

**2017年2月改訂（第11版）

*2015年11月改訂

貯 法：室温保存

開封後は湿気を避けて
保存すること

使用期限：製造後3年（外箱に表示）

過敏性腸症候群治療剤

ポリフル[®]錠500mg

〈ポリカルボフィルカルシウム錠〉

ポリフル[®]細粒83.3%

〈ポリカルボフィルカルシウム細粒〉

®登録商標

日本標準商品分類番号

872399

承認番号

錠：21200AMZ00462000

細粒：22000AMX00219000

薬価収載

錠：2000年8月

細粒：2008年6月

販売開始

2000年10月

再審査結果

2009年3月

Polyful[®]**■禁忌（次の患者には投与しないこと）**

- (1)急性腹部疾患（虫垂炎、腸出血、潰瘍性結腸炎等）の患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕
- (2)術後イレウス等の胃腸閉塞を引き起こすおそれのある患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕
- (3)高カルシウム血症の患者〔高カルシウム血症を助長するおそれがある。〕
- (4)腎結石のある患者〔腎結石を助長するおそれがある。〕
- (5)腎不全（軽度及び透析中を除く）のある患者〔組織への石灰沈着を助長するおそれがある。〕
- (6)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- (1)下痢状態では1日1.5gでも効果が得られているので、下痢状態の場合には1日1.5gから投与を開始することが望ましい。
- (2)本剤は、服用後に途中でつかえた場合に、膨張して喉や食道を閉塞する可能性があるため、十分量（コップ1杯程度）の水とともに服用させること。

■使用上の注意**1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）**

- (1)活性型ビタミンD製剤を服用中の患者〔高カルシウム血症があらわれやすい。〕
- (2)強心配糖体の投与を受けている患者〔強心配糖体の作用を増強するおそれがある。〕
- (3)高カルシウム血症があらわれやすい患者〔高カルシウム血症を起すおそれがある。〕
- (4)無酸症・低酸症が推定される患者及び胃全切除術の既往のある患者〔本剤の薬効が十分に発揮されない可能性がある。〕
- (5)透析中の患者及び軽度の腎不全のある患者〔組織への石灰沈着を助長するおそれがある。〕


2. 重要な基本的注意

- (1)本剤による治療は対症療法である。
- (2)症状の改善が認められない場合、長期にわたって漫然と使用しないこと（通常2週間）。

3. 相互作用**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 |
|---------------------------------------|---|--|
| 活性型ビタミンD製剤 アルファカルシドール カルシトリオール等 | 臨床症状：高カルシウム血症があらわれるおそれがある。 | 機序：これらの薬剤は腸管でのカルシウムの吸収を促進させる。 |
| カルシウム剤 L-アスパラギン酸カルシウム 乳酸カルシウム等 | 臨床症状： (1)高カルシウム血症があらわれるおそれがある。 (2)本剤の作用が減弱するおそれがある。 | 機序： (1)本剤はカルシウムを含有（ポリカルボフィルカルシウム1.0g中にカルシウムとして約200mg含有）するため、これらの薬剤と併用するとカルシウムの過剰摂取となる。 (2)本剤はカルシウムが脱離して薬効を発揮するが、カルシウムとの共存下では再結合により薬効が減弱する。 |
| 強心配糖体 ジゴキシン等 | 臨床症状：これらの薬剤の作用を増強し、不整脈等を誘発するおそれがある。 | 機序：カルシウムは強心配糖体の心筋収縮力増強作用を強める。 |

■組成・性状

| 販売名 | ポリフル錠500mg | ポリフル細粒83.3% |
|------------|--|--|
| 有効成分の名称・含量 | 1錠中 ポリカルボフィルカルシウム 乾燥物として500mg | 1g中 ポリカルボフィルカルシウム 乾燥物として833mg 分包： 1包（0.6g）中 ポリカルボフィルカルシウム 乾燥物として500mg 1包（1.2g）中 ポリカルボフィルカルシウム 乾燥物として1,000mg |
| 添加物 | 結晶セルロース、カルメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート、カルナウバロウ | 結晶セルロース、カルメロース、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、タルク、含水二酸化ケイ素 |
| 色・剤形 | 白色のフィルムコーティング錠 | 白色～微黄白色の細粒 |
| 味 | ————— | 甘い |
| 外形 |  | ————— |
| 大きさ | 長径 約17.8mm 短径 約7.6mm 厚さ 約5.9mm | ————— |
| 平均重量 | 約0.785g | ————— |
| 識別コード | HC237 | HC236 (分包剤ヒートシールに表示) |

■効能・効果

過敏性腸症候群における便秘異常（下痢、便秘）及び消化器症状

■用法・用量

通常、成人にはポリカルボフィルカルシウムとして1日量1.5～3.0gを3回に分けて、食後に水とともに経口投与する。

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|---|----------------------------|--|
| テトラサイクリン系抗生物質 テトラサイクリン ミノサイクリン等 | 臨床症状：これらの薬剤の作用を減弱するおそれがある。 | 機序：カルシウムイオンはこれらの薬剤とキレートを形成し、吸収を阻害する。 |
| ニューキノロン系抗菌剤 ノルフロキサシン 塩酸シプロフロキサシン トスフロキサシントシル酸塩水和物等 | | |
| プロトンポンプ阻害剤 オメプラゾール ランソプラゾール等 | 臨床症状：本剤の作用が減弱するおそれがある。 | 機序：本剤は酸性条件下でカルシウムが脱離して薬効を発揮するが、これらの薬剤の胃内pH上昇作用によりカルシウムの脱離が抑制される。 |
| H ₂ 受容体拮抗剤 ファモチジン ラニチジン等 | | |
| 制酸剤 水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウム 乾燥水酸化アルミニウムゲル等 | | |

4. 副作用

承認時までの臨床試験では、751例中66例(8.79%)に、市販後の使用成績調査では、3,096例中68例(2.20%)に臨床検査値異常を含む副作用が認められている。(再審査終了時)

| | 0.1～1%未満 | 0.1%未満 | 頻度不明 |
|-------------------|--|------------------|--------|
| 過敏症 ^{注)} | 発疹, そう痒感 | | |
| 血液 | | 白血球減少 | |
| 消化器 | 嘔気・嘔吐, 口渇, 腹部膨満感, 下痢, 便秘, 腹痛 | 腹鳴 | |
| 肝臓 | AST (GOT) 上昇, ALT (GPT) 上昇, γ -GTP 上昇, ALP 上昇 | 総ビリルビン上昇 | LDH 上昇 |
| その他 | 浮腫 | 頭痛, 尿潜血陽性, 尿蛋白陽性 | |

注) 症状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。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では腎機能が低下していることが多く、高カルシウム血症があらわれやすいので、減量するなど用量に留意すること。

6. 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。〕

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

8. 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、更には穿孔を起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)。

■薬物動態

(参考) 動物実験の結果

ラット及びイヌに¹⁴C標識ポリカルボフィルカルシウムを経口投与したときの血液中放射能濃度試験、尿・糞中排泄試験及びラットにおける全身オートラジオグラフィー、胆汁中排泄試験、*in situ*ループ法での消化管吸収試験の結果、本剤は消化管から吸収されなかった¹⁾。

また、他の薬剤の吸収に及ぼす影響をトリメプチンマレイン酸塩、ジアゼパム、チキジウム臭化物、シメチジン及びジギトキシンについて血漿中濃度を指標としてイヌで検討した結果、本剤はいずれの薬剤の吸収にも影響を及ぼさなかった²⁾。

■臨床成績

過敏性腸症候群の患者の便通異常(下痢, 便秘)及び消化器症状に対する一般臨床試験(投与期間：2週間～3ヵ月)及び二重盲検試験(投与期間：2週間)における本剤の承認用法用量1.5～3.0g/日・分3の有効率(「改善」以上)は63.5%(351/553例)であり、有効性が認められている³⁻⁹⁾。

■薬効薬理

1. 作用機序

本剤は胃内の酸性条件下でカルシウムを脱離してポリカルボフィルとなり、小腸や大腸等の中性条件下で高い吸水性を示し、膨潤・ゲル化する。下痢及び便秘には消化管内水分保持作用及び消化管内容物輸送調節作用により効果を発現すると考えられる。

(1) 消化管内水分保持作用

ラットにおいて、腸管の水分分泌に影響することなく腸管内で水分を保持した¹⁰⁾。

(2) 消化管内容物輸送調節作用

マウス及びラットにおいて、亢進させた消化管内容物の輸送を抑制し、遅延させた消化管内容物の輸送を改善した¹¹⁾。

2. 下痢抑制効果

マウス、ラット及びイヌの下痢モデルに対して抑制作用を示したが、便秘を誘発しなかった^{12,13)}。

3. 便秘改善効果

ラット及びイヌの排便量を増加し、ラット便秘モデルに対して改善作用を示したが、下痢は誘発しなかった^{12,13)}。

■有効成分に関する理化学的知見

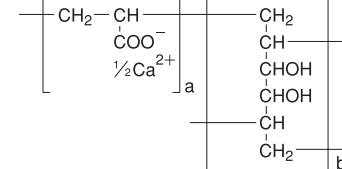
一般名：ポリカルボフィルカルシウム

Polycarbophil calcium (JAN)

本質：3,4-ジヒドロキシ-1,5-ヘキサジエンにより架橋したポリアクリル酸のカルシウム塩

Calcium salt of polyacrylic acid cross-linked with 3,4-dihydroxy-1,5-hexadiene

構造式：



分子式：(C₆H₆CaO₄)_a・(C₆H₁₀O₂)_b

性状：白色～微黄白色の粉末である。

水又はエタノール(95)にほとんど溶けない。

吸湿性である。

■包装

ポリフル錠500mg

PTP：100錠（10錠×10）

1,000錠（10錠×100）

バラ：500錠

ポリフル細粒83.3%

分包：0.6g×105包 0.6g×1,050包

1.2g×105包 1.2g×1,050包

瓶：600g

■主要文献

- 1) 山田健久 他：医薬品研究, **28**(1), 23(1997)
- 2) 山田健久 他：医薬品研究, **28**(1), 33(1997)
- 3) 正宗 研 他：薬理と治療, **26**(S-5), 21(1998)
- 4) 正宗 研 他：薬理と治療, **26**(S-5), 41(1998)
- 5) 正宗 研 他：薬理と治療, **26**(S-5), 63(1998)
- 6) 福土 審 他：薬理と治療, **26**(S-5), 123(1998)
- 7) 佐々木大輔 他：薬理と治療, **26**(S-5), 157(1998)
- 8) 齋藤 治 他：薬理と治療, **26**(S-5), 189(1998)
- 9) 伊藤 誠 他：薬理と治療, **26**(S-5), 205(1998)
- 10) T. Yamada et al. : Pharm. Sci., **2**, 149(1996)
- 11) A. Yasumori et al. : Jpn. J. Pharmacol., **76**(Suppl 1), 296(1998)
- 12) T. Saito et al. : Jpn. J. Pharmacol., **83**(3), 206(2000)
- 13) T. Saito et al. : Jpn. J. Pharmacol., **89**, 133(2002)

■文献請求先***

マイランEPD合同会社 くすり相談室

〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

フリーダイヤル 0120-938-837

製造販売元
*** **マイランEPD合同会社**
東京都港区虎ノ門5丁目11番2号