

|            |
|------------|
| 日本標準商品分類番号 |
| 872259     |

貯法：室温保存  
有効期間：錠 3年  
散 4年

|      |               |               |
|------|---------------|---------------|
|      | 錠 3mg         | 散 1%          |
| 承認番号 | 21900AMX00257 | 21900AMX00232 |
| 販売開始 | 1969年2月       | 1974年5月       |

## 気管支拡張剤

トリメトキノール塩酸塩水和物製剤

イノリン錠 3mg  
イノリン散 1%

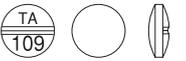
INOLIN Tablets・Powder

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

| 販売名  | イノリン錠3mg  | イノリン散1%                       |
|------|---|-------------------------------|
| 有効成分 | 日局 トリメトキノール塩酸塩水和物                                 |                               |
|      | 1錠中3mg  | 1g中10mg                       |
| 添加剤  | クエン酸水和物、クエン酸カルシウム、コムギデンプン、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン | エチルセルロース、クエン酸水和物、二酸化ケイ素、乳糖水和物 |

#### 3.2 製剤の性状

| 販売名     | イノリン錠3mg  | イノリン散1% |
|---------|---|---------|
| 剤形      | 素錠(割線)  | 微粒状の散剤  |
| 色調      | 白色  |         |
| 製剤の性状   | わずかに苦味  |         |
| 外形      |  |         |
| サイズ(mm) | 直径：7.0 厚さ：2.8   |         |
| 重さ(g)   | 0.12  |         |
| 識別コード   | TA109   |         |

### 4. 効能又は効果

下記疾患の気道閉塞性障害に基づく諸症状の緩解  
気管支喘息、慢性気管支炎、塵肺症

### 6. 用法及び用量

#### 〈錠〉

通常成人には1回トリメトキノール塩酸塩水和物2～4mg相当量を1日2～3回経口投与する。  
年齢・症状により適宜増減する。

#### 〈散〉

通常成人は1回0.2～0.4g(トリメトキノール塩酸塩水和物として2～4mg)を1日2～3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

8.1 用法・用量どおり正しく使用しても効果が認められない場合は、本剤が適当でないと考えられるので、投与を中止すること。

8.2 過度に使用を続けた場合、不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがあるので、使用が過度にならないように注意すること。

### 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 甲状腺機能亢進症の患者

交感神経刺激作用により甲状腺機能亢進症を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.2 高血圧症の患者

交感神経刺激作用により高血圧症状を悪化させるおそれがある。

#### 9.1.3 心疾患のある患者

交感神経刺激作用により心拍数が増加し、心臓に過負荷をかけることがあるため、症状を悪化させるおそれがある。

#### 9.1.4 糖尿病の患者

交感神経刺激作用により糖代謝を促進し、血中グルコースを増加させるおそれがある。

#### 9.1.5 低酸素血症のある患者

定期的に血清カリウム値を観察することが望ましい。低酸素血症においては、血清カリウム値の低下が心リズムに及ぼす作用を増強することがある。[11.1.1 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。

### 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。一般に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                    |
|-----------------------------------|---|----------------------------|
| カテコールアミン製剤<br>アドレナリン及びイソプレナリン等    | 不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがある。<br>併用する場合には過度の使用を避け、定期的に臨床症状を観察し、異常が認められた際には減量するなど適切な処置を行うこと。 | 相加的に作用(交感神経刺激作用)を増強させる。    |
| キサンチン誘導体<br>テオフィリン<br>[11.1.1 参照] | 血清カリウム値が低下するおそれがある。<br>併用する場合には定期的に血清カリウム値を観察し、用量について注意すること。                            | 相加的に作用(血清カリウム値の低下作用)を増強する。 |
| ステロイド剤<br>プレドニゾロン<br>[11.1.1 参照]  |   | 本剤はcAMPを活性化し、Na-Kポンプを刺激する。 |
| 利尿剤<br>アミノフィリン<br>[11.1.1 参照]     |   |                            |

### 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 重篤な血清カリウム値の低下(頻度不明)

キサンチン誘導体、ステロイド剤及び利尿剤の併用により増強することがあるので、重症喘息患者では特に注意すること。[9.1.5、10.2 参照]

### 11.2 その他の副作用

|       | 0.1～5%未満 | 0.1%未満     | 頻度不明 |
|-------|----------|------------|------|
| 循環器   | 心悸亢進     | 血圧変動、胸部圧迫感 |      |
| 精神神経系 | 頭痛       | 振戦、眩暈、熱感   |      |
| 消化器   | 悪心、食欲不振  |            |      |
| 過敏症   |          |            | 発疹   |
| その他   | 口渇       |            |      |

## 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

健康成人男子にトリメトキノール塩酸塩水和物を6mg経口投与した場合、血中濃度は30分以内に最高に達した後、速やかに減少する。<sup>1)</sup>

### 16.5 排泄

健康成人男子にトリメトキノール塩酸塩水和物を6mg経口投与した場合、24時間以内に投与量の13～33%が尿中に排泄され、尿中代謝物の大部分はトリメトキノールのメチル化体のグルクロン酸抱合体である。<sup>1)</sup>

## 17. 臨床成績

### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

7種の二重盲検試験を含む70施設1,265例についての臨床試験の結果、気管支喘息、慢性気管支炎、塵肺症に対して有用性が認められている。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

$\beta$ 受容体の刺激作用により気管支を拡張させる。(ネコ<sup>2)</sup>、モルモット<sup>3)</sup>)

### 18.2 気管支拡張作用

18.2.1 各種スパasmogen(ヒスタミン、セロトニン、アセチルコリン)静脈内投与、又は迷走神経刺激により誘発されたネコの気管支収縮に対して、トリメトキノールはイソプレナリンと同程度の気管支拡張作用を示し、作用持続時間はイソプレナリンより長い。<sup>2)</sup>

18.2.2 ヒスタミン又はメタコリン溶液を噴霧して誘発されたモルモットの気管支痙攣に対して、トリメトキノールはイソプレナリンの5～10倍の痙攣緩解作用を示す。ヒスタミンによる気管支痙攣に対して、トリメトキノール0.4mg/kg経口投与5時間後でも緩解作用が認められる。<sup>3)</sup>

### 18.3 気管支 $\beta_2$ 受容体の選択性

ネコにおいて、トリメトキノールの気管支拡張作用( $\beta_2$ 刺激作用)は心拍数増加作用( $\beta_1$ 刺激作用)、拡張期血圧低下作用( $\beta_2$ 刺激作用)、及びヒラメ筋に対する作用( $\beta_2$ 刺激作用、振戦の実験的モデル)より強く、気管支 $\beta_2$ 受容体に対し作用選択性の高いことが認められている。<sup>2,4)</sup>

### 18.4 抗アレルギー作用

ヒスタミン遊離抑制作用(in vitro:モルモット肺臓細片)及びPCA反応抑制作用(in vivo:ラット)を有することが認められている。<sup>5)</sup>

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：トリメトキノール塩酸塩水和物

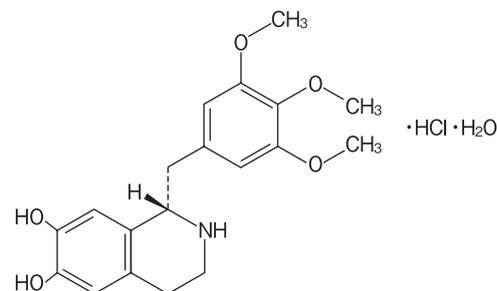
(Trimetoquinol Hydrochloride Hydrate)

化学名：(1S)-1-(3,4,5-Trimethoxybenzyl)-1,2,3,4-tetrahydroisoquinoline-6,7-diol monohydrochloride monohydrate

分子式：C<sub>19</sub>H<sub>23</sub>NO<sub>5</sub> · HCl · H<sub>2</sub>O

分子量：399.87

構造式：



性状：

- ・白色の結晶又は結晶性の粉末である。
- ・メタノールに溶けやすく、水又はエタノール(99.5)にやや溶けにくい。
- ・融点：約151℃(分解、ただし105℃で4時間減圧乾燥後)

## 22. 包装

### 〈イノリン錠3mg〉

100錠[10錠(PTP)×10]

### 〈イノリン散1%〉

100g[褐色ガラス瓶]

## 23. 主要文献

- 1) 鈴木利一 他：田辺製薬研究報告 1983；1-9
- 2) 佐藤匡徳 他：応用薬理 1980；19(2)：269-276
- 3) Kiyomoto, A. et al.：Arzneimittelforschung 1970；20：46-52
- 4) 池沢一郎 他：応用薬理 1981；21(5)：847-854
- 5) Tsuzurahara, K. et al.：Chem. Pharm. Bull. 1979；27(8)：1715-1724

## \* 24. 文献請求先及び問い合わせ先

ニプロ株式会社 医薬品情報室  
〒566-8510 大阪府摂津市千里丘新町3番26号  
TEL：0120-226-898  
FAX：050-3535-8939

## \* 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元



**NIPRO**

ニプロESファーマ株式会社  
大阪府摂津市千里丘新町3番26号