

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2013に準拠して作成

活性型ビタミンB6製剤

ピリドキサールリン酸エステル水和物錠

ピドキサール錠10mg[®]

ピドキサール錠20mg[®]

ピドキサール錠30mg[®]

PYDOXAL[®] Tablets

剤 形	白色糖衣錠（腸溶錠）		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	1錠中：日局ピリドキサールリン酸エステル水和物 ピドキサール錠10mg……………10mg 含有 ピドキサール錠20mg……………20mg 含有 ピドキサール錠30mg……………30mg 含有		
一般名	和名：ピリドキサールリン酸エステル水和物（JAN） 洋名：Pyridoxal Phosphate Hydrate（JAN）		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日 (販売名変更による)	薬価基準収載年月日 (販売名変更による)	発売年月日
	錠10mg	2002年1月28日	2002年7月5日
	錠20mg	2002年1月28日	2002年7月5日
	錠30mg	2002年1月28日	2002年7月5日
開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元 太陽ファルマ株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	太陽ファルマ株式会社 お客様相談室 TEL：0120-533-030 受付時間 9:00-17:30（土・日・祝・弊社休日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.taiyo-pharma.co.jp/		

本IFは2023年2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 <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

I F 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

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、I F と略す）の位置付け並びに I F 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 I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、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、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F を紙媒体の冊子として提供する方式から、P D F 等の電磁的データとして提供すること（e – I F）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e – I F が提供されることとなった。

最新版の e – I F は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ (<http://www.pmda.go.jp/>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e – I F を掲載する医薬品医療機器総合機構ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e – I F の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. I F とは

I F 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 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、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。

【I F の様式】

- 規格は A 4 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。

- ② I F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「I F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。

[I F の作成]

- ① I F 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。
 - ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
 - ③添付文書の内容を補完するとの I F 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「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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（P D F）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

〔 I F の発行 〕

- ①「I F 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 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、「I F 記載要領 2013」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 I F が改訂される。

3. I Fの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、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ある。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構ホームページに掲載場所が設定されている。製薬企業は「医薬品インター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、隨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総合機構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があり、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

I F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。I F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、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。

(2013年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	V. 治療に関する項目
1. 開発の経緯 1	1. 効能又は効果 7
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 1	2. 用法及び用量 7
	3. 臨床成績 7
II. 名称に関する項目	VII. 薬効薬理に関する項目
1. 販売名 2	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 9
2. 一般名 2	2. 薬理作用 9
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. C A S 登録番号 2	
III. 有効成分に関する項目	VIII. 薬物動態に関する項目
1. 物理化学的性質 3	1. 血中濃度の推移・測定法 10
2. 有効成分の各種条件下における安定性 3	2. 薬物速度論的パラメータ 10
3. 有効成分の確認試験法 3	3. 吸収 11
4. 有効成分の定量法 3	4. 分布 11
	5. 代謝 11
IV. 製剤に関する項目	6. 排泄 12
1. 剤形 4	7. トランスポーターに関する情報 12
2. 製剤の組成 4	8. 透析等による除去率 12
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 4	
4. 製剤の各種条件下における安定性 5	
5. 調製法及び溶解後の安定性 5	
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） 5	
7. 溶出性 5	
8. 生物学的試験法 5	
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 5	
10. 製剤中の有効成分の定量法 5	
11. 力値 5	
12. 混入する可能性のある夾雑物 6	
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器 に関する情報 6	
14. その他 6	
	V. 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 13
	2. 禁忌内容とその理由 13
	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由 13
	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由 13
	5. 重要な基本的注意とその理由 13
	6. 特定の背景を有する患者に関する注意と その理由 13
	7. 相互作用 13
	8. 副作用 14
	9. 高齢者への投与 14
	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 14
	11. 小児等への投与 15
	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 15
	13. 過量投与 15

14. 適用上の注意	15
15. その他の注意	15
16. その他	15

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	16
2. 毒性試験	16

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	17
2. 有効期間又は使用期限	17
3. 貯法・保存条件	17
4. 薬剤取扱い上の注意点	17
5. 承認条件等	17
6. 包装	17
7. 容器の材質	17
8. 同一成分・同効薬	17
9. 國際誕生年月日	18
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	18
11. 薬価基準収載年月日	18
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	18
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	18
14. 再審査期間	18
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	18
16. 各種コード	18
17. 保険給付上の注意	18

XI. 文献

1. 引用文献	19
2. その他の参考文献	19

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	20
2. 海外における臨床支援情報	20

XIII. 備考

その他の関連資料	21
----------	----

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ビタミン B₆はネズミの抗皮膚炎因子として 1934 年 György によって発見され、酵母・米糠・肝臓などより抽出された。その後 Kuhn、Keresztesy により構造が決定され、Harris らの研究グループによって合成され 2-Methyl-3-hydroxy-4,5-hydroxymethylpyridine (Adermin または Pyridoxine) と呼ばれた。今日ビタミン B₆といえば慣習的にピリドキシン (PIN)、ピリドキサール (PAL)、ピリドキサミン (PAM) の 3 種をさす。¹⁾

これらの生体内誘導体の一つがピリドキサールリン酸エステル水和物 (PAL-P) である。

2019 年 1 月、太陽ファルマ株式会社は中外製薬株式会社から製造販売を承継した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

ビタミン B₆は、生体内で補酵素として蛋白質代謝のほか、炭水化物や脂質代謝にも関与する。そして、生体内において実際にビタミン B₆としてこれらの作用をするのは主にピリドキサールリン酸エステルであるということが明らかにされている。

ピドキサール錠は、このピリドキサールリン酸エステル水和物を製剤化したもので、活性型ビタミン B₆として効果を発揮する。

ピドキサール錠は、使用成績調査等を実施していないため、副作用発現頻度は不明である（再審査対象外）。主な副作用として、発疹等の過敏症状、恶心、食欲不振、腹部膨満感、下痢、嘔吐等の消化器症状、肝機能異常があらわれることがある。

また、重大な副作用として、新生児、乳幼児に大量に用いた場合に横紋筋融解症が報告されている。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ピドキサール[®] 錠 10mg

ピドキサール[®] 錠 20mg

ピドキサール[®] 錠 30mg

(2) 洋名

PYDOXAL[®] Tablets 10mg

PYDOXAL[®] Tablets 20mg

PYDOXAL[®] Tablets 30mg

(3) 名称の由来

Pyridoxal (一般名の一部) より

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

ピリドキサールリン酸エステル水和物 (JAN)

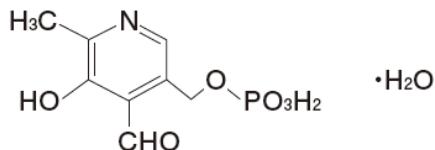
(2) 洋名 (命名法)

Pyridoxal Phosphate Hydrate (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

分子式 : C₈H₁₀NO₆P · H₂O

分子量 : 265.16

5. 化学名

(4-Formyl-5-hydroxy-6-methylpyridin-3-yl)methyl dihydrogenphosphate monohydrate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号 : PAL-P、PLP

治験番号 : CG-A3H

7. C A S 登録番号

54-47-7

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

微黄白色～淡黄色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水に溶けにくく、エタノール（99.5）にほとんど溶けない。

希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

(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

pH：本品 0.1g を水 200mL に溶かした液の pH は 3.0～3.5 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は光によって淡紅色となる。

3. 有効成分の確認試験法

日局ピリドキサールリン酸エステル水和物確認試験による。

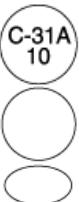
4. 有効成分の定量法

日局ピリドキサールリン酸エステル水和物定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	ピドキサール錠 10mg	ピドキサール錠 20mg	ピドキサール錠 30mg
色・剤形	白色糖衣錠（腸溶錠）		
外形			
直径	8.2mm	8.2mm	9.1mm
厚さ	4.4mm	4.4mm	4.8mm
総重量	約 240mg	約 240mg	約 300mg

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

販売名	ピドキサール錠 10mg	ピドキサール錠 20mg	ピドキサール錠 30mg
識別コード	C-31A 10	C-31A 20	C-31A 30

(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：日局ピリドキサールリン酸エステル水和物
 ピドキサール錠 10mg……………10mg
 ピドキサール錠 20mg……………20mg
 ピドキサール錠 30mg……………30mg

(2) 添加物

クエン酸カルシウム水和物、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、タルク、ヒプロメロースフタル酸エステル、白色セラック、白糖、沈降炭酸カルシウム、酸化チタン、ゼラチン、ヒマシ油、グリセリン脂肪酸エステル、アラビアゴム末、ステアリン酸マグネシウム、ポリオキシエチレン(160)ポリオキシプロピレン(30)グリコール、ステアリン酸、カルナウバロウ

(3) その他

該当しない

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 (包装)	保存期間	結果
室温	PTP 包装 スチール缶*	36 カ月	変化なし

試験項目：性状、定量、溶出性等

*スチール缶は 10mg 錠のみ

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（物理化学的変化）

該当資料なし

7. 溶出性

日本薬局方外医薬品規格 第三部「ピリドキサールリン酸エステル腸溶錠」による。

[pH1.2]

(方法) 日本薬局方溶出試験法（パドル法）により試験を行う。

条件：回転数 100 回転

試験液 ラウリル硫酸ナトリウムの崩壊試験法の第 1 液溶液 (1→10000)

[pH6.8]

(方法) 日本薬局方溶出試験法（パドル法）により試験を行う。

条件：回転数 100 回転

試験液 ラウリル硫酸ナトリウムの pH6.8 のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液溶液 (1→10000)

溶出規格

表示量	pH	規定時間	溶出率
10mg	1.2	120 分	5%以下
	6.8	90 分	85%以上
20mg	1.2	120 分	5%以下
	6.8	90 分	85%以上
30mg	1.2	120 分	5%以下
	6.8	90 分	85%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塩化第二鉄試液による呈色反応
- ②紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雜物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外觀が特殊な容器に関する情報

該当しない

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

4. 効能又は効果

- (1) ビタミンB6欠乏症の予防及び治療（薬物投与によるものを含む。例えばイソニアジド）
- (2) ビタミンB6の需要が増大し、食事からの摂取が不十分な際の補給（消耗性疾患、妊娠婦、授乳婦等）
- (3) ビタミンB6依存症（ビタミンB6反応性貧血等）
- (4) 下記疾患のうち、ビタミンB6の欠乏又は代謝障害が関与すると推定される場合
 - ・口角炎、口唇炎、舌炎、口内炎
 - ・急・慢性湿疹、脂漏性湿疹、接触皮膚炎、アトピー皮膚炎
 - ・尋常性痤瘡
 - ・末梢神経炎
 - ・放射線障害（宿醉）
- (4) の適用（効能又は効果）に対して、効果がないのに月余にわたって漫然と使用すべきでない。

2. 用法及び用量

6. 用法及び用量

ピリドキサールリン酸エステル水和物として、通常、成人1日10～60mgを1～3回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
極めてまれであるが、依存症の場合には、より大量を用いる必要のある場合もある。

7. 用法及び用量に関する注意

依存症に大量を用いる必要のある場合は観察を十分に行なながら投与すること。特に新生児、乳幼児への投与は少量から徐々に增量し、症状に適合した投与量に到達させること。[9.7.1、11.1.1参照]

＜解説＞

同一成分他剤で、ビタミンB₆依存症に対する大量投与において、因果関係の否定できない横紋筋融解症等の副作用発症例が報告されたため、厚生省医薬安全局安全対策課長事務連絡（平成11年7月16日付）に基づき記載した。

3. 臨床成績

（1）臨床データパッケージ

該当しない

（2）臨床効果

脂漏性皮膚炎を中心とした皮膚疾患に対する二重盲検試験において有用性が認められている²⁾。

（3）臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

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²⁾

目的	主として脂漏性湿疹に対するピドキサール錠の効果を、プラセボを用いた二重盲検法により検討する（ピドキサール群：29例、プラセボ群：27例）。
投与方法	1日 60mg 1回 20mg を、4～106日間食後経口投与した。
結果	脂漏性皮膚炎では、ピドキサール投与症例中全治2例、略治5例、軽快10例、やや軽快3例、不变1例で、軽快以上を有効とすれば21例中17例（有効率81%）を数えた。これに対してプラセボ投与症例では、症状の軽快したものは15例中4例（26.6%）であった。また、副作用は認められなかった。

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）

該当しない

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

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ピリドキシン、ピリドキサミン等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ピリドキサールリン酸エステルは、補酵素として数多くの酵素に関与しているが、代表的なものとして、アミノ基転移酵素 (Transaminase)、キヌレンイン分解酵素 (Kynureninase)、アミノ酸脱炭酸酵素 (Aminoacid decarboxylase)、脱水素酵素 (Dehydrase)、モノアミン酸化酵素 (Monoamine oxidase) ヒスタミン分解酵素 (Histaminase) 等があげられている。³⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

①ビタミン B₆欠乏食飼育ラットでは体重減少、運動遲鈍、刺激感受性増加とともに acrodynia (人の脂漏性湿疹に類似) が発症する。これらの症状はピリドキサールリン酸エステル投与により回復した。⁴⁾

②体重 160g の Wistar 系雄性ラットに対し、致死量に近い (LD₉₆) 放射線量 955R を照射してピリドキサールリン酸エステルの防護効果を検討した。効果判定は照射 30 日後の生存率にて行った。

ピリドキサールリン酸エステルは照射 5 分前に投与した場合最も良く防護し、静脈内投与の場合がより良い結果を示した。

別に犬を用いた実験においてもピリドキサールリン酸エステルの効果は認められた。⁵⁾

放射線照射に対する防護効果

投与量 (mg/匹)	投与から放射線照射までの時間 (分)	投与経路	ラット数 (匹)	30 日後生存数 (%)
15	5	i.p.	46	11 (24)
25	5	i.p.	43	12 (28)
25	30	i.p.	44	4 (9)
12.5	5	i.v.	57	33 (70)
コントロール、無処置			50	2 (4)

③ビタミン B₆依存性痙攣症状を有する 1 歳半の男児と、対照として B₆ 依存性障害をもたない 3 例のバイオプシーにより得られた腎皮質組織についてグルタミン酸脱炭酸酵素活性を測定し、次の結果を得た。

¹⁴C-グルタミン酸からの ¹⁴CO₂ 生成量は患者の腎ホモジエネートを用いた場合と対照腎ホモジエネートとの間には有意差がなかったが、反応系にピリドキサールリン酸エステルを添加した場合は対照腎ホモジエネートよりも患者の腎ホモジエネートの方が、¹⁴CO₂ 生成が著明に増加した。

¹⁴C-グルタミン酸から GABA への ¹⁴C のとり込みは、反応系にピリドキサールリン酸エステルを添加しない場合は、患者腎ホモジエネートは対照に比して著明に低下しているが、大量のピリドキサールリン酸エステルを添加すると著しく増加する。⁶⁾

(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

「VII-1 (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項を参照のこと。

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

腎障害の認められない患者各3例にピリドキサールリン酸エステル水和物10mg、30mgを単回投与した場合の血中総ビタミンB₆濃度推移は下記の通りであった。⁷⁾

投与量	血中総ビタミンB ₆ 濃度 (ng/mL)				
	投与前	投与後			
		1時間	2時間	4時間	6時間
10mg	14	98	257	106	96
30mg	12	236	—	361	218

〈参考：イヌ〉

ピドキサール錠10mgを空腹状態のビーグル犬12頭(9.0～10.8kg)に経口投与し、ピドキサールリン酸エステルの経時的血中濃度変化、最高血中濃度到達時間(T_{max})、最高血中濃度(C_{max})、血中濃度一時間曲線下面積(AUC)、消失半減期(T_{1/2})を求めた。⁸⁾

	経過時間 (hr)						
	0.5	1	2	4	6	8	24
血中濃度 (μ g/mL)	0.155±0.350	0.778±0.670	0.827±0.191	0.430±0.141	0.278±0.087	0.179±0.069	0.043±0.050

mean (n=12) ± S.D.

T _{max} (hr)	C _{max} (μ g/mL)	AUC ₀₋₈ (hr · μ g/mL)	AUC ₀₋₂₄ (hr · μ g/mL)	T _{1/2} (hr)
1.38±0.57	1.142±0.341	3.409±0.803	5.184±1.596	2.57±0.40

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 7. 相互作用」の項を参照のこと。

(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) 解析方法

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

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

腸管より吸収される。

4. 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

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

該当資料なし

(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

主として尿中へ排泄される。

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 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

該当しない

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. 重要な基本的注意とその理由

該当しない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意とその理由

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.7 小児等

9.7.1 新生児、乳幼児に大量に用いた場合、横紋筋融解症、下痢、嘔吐、肝機能異常等の副作用があらわれることがある。 [7.、11.1.1参照]

9.7.2 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

「VIII-1 1. 小児等への投与」を参照すること。

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

10. 相互作用

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
レボドパ	レボドパの作用を減弱することがある。	ピリドキシンがレボドパの末梢での脱炭酸化を促進し、脳内作用部位への到達量を減少させ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 副作用

11.1.1 重大な副作用

11.1.1.1 横紋筋融解症 (頻度不明)

新生児、乳幼児に大量に用いた場合、CK上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれ、急性腎障害等の重篤な腎障害に至ることがある。[7.、9.7.1参考]

〈解説〉

ビタミンB₆製剤の小児への大量投与において、横紋筋融解症の報告が集積されたため、厚生労働省医薬食品局安全対策課長事務連絡（平成19年9月21日付）に基づき記載した。

「V-2. 用法及び用量」「VIII-11. 小児等への投与」の項を参照のこと。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	発疹等の過敏症状
消化器	恶心、食欲不振、腹部膨満感、下痢 ^{注)} 、嘔吐 ^{注)}
肝臓 ^{注)}	肝機能異常

注) 新生児、乳幼児に大量に用いた場合、認められたとの報告がある。

(3) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(4) 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

該当しない

(5) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

9. 高齢者への投与

該当しない

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

該当しない

11. 小児等への投与

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.7 小児等

9.7.1 新生児、乳幼児に大量に用いた場合、横紋筋融解症、下痢、嘔吐、肝機能異常等の副作用があらわれることがある。 [7.、11.1.1 参照]

9.7.2 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

〈解説〉

9.7.1 新生児、乳幼児に大量に用いた際に、横紋筋融解症、下痢、嘔吐、肝機能異常があらわれることがあることから、厚生労働省医薬食品局安全対策課長事務連絡（平成19年9月21日付）に基づき記載した。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

該当しない

（参考）

「V-2. 用法及び用量」 「VIII-11. 小児等への投与」の項を参照のこと。

14. 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。

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

- ①チロキシン投与ラットの肝臓ではビタミン B₆ 酵素活性が減少し、ビタミン B₆ 要求量が増加する。これはピリドキサールリン酸エステルにより回復する。大腸菌でもビタミン B₆ 酵素 Decarboxylase、Tryptophanase は 1-チロキシンにより比較的低濃度で阻害され、ピリドキサールリン酸エステルで回復する。また、ピリドキサールリン酸エステルは組織呼吸に阻害的に作用すること、ラットの甲状腺ホルモンの生合成を阻害することも知られている。¹⁾
- ②Wistar 系ラット (130g～260g) にトキソピリミジン (2-Methyl-4-oxymethyl-6-aminopyrimidin) 水溶液を 150mg/kg の割合で経口投与すると、投与後 3～4 時間で大半に反復性の劇烈な突発性 Spring krampf (running fit) がおこり、時には間代一強直性痙攣を経て死亡する。そこでトキソピリミジン投与と同時に、ビタミン B₆ 及びその誘導体の非完全痙攣抑制量を投与した時には、痙攣初発時間の延長と、痙攣回数の減少がみられる。動物の半数に痙攣抑制をおこす ED₅₀ をみると、ピリドキシン塩酸塩、二塩酸ピリドキサミン、ピリドキサールリン酸エステルは、大体効力は等しく、ピリドキサールはこれらの 2 倍、他のビタミン B₆ 誘導体はいずれもこれらより効力が弱い。⁹⁾

(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

ピリドキサールリン酸エステル水和物の LD₅₀

動物	経口 (mg/kg)	皮下 (mg/kg)	筋肉内 (mg/kg)
マウス	4,640	870	—
ラット	5,900	850	—
ネコ	—	—	250

ビタミン B₆ 投与によりマウスで呼吸促進、めまい、痙攣発作、ラットで興奮痙攣、ネコで唾液漏、嘔吐、痙攣などが見られた。¹⁰⁾

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

マウスに、経口で 12mg/kg、1,000mg/kg、皮下注で 8mg/kg、250mg/kg、妊娠 7 日目より連続 6 日間投与した結果、いずれの投与でも胎児毒性、胎児の奇形、出生児の発育異常は認められなかった。

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的項目に関する事項

1. 規制区分

製剤：該当しない

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

有効期間：3年（包装に表示の使用期限内に使用すること）

3. 貯法・保存条件

貯法：室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱い上の留意点について

該当しない

（2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII-14. 適用上の注意」参照

くすりのしおり：有

（3）調剤時の留意点について

複数の含量規格があるため、製品の表示、色調、デザイン等に注意し、取り違えないこと。

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

販売名	包装
ピドキサール錠 10mg	100錠（PTP10錠×10）、500錠（PTP10錠×50）、2100錠（PTP21錠×100）、1000錠（バラ）
ピドキサール錠 20mg	100錠（PTP10錠×10）、500錠（PTP10錠×50）
ピドキサール錠 30mg	100錠（PTP10錠×10）、500錠（PTP10錠×50）

7. 容器の材質

容器の種類	容器の材質
PTP 包装（100、500錠）	成形シート：ポリ塩化ビニル、アルミニウム バンド：ポリプロピレン
PTP 包装（2100錠）	成形シート：ポリ塩化ビニル、アルミニウム バンド：ポリエチレン
バラ包装	缶：スチール 袋：ポリエチレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ピドキサール注 10mg、ピドキサール注 30mg（太陽ファルマ） 他

同 効 薬：ピリドキシン塩酸塩、リン酸ピリドキサールカルシウム

9. 國際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
ピドキサール錠 10mg	2002年1月28日	21400AMZ00058
ピドキサール錠 20mg	2002年1月28日	21400AMZ00059
ピドキサール錠 30mg	2002年1月28日	21400AMZ00060

(旧販売名) ピドキサール錠 (10mg、20mg、30mg)

承認年月日 : 1965年3月17日

承認番号 : 14000AZZ01028

11. 薬価基準収載年月日

2002年7月5日

(旧販売名) ピドキサール錠 (10mg、20mg、30mg)

	薬価基準収載年月日	経過措置期間終了年月日
錠 10mg	1965年11月1日	2003年3月31日
錠 20mg	1969年1月1日	
錠 30mg	1965年12月1日	

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

1976年4月28日の再評価結果第8次公示により、効能又は効果、用法及び用量の一部を変更した。

「V-1. 効能又は効果」「V-2. 用法及び用量」の項を参照のこと。

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知年月日 : 1976年4月28日

「適応の一部について有用性が認められるもの」と判定され、

「有効であることが推定できるものと判定されたの適用（効能又は効果）に対して、効果がないのに月余にわたって漫然と使用すべきでない。」とされた。

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

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁) 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
ピドキサール錠 10mg	107013202	3134003F1388	610463157
ピドキサール錠 20mg	107029302	3134003F2147	610463158
ピドキサール錠 30mg	107035402	3134003F3330	610463159

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文獻

1. 引用文献

- 1) 山田弘三：現代内科学体系、代謝異常(III)(中山書店), 1966 : 273-309
- 2) 坂本邦樹, 他 : 臨床皮膚泌尿器科, 1964 ; 18 : 1145-1147
- 3) Holtz, P.,et al. : Pharm.Rev., 1964 ; 16(2) : 113-178
- 4) 竹内勝 : 日本皮膚科学会雑誌, 1963 ; 73(7) : 497
- 5) Ladner, H. A.,et al. : Naturwissenschaften, 1964 ; 51(17) : 407-408
- 6) Yoshida, T.,et al. : Tohoku J,exp.Med., 1971 ; 104 : 195-198
- 7) 社内資料 : 社内資料 : 松永藤雄、他 : ビタミン B₆ 代謝に関する臨床的研究, 1967
- 8) 社内資料 : 高梨 茂, 他 : ピドキサール錠の血中濃度, 1979
- 9) 田豫修治、他 : 医学のあゆみ, 1962 ; 43(4) : 137-141
- 10) Kraft, H. G.,et al. : Arzneim.-Forsch., 1961 ; 11 : 922-929

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

ピドキサール錠としての販売はしていない。

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

X III. 備考

その他の関連資料

PAL 031.02