

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



剤形	散剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1g 中シメチジン 400 mg
一般名	和名：シメチジン 洋名：Cimetidine
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：2006年3月1日 薬価基準収載年月日：2006年6月9日 発売年月日：2006年7月31日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：藤本製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	藤本製薬株式会社 医薬学術部 TEL：0120-225-591 FAX：0120-116-026（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.fujimoto-pharm.co.jp/

本 IF は 2014 年 4 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、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

® 登録商標

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、IF と略す）の位置付け並びに IF 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 IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、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て、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな IF 記載要領が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）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-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.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-IF を掲載する医薬品情報提供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-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF 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。

平成 20 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、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF 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 IF 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 IF 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。

[IF の様式]

- ① 規格は A4 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 IF 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「IF 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。

【IF の作成】

- ① IF 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 IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの IF 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、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF 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（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【IF の発行】

- ① 「IF 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、「IF 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 IF が改訂される。

3. IF 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の医薬品医療機器情報提供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、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、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情報提供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もあり、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

IF 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。IF 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	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
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. CAS登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
4. 製剤の各種条件下における安定性	6
5. 調製法及び溶解後の安定性	6
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6
7. 溶出性	6
8. 生物学的試験法	6
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
10. 製剤中の有効成分の定量法	7
11. 力価	7
12. 混入する可能性のある夾雑物	7
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	7
14. その他	7
V. 治療に関する項目	8
1. 効能又は効果	8
2. 用法及び用量	8
3. 臨床成績	8
VI. 薬効薬理に関する項目	11
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	11

2. 薬理作用	11
VII. 薬物動態に関する項目	12
1. 血中濃度の推移・測定法	12
2. 薬物速度論的パラメータ	12
3. 吸収	13
4. 分布	13
5. 代謝	14
6. 排泄	15
7. トランスポーターに関する情報	15
8. 透析等による除去率	15
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16
1. 警告内容とその理由	16
2. 禁忌内容とその理由	16
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
5. 慎重投与内容とその理由	16
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
7. 相互作用	16
8. 副作用	17
9. 高齢者への投与	21
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	21
11. 小児等への投与	21
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	21
13. 過量投与	22
14. 適用上の注意	22
15. その他の注意	22
16. その他	22
IX. 非臨床試験に関する項目	23
1. 薬理試験	23
2. 毒性試験	24
X. 管理的事項に関する項目	26
1. 規制区分	26
2. 有効期間又は使用期限	26
3. 貯法・保存条件	26
4. 薬剤取扱い上の注意点	26
5. 承認条件等	26
6. 包装	26
7. 容器の材質	26
8. 同一成分・同効薬	26
9. 国際誕生年月日	27

10. 製造販売承認年月日及び承認番号	27
11. 薬価基準収載年月日	27
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	27
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	27
14. 再審査期間	27
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	27
16. 各種コード	27
17. 保険給付上の注意	27
XI. 文献	28
1. 引用文献	28
2. その他の参考文献	28
3. 文献請求先	28
XII. 参考資料	29
1. 主な外国での発売状況	29
2. 海外における臨床支援情報	29

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1966年 Ash and Schild (Br. J. Pharmacol. Chemother., 27, 427, 1966)によりヒスタミンの受容体は少なくとも2種類(H₁受容体・non-H₁受容体)存在することが明らかにされ、1972年 Blackら(Nature, 236, 385, 1972)によって『H₂受容体』と命名された。カイロク細粒40%とカイロク錠200はこのH₂受容体を介した酸分泌機構を抑制するH₂受容体拮抗剤として開発された胃酸分泌抑制剤である。1987年12月に再審査申請を行い、1989年3月に結果通知が出され申請通り(現、承認内容)の有効性が認められた。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は胃液分泌におけるヒスタミンの役割を重視して開発されたH₂受容体拮抗剤で、胃粘膜の壁細胞にあるヒスタミンH₂受容体に特異的に拮抗し胃酸分泌及びペプシン分泌を適度に、かつ持続的に抑制し、消化性潰瘍及び胃炎に対して優れた効果を示す。

胃潰瘍・十二指腸潰瘍に対してゲファルナートを対照薬とした二重盲検試験で、潰瘍改善度、自覚症状改善度、有用性において本剤は有意に優れており、早期の潰瘍治癒・自覚症状の改善が得られている。

朝食後及び就寝前の1日2回の用法・用量、さらに就寝前の1日1回の用法・用量が加わったことで、患者の生活に合わせた投与法が選択でき、コンプライアンスの向上が望める。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名 カイロック[®] 細粒 40%

(2) 洋名 CYLOCK[®]

(3) 名称の由来

H₂ブロッカーで潰瘍をブロックするところからカイロックと名付けた。

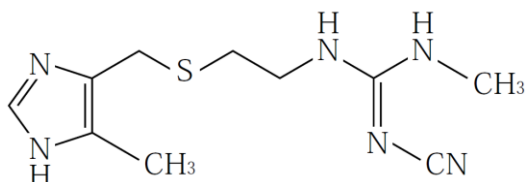
2. 一般名

(1) 和名(命名法) シメチジン (JAN)

(2) 洋名(命名法) Cimetidine (JAN)

(3) ステム シメチジン系ヒスタミン H₂受容体拮抗剤：-tidine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

(1) 分子式 C₁₀H₁₆N₆S

(2) 分子量 252.34

5. 化学名(命名法)

2-Cyano-1-methyl-3-{2-[(5-methyl-1H-imidazol-4-yl) methylsulfanyl] ethyl} guanidine (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

治験番号：FPF 1002

7. CAS登録番号

51481-61-9

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。光によって徐々に着色する。

(2) 溶解性

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
メタノール	溶けやすい
酢酸(100)	溶けやすい
エタノール(95)	やや溶けにくい
水	溶けにくい
ジエチルエーテル	ほとんど溶けない
希塩酸	溶ける

(3) 吸湿性

30℃/90%RH、48時間放置においても吸湿性を有しない。

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点 140～144℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa=約 6.85

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

pHは9.0～10.5である(日本薬局方)。旋光性は認められない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

保存条件	保存期間	保存形態	結果
室温	39 ヶ月	褐色ガラス瓶詰密栓 褐色ガラス瓶詰開栓	いずれの場合も、性状、確認試験、融点、溶状、pH、薄層クロマトグラフィー、乾燥減量及び定量の各試験において経時的な変化は認められず安定であった。
加温(40℃)	6 ヶ月	褐色ガラス瓶詰密栓	
加温(60℃)	6 ヶ月	褐色ガラス瓶詰密栓	
加温加湿(40℃/75%RH)	6 ヶ月	褐色ガラス瓶詰開栓	
加温加湿(40℃/90%RH)	6 ヶ月	褐色ガラス瓶詰開栓	
光照射(700 lx/hr)	6 ヶ月	無色透明ガラスシャーレ	

酸及びアルカリ溶液中では、アミド体、グアニジン体、スルホキシド体等の分解物を生成する。

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「シメチジン」の確認試験による。

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「シメチジン」の定量法による(滴定終点検出法:電位差滴定法)。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状


白色～微黄色の細粒である。

(2) 製剤の物性

粒 度：日本薬局方・一般試験法「製剤の粒度の試験法」により試験を行うとき、製剤総則・顆粒剤（細粒剤）に適合する。

製剤均一性：分包したものは、日本薬局方・一般試験法「製剤均一性試験 2.質量偏差試験」により試験を行うとき、これに適合する。

(3) 識別コード

 422；アルミ資材（裏面）

(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

1g 中シメチジンを 400 mg 含有する。

(2) 添加物

精製白糖、D-マンニトール、エチルセルロース、無水ケイ酸を含有する。

(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	保存期間	保存形態	結果
室温	39 ヶ月	ポリエチレン・セロファンフィルム	変化なし
	6 ヶ月	褐色ガラス瓶	
40°C/75%RH	6 ヶ月	ポリエチレン・セロファンフィルム	変化なし
		褐色ガラス瓶	
40°C/90%RH	3 ヶ月	ポリエチレン・セロファンフィルム	変化なし
		褐色ガラス瓶	
60°C	3 ヶ月	ポリエチレン・セロファンフィルム	変化なし
700 lx/hr 12 hr/day 光照射	6 ヶ月	ポリエチレン・セロファンフィルム	6 ヶ月目に外観が微黄色に変化した。
		無色ガラス瓶	

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(物理化学的变化)

カイロック細粒 40%と配合併用されると考えられる市販薬剤 25 品目について 1 日投与量を量り、乳鉢で混合し、薬包紙で包み 20°C/75%RH の条件下で配合変化を 14 日間観察した。(結果は巻末の一覧表参照)

7. 溶出性

試験方法：日本薬局方溶出試験法 パドル法

試験条件：回転数 50 rpm

試験液 水

結果：日本薬局方外医薬品規格第 3 部 シメチジン 40%細粒の溶出規格に適合する。

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) 呈色反応

イミダゾール環、グアニジノ基

(2) 紫外可視吸光度測定法

(3) 薄層クロマトグラフィー

シメチジンと比較

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雑物

特になし

13. 注意が必要な容器・外観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

- ・胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison 症候群、逆流性食道炎、上部消化管出血(消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による)
- ・下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善
急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

2. 用法及び用量

胃潰瘍、十二指腸潰瘍

通常、成人にはシメチジンとして1日 800 mg を2回(朝食後及び就寝前)に分割して経口投与する。また、1日量を4回(毎食後及び就寝前)に分割もしくは1回(就寝前)投与することもできる。なお、年齢、症状により適宜増減する。

吻合部潰瘍、Zollinger-Ellison 症候群、逆流性食道炎、上部消化管出血(消化性潰瘍、急性ストレス潰瘍、出血性胃炎による)

通常、成人にはシメチジンとして1日 800 mg を2回(朝食後及び就寝前)に分割して経口投与する。また、1日量を4回(毎食後及び就寝前)に分割して投与することもできる。なお、年齢、症状により適宜増減する。

ただし、上部消化管出血の場合には、通常注射剤で治療を開始し、内服可能となった後は経口投与に切り替える。

下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善

急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

通常、成人にはシメチジンとして1日 400 mg を2回(朝食後及び就寝前)に分割して経口投与する。また、1日量を1回(就寝前)投与することもできる。なお、年齢、症状により適宜増減する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

- 1.腎障害のある患者では、血中濃度が持続するので、投与量を減ずるか投与間隔をあけて使用すること。
- 2.シメチジンは血液透析により除去されるため、血液透析を受けている患者に投与する場合は、透析後に投与すること。なお、腹膜透析においては、シメチジンの除去率はわずか(投与量の約 5%以下)である。

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

カイロック細粒 40%およびカイロック錠 200 の二重盲検試験を含む一般臨床試験を行った結果の概要は次の通りであった¹⁻⁴⁾。

1) 胃潰瘍、十二指腸潰瘍、吻合部潰瘍の臨床効果

	内視鏡判定による潰瘍治癒率	自覚症状改善度(中等度以上改善率)
胃潰瘍	68.7%(180/262 例)	90.9%(259/285 例)
十二指腸潰瘍	76.0%(114/150 例)	90.5%(152/168 例)
吻合部潰瘍	71.4%(15/21 例)	95.5%(21/22 例)
総数	71.4%(309/433 例)	90.9%(432/475 例)

2) 上部消化管出血に対する効果

止血効果：内服可能な上部消化管出血に対して、1日 800 mg 投与後 3 日以内の止血率は 77.3%(99/128 例)、7 日以内の止血率は 96.1%(123/128 例)、止血効果として有効以上が 97.6%(123/126 例)であった。

自覚症状改善度：中等度改善以上が 93.7%(104/111 例)であった。

以上のように上部消化管出血に対しても良好な結果を示した。

3) Zollinger-Ellison 症候群

Zollinger-Ellison 症候群に対して、自他覚症状及び内視鏡所見において有用性が認められた。

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

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

該当資料なし

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）

使用成績調査： カイロック細粒 40%およびカイロック錠 200 の市販後の有効性および安全性に関して調査を実施し、計 930 例(男性 714 例、女性 216 例)について解析を行った。

有効性に関しては、主たる対象疾患は胃潰瘍、十二指腸潰瘍のいわゆる消化性潰瘍で、吻合部潰瘍および上部消化管出血は若干例であった。各疾患とも承認一日用量である 800 mg 投与で承認時とほぼ同様の有効性が認められたが、600 mg 投与においては有効性が低い傾向にあった。また、安全性に関しては市販後に新規の重篤な副作用の発現および副作用の発現頻度の増加は認めなかった。

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. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

塩酸ラニチジン、塩酸ロキサチジンアセタート、ニザチジン、ファモチジン、ラフチジン

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：胃粘膜の壁細胞にあるヒスタミン H₂ 受容体

作用機序：

1) 胃酸分泌抑制作用

基礎分泌(ラット)の抑制及びヒスタミン、カルバコール、食餌、インスリン等の各種刺激に対する分泌(イヌ、ラット)を著明に抑制する⁵⁾。

2) ペプシン分泌抑制作用

ヒスタミン、カルバコール、インスリン刺激に対するペプシン分泌(イヌ)を抑制する⁵⁾。

3) 実験的潰瘍に対する作用

(急性胃・十二指腸潰瘍)

ラットのアスピリン潰瘍、インドメタシン潰瘍、ストレス潰瘍、カルバコール・ヒスタミン潰瘍及びモルモットにおけるヒスタミン潰瘍に対して抗潰瘍効果を認めた⁶⁾。

(慢性胃・十二指腸潰瘍)

ラット及びイヌにおける酢酸胃潰瘍及び酢酸十二指腸潰瘍に対して治癒の促進効果を認めた⁷⁾。

4) 急性胃出血に対する作用

ラット脱血ショックにおいて胃出血を著明に減少させた。

5) 胃粘膜血流に対する作用

ラット脱血ショックにおいて粘膜血流、粘膜内ヘモグロビン酸素飽和度の低下を抑制し、潰瘍発生を減少させた⁸⁾。

6) 胃粘液成分に対する作用

ラット胃粘膜器官培養法において、粘液糖蛋白質の合成を促進した⁹⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(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

酸分泌抑制を指標とした $IC_{50} = 0.5 \mu g/mL^{10)}$

(2) 最高血中濃度到達時間

健康成人 1回 200 mg を単回経口投与した場合 0.925 ± 0.157 時間¹¹⁾

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

<参考>

1回 200 mg 1日 4回(毎食後及び就寝前)で1週間健康成人に反復経口投与したところ平均血中濃度は $0.40 \sim 1.10 \mu g/mL$ の範囲内を維持した(カイロク錠 200)¹²⁾。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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

<参考>

静注後の AUC に対する本剤経口投与後の AUC から求めた生物利用率は、79.9%であった(カイロク錠 200)。

(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

ヒト血液を用いて³H-シメチジンで測定した結果、血漿蛋白結合率は9.7～10.2%、血球結合率は45.9～46.4%であった。

3. 吸収

ヒトの血中濃度の測定において2峰性のパターンを示す場合が多いことから、Boderman G.ら (Br. J. Clin. Pharmacol., 7, 23, 1979)が述べるように腸肝循環をするものと思われる。

<参考>

ラットに300 mg/kgを単回経口投与したとき、2時間後に血中濃度はピークに達し、消失半減期は α 相(1.96 hr)と β 相(7.69 hr)に分かれた。

吸収部位：幽門部を結紮したラットにシメチジンを単回経口投与したが、胃内での吸収部位はほとんどみられなかった。また、ラットの反転腸管法、腸管膜灌流法により吸収部位を検討したところ、腸管の中でも特に回腸部位からの吸収が高く、空腸部位が最も低かった。

4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

<参考>

ラットに³H-シメチジンを単回経口投与したところ、脳内への移行は認められるが、濃度はわずかであり、24時間後には消失し、蓄積性はなかった。

(2) 血液-胎盤関門通過性

ヒトに静注後、臍帯血、羊水、胎児の血中にも移行し、分娩時の血中濃度の比率は最高で(胎児/母体)0.84であった¹³⁾。

<参考>

ラットに³H-シメチジンを単回経口投与したところ、胎盤関門を通過し、胎仔中のシメチジン濃度は約4時間程度で最高値に達し、臍帯中には24時間後も認められ胎盤にも移行した。

(3) 乳汁への移行性

ヒトに 1 回 400 mg を単回経口投与した試験で、血漿中の 3 倍の濃度が乳汁中へ移行しているのが認められた¹⁴⁾。

<参考>

授乳ラットにおいては、³H-シメチジンを単回経口投与後 2 時間で放射能の乳汁中移行が最高値に達し、その後次第に減少し、24 時間後には認められなかった。

(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

<参考>

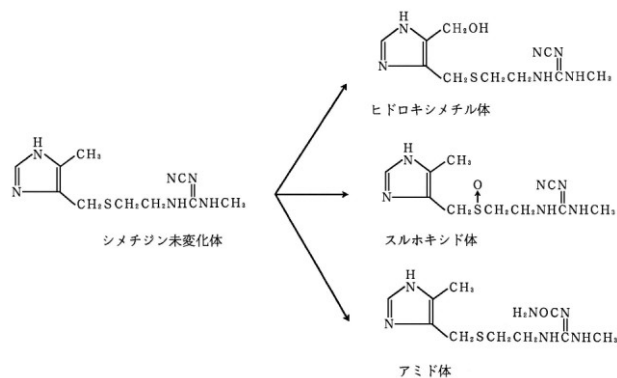
ラットに ³H-シメチジンを単回経口投与したところ、肝臓、消化管に高濃度に分布し、各臓器とも 4 時間でピークに達し、以後減少し、24 時間後には痕跡程度まで消失した。

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

<参考>

ラット、イヌ及びヒトの尿中より代謝産物として、ヒドロキシメチル体、スルホキシド体、アミド体が検出された¹⁵⁾。



(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

シメチジンは CYP2D6 及び 3A4 の阻害作用を有する¹⁶⁾。

(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

シメチジンの代謝物として、ヒドロキシメチル体、アミド体、スルホキシド体が尿・糞便中に確認された。

(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

尿中、糞便中

(2) 排泄率

尿 中：未変化体は 90%以上を占め、代謝物としてヒドロキシメチル体(2.4%)、スルホキシド体(5.5%)が含まれていた(経口投与)。

糞便中：未変化体は 96%を占め、代謝物としてアミド体(1.4%)、スルホキシド体(2.4%)が含まれていた(経口投与)。

(3) 排泄速度

尿 中：0～24 時間で 55.0%、24～48 時間で 1.6%が排泄された(経口投与)。

糞便中：24 時間で 5.7%、48 時間までの合計で 6.8%が排泄された(経口投与)。

<参考>

ラットに経口投与したところ 48 時間で尿中に約 51%、糞中に 43%排泄された。

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

腹 膜 透 析：腹膜灌流によってはほとんど除去されない¹⁷⁾。

血 液 透 析：血液透析で除去される¹⁸⁾。

直接血液灌流：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

〔禁忌 (次の患者には投与しないこと)〕
シメチジンに対し過敏症の既往歴のある患者

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

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

5. 慎重投与内容とその理由

- (1) 腎障害のある患者(用法・用量に関連する使用上の注意)の項参照)
- (2) 肝障害のある患者
- (3) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- (4) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

治療にあたっては経過を十分に観察し、病状に応じ治療上必要最小限の使用にとどめ、本剤で効果がみられない場合には他の療法に切り替えること。なお、血液像、肝機能、腎機能等に注意すること。

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

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
肝薬物代謝酵素 P-450 の活性低下により代謝、排泄が遅延する薬剤 主な薬剤： クマリン系抗凝血剤 ワルファリン ベンゾジアゼピン系薬剤 ジアゼパム トリアゾラム ミダゾラム等 抗てんかん剤 フェニトイン カルバマゼピン等 抗うつ剤 三環系抗うつ剤 イミプラミン等 パロキセチン β-遮断剤 プロプラノロール メトプロロール ラベタロール等 カルシウム拮抗剤 ニフェジピン等 抗不整脈剤 リドカイン等 キサンチン系薬剤 テオフィリン アミノフィリン等	これらの医薬品の血中濃度を高めることが報告されているので、これらの医薬品を減量するなど慎重に投与すること。	本剤が肝臓の薬物代謝酵素 P-450 を阻害して、これらの医薬品の代謝、排泄を遅延させる。
プロカインアミド		本剤が近位尿細管におけるプロカインアミドの輸送を阻害し、腎クリアランスを減少させる。
エリスロマイシン		機序不明

8. 副作用

(1) 副作用の概要

調査症例 1510 例中 24 例(1.6%)に副作用が認められた。主な副作用は血清 ALT(GPT)上昇(0.4%)、痒痒(0.2%)、めまい(0.2%)、血清 AST(GOT)上昇(0.2%)であった。(カイロック細粒 40%およびカイロック錠 200 の再審査終了時)本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。

(2) 重大な副作用と初期症状

① ショック、アナフィラキシー様症状

ショック、アナフィラキシー様症状(全身発赤、呼吸困難等)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し、適切な処置を行うこと。

② 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少

再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少があらわれることがあるので、初期症状として全身倦怠、脱力、皮下・粘膜下出血、発熱等がみられたら、その時点で血液検査を実施し、異常が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

③ 間質性腎炎、急性腎不全

間質性腎炎、急性腎不全があらわれることがあるので、初期症状として発熱、腎機能検査値異常(BUN、クレアチニン上昇等)等が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

④ 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell 症候群)

皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell 症候群)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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

⑤ 肝障害

黄疸、また、AST(GOT、0.2%)、ALT(GPT、0.4%)の上昇等があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止すること。

⑥ 房室ブロック等の心ブロック

房室ブロック等の心ブロックがあらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

⑦ 意識障害、痙攣

意識障害、痙攣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し、適切な処置を行うこと。特に腎機能障害を有する患者においてあらわれやすいので、注意すること。

(3) その他の副作用

	頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
腎臓	BUN 上昇、一過性のクレアチニン 上昇		
過敏症 ^{注1)}	末梢神経障害 ^{注2)}		発疹
内分泌 ^{注1)}	乳汁分泌、帯下増加、勃起障害		女性化乳房
精神神経系	可逆性の錯乱状態、痙攣、頭痛、 四肢のしびれ・こわばり感、眠気、 ヒポコンドリー様症状、無気力感、 うつ状態、幻覚	めまい	
循環器	頻脈、徐脈		動悸
消化器	腹部膨満感、下痢	便秘	
その他	発熱、全身熱感、排尿困難、筋肉 痛、腭炎、脱毛		

注 1) これらの症状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。

注 2) 過敏性血管炎に基づく末梢神経障害が報告されている。

発現頻度はカイロック細粒 40%およびカイロック錠 200 の臨床試験および使用成績調査の結果を合わせて算出した。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

調査症例数	1,510	
副作用発現症例数	24	
副作用発現件数	28	
副作用発現症例率(%)	1.59	
副作用の種類	副作用発現件数	副作用発現頻度(%)
〔過敏症〕		
瘙 痒	3	0.20
発 疹	1	0.07
〔精神神経系〕		
不 安	2	0.13
めまい	3	0.20
〔循環器〕		
動 悸	1	0.07
〔消化器〕		
便 秘	2	0.13
胃不快感	1	0.07
舌 苔	1	0.07
〔肝臓〕		
血清 AST(GOT)上昇	3	0.20
血清 ALT(GPT)上昇	6	0.40
〔内分泌〕		
女性化乳房	1	0.07
〔血液〕		
白血球減少	1	0.07
〔腎臓〕		
血中クレアチニン上昇	1	0.07
〔その他〕		
不快感	2	0.13

発現頻度はカイロック細粒 40%およびカイロック錠 200 の臨床試験および使用成績調査の結果を合わせて算出した。

(5) 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

合併症の有無別及び合併症の疾患別で呼吸器疾患、胃腸疾患、泌尿生殖器疾患、筋骨格疾患において副作用の出現率に差が認められた。

合併症		症例数	副作用発現症例数	副作用発現件数	副作用発現症例率(%)
全体	有	149	3	5	2.0
	無	781	2	2	0.26
呼吸器疾患	有	6	1	2	16.7
	無	924	4	5	0.43
胃腸疾患	有	27	1	1	3.7
	無	903	4	6	0.44
泌尿生殖器疾患	有	1	1	1	100
	無	929	4	6	0.43
筋骨格疾患	有	14	1	2	7.1
	無	916	4	5	0.44

重症度別では副作用発現症例数に差は認められなかった。

発現頻度はカイロック細粒 40%およびカイロック錠 200 の臨床試験および使用成績調査の結果を合わせて算出した。

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「Ⅷ-8 (1) 副作用の概要」の項、「Ⅷ-8 (2)-① ショック、アナフィラキシー様症状」の項を参照すること。

9. 高齢者への投与

高齢者では減量するか投与間隔を延長するなど慎重に投与すること。[本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため血中濃度が持続するおそれがある。]

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦等 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。]
- (2) 授乳婦 授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。[母乳中に移行することが報告されている。]

11. 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。)

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

「Ⅷ-8 (1) 副作用の概要」の項、「Ⅷ-8 (2)-③ 間質性腎炎、急性腎不全」の項、「Ⅷ-8 (2)-⑤ 肝障害」の項を参照すること。

13. 過量投与

症状・徴候 外国において、シメチジン 20 g から 40 g を投与後に意識喪失等の重篤な中枢神経症状が発現した症例、及び 40 g 以上のシメチジンを単回経口服用した成人での死亡症例の報告がある。日本では 1 回 50 錠(10 g)、外国では 100 錠(20 g)までの過量投与の報告があるが、特に重大な影響はみられなかった。

処置 催吐、胃洗浄等を行うとともに適切な療法を行うこと。

14. 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。]

15. その他の注意

- (1)動物の毒性試験で弱い抗アンドロジェン作用に基づく前立腺及び精のう重量の減少が報告されている。
- (2)ラットに 24 ヶ月投与した毒性試験で良性の精巣の間細胞腫の発生が増加したとの報告がある。
- (3)本剤の投与が胃がんによる症状を隠蔽することがあるので、悪性でないことを確認のうえ投与すること。

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) 中枢神経系に対する作用

300 mg/kg の大量皮下投与により鎮痛作用が軽度に見られ、100 mg/kg 以上の経口投与でペントバルビタール睡眠を延長したが、脳波、体温、自発運動に対して何ら影響を及ぼさなかった¹⁹⁾。

2) 呼吸・循環器系に対する作用

2.5 mg/kg 静注以上で、直接血管拡張作用によると考えられる一過性の血流増加・血圧降下が見られ、10 mg/kg 以上で血圧降下に伴う呼吸促進が見られたが、心電図には影響はなく、心抑制の傾向もみられなかった¹⁹⁾。

3) 消化器系に対する作用

摘出腸管(モルモット)に対して、高濃度で自発運動の抑制が見られるが、消化管輸送能(ラット)には影響を与えず、腸管収縮における抗アセチルコリン作用、抗ヒスタミン作用、抗バリウム作用は認められなかった¹⁹⁾。

4) 子宮に対する作用

摘出子宮自発運動(ラット)において収縮の軽度抑制が見られる¹⁹⁾。

5) 局所に対する作用

モルモットの眼に対して局所刺激作用及び局所麻酔作用は認められなかった¹⁹⁾。

6) 血液に対する作用

血液凝固時間、出血時間、血小板凝集能には影響を及ぼさない¹⁹⁾。

7) 腎機能に及ぼす影響

腎クリアランス、尿生成には影響は認められなかった¹⁹⁾。

(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

マウス、ラット及びウサギにおける中毒症状は、投与経路による差はなく、自発運動の低下、呼吸異常、歩行失調が観察され、死亡例では、これらの症状後、間代性痙攣及び呼吸困難となり、4時間以内に死亡した²⁰⁾。

単回投与毒性 LD₅₀ (mg/kg)

動物(♂)	性	投 与 経 路			
		経 口	皮 下	腹腔内	静脈内
ddY 系 マウス	♂	2550 (2240~2907)	437 (411~464)	525 (490~563)	164 (154~175)
	♀	2820 (2496~3187)	500 (451~555)		186 (170~204)
Wistar 系 ラット	♂	>7200	910 (805~1028)	460 (414~511)	168 (157~179)
	♀	>7200	860 (806~918)	328 (301~358)	235 (220~251)
日本白色種 ウサギ	♂	>8600	————	1063 (842~1342)	164 (143~189)
	♀	————	————	————	203 (172~239)

(2) 反復投与毒性試験

1) 亜急性毒性(最大無作用量、回復試験)²¹⁾

Wistar 系ラット(雌雄)に 30 日間、シメチジン 150、450、1,350 mg/kg を反復経口投与した結果、薬物の影響によると思われる死亡例はなく、体重増加、摂餌量にも変化はみられなかった。病理解剖学的検査で、雌の 1,350 mg/kg 投与群で肝臓重量の増加がみられた。病理組織学的検査において、雄の 1,350 mg/kg 投与群で精巣、前立腺、精巣上体の軽度の萎縮像が認められた。

シメチジンの 30 日間反復経口投与の最大無作用量は 450 mg/kg と判断した。

2) 慢性毒性(最大無作用量)²²⁾

Wistar 系ラット(雌雄)に 6 ヶ月間、シメチジン 150、450、1,350 mg/kg を反復経口投与した結果、薬物によると思われる死亡例はなかった。雄の 1,350 mg/kg 投与群で体重増加抑制、雌で体重増加がみられ、雌雄で肝臓重量増加、雌の副腎重量減少及び卵巣重量増加、雄の前立腺、精のう腺、精巣の萎縮がみられた。また、雄 450 mg/kg 以上の投与群で精巣、前立腺及び精のう腺重量の減少がみられた。しかし、3 ヶ月間の休薬期間によりこれらの異常は消失していた。その他、血液学的、臨床生化学的、尿検査及び病理組織学的検査において、いずれの投与群とも異常はみられなかった。

シメチジンの 6 ヶ月間反復経口投与の最大無作用量は 150 mg/kg と推定された。

(3) 生殖発生毒性試験

妊娠前及び妊娠初期投与試験において 450 mg/kg 以上の投与で胎仔の着床数、生存胎仔数の減少、胎仔の椎体分離がみられ、1,350 mg/kg 投与で吸収胚数の増加がみられた²³⁾。

ラットの胎仔の器官形成期投与試験では 450 mg/kg 以上で胎仔の体重抑制、第 9～13 胸椎の椎体変異、1,350 mg/kg で新生仔の生存率抑制が認められた²⁴⁾。

ウサギでは 1,200 mg/kg 群で胎仔の成長抑制が認められた。

ラットにおける周産期及び授乳期投与試験において 1,350 mg/kg で妊娠末期から分娩後 1 日の間に母体の衰弱・死亡例がみられたが、新生仔については特記すべき異常は認められなかった²⁵⁾。

(4) その他の特殊毒性

1) 抗原性

モルモットを用いて抗原性試験を行ったところ、すべての試験に陰性であり、抗原性を有さないか、あっても極めて低いと考えられる。

2) 依存性

動物試験ならびに臨床試験において依存性を示唆する所見は認められなかった。

3) 変異原性

エームズ試験、修復試験、マウスの小核試験を実施したところ、いずれの試験も陰性であった。

また、用量依存的に溶血性を増加させるが、実際の血中濃度では影響ないものと考えられる(120 μ g/mL、4%)¹⁹⁾。

X. 管理的事項に関する項目

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

使用期限：3年間

3. 貯法・保存条件

遮光・室温保存、気密容器

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

光により、わずかに着色することがあるため、開封後の保存に注意すること。

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14. 適用上の注意」の項参照。

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

規格：400 mg 1g

包装：(0.5g 分包)× 200 包

(0.5g 分包)×1,000 包

(0.5g 分包)×2,000 包

(バラ) 100g

500g

7. 容器の材質

(分包) アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

(バラ) アルミニウム・ポリエチレンラミネート

8. 同一成分・同効薬

タガメット錠 200 mg

タガメット細粒 20%

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

2006年3月1日 21800AMX10378000

11. 薬価基準収載年月日

2006年6月9日 (旧販売名：1987年10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

効能・効果追加年月日：1989年2月10日

内容：「逆流性食道炎、急性胃炎・慢性胃炎の急性増悪期の胃粘膜病変(びらん、出血、
発赤、浮腫)の改善」の効能・効果を追加

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果公表年月日：1989年3月1日

14. 再審査期間

1987年5月19日～1987年9月19日

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない

16. 各種コード

HOT 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
104292401	2325001C2092	620003527

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 藤本製薬株式会社:カイロック錠臨床報告集計(社内資料)
- 2) 藤本製薬株式会社:カイロック細粒臨床報告集計(社内資料)
- 3) 藤本製薬株式会社:カイロック錠止血効果集計(社内資料)
- 4) 藤本製薬株式会社:カイロック錠 Zollinger-Ellison 症候群症例報告(社内資料)
- 5) 小林 省三 他:薬理と治療 11(5), 1631-1641, 1983
- 6) 小林 省三 他:薬理と治療 11(5), 1643-1650, 1983
- 7) 小林 省三 他:薬理と治療 11(5), 1651-1655, 1983
- 8) 李 和泉 他:日本消化器病学会雑誌 80(5), 1126-1131, 1983
- 9) 石原 和彦 他:日本消化器病学会雑誌 78(10), 1896-1900, 1981
- 10) Pounder, R. E. et al., *Excerpta Medica* 189-206, 1977
- 11) 藤本製薬株式会社:カイロック細粒 40%のヒトにおける血中濃度に関する資料
ーカイロック錠 200 との比較試験ー(社内資料)
- 12) 藤本製薬株式会社:カイロック錠 200 のヒトにおける血中濃度に関する資料
ー単回及び 1 週間反復投与ー(社内資料)
- 13) Howe, J. P. et al., *Anaesthesia*, 36, 371-375, 1981
- 14) Somogyi, A. and Gugler, R., *Br. J. Clin. Pharmacol.*, 7, 627-629, 1979
- 15) Taylor, D. C. and Cresswell, P. R., *Biochem. Soc. Transactions*, 3, 884-885, 1975
- 16) 千葉 寛:医学のあゆみ, 182(11), 803-806, 1997
- 17) Hyneck, M. L. et al., *Am. J. Hosp. Pharm.*, 38, 1760-1762, 1981
- 18) Ma, K. W. et al., *Gastroenterology*, 74(2), 473-477, 1978
- 19) 高橋 宏幸 他:薬理と治療 11(5), 1665-1684, 1983
- 20) 北尾 勉 他:薬理と治療 11(5), 1685-1691, 1983
- 21) 北尾 勉 他:薬理と治療 11(5), 1693-1701, 1983
- 22) 北尾 勉 他:薬理と治療 11(5), 1703-1718, 1983
- 23) 北尾 勉 他:薬理と治療 11(5), 1719-1725, 1983
- 24) 北尾 勉 他:薬理と治療 11(5), 1727-1741, 1983
- 25) 北尾 勉 他:薬理と治療 11(5), 1743-1753, 1983

2. その他の参考文献

該当資料なし

3. 文献請求先

引用文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

藤本製薬株式会社 医薬学術部

〒580-8503 大阪府松原市西大塚 1 丁目 3 番 40 号

TEL : 0120-225-591 FAX : 0120-116-026

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

国名	米国	英国
販売名	Tagamet	Tagamet
会社名	Glaxo-Smithkline	Glaxo-Smithkline
発売年	1977年	1976年
剤形・含量	錠剤：200 mg 錠、300 mg 錠 400 mg 錠、800 mg 錠 (液剤、注射剤もあり)	錠剤：200 mg 錠、300 mg 錠 400 mg 錠、800 mg 錠 (発泡錠、シロップ剤、注射剤もあり)
効能・効果	<ul style="list-style-type: none"> ・活動性十二指腸潰瘍の短期治療 ・活動性潰瘍治癒後の十二指腸潰瘍患者に対する減量維持療法 ・良性の活動性胃潰瘍の短期治療 ・びらん性逆流性食道炎(GERD) ・重篤患者に対する上部消化管出血の予防 ・分泌過多異常症の治療 (例. Zollinger-Ellison 症候群、全身性肥満細胞症、多発性内分泌腺腫) 	<ul style="list-style-type: none"> ・十二指腸潰瘍及び良性の胃潰瘍 (非ステロイド性抗炎症薬に関連したもの、再発性及び口腔潰瘍形成や逆流性食道炎を含む) ・持続性の消化不良の症状—特に食事に関連した上腹部痛(非ステロイド性抗炎症薬に関連した症状を含む) ・危篤状態の患者のストレス潰瘍による消化管出血の予防 ・Mendelson 症候群の危険があると考えられる全身麻酔前の患者(特に分娩中の妊婦の患者) ・短腸症候群における吸収不良及び体液の損失の減少 ・Zollinger-Ellison 症候群
用法・用量	<p>活動性十二指腸潰瘍 800 mg か 1600 mg の就寝前投与</p> <p>十二指腸潰瘍に対する維持療法 就寝前 400 mg</p> <p>良性の活動性胃潰瘍 800 mg 就寝前投与あるいは、300 mg の 1 日 4 回毎食後及び就寝前投与。</p> <p>びらん性逆流性食道炎(GERD) 1 日 1600 mg を分服(800 mg 1 日 2 回あるいは 400 mg 1 日 4 回)、12 週間投与</p> <p>胃酸分泌過多異常 (Zollinger-Ellison 症候群など) 300 mg 1 日 4 回毎食後と就寝前投与。 通常 1 日 2400 mg を越えないこと。</p>	<p>十二指腸潰瘍及び良性の胃潰瘍 ・1 日 1 回 800 mg 就寝前投与 ・1 日 2 回 400 mg 朝食時と就寝前投与 ・200 mg 1 日 3 回毎食後及び 400 mg 就寝前投与 (計 1.0 g/日) ・400 mg 1 日 4 回毎食後及び就寝前投与 (計 1.6 g/日)</p> <p>重篤患者のストレス潰瘍による出血の予防 1 日 200~400 mg 投与</p> <p>Mendelson 症候群の危険があると考えられる患者 全身麻酔導入前あるいは分娩開始処置前に 400 mg、90~120 分間の経口投与。最大 2.4 g まで増量可能。</p> <p>胃酸分泌過多異常の患者 (例. Zollinger-Ellison 症候群) 1 日 4 回 400 mg の経口投与。</p>

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

カイクック細粒40%の配合変化表

※: 単品も同様の変化あり ー: いずれの項目も変化なし

商品名	Lot No.	会社名	配合前の外観		0日目	1日目	2日目	3日目	7日目	10日目	14日目
			色及び形状	におい							
カイクック細粒40% 単品	1712	藤本製薬	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
アスコンP顆粒50%	1610	日本ケミフア	白色の顆粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
アラタSP細粒20%	VN051VR	キッセイ薬品工業	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
アルミガル細粒99%	I5G020H	中外製薬	白色の細粒	わずかに特異な芳香あり	ー	ー	ー	ー	ー	湿潤あり※	湿潤あり※
アルサルミン細粒90%	U5D160G	中外製薬	白色の細粒	わずかに特異な芳香あり	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
イサロン顆粒25%	489	あすか製薬	白色の顆粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
S・M配合散	444U	第一三共エスファ	淡黄褐色の散剤	芳香あり	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
キャバジンUコーワ配合散	XH5E	興和	緑色の散剤	特異なおいあり	ー	ー	ー	ー	異臭あり※	異臭あり※	異臭あり※
ゲファエニール細粒10%	PH044	大日本住友製薬	白色の細粒	特異なおいあり	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
コランチル配合顆粒	FG02	塩野義製薬	白色の顆粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
ストロカイン顆粒5%	5402	サンノーマ	白色の円柱状の顆粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
セルベックス細粒10%	9932	エーザイ	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
セレキノン細粒20%	7Y044	田辺三菱製薬	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
ソロン細粒20%	2088C	大正製薬	微黄色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
チアトニ顆粒2%	3K11	アボットジャパン	微黄白色の顆粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
ドクマチール細粒10%	0010	アステラス製薬	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
ドクマチール細粒50%	2090	アステラス製薬	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
ナウゼリン細粒1%	166AG	協和発酵キリン	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
ノイエル細粒40%	E1313	第一三共エスファ	白色の細粒	わずかに特異なおいあり	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
プリンパラン細粒2%	4910	アステラス製薬	白色の細粒	なし	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
マーズレンS配合顆粒	H290	寿製薬	淡青色の顆粒	わずかに特異なおいあり	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
メサブリン配合散	5309	サンノーマ	緑色の粉末	わずかに特異なおいあり	ー	ー	ー	ー	ー	ー	ー
ロートエキス散「ホエイ」	2190H	マイラン製薬	黄褐色の粉末	わずかに特異なおいあり	ー	ー	ー	ー	湿潤あり※	湿潤あり※	湿潤あり※