

貯法：室温保存

有効期間：3年

中枢興奮・鎮痛剤

日本薬局方 カフェイン水和物

劇薬

カフェイン水和物原末「マルイシ」

Caffeine Hydrate「Maruishi」

承認番号 22000AMX01636

販売開始 1958年10月

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	カフェイン水和物原末「マルイシ」
有効成分	1g中 日局カフェイン水和物1g

3.2 製剤の性状

販売名	カフェイン水和物原末「マルイシ」
性状	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。

4. 効能又は効果

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）

6. 用法及び用量

カフェイン水和物として、通常成人1回0.1～0.3g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。

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 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。

9.1.2 心疾患のある患者

徐脈又は頻脈を起こすことがある。

9.1.3 緑内障の患者

症状が悪化するおそれがある。

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し、長期連用を避けること。胎盤を通過する。

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、長期連用は避けること。母乳中に容易に移行する。

9.8 高齢者

本剤を減量するなど注意すること。一般に高齢者では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
他のキサンチン系薬剤 アミノフィリン水和物 ジプロフィリン テオフィリン等 中枢神経興奮薬 エフェドリン塩酸塩 マオウ等	過度の中枢神経刺激作用が現れることがある。	併用薬の代謝・排泄を遅延させることがある。
MAO阻害剤 セレギリン塩酸塩 ラサギリンメシル酸塩 サフィナミドメシル酸塩	頻脈、血圧上昇等が現れることがある。	機序は不明である。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
シメチジン	過度の中枢神経刺激作用が現れることがある。	本剤の代謝・排泄を遅延させることがある。

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。

11.2 その他の副作用

	頻度不明
循環器	不整脈 ^{注)}
精神神経系	振戦 ^{注)} 、めまい ^{注)} 、不眠 ^{注)} 、不安 ^{注)}
感覚器	瞳孔散大 ^{注)}
その他	虚脱 ^{注)}

注) 大量投与によりあらわれることがある。

13. 過量投与

13.1 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。

13.2 処置

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などの中枢神経抑制薬投与を考慮し、呼吸管理を実施する。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

カフェインは、非選択的ホスホジエステラーゼ阻害薬であり、cAMP及びcGMPの分解を抑制し、cAMP及びcGMPをセカンドメッセンジャーとする受容体機能を亢進させる。また、アデノシン受容体拮抗薬であり、A₁、A_{2A}受容体に拮抗して神経伝達物質遊離を脱抑制する¹⁾。

18.2 中枢神経系への作用

カフェインは、大脳皮質及び延髄中枢の興奮を起こす。常用量で覚せい、不穏、精神緊張を生じ、知覚及び運動機能を高める。また、脳細動脈に作用して収縮させ脳血流量を減少させる¹⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

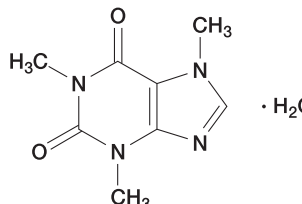
一般名：カフェイン水和物（Caffeine Hydrate）

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

分子式：C₈H₁₀N₄O₂・H₂O

分子量：212.21

構造式：



性状：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。

乾燥空气中で風解する。

融点：235～238℃（乾燥後）

22. 包装

25g [瓶]

500g [袋]

23. 主要文献

1) 田中千賀子 他：NEW薬理学 第7版，2017：300

24. 文献請求先及び問い合わせ先

丸石製薬株式会社 学術情報部

〒538-0042 大阪市鶴見区今津中2-4-2

TEL. 0120-014-561

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **丸石製薬株式会社**

大阪市鶴見区今津中2-4-2