

消化器系 鎮痙・鎮痛剤
N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩錠

ダイピン[®]錠1mg

貯法：室温保存
有効期間：5年

DAIPIN[®] Tablets 1mg

承認番号	22000AMX02063
販売開始	1972年11月

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕
- 前立腺肥大による排尿障害のある患者〔排尿筋を弛緩、膀胱括約筋を収縮させるため、更に排尿が困難となり、症状が悪化するおそれがある。〕
- 重篤な心疾患のある患者〔心拍数の増加をきたし、また末梢血管の収縮も起こるため、心臓の仕事量が増加し、症状が悪化するおそれがある。〕
- 麻痺性イレウスの患者〔消化管運動を低下させるため症状が悪化するおそれがある。〕
- 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

販売名	有効成分	添加剤
ダイピン錠 1mg	1錠中N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩1mg	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、ステアリン酸マグネシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク、白糖、沈降炭酸カルシウム、グリセリン脂肪酸エステル、カルナウバロウ

3.2 製剤の性状

販売名	色・剤形	外形			識別コード
		直径(mm)	厚さ(mm)	質量(mg)	
ダイピン錠 1mg	白色・糖衣錠				D106
		6.7	3.8	130	

4. 効能又は効果

次の疾患時の痙攣性疼痛

胃炎、胃潰瘍、十二指腸潰瘍

6. 用法及び用量

通常成人1回1~2錠、1日3~4回経口投与する。
年齢、症状により適宜増減する。

8. 重要な基本的注意

眼の調節障害、めまい等を起こすことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意させること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 開放隅角緑内障の患者

抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。

9.1.2 前立腺肥大のある患者(排尿障害のある患者を除く)

排尿が困難となり、症状が悪化するおそれがある。

9.1.3 うっ血性心不全のある患者

心拍数の増加をきたし、症状が悪化するおそれがある。

9.1.4 不整脈のある患者

心拍数の増加をきたし、症状が悪化するおそれがある。

9.1.5 潰瘍性大腸炎の患者

中毒性巨大結腸があらわれることがある。

9.1.6 甲状腺機能亢進症の患者

本剤の抗コリン作用により症状が悪化することがある。

9.1.7 高温環境にある患者

発汗が抑制され、体温の上昇をきたすことがある。

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。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。前立腺肥大を伴っている場合が多く、また生理機能が低下している。

10. 相互作用

10.2 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
抗コリン作用を有する薬剤 三環系抗うつ薬、フェンチアジン系薬剤、モノアミン酸化酵素阻害薬、抗ヒスタミン薬等	本剤の作用が増強されることがある。	これらの薬剤の抗コリン作用によると考えられている。

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。

	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満
眼	—	調節障害	—
消化器	口渇、便秘	腹部膨満感、下痢	悪心、食欲不振
泌尿器	—	排尿障害	—
循環器	—	心悸亢進	—
過敏症	—	発疹等	—
その他	—	熱感	鼻閉、めまい

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

マウスに¹⁴C-N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩を経口投与した場合、投与30分後より血中に認められ1時間後に最高血中濃度に達し、6時間後ではごく少量しか認められなかった¹⁾。

16.3 分布

マウスに¹⁴C-N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩を経口投与した場合、胃、副腎、脳、顎下腺、脾、肺、心、脾、腎、肝、眼球、睾丸及び前立腺では1時間後に、筋では2時間後、腸では6時間後に最高濃度に達した。各臓器内濃度の比較では、胃、腸>肝>腎の順に高く分布した¹⁾。

16.4 代謝

16.4.1 尿中代謝物

ラットに¹⁴C-N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩を経口投与した場合、48時間後までに尿中より46.9%が回収され、主なものは未変化体(34.9%)及び4'-hydroxy体(39.6%)であった²⁾。

16. 4. 2 糞中代謝物

ラットに¹⁴C-N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩を経口投与した場合、48時間後までに糞中より35.3%が回収され、ほとんどが未変化体(91.7%)であった²⁾。

16. 5 排泄

マウスに¹⁴C-N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩226mg/kgを経口投与した場合、投与後48時間以内に全投与量の90%程度(尿中排泄：67.2%、糞中排泄：21.2%)が排泄された¹⁾。

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。
水に極めて溶けやすく、酢酸(100)、メタノール又はN,N-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、アセトンに溶けにくく、クロロホルムに極めて溶けにくい。
水溶液(1→50)のpHは4.0~6.0である。
融点：173~177℃(分解)

17. 臨床成績

17. 1 有効性及び安全性に関する試験

17. 1. 1 国内一般臨床試験

多施設で実施された国内一般臨床試験において、有効率は、胃潰瘍80.0%(48例/60例)、十二指腸潰瘍85.0%(51例/60例)、胃炎83.3%(80例/96例)であった。

17. 1. 2 国内二重盲検比較試験

本剤及びプラセボを二重盲検クロスオーバー法にて1回2錠、1日3回2日間ずつ投与した結果、本剤の有用性が認められた。本剤の有効率は胃潰瘍85.7%(12例/14例)、十二指腸潰瘍90.0%(9例/10例)、胃炎81.3%(13例/16例)であった。また、副作用発現率は25.8%(17例/66例³⁾)で、主な副作用は口渇18.2%(12例/66例)であった。

注)安全性評価対象例66例には、承認された効能又は効果以外の腹痛を主訴とする消化器疾患を含む。

18. 薬効薬理

18. 1 作用機序

副交感神経の末端シナプスに働き、アセチルコリンと競合的に拮抗して強力な抗コリン作用を示すが、自律神経節遮断作用はほとんど認められていない³⁾。

血中ガストリンの上昇は抑制しないが、ガストリンによる壁細胞からの胃液分泌をほとんど完全に抑制する⁴⁾。

18. 2 鎮痙作用

18. 2. 1 摘出腸管に対する作用

アセチルコリン、ヒスタミン等による腸管収縮を抑制する。抗アセチルコリン作用はブチルスコポラミン臭化物の90倍以上であることが認められている(モルモット)³⁾。

18. 2. 2 生体内胃及び腸管に対する作用

胃及び腸管の緊張を低下し、自動運動、迷走神経刺激による運動亢進を抑制する(イヌ、ヒト)^{3,5,6)}。

18. 3 胃液分泌抑制作用・抗潰瘍作用

テトラガストリン刺激による胃液分泌の亢進(ラット)、グリシン経口投与刺激による胃液分泌の亢進(イヌ)を抑制する。実験潰瘍に対してアトロピン硫酸塩水和物の8倍以上の抗潰瘍作用が認められている(ラット)⁴⁾。

18. 4 制酸効果の持続作用

重炭酸ナトリウムの酸中和作用による胃液pHの上昇を持続・増強させることが認められている(ラジオカプセル法)。

18. 5 自律神経系に対する作用

自律神経節遮断作用はブチルスコポラミン臭化物と比較して弱いことが認められている(ネコ)が、静脈内投与実験で一過性の血圧下降、心拍数の減少、呼吸の抑制が認められている(イヌ)³⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

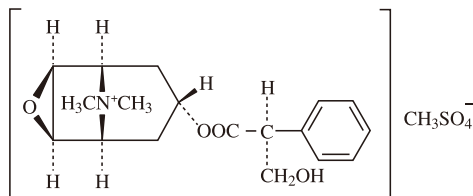
一般的名称：N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩
(N-Methylscopolamine Methylsulfate)

化学名：[(1R,2R,4S,5S)-9,9-dimethyl-3-oxa-9-azoniatricyclo[3.3.1.0^{2,4}]nonan-7-yl](2S)-3-hydroxy-2-phenylpropanoate;methyl sulfate

分子式：C₁₉H₂₇NO₈S

分子量：429.48

化学構造式：



22. 包装

100錠 [10錠(PTP)×10]

23. 主要文献

- 1) 豊島 滋 他：薬物療法. 1970；3(12)：2143-2148
- 2) 佐野光司 他：Chem Pharm Bull. 1974；22(3)：696-706
- 3) 笠原 明 他：日本薬理学雑誌. 1971；67(1)：100-124
- 4) 松尾 裕：基礎と臨床. 1973；7(12)：2846-2856
- 5) 福原 武 他：日本平滑筋学会雑誌. 1970；6(4)：263-269
- 6) 木原 彊 他：臨牀と研究. 1972；49(7)：2009-2012

24. 文献請求先及び問い合わせ先

アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

26. 製造販売業者等

26. 1 製造販売元

alfresa アルフレッサ ファーマ株式会社
大阪市中央区石町二丁目2番9号

®登録商標