

貯法	室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

日本標準商品分類番号	871242
------------	--------

承認番号	22000AMX02063
薬価収載	2008年12月
販売開始	2008年12月

消化器系 鎮痙・鎮痛剤
ダイピン[®]錠1mg
(N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩錠)
DAIPIN[®] Tablets 1mg

【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




【組成・性状】

1. 組成

1錠中に次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
ダイピン錠1mg	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

2. 製剤の性状

販売名	剤形	色	外形			識別コード
			直径(mm)	厚さ(mm)	重さ(mg)	
ダイピン錠1mg	糖衣錠	白色				φ106
			6.7	3.8	130	

【効能・効果】

次の疾患時の痙攣性疼痛
胃炎、胃潰瘍、十二指腸潰瘍

【用法・用量】

通常成人1回1～2錠(N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩として1～2mg)、1日3～4回経口投与する。
年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
 - 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。]
 - 前立腺肥大のある患者[排尿が困難となり、症状が悪化するおそれがある。]
 - 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。]
 - 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。]
 - 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。]
 - 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。]

(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。]

2. 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に注意させること。

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
抗コリン作用を有する薬剤 三環系抗うつ薬、フェノチアジン系薬剤、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可能性がある。	これらの薬剤の抗コリン作用によると考えられている。

4. 副作用

承認前の調査341例中報告された副作用は21.4%(73例)で、主な副作用は本剤の抗コリン作用によるものと考えられる口渇13.2%(45件)、便秘7.9%(27件)であった。

承認後の調査6,351例中報告された主な副作用は、本剤の抗コリン作用によるものと考えられる口渇8.7%(553件)、便秘7.9%(502件)、排尿困難0.3%(17件)、遠近調節障害0.2%(15件)、心悸亢進0.1%(9件)、その他に腹部膨満感0.3%(20件)、熱感0.1%(9件)であった。〔再審査対象外〕

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ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

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では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ので減量するなど注意すること。

6. 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。〕

7. 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。)

00552400

【薬物動態】

1. 血中濃度¹⁾

参考(動物実験)

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。

2. 分布¹⁾

参考(動物実験)

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、膵、腎、肝、眼球、睪丸及び前立腺では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。

3. 代謝²⁾

参考(動物実験)

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。

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。

4. 排泄¹⁾

参考(動物実験)

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。

【臨床成績】

多施設で実施された一般臨床試験において、有効率(有効以上)は、胃炎76%(366例/481例)、胃潰瘍74%(271例/364例)、十二指腸潰瘍80%(164例/204例)であった。

また、腹痛を主訴とした消化器疾患を対象に、ブチルスコポラミン臭化物を対照薬とした2種の二重盲検比較試験で、本剤の有用性が認められている^{3,4)}。

【薬効薬理】

1. 鎮痙作用

(1) 摘出腸管に対する作用⁵⁾

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)。

(2) 生体内胃及び腸管に対する作用^{5,6,7)}

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)。

2. 胃液分泌抑制作用・抗潰瘍作用⁸⁾

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)。

3. 制酸効果の持続作用⁹⁾

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)。

4. 自律神経系に対する作用⁵⁾

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)。

5. 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⁵⁾。

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⁸⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：N-メチルスコポラミンメチル硫酸塩

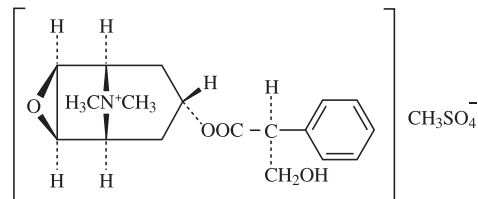
(N-Methylscopolamine Methylsulfate)

化学名：6β, 7β-epoxy-3α-(L-3-hydroxy-2-phenylpropionyloxy)-8-methyltropanium methylsulfate

分子式：C₁₉H₂₇NO₈S

分子量：429.48

構造式：



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、氷酢酸、メタノール又はジメチルホルムアミドに溶けやすく、エタノールにやや溶けにくく、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)

【包装】

ダイピ錠 1 mg (PTP)100錠

【主要文献】

- 1) 豊島 滋ほか：薬物療法 1970; 3(12)：2143-2148
- 2) 佐野光司ほか：Chem Pharm Bull. 1974; 22(3)：696-706
- 3) 久村正也ほか：新薬と臨床 1973; 22(2)：211-219
- 4) 品川晃二ほか：診療と新薬 1973; 10(7)：1581-1585
- 5) 笠原 明ほか：日本薬理学雑誌 1971; 67(1)：100-124
- 6) 福原 武ほか：日本平滑筋学会雑誌 1970; 6(4)：263-269
- 7) 木原 彊ほか：臨床と研究 1972; 49(7)：2009-2012
- 8) 松尾 裕：基礎と臨床 1973; 7(12)：2846-2856
- 9) 三好秋馬ほか：消化器系薬物研究会報告集 1972：51-61

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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

alfresa

製造販売元 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