

** 2013年5月改訂(第4版 会社住所の変更)
* 2009年9月改訂

日本標準商品分類番号
871149

貯 法：室温保存
使用期限：外箱、容器に表示

鎮痛剤

* キョーリンAP2® 配合顆粒

KYORIN AP-2® Combination Granules

* 承認番号	22100AMX0119900
* 薬価収載	2009年9月
販売開始	1965年12月
再評価結果	1980年8月

【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

【組成・性状】

成分・含量 (1g中)	シメトリド 日局 無水カフェイン	0.8g 0.02g
添加物	大豆リン脂質、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	
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	

【効能・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

【用法・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。

【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)

肝又は腎機能障害のある患者
[代謝、排泄が遅延するおそれがある。]

2. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していないため、発現頻度については文献を参考に集計した。総症例3,553例中、213例(5.99%)に副作用が認められ、主な副作用は悪心・嘔吐44件(1.24%)、腹痛41件(1.15%)、眠気41件(1.15%)であった。(承認時~1995年7月迄の集計)

その他の副作用

	0.1~5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注)}		発疹 等
精神神経系	眠気、めまい、頭痛、不眠 等	
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 等
その他		悪寒、胸部圧迫感、倦怠感、心悸亢進 等

注)発現した場合には投与を中止すること。

3. 高齢者への投与

高齢者では、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ので慎重に投与すること。

4. 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投与しないことが望ましい。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

【薬効薬理】

1. 基礎薬理作用

シメトリドは間脳視床下部に作用し(家兔)¹⁾、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(マウス)²⁾。

2. 配合意義(シメトリド：無水カフェイン=40:1)

(1) 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(マウス)³⁾。

(2) 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(ラット)⁴⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

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

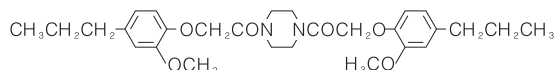
分子量：498.61

融点：135~138°C

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：



無水カフェイン

一般名：無水カフェイン (Anhydrous Caffeine)

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

分子式：C₈H₁₀N₄O₂

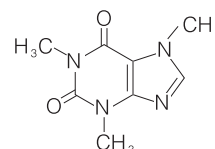
分子量：194.19

融点：235~238°C

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：



【包装】

キョーリンAP2配合顆粒

分包装：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)

バラ包装：100g、500g

【主要文献】

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

【文献請求先】「*」「」**

杏林製薬株式会社 くすり情報センター
〒101-8311 東京都千代田区神田駿河台4-6
電話 0120-409341
受付時間 9:00~17:30(土・日・祝日を除く)

**** 杏林製薬株式会社**
東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地