



日本標準商品分類番号
872399

貯 法：室温保存
使用期限：外箱、容器に使用期限を表示

	錠100mg	細粒20%
承認番号	21900AMX00681	21900AMX00682
薬価収載	2007年6月	
販売開始	1984年5月	1987年11月
再審査結果	1991年3月	

消化管運動調律剤

セレキノン®錠100mg

セレキノン®細粒20%

CEREKINON® Tablets 100mg・Fine Granules 20%

(トリメブチンマレイン酸塩製剤)

【組成・性状】

販売名	セレキノン錠100mg	セレキノン細粒20%
成分・含量	日局 トリメブチンマレイン酸塩	
	1錠中 100mg	1g中 200mg
添加物	エチルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、セルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000	エチルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、デキストリン、二酸化ケイ素、乳糖水和物
剤形	フィルムコーティング錠	マイクロカプセル化した細粒剤
色調	白色～微黄白色	白色～微黄白色
外形		/
サイズ(mm)	直径：8.0 厚さ：3.5	
重さ(g)	0.17	
識別コード	TA127	

【効能・効果】

- 慢性胃炎における消化器症状(腹部疼痛、悪心、嘔気、腹部膨満感)
- 過敏性腸症候群

【用法・用量】

- 慢性胃炎における消化器症状に使用する場合
トリメブチンマレイン酸塩として、通常成人1日量300mg(錠：3錠、細粒：1.5g)を3回に分けて経口投与する。
年齢、症状により適宜増減する。
- 過敏性腸症候群に使用する場合
トリメブチンマレイン酸塩として、通常成人1日量300～600mg(錠：3～6錠、細粒：1.5～3.0g)を3回に分けて経口投与する。

【使用上の注意】

1. 副作用

臨床試験(治験)：総症例1,515例中、副作用が報告されたのは74例(4.88%)で、主な副作用は便秘20件(1.32%)、口渇10件(0.66%)、下痢8件(0.53%)等であった。
使用成績調査(承認時～再審査終了時)：総症例61,246例中、副作用が報告されたのは198例(0.32%)で、主な副作用は発疹51件(0.08%)、下痢32件(0.05%)、便秘22件(0.04%)、そう痒感18件(0.03%)、口渇14件(0.02%)等であった。

(1) 重大な副作用

肝機能障害(0.1%未満)、**黄疸**(頻度不明)：AST(GOT)、ALT(GPT)、ALP、LDH、 γ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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) その他の副作用

副作用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。

種類	頻度	0.1%未満
消化器		便秘、下痢、腹鳴、口渇、口内しびれ感、悪心、嘔吐
循環器		心悸亢進
精神神経系		眠気、めまい、倦怠感、頭痛
過敏症		発疹、蕁麻疹、そう痒感
泌尿器		排尿障害、尿閉

2. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

3. 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まわ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。〕
- 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。〔授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

4. 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(なお、再審査時の15歳未満の調査例数381例で副作用は認められなかった)。

5. 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、更には穿孔をお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】

1. 吸収・血中濃度

健康成人男子にトリメブチンマレイン酸塩を100mg経口投与したとき、血漿中トリメブチン濃度は30分前後に最高値32.5～42.3ng/mLを示す。半減期は約2時間である。

2. 代謝・排泄

健康成人男子にトリメブチンマレイン酸塩を経口投与したとき、加水分解、N-脱メチル及び抱合化を受け尿中へ排泄される。
24時間尿中未変化体の排泄率は0.01%以下である。

【臨床成績】

臨床効果

1) 慢性胃炎

2種の二重盲検比較試験を含む臨床試験の結果、慢性胃炎(526例)における消化器症状(腹部膨満感、腹部疼痛、悪心、嘔気など)に対し総合改善率(中等度改善以上)は64.1%であった。
なお、市販後の使用成績調査(27,096例)においても承認時までの臨床成績と同等以上の結果が得られている。(再審査終了時)

2)過敏性腸症候群

2種の二重盲検比較試験を含む臨床試験の結果、過敏性腸症候群(642例)における便通異常及び消化器症状の総合改善率(中等度改善以上)は56.5%であった。なお、市販後の使用成績調査(2,152例)においても承認時までの臨床成績と同等以上の結果が得られている。(再審査終了時)

【薬効薬理】

1.消化管運動に対する作用

1)胃運動調律作用

- モルモット摘出胃前庭部の輪状筋標本に対し、 10^{-5} g/mLで自動運動の振幅を減少させる。一方、同標本の28℃での不規則かつ減弱した運動に対しては頻度及び振幅を増加させ、規則的な律動性収縮運動へ移行させる。¹⁾
- 胸部迷走神経を切断した麻酔犬の不規則な胃運動に対し、3mg/kgの静脈内投与で規則的な胃運動に移行させる。²⁾
- 消化器疾患患者の胃幽門部運動に対し、1mg/kgの静脈内投与で運動機能亢進群では運動抑制が認められる。一方、運動機能低下群では運動亢進が認められる。³⁾

2)消化管運動誘発作用

ヒトの消化管運動に対し、4~6mg/kgの空腸内投与で生理的な消化管運動の誘発が認められる。⁴⁾

3)胃排出能改善作用

上腹部消化器不定愁訴を有する慢性胃炎患者に対し、200mgの経口投与で、胃排出能の低下している場合には亢進させる。一方、亢進している場合には抑制傾向が認められる。⁵⁾

4)腸運動調律作用

- モルモット摘出結腸標本に対し、 10^{-5} g/mLで筋の緊張度が低い場合(低負荷時)にはトーンスを増加させる。一方、筋の緊張度が高い場合(高負荷時)にはトーンスを低下させ、振幅を減少させる。⁶⁾
- 過敏性腸症候群患者の心理ストレス負荷による大腸運動亢進に対し、300mg経口投与で運動抑制が認められる。⁷⁾
- ネオスチグミン負荷により運動亢進したヒトの回腸、上行結腸、S状結腸に対し、50mg静脈内投与で、負荷前のレベルまで運動を抑制する。⁸⁾

5)食道下端括約圧(LESP)調節作用

麻酔犬の食道下端括約圧に対し、0.6mg/kg静脈内投与でテトラガストリン負荷による内圧上昇を低下させる。一方、セクレチン負荷による内圧低下を上昇させる。⁹⁾

6)消化管平滑筋直接作用

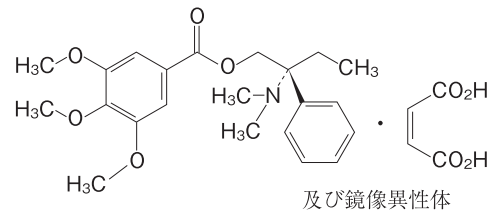
- モルモット摘出胃前庭部の輪状筋標本に対する作用はアトロピン、フェントラミン、プロプラノロール及びテトロドトキシンの存在下でも発現する。¹⁾
- モルモット摘出回腸のアセチルコリンによる収縮を非競合的に抑制する。¹⁰⁾また、麻酔犬の消化管運動に対する作用は胸部迷走神経を切断しても発現する。²⁾

2.末梢性鎮吐作用

イヌにおいて、アポモルヒネ誘発の嘔吐に対する抑制作用は弱い。硫酸銅誘発の嘔吐に対し3mg/kgの静脈内投与又は60mg/kgの経口投与で嘔吐発現潜時を明らかに延長させる。¹¹⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

- 一般名：トリメブチンマレイン酸塩
(Trimebutine Maleate)
- 化学名：(2RS)-2-Dimethylamino-2-phenylbutyl 3,4,5-trimethoxybenzoate monomaleate



$C_{22}H_{29}NO_5 \cdot C_4H_4O_4$: 503.54

**○性状：

- ・白色の結晶又は結晶性の粉末である。
- ・*N,N*-ジメチルホルムアミド又は酢酸(100)に溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けやすく、水又はエタノール(99.5)に溶けにくい。
- ・0.01mol/L塩酸試液に溶ける。
- ・本品の*N,N*-ジメチルホルムアミド溶液(1→20)は旋光性を示さない。
- ・融点：131~135℃

【包装】

セレキノン錠100mg： 100錠(10錠×10)、
1,000錠(10錠×100)、
2,100錠(21錠×100)、
500錠(バラ)

セレキノン細粒20%： 300g(0.5g×600包)、
100g、
500g

【主要文献】

- 1) 竹永秀幸 他：日本薬理学雑誌 1982；80(2)：163-168
- 2) 玉木 元 他：日本平滑筋学会雑誌 1984；20(5)：407-412
- 3) Mazzone, O. et al. : Clin. Ter. 1980；95(6)：629-635
- 4) 西岡利夫 他：日本平滑筋学会雑誌 1982；18(2)：105-113
- 5) 原沢 茂 他：臨牀と研究 1985；62(5)：1487-1491
- 6) Takenaga, H. et al. : Jpn. J. Pharmacol. 1984；34(2)：177-181
- 7) 福土 審 他：薬理と治療 1986；14(9)：5841-5854
- 8) 佐々木大輔：Therapeutic Research 1985；3(5)：788-797
- 9) 川村 武：Therapeutic Research 1985；3(5)：761-766
- 10) 石田柳一 他：基礎と臨床 1982；16(8)：4139-4152
- 11) 玉木 元 他：基礎と臨床 1982；16(8)：4153-4160

**【文献請求先】

田辺三菱製薬株式会社 くすり相談センター
〒541-8505 大阪市中央区道修町3-2-10
電話 0120-753-280

**



製造販売元

田辺三菱製薬株式会社
大阪市中央区道修町3-2-10