

鎮痛剤

シメトリド／日本薬局方 無水カフェイン配合顆粒

キョーリンAP2[®] 配合顆粒KYORIN AP-2[®] Combination Granules

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分	1g中 シメトリド0.8g 日局 無水カフェイン0.02g
添加剤	精製大豆レシチン、乳糖水和物、カルメロースカルシウム、ポリソルベート80、ヒドロキシプロピルセルロース

3.2 製剤の性状

剤形	顆粒剤
色調	白色
識別コード	KP-107（包装）
味	わずかに苦い
におい	においはないか、又はわずかに特異なにおい

4. 効能又は効果

腰痛症、症候性神経痛、頭痛、月経痛、炎症による咽頭痛・耳痛、歯痛、術後疼痛

6. 用法及び用量

通常成人1回0.5gを1日3～4回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.2 腎機能障害患者

代謝、排泄が遅延するおそれがある。

9.3 肝機能障害患者

代謝、排泄が遅延するおそれがある。

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。

9.8 高齢者

肝機能、腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがある。

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。

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症		発疹
精神神経系	眠気、めまい、頭痛、不眠	
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐、腹痛、下痢、口渇、胸やけ	便秘、口内炎
その他		悪寒、胸部圧迫感、倦怠感、心悸亢進

注）発現頻度は再評価時の文献調査による集計を含む。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

シメトリドは間脳視床下部に作用して鎮痛効果を示す¹⁾（ウサギ）。

18.2 鎮痛効果（圧刺激法）

鎮痛効果（圧刺激法）は経口及び腹腔内投与のいずれにおいてもリン酸コデインと同等の効果を示した²⁾（マウス）。

18.3 配合意義（シメトリド：無水カフェイン＝40：1）

18.3.1 酢酸Writhing法

配合剤及びシメトリド単味をそれぞれ経口投与し、鎮痛効果を比較（酢酸Writhing法）した結果、シメトリドの最小有効量及びED₅₀値はカフェインの配合により1/2～1/4及び約1/3まで減少した³⁾（マウス）。

18.3.2 Randall-Selitto法

配合剤及びシメトリド単味をそれぞれ経口投与し、鎮痛効果を比較（Randall-Selitto法）した結果、シメトリドの効果はカフェインの配合により1.85～2.42倍増強され、作用持続時間の延長が認められた⁴⁾（ラット）。

19. 有効成分に関する理化学的知見

19.1 シメトリド

一般名：シメトリド (Simetride) [JAN]

化学名：1,4-Bis[(2-methoxy-4-n-propylphenoxy)acetyl]-piperazine

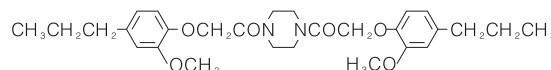
分子式：C₂₈H₃₈N₂O₆

分子量：498.61

融点：135～138℃

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なにおいがあり、味はない。本品はクロロホルムに溶けやすく、ジメチルホルムアミドにやや溶けにくく、アセトンに溶けにくく、水、エタノール又はエーテルにほとんど溶けない。

化学構造式：



19.2 無水カフェイン

一般名：無水カフェイン (Anhydrous Caffeine) [JAN]

化学名：1,3,7-Trimethyl-1*H*-purine-2,6(3*H*,7*H*)-dione分子式：C₈H₁₀N₄O₂

分子量：194.19

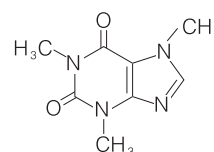
融点：235～238℃

性状：本品は白色の結晶又は粉末で、においはなく、味は苦い。

本品はクロロホルムに溶けやすく、水、無水酢酸又は酢酸（100）にやや溶けにくく、エタノール（95）又はジエチルエーテルに溶けにくい。

本品1.0gを水100mLに溶かした液のpHは5.5～6.5である。

化学構造式：



22. 包装

- 0.5g×120包 [3包×40]
- 0.5g×1,200包 [3包×400]
- 1g×120包 [3包×40]
- 1g×600包 [3包×200]
- 100g [ポリ瓶、バラ]
- 500g [缶、バラ]

23. 主要文献

- 1) 柳浦才三, 他. :日薬理誌. 1968 ;64(4) :458-466
- 2) 入倉勉, 他. :薬学雑誌. 1963 ;83(8) :785-791
- 3) 西納啓吾, 他. :基礎と臨床. 1978 ;12(6) :1357-1359
- 4) 西納啓吾, 他. :基礎と臨床. 1978 ;12(6) :1360-1362

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

杏林製薬株式会社 くすり情報センター
〒160-0017 東京都新宿区左門町20番地
電話 0120-409341
受付時間 9:00~17:30 (土・日・祝日を除く)

26. 製造販売業者等

*26.1 製造販売元

杏林製薬株式会社
東京都千代田区大手町一丁目3番7号