与期間：12 週間）における成績は以下のとおりであった。主要評価項目である 24 時間あたりの平均排尿回数の変化量、副次評価項目である 24 時間あたりの平均尿意切迫感回数の変化量及び 24 時間あたりの平均切迫性尿失禁回数の変化量に関してプロピペリン塩酸塩 20mg 群がプラセボ群に比し有意な減少が認められた。プロピペリン塩酸塩の副作用評価可能症例は 291 例であり、副作用発現率は 27.5%（80/291 例）であった。主な副作用は口渇 19.6%（57/291 例）、便秘 6.2%（18/291 例）等であった^{9), 10)}。

最終評価時の 24 時間あたりの平均排尿回数変化量

投与群	症例数	投与前値		最終評価時変化量			
		平均値	標準偏差	平均値	標準偏差	両側 95%信頼区間	
						下限	上限
プラセボ	270	11.10	2.52	-1.36	1.67	-1.56	-1.16
プロピペリン塩酸塩 20mg	284	11.03	2.16	-1.86	1.86	-2.07	-1.64

最終評価時の 24 時間あたりの平均尿意切迫感回数変化量

投与群	症例数	投与前値		最終評価時変化量			
		平均値	標準偏差	平均値	標準偏差	両側 95%信頼区間	
						下限	上限
プラセボ	270	4.17	3.01	-1.99	2.59	-2.30	-1.68
プロピペリン塩酸塩 20mg	284	4.33	2.92	-2.84	2.52	-3.13	-2.54

最終評価時の 24 時間あたりの平均切迫性尿失禁回数変化量

投与群	症例数	投与前値		最終評価時変化量			
		平均値	標準偏差	平均値	標準偏差	両側 95%信頼区間	
						下限	上限
プラセボ	229	1.22	1.05	-0.68	1.04	-0.81	-0.54
プロピペリン塩酸塩 20mg	231	1.61	1.84	-1.18	1.64	-1.40	-0.97

17.1.3 国内第Ⅲ相高用量試験

プロピペリン塩酸塩 20mg を 1 日 1 回投与で効果不十分な過活動膀胱患者を対象に、プロピペリン塩酸塩 20mg を 1 日 2 回へ増量した高用量試験（非盲検非対照試験）（投与期間：12 週間）の結果、評価対象 44 例において過活動膀胱の主症状である排尿回数、尿意切迫感及び切迫性尿失禁のすべての症状に対して増量前後で有意差が認められた。副作用評価可能症例は 45 例であり、副作用発現率は 42.2%（19/45 例）であった。主な副作用は口渇 24.4%（11/45 例）、便秘 15.6%（7/45 例）等であった¹¹⁾。

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

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当しない

V I . 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

フラボキサート塩酸塩、オキシブチニン塩酸塩、酒石酸トルテロジン

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

摘出膀胱においてアセチルコリン及び塩化カリウム収縮を抑制し¹²⁾、ムスカリン受容体への親和性を有し¹³⁾、アトロピンで抑制されない経壁電気刺激収縮の抑制作用を示す¹⁴⁾。また、骨盤神経の切断末梢端刺激による膀胱収縮が抑制されることより、プロピペリン塩酸塩の作用は膀胱平滑筋側にあることが示唆される¹⁵⁾。一方、主代謝物である M-1 は平滑筋直接作用を、M-2 は抗コリン作用を有する。

プロピペリン塩酸塩は平滑筋直接作用及び抗コリン作用を有し、主として平滑筋直接作用により排尿運動抑制作用を示すと推定される¹²⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 生体位膀胱の排尿運動抑制作用

18.2.1 膀胱容量の増加作用

麻酔ラット及びイヌを用いたシストメトリーにおいて最大膀胱容量の増加作用を、また、除脳イヌを用いたシストメトリーにおいて最大膀胱容量並びに有効膀胱容量（1回排尿量）の増加作用を示すが、残尿量の有意な増加は認められなかった^{16)~19)}。

18.2.2 排尿運動の抑制作用

麻酔ラット及びイヌにおいて膀胱充満時の律動的収縮（排尿運動）の回数減少が認められた^{16), 17)}。

18.2.3 電気刺激による膀胱収縮の抑制作用

骨盤神経を切断した麻酔イヌにおいて骨盤神経の電気刺激による膀胱収縮力の低下作用が認められた¹⁵⁾。

18.3 摘出膀胱に対する作用

膀胱平滑筋においてアセチルコリン及び塩化カリウムによる収縮（ラット、イヌ及びモルモット）と経壁電気刺激による収縮（ラット、イヌ）の抑制が用量依存的に認められた^{12), 14)}。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

V II. 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

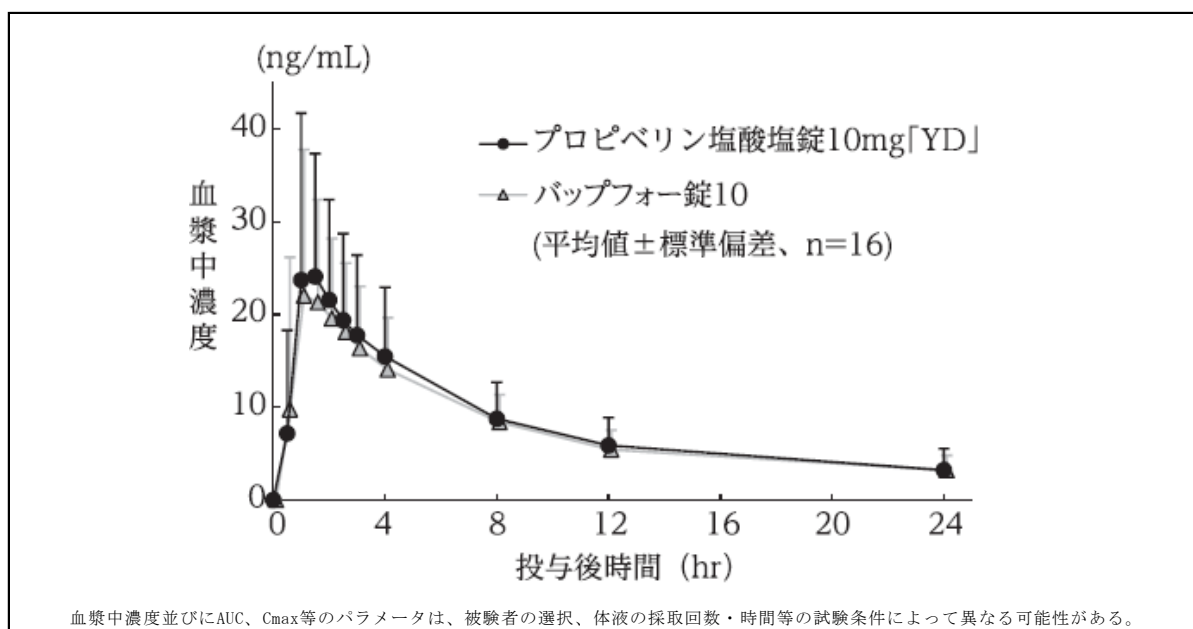
(2) 臨床試験で確認された血中濃度^{4), 5)}

プロピペリン塩酸塩錠 10 mg 「YD」

ガイドライン	後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン
概要	プロピペリン塩酸塩錠 10mg 「YD」 とバップフォー錠 10 をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（プロピペリン塩酸塩として 10mg）、健康成人男子 16 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した
結果	本試験より得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）を統計的に解析したところ、両剤は生物学的に同等と推定された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
プロピペリン塩酸塩錠 10mg 「YD」	201.6 ± 104.4	26.9 ± 16.3	1.4 ± 0.4	7.8 ± 1.5
バップフォー錠 10	189.2 ± 82.1	24.9 ± 13.6	1.4 ± 0.5	8.3 ± 1.2

平均値 ± 標準偏差 n=16

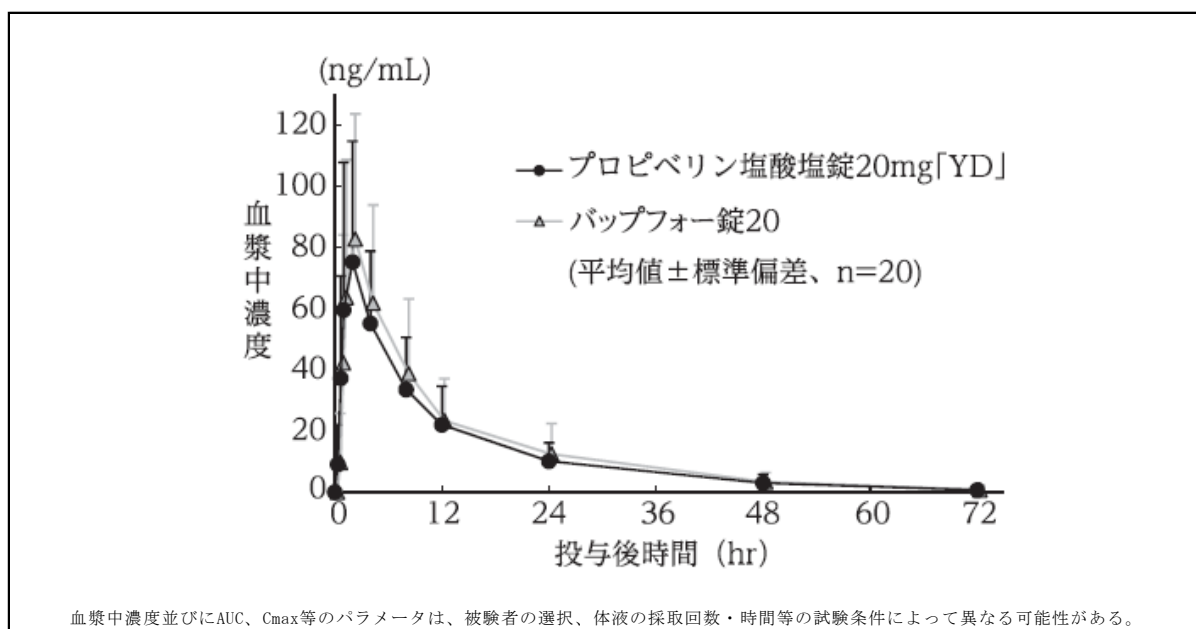


プロピペリン塩酸塩錠 20 mg 「YD」

ガイドライン	後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン
概要	プロピペリン塩酸塩錠 20mg 「YD」 とバップフォー錠 20 をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（プロピペリン塩酸塩として 20mg）、健康成人男子 20 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。
結果	本試験より得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）を統計的に解析したところ、両剤は生物学的に同等と推定された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
プロピペリン塩酸塩錠 20mg 「YD」	904.3 ± 501.8	78.9 ± 43.8	1.9 ± 0.6	12.6 ± 3.8
バップフォー錠 20	1021.6 ± 645.0	86.1 ± 44.7	2.1 ± 0.8	12.4 ± 3.3

平均値 ± 標準偏差 n=20



(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

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

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

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

プロピペリン塩酸塩から主代謝物 M-1 への代謝には主として CYP3A4 が関与する³⁾。[9.3.1 参照]

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄経路及び排泄率

健康成人男子にプロピペリン塩酸塩 20mg を単回経口投与した時の 0～48 時間尿には代謝物である M-1、M-2 及び 2,2-ジフェニル-5-メチル-1,4-ジオキサン-3-オンなどが主に排泄され、それらの尿中総排泄量は投与量の約 16%であった⁶⁾。
[9.2.1 参照]

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

V Ⅲ. 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 幽門、十二指腸又は腸管が閉塞している患者〔胃腸の平滑筋の収縮及び運動が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.3 参照〕

2.2 胃アトニー又は腸アトニーのある患者〔抗コリン作用により症状が悪化するおそれがある。〕

2.3 尿閉を有する患者〔抗コリン作用により排尿時の膀胱収縮が抑制され、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.2 参照〕

2.4 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、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.1 参照〕

2.5 重症筋無力症の患者〔抗コリン作用により症状が悪化するおそれがある。〕

2.6 重篤な心疾患の患者〔期外収縮等が報告されており、症状が悪化するおそれがある。〕〔11.1.9 参照〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

V. 治療に関する項目 2. 効能又は効果に関連する使用上の注意 参照

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

V. 治療に関する項目 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 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

眼調節障害、眠気、めまいがあらわれることがあるので、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十分に注意すること。

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 排尿困難のある患者

前立腺肥大症等では排尿困難が更に悪化又は残尿が増加するおそれがある。〔11.1.2 参照〕

9.1.2 緑内障の患者（閉塞隅角緑内障の患者を除く）

閉塞隅角緑内障以外でも抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状が悪化するおそれがある。 [11.1.1 参照]

9.1.3 不整脈又はその既往歴のある患者

期外収縮等が報告されており、症状が悪化又は再発するおそれがある。
[11.1.9 参照]

9.1.4 パーキンソン症状又は脳血管障害のある患者

症状の悪化あるいは精神神経症状があらわれるおそれがある。

9.1.5 潰瘍性大腸炎のある患者

中毒性巨大結腸があらわれるおそれがある。

9.1.6 甲状腺機能亢進症の患者

抗コリン作用により頻脈等の交感神経興奮症状が悪化するおそれがある。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 腎障害又はその既往歴のある患者

腎排泄が減少し、副作用が発現しやすいおそれがある。 [16.5参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 肝障害又はその既往歴のある患者

主として肝で代謝されるため、副作用が発現しやすいおそれがある。 [16.4 参照]

(4) 生殖能を有するもの

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投与しないことが望ましい。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている¹⁾。

(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

安全性を考慮して 10mg/日より投与を開始するなど慎重に投与すること。肝機能、腎機能が低下していることが多い。

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
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	口渇、便秘、排尿困難等があらわれるおそれがある。	抗コリン作用が増強されるおそれがある。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 急性緑内障発作（頻度不明）

眼圧亢進、嘔気・頭痛を伴う眼痛、視力低下等があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、直ちに適切な処置を行うこと。〔2.4、9.1.2参照〕

11.1.2 尿閉（0.62%）

〔2.3、9.1.1参照〕

11.1.3 麻痺性イレウス（頻度不明）

著しい便秘、腹部膨満等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。〔2.1参照〕

11.1.4 幻覚・せん妄（0.25%）

11.1.5 腎機能障害（頻度不明）

BUN、血中クレアチニンの上昇があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.6 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.7 血小板減少 (0.12%)
11.1.8 皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群) (頻度不明) 発熱、紅斑、そう痒感、眼充血、口内炎等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
11.1.9 QT延長 (0.25%)、心室性頻拍 (頻度不明) QT延長、心室性頻拍、房室ブロック、徐脈等があらわれることがある。[2.6、9.1.3参照]
11.1.10 肝機能障害 (1.0%)、黄疸 (頻度不明) AST、ALT、 γ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	5%以上	0.1～5%未満	頻度不明
消化器	口渇 (12.8%)	便秘、腹痛、嘔気・嘔吐、食欲不振、下痢、口内炎	消化不良、舌炎
泌尿器		排尿困難、残尿	尿意消失
精神神経系		めまい、頭痛、しびれ、眠気	意識障害 (見当識障害、一過性健忘)、パーキンソン症状 (すくみ足、小刻み歩行等の歩行障害、振戦等)、ジスキネジア
循環器		血圧上昇	動悸、徐脈、期外収縮、胸部不快感
過敏症		そう痒、発疹、蕁麻疹	
眼		調節障害、眼球乾燥	
肝臓		AST 上昇、ALT 上昇、ALP 上昇	
腎臓			BUN 上昇、クレアチニン上昇
血液		白血球減少	
その他		浮腫、脱力感、味覚異常	倦怠感、咽頭部痛、腰痛、嘔声、痰のからみ

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

13.1 症状

せん妄、興奮、全身痙攣、歩行障害、言語障害、散瞳、麻痺性イレウス、尿閉、頻脈、血圧上昇、全身紅潮、肝機能障害等。

13.2 処置

胃洗浄し、次にアトロピン過量投与の場合と同様の処置を行う。例えば、ネオスチグミン (抗コリン症状に対して)、抗不安剤、補液等の対症療法を行う。

1 1. 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。

1 2. 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

15.2 非臨床試験に基づく情報

雌雄ラット及びマウスに 2 年間経口投与したところ、雄ラットにおいて臨床用量の 122 倍 (49mg/kg/日) 投与群に腎腫瘍、雄マウスにおいて臨床用量の 447 倍 (179mg/kg/日) 投与群に肝腫瘍の発生率が対照群に比べ高いとの報告がある。

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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(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

製剤：処方箋医薬品

原薬：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

該当しない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし くすりのしおり：あり

その他の患者向資材：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分：バップフォー錠

同効薬：フラボキサート塩酸塩、オキシブチニン塩酸塩、酒石酸トルテロジン

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価収載年月日、販売開始年月日

製品名	製造販売 承認年月	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
プロピペリン塩酸塩 錠 10mg「YD」	2013 年 2 月 15 日	22500AMX00511	2013 年 6 月 21 日	2005 年 7 月
プロピペリン塩酸塩 錠 20mg「YD」	2013 年 2 月 15 日	22500AMX00512	2013 年 6 月 21 日	2005 年 7 月

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月及びその内容

変更品目名：プロピペ錠 10mg、プロピペ錠 20mg（旧販売名）

変更年月日：2010 年 8 月 3 日

変更内容：効能・効果に「過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁」を追加し、それに伴い用法・用量を変更した。

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

該当しない

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別医薬品 コード (YJ コード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算 処理システム用 コード
プロピペリン塩酸塩錠 10mg「YD」	2590007F1013	2590007F1269	116886001	621688601
プロピペリン塩酸塩錠 20mg「YD」	2590007F2257	2590007F2257	116887701	621688701

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文献

1. 引用文献

23. 主要文献

- 1) 宇田和彦 他：薬物動態. 1989 ; 4(5) : 581-593
- 2) 西村貴子 他：薬理と治療. 2006 ; 34(7) : 859-867
- 3) 第十八改正日本薬局方解説書廣川書店. 2021 ; C5060-5063
- 4) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験（錠 10mg）
- 5) (株)陽進堂社内資料：生物学的同等性試験（錠 20mg）
- 6) 釘宮豊城 他：臨床薬理. 1990 ; 21(3) : 555-565
- 7) 高安久雄 他：医学のあゆみ. 1990 ; 153(8) : 459-471
- 8) 高安久雄他：西日本泌尿器科. 1990 ; 52(2) : 248-258
- 9) Gotoh, M. et al. : Int. J. Urol. 2011 ; 18(5) : 365-373
- 10) 国内第Ⅲ相比較試験（過活動膀胱患者）（バップフォー錠/細粒：2009 年 12 月 18 日承認、審査報告書）
- 11) 横山修 他：泌尿器外科. 2011 ; 24(6) : 1023-1030
- 12) 春野明弘他：日本薬理学雑誌. 1989 ; 94(2) : 145-150
- 13) 長尾光啓他：日本薬理学雑誌. 1999 ; 113(3) : 157-166
- 14) 金子茂 他：日本薬理学雑誌. 1999 ; 113(3) : 145-156
- 15) 金子茂 他：日本薬理学雑誌. 1989 ; 94(2) : 151-157
- 16) 金子茂 他：日本薬理学雑誌. 1989 ; 93(2) : 55-60
- 17) 野村鳴夫他：日本薬理学雑誌. 1989 ; 94(3) : 173-180
- 18) 金子茂 他：日本薬理学雑誌. 1990 ; 95(2) : 55-61
- 19) 土田正義 他：泌尿器科紀要. 1990 ; 36(8) : 915-919(63)
- 20) (株)陽進堂社内資料：安定性資料

2. その他の文献

該当資料なし

XⅡ． 参考資料

1． 主な外国での発売状況

該当しない

2． 海外における臨床支援情報

該当しない

XⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

個別に照会すること。

照会先：お客様相談室 0120 - 647 - 734

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること。

照会先：お客様相談室 0120 - 647 - 734

2. その他の関連資料

該当資料なし

