

**2015年6月改訂（第10版）
*2014年4月改訂

日本標準商品分類番号
8 7 2 3 2 5

胃炎・消化性潰瘍治療剤

カイロック® 細粒40%

CYLOCK® (シメチジン製剤)

	カイロック細粒40%
承認番号	21800AMX10378000
薬価収載	2006年6月
販売開始	1987年12月
再審査結果	1989年3月
効能追加	1989年2月


貯 法：遮光・室温保存、気密容器
「取扱い上の注意」の項参照

使用期限：外箱に表示

【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

【組成・性状】

品 名	カイロック細粒40%
成分・含量	1g中 シメチジンを400mg含有
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
外観・性状	白色～微黄色の細粒
識別コード	 422

【効能・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

【用法・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800mg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800mg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400mg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】

- 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。

【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）

- 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）
- 肝障害のある患者
- 薬物過敏症の既往歴のある患者
- 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

2. 重要な基本的注意

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。

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
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	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。

薬 剤 名 等	臨 床 症 状 措 置 方 法	機 序 危 険 因 子
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	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。	本剤が近位尿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	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。	機序不明

4. 副作用

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。（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。

(1) 重大な副作用

- 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。

(2) 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、膝炎、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。

5. 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。]

6. 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。]

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. 過量投与

症状・徴候 外国において、シメチジン20gから40g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40g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（10g）、外国では100錠（20g）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。

9. 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重量の減少が報告されている。
- (2) ラットに24ヵ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。

〔薬物動態〕^{1, 2)}

血中濃度

健康人に経口投与した場合、約1時間後に最高血中濃度に達した。また、1週間連続経口投与においても蓄積傾向は認められなかった。

〔臨床成績〕^{3, 4, 5, 6)}

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. 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800mg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、自覚症状及び内視鏡所見において有用性が認められた。

〔薬効薬理〕

1. 胃液分泌抑制作用⁷⁾

ラット及びイヌにおいて基礎分泌並びにヒスタミン、カルバコール、食餌、インスリン刺激による胃酸分泌及びペプシン分泌を著明に抑制した。

2. 急性胃・十二指腸潰瘍⁸⁾

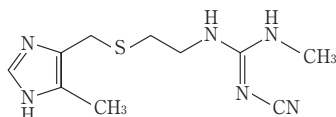
モルモットにおけるヒスタミン潰瘍及びラットにおけるアスピリン潰瘍、インドメタシン潰瘍、ストレス潰瘍、カルバコール・ヒスタミン潰瘍に対して抗潰瘍効果を認めた。

3. 慢性胃・十二指腸潰瘍⁹⁾

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。

〔有効成分に関する理化学的知見〕

構造式：



一般名：シメチジン (Cimetidine)

化学名：2-Cyano-1-methyl-3-[(2-[(5-methyl-1H-imidazol-4-yl)methylsulfanyl]ethyl)guanidine]

分子式：C₁₀H₁₆N₆S

分子量：252.34

融点：140~144℃

性状：白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。メタノール又は酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、水に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。光によって徐々に着色する。

〔取扱い上の注意〕

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。

**〔包装〕

(0.5g分包) × 200包
(バラ) 100g
500g

〔主要文献〕

- 1) 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－単回及び1週間反復投与－(社内資料)
- 2) 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－カイロック錠200との比較試験－(社内資料)
- 3) 藤本製薬株式会社：カイロック錠臨床報告集計(社内資料)
- 4) 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)
- 5) 藤本製薬株式会社：カイロック錠止血効果集計(社内資料)
- 6) 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)
- 7) 小林省三 他：薬理と治療, 11, 1631-1641, 1983
- 8) 小林省三 他：薬理と治療, 11, 1643-1650, 1983
- 9) 小林省三 他：薬理と治療, 11, 1651-1655, 1983

〔文献請求先〕

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

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



藤本製薬株式会社

大阪府松原市西大塚1丁目3番40号

(Ro-7)

®登録商標