

〈貯法〉  
容器：気密容器

カフェイン系製剤  
劇薬 日本薬局方

〈販売名〉「純生」カフェイン

# カフェイン水和物

Caffeine Hydrate

## 【組成・性状】

本品 1g 中、日本薬局方 カフェイン水和物 1g を含有する。  
本品は白色の柔らかい結晶又は粉末で、においはなく、味はやや苦い。クロロホルムに溶けやすく、水、酢酸 (100) 又は無水酢酸にやや溶けにくく、エタノール (95) に溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくい。  
本品 1.0g を水 100mL に溶かした液の pH は 5.5 ～ 6.5 である。  
本品は乾燥空气中で風解する。

## 【効能・効果】

ねむけ、倦怠感、血管拡張性及び脳圧亢進性頭痛（片頭痛、高血圧性頭痛、カフェイン禁断性頭痛など）

## 【用法・用量】

カフェイン水和物として通常成人 1 回 0.1 ～ 0.3 g を 1 日 2 ～ 3 回経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

## 【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）

- 胃潰瘍又はその既往歴のある患者〔胃液分泌を促進するため、悪影響を及ぼすおそれがある。〕
- 心疾患のある患者〔徐脈または頻脈を起こすことがある。〕
- 緑内障の患者〔症状が悪化するおそれがある。〕

### 2. 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
キサンチン系薬剤 アミノフィリン ジプロフィリン テオフィリン等 中枢神経興奮薬	過度の中枢神経刺激作用があらわれることがある。	併用薬の代謝・排泄を遅延させることがある。
MAO阻害剤	頻脈、血圧上昇等があらわれることがある。	
シメチジン	過度の中枢神経刺激作用があらわれることがある。	カフェインの代謝・排泄を遅延させることがある。

### 3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

種類／頻度	頻度不明
大量投与	振せん、不整脈、虚脱、めまい、眩暈、不眠、不安、瞳孔散大等

### 4. 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。

### 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

胎盤を通過し、また母乳中に容易に移行するので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳婦には長期連用を避けること。

### 6. 過量投与

徴候、症状

消化器症状（悪心、嘔吐等）、循環器症状（不整脈、血圧上昇等）、精神神経症状（痙攣、昏睡）、呼吸器症状（呼吸促進、呼吸麻痺等）などの増悪を起こすことがある。

## 処置

胃洗浄や吸着剤・下剤の投与により薬物を除去し、輸液等により排泄促進を行う。また、興奮状態には対症療法としてジアゼパム注、フェノバルビタール注等の中枢神経抑制薬投与を考慮し、呼吸管理を実施する。

## 【薬物動態】

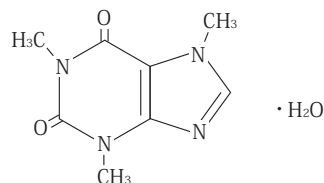
経口投与でも容易に吸収される。体内変化は主としてN-脱メチル化と8位の酸化である。ヒトの場合はN-脱メチル化した1,7-ジメチルキサンチンが多い。服用後48時間の尿中への排泄物は1,7-ジメチルキサンチンが更に脱メチル化した1-メチルキサンチンとそれが酸化された1-メチル尿酸が多く、両者で46%、1,7-ジメチルキサンチン、7-メチルキサンチン、1,3-ジメチル尿酸と未変化体が少量ずつである。  
ヒトでの半減期は成人では約3～6時間であるが、新生児では100時間にもなる。生後6箇月までは肝の代謝機能が発達していないので、未変化体のまま尿中に排泄される。血中たん白結合率は約37%で、分布容積は0.6L/kgである。

## 【薬効薬理】

中枢作用としては、大脳皮質を中心とした興奮作用、末梢作用としては、心筋収縮力増強作用、血管拡張作用、平滑筋弛緩作用、利尿作用などを現す。細胞レベルでの作用機序としては、筋小胞体からのCa<sup>2+</sup>遊離作用、ホスホジエステラーゼ阻害作用、アデノシンA<sub>1</sub>受容体遮断作用などを示す。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：カフェイン水和物（Caffeine Hydrate）  
化学名：1,3,7-Trimethyl-1*H*-purine-2,6(3*H*,7*H*)-dione monohydrate  
分子式：C<sub>8</sub>H<sub>10</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>・H<sub>2</sub>O  
分子量：212.21  
融点：235～238℃（乾燥後）  
構造式：



## 【包装】

100g、500g

## 【参考文献】

第十六改正日本薬局方解説書 2011、（廣川書店）

## 【文献請求先】

小堺製薬株式会社 品質保証室  
〒130-0026 東京都墨田区両国 4-36-9  
TEL：03-3631-1495

製造販売元



小堺製薬株式会社  
東京都墨田区両国 4-36-9