

解熱鎮痛剤

貯 法：室温保存
有効期間：3年

イソプロピルアンチピリン・アセトアミノフェン・アリ
ルイソプロピルアセチル尿素・無水カフェイン配合顆粒

承認番号 22100AMX00809000
販売開始 2003年7月

SG 配合顆粒

SG Combination Granules

シオノギ製薬

1. 警告

- 1.1 本剤中のアセトアミノフェンにより重篤な肝障害が発現するおそれがあるので注意すること。[2.3、9.1.3、9.1.4、9.3.1、9.3.2、10.2、11.1.7、13.1.1参照]
- 1.2 本剤とアセトアミノフェンを含む他の薬剤（一般用医薬品を含む）との併用により、アセトアミノフェンの過量投与による重篤な肝障害が発現するおそれがあることから、これらの薬剤との併用を避けること。[11.1.7、13.1.2参照]

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤、ピラゾロン系薬剤（スルピリン等）又はアミノフェノール系薬剤（アセトアミノフェン等）に対し過敏症の既往歴のある患者 [8.5参照]
- 2.2 アスピリン喘息（非ステロイド性消炎鎮痛剤等による喘息発作の誘発）又はその既往歴のある患者 [喘息発作を誘発することがある。] [11.1.4参照]
- 2.3 重篤な肝障害のある患者 [1.1、9.1.3、9.1.4、9.3.1、10.2、11.1.7、13.1.1参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	SG 配合顆粒	
有効成分	1g 中	
	イソプロピルアンチピリン	150mg
	アセトアミノフェン	250mg
	アリルイソプロピルアセチル尿素 無水カフェイン	60mg 50mg
添加剤	乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、メチルセルロース、含水二酸化ケイ素	

3.2 製剤の性状

販売名	SG 配合顆粒
性状・剤形	白色の顆粒剤である。

4. 効能・効果

感冒の解熱、耳痛、咽喉痛、月経痛、頭痛、歯痛、症候性神経痛、外傷痛

6. 用法・用量

通常、成人1回1gを1日3~4回経口投与する。
頓用の場合には、1~2gを服用させるが、追加するときは少なくとも4時間以上経過後とする。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
ただし、1日最高4gまでとする。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 解熱鎮痛剤による治療は原因療法ではなく対症療法であることに留意すること。
- 8.2 原則として長期投与を避けること。[15.1.1-15.1.3、15.2参照]
- 8.3 過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等があらわれることがあるので、特に高熱を伴う高齢者又は消耗性疾患の患者においては、投

与後の患者の状態に十分注意すること。[9.8参照]

- 8.4 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転、機械の操作等、機敏な動作を必要とする仕事になるべく従事させないように注意すること。
- 8.5 過敏症状等を予測するため十分な問診を行うこと。[2.1参照]

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 血液障害（貧血、白血球減少症等）のある患者
血液障害を悪化させるおそれがある。[11.1.1参照]
- 9.1.2 本人又は両親、兄弟に他の薬物に対するアレルギー、蕁麻疹、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、食物アレルギー等のある患者〔アスピリン喘息（非ステロイド性消炎鎮痛剤等による喘息発作の誘発）又はその既往歴のある患者を除く〕
[11.1.4参照]

9.1.3 アルコール多量常飲者

肝障害があらわれやすくなる。[1.1、2.3、9.1.4、9.3.1、9.3.2、10.2、11.1.7、13.1.1参照]

9.1.4 絶食・低栄養状態・摂食障害等によるグルタチオン欠乏、脱水症状のある患者

肝障害があらわれやすくなる。[1.1、2.3、9.1.3、9.3.1、9.3.2、10.2、11.1.7、13.1.1参照]

9.2 腎機能障害患者

腎障害を悪化させるおそれがある。[11.1.6参照]

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝障害のある患者

投与しないこと。肝障害を悪化させるおそれがある。[1.1、2.3、9.1.3、9.1.4、10.2、11.1.7、13.1.1参照]

9.3.2 肝障害のある患者（重篤な肝障害のある患者を除く）

肝障害を悪化させるおそれがある。[1.1、9.1.3、9.1.4、10.2、11.1.7、13.1.1参照]

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。投与する際には、必要最小限にとどめ、適宜羊水量を確認するなど慎重に投与すること。シクロオキシゲナーゼ阻害剤（経口剤、坐剤）を妊婦に使用し、胎児の腎機能障害及び尿量減少、それに伴う羊水過少症が起きたとの報告がある。また、動物試験（マウス）でイソプロピルアンチピリンの類似化合物（スルピリン）に催奇形作用が報告されている¹⁾。妊娠後期の女性へのアセトアミノフェンの投与により胎児に動脈管収縮を起こすことがある。また、妊娠後期のラットにイソプロピルアンチピリン又はアセトアミノフェンを投与した試験で、弱い胎児の動脈管収縮が報告されている²⁾。

*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。また、長期連用を避けること。本剤中の成分は母乳中に移行する。

SG 配合顆粒 (2)

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

少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。副作用があらわれやすい。[8.3 参照]

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
アルコール [1.1、2.3、9.1.3、9.1.4、9.3.1、9.3.2、11.1.7、13.1.1 参照]	アルコール多量常飲者がアセトアミノフェンを服用したところ肝不全を起こしたとの報告がある。	アルコールによりアセトアミノフェンから肝毒性を持つ <i>N</i> -アセチル- <i>p</i> -ベンゾキノンイミンへの代謝が促進される。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 血小板減少、溶血性貧血 (いずれも頻度不明)

[9.1.1 参照]

11.1.2 中毒性表皮壊死融解症 (Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson 症候群)、急性汎発性発疹性膿疱症 (いずれも頻度不明)

11.1.3 ショック、アナフィラキシー (いずれも頻度不明)

不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗、呼吸困難、血圧低下等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。

11.1.4 喘息発作 (頻度不明)

重篤な喘息発作を誘発することがある。[2.2、9.1.2 参照]

11.1.5 間質性肺炎 (頻度不明)

咳嗽、呼吸困難、発熱、肺音の異常等が認められた場合には、速やかに胸部 X 線、胸部 CT、血清マーカー等の検査を実施すること。異常が認められた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

11.1.6 間質性腎炎、急性腎障害 (いずれも頻度不明)

[9.2 参照]

11.1.7 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸 (いずれも頻度不明)

劇症肝炎、AST、ALT、 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。[1.1、1.2、2.3、9.1.3、9.1.4、9.3.1、9.3.2、10.2、13.1.1、13.1.2 参照]

11.2 その他の副作用

種類\頻度	頻度不明
過敏症	発疹、紅斑、そう痒
血液	血小板減少、顆粒球減少、溶血性貧血
肝臓	肝機能障害
腎臓	腎障害
消化器	悪心・嘔吐、腹痛、食欲不振、腹部膨満感、胃不快感、便秘、下痢、口内炎
精神神経系	眠気、ふらつき、めまい、頭痛、しびれ感
その他	発汗、熱感、全身倦怠感、脱力感、肩こり

13. 過量投与

13.1 症状

13.1.1 アセトアミノフェンの過量投与により、肝臓・腎臓・心筋の壊死 (初期症状：悪心、嘔吐、発汗、全身倦怠感等) が起こったとの報告がある。[1.1、2.3、9.1.3、9.1.4、9.3.1、9.3.2、10.2、11.1.7 参照]

13.1.2 総合感冒剤や解熱鎮痛剤等の配合剤には、アセトアミノフェンを含むものがあり、本剤とアセトアミノフェン又はその配合剤との偶発的な併用により、アセトアミノフェンの過量投与による重篤な肝障害が発現するおそれがある。[1.2、11.1.7 参

照]

13.2 処置

アセトアミノフェン過量投与時の解毒 (肝障害の軽減等) には、アセチルシステインの投与を考慮すること。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 本剤中のアセトアミノフェンの類似化合物 (フェナセチン) の長期投与により、血色素異常を起こすことがあるので、長期投与を避けること。[8.2 参照]

15.1.2 腎孟及び膀胱腫瘍の患者を調査したところ、類薬のフェナセチン製剤を長期・大量に使用 (例：総服用量 1.5~27kg、服用期間 4~30 年) していた人が多いとの報告がある。[8.2 参照]

15.1.3 非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。[8.2 参照]

15.2 非臨床試験に基づく情報

類似化合物 (フェナセチン) を長期・大量投与した動物実験で、腫瘍発生が認められたとの報告がある。[8.2 参照]

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人男性 16 例に本剤 1g を空腹時単回経口投与したときの各成分の平均血漿中濃度の推移を図 16-1 に、薬物動態パラメータを表 16-1 に示す。

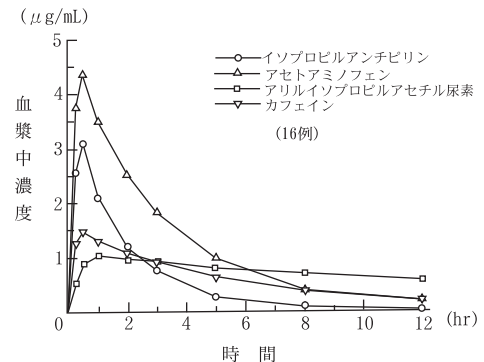


図16-1 経口投与時の血漿中濃度

表 16-1 薬物動態パラメータ

薬物	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	AUC ₀₋₁₂ (μg·hr/mL)	T _{1/2} (hr)
イソプロピルアンチピリン	3.42±0.85	0.45±0.19	6.60±2.05	1.49±0.30
アセトアミノフェン	4.95±1.31	0.56±0.45	14.63±2.28	2.57±0.32
アリルイソプロピルアセチル尿素	1.09±0.12	1.08±0.71	9.08±1.35	14.28±5.81
カフェイン	1.62±0.33	0.52±0.27	7.55±1.45	4.00±0.94

(測定法：液体クロマトグラフ・タンデム質量分析) (平均値±標準偏差)

16.4 代謝

16.4.1 イソプロピルアンチピリンの主な尿中代謝物は脱メチル体の *N*-デスマチル-イソプロピルアンチピリンのエノール型グルクロン酸抱合体である³⁾。

16.4.2 アセトアミノフェンは肝臓で主にグルクロン酸抱合体、硫酸抱合体に代謝される。また、一部は CYP2E1 等により水酸化され、*N*-アセチル-*p*-ベンゾキノンイミンとなるが、肝細胞内でグルタチオン抱合を受け、メルカプツール酸となる⁴⁾。

16.4.3 カフェインは CYP1A2 による脱メチル化及び酸化によって代謝され、メチルキサンチンあるいはメチル尿酸となる^{5)、6)}。

16.5 排泄

16.5.1 カフェインはメチルキサンチンあるいはメチル尿酸となって排泄される。しかし尿中排泄は約 2/3 で残りは完全に酸化されるか、又は別の経路から排泄される⁶⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

本剤と同一有効成分を含有する錠剤の一般臨床試験を含む臨床試験成績における有効率は77.0% (204例/265例)であった^{7)~9)}。疼痛の種類別では頭痛74.5% (123例/165例)、生理痛83.5% (66例/79例)、歯痛90.0% (9例/10例)であった^{7)~9)}。

(「著効」例数+「有効」例数/有効性評価対象例数)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

イソプロピルアンチピリンとアセトアミノフェンは、体温調節中枢に作用して皮膚血管を拡張し、熱の放散を盛んにして解熱効果を示す。

アリルイソプロピルアセチル尿素は穏和な鎮静薬で、痛みに伴う不安、不快感、恐怖心等の疼痛反応を除去することにより疼痛を緩和するとともに、鎮痛薬の作用を増強する^{10)、11)}。

イソプロピルアンチピリンとアセトアミノフェンの配合により、鎮痛作用は増強される。

カフェインの中枢神経興奮作用は精神機能を活発にして、不快感等の疼痛反応を除去することにより、疼痛を緩和し、更に、血管性頭痛に対しては脳血管を収縮して鎮痛作用を示す⁶⁾。

19. 有効成分に関する理化学的見知

19.1 イソプロピルアンチピリン

一般的名称：イソプロピルアンチピリン

(Isopropylantipyrine) (JAN) [日局]

化学名：1,5-Dimethyl-4-(1-methylethyl)-2-phenyl-1,2-dihydro-3H-pyrazol-3-one

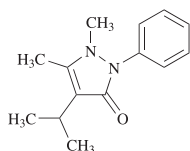
分子式：C₁₄H₁₈N₂O

分子量：230.31

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。

酢酸 (100) に極めて溶けやすく、エタノール (95) 又はアセトンに溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けやすく、水に溶けにくい。

化学構造式：



融点：103~105℃

分配係数：86.1 [pH7.4, 1-オクタノール/緩衝液]

19.2 アセトアミノフェン

一般的名称：アセトアミノフェン

(Acetaminophen) (JAN) [日局]

化学名：N-(4-Hydroxyphenyl)acetamide

分子式：C₈H₉NO₂

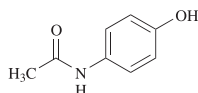
分子量：151.16

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノール又はエタノール (95) に溶けやすく、水にやや溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくい。

水酸化ナトリウム試液に溶ける。

化学構造式：



融点：169~172℃

19.3 アリルイソプロピルアセチル尿素

一般的名称：アリルイソプロピルアセチル尿素

(Allylisopropylacetylurea)

化学名：2-Isopropyl-4-pentenylurea

分子式：C₉H₁₆N₂O₂

分子量：184.24

性状：無色又は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

酢酸 (100) に溶けやすく、メタノール、エタノール

(95) 又はクロロホルムにやや溶けにくく、ジエチルエーテル又は沸騰水に溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

化学構造式：

$$\text{CH}_2=\text{CH}-\text{CH}_2-\underset{(\text{CH}_3)_2\text{CH}}{\text{C}}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{NH}_2$$

融点：194~198℃

19.4 無水カフェイン

一般的名称：無水カフェイン

(Anhydrous Caffeine) (JAN) [日局]

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

分子式：C₈H₁₀N₄O₂

分子量：194.19

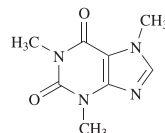
性状：白色の結晶又は粉末で、においはなく、味は苦い。

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。

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：



融点：235~238℃

22. 包装

105包 [1g×3包 (SP) ×35]

1050包 [1g×3包 (SP) ×350]

23. 主要文献

[文献請求番号]

- 1) Ungthavorn, S. et al.: J. Med. Ass. Thailand. 1970;53:550-557 [197000342]
- 2) 門間和夫ほか：日本新生児学会雑誌. 1984;20:508-518 [198402783]
- 3) 藤井彰：日大口腔科学. 1983;9:150-163 [198302278]
- 4) 東純一ほか：月刊薬事. 1998;40:3005-3016 [200400816]
- 5) Bloomer, J. C. et al.: Xenobiotica. 1995;25:917-927 [200300367]
- 6) 長崎信行ほか：現代の薬理学 (田中潔編). 東京：金原出版; 1968. p104-109
- 7) 加地正郎ほか：臨床と研究. 1991;68:853-860 [200300464]
- 8) 鎌田武信ほか：新薬と臨床. 1991;40:473-482 [199001651]
- 9) 鎌田武信ほか：新薬と臨床. 1991;40:483-489 [200300671]
- 10) Martindale: The Extra Pharmacopoeia. 27th ed. (Wade, A. et al., ed.). London: The Pharmaceutical Press; 1977. p750-751
- 11) 高木博司：常用処方薬理. 東京：南山堂; 1964. p61-73

24. 文献請求先及び問い合わせ先

塩野義製薬株式会社 医薬情報センター

〒541-0045 大阪市中央区道修町3丁目1番8号

電話 0120-956-734

FAX 06-6202-1541

<https://www.shionogi.co.jp/med/>

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

シオノギファーマ株式会社

大阪府摂津市三島2丁目5番1号

26.2 販売元

塩野義製薬株式会社

大阪市中央区道修町3丁目1番8号