＊2016年11月改訂（第13版）P
2014年10月改訂

| 日本標準商品分類番号 | 87 1179 |
|---|---|

| 承認番号 | | |
|---|---|---|
| | 錠25mg | 22500AMX01268000 |
| | 錠50mg | 22500AMX01269000 |
| | 細粒10% | 22500AMX01267000 |
| 薬価収載 | 2014年6月 | |
| 販売開始 | 1996年7月 | |
| 再評価結果 | 1999年9月 | |

チアプリド製剤

# 日本薬局方 チアプリド塩酸塩錠

処方箋医薬品[注]

# チアプリド錠25mg「JG」
# チアプリド錠50mg「JG」

〔貯法〕
室温保存（開封後は光を避けて保存すること。）
〔使用期限〕
外箱に表示の期限内に使用すること。

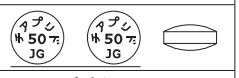
処方箋医薬品[注]

# チアプリド細粒10%「JG」

（チアプリド塩酸塩細粒）

**【禁忌（次の患者には投与しないこと）】**
プロラクチン分泌性の下垂体腫瘍（プロラクチノーマ）の患者［抗ドパミン作用によりプロラクチン分泌が促進し、病態を悪化させるおそれがある。］

## ＊【組成・性状】

| 販売名 | チアプリド錠25mg「JG」 | チアプリド錠50mg「JG」 |
|---|---|---|
| 成分・含量（1錠中） | 日局 チアプリド塩酸塩 27.8mg（チアプリドとして25mg） | 日局 チアプリド塩酸塩 55.6mg（チアプリドとして50mg） |
| 添加物 | 乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート、タルク、マクロゴール6000、酸化チタン | |
| 剤形・性状 | 白色～微帯黄白色のフィルムコーティング錠 | |
| 外形 | |  |
| 大きさ(mm) | 直径：6.1<br>厚さ：3.1 | 直径：7.1<br>厚さ：3.5 |
| 重量(mg) | 95 | 148 |
| 本体表示 | チアプリド 25 JG | チアプリド 50 JG |

| 販売名 | チアプリド細粒10%「JG」 |
|---|---|
| 成分・含量（1g中） | 日局 チアプリド塩酸塩 111.1mg（チアプリドとして100mg） |
| 添加物 | 乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、トウモロコシデンプン、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート、マクロゴール6000、タルク、ジメチルポリシロキサン（内服用）、含水二酸化ケイ素 |
| 剤形・性状 | 白色～微帯黄白色のフィルムコーティング細粒剤 |

**【効能・効果】**
◦脳梗塞後遺症に伴う攻撃的行為、精神興奮、徘徊、せん妄の改善
◦特発性ジスキネジア及びパーキンソニズムに伴うジスキネジア

**【用法・用量】**
チアプリドとして、通常成人1日75mg～150mgを3回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
パーキンソニズムに伴うジスキネジアの患者では、1日1回、25mgから投与を開始することが望ましい。

**〈用法・用量に関連する使用上の注意〉**
脳梗塞後遺症の場合：本剤の投与期間は、臨床効果及び副作用の程度を考慮しながら慎重に決定するが、投与6週で効果が認められない場合には投与を中止すること。

**【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）**
(1)重篤な循環器障害のある患者［血圧低下があらわれやすい。］
(2)QT延長のある患者［QT延長が悪化するおそれがある。］
(3)QT延長を起こしやすい患者［QT延長が発現するおそれがある。］
1)著明な徐脈のある患者
2)低カリウム血症のある患者等
(4)腎障害のある患者［高い血中濃度が持続するおそれがある。］
(5)高齢者（「**5．高齢者への投与**」の項参照）
(6)褐色細胞腫の疑いのある患者［類似化合物であるスルピリドの投与により急激な昇圧発作があらわれたとの報告がある。］
(7)脱水・栄養不良状態等を伴う身体的疲弊のある患者［悪性症候群（Syndrome malin）が起こりやすい。］

**2．重要な基本的注意**
(1)**眠気、めまい・ふらつき等**があらわれることがあるので、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すること。
(2)制吐作用を有するため、他の薬剤に基づく中毒、腸閉塞、脳腫瘍等による**嘔吐症状を不顕性化**することがあるので注意すること。

**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 |
|---|---|---|
| QT延長を起こすことが知られている薬剤<br>ハロペリドール等 | QT延長、心室性不整脈等の重篤な副作用を起こすおそれがある。 | 本剤及びこれらの薬剤はいずれもQT間隔を延長させるおそれがあるため、併用により作用が増強するおそれがある。 |
| ベンザミド系薬剤<br>メトクロプラミド<br>スルピリド等<br>フェノチアジン系薬剤<br>クロルプロマジン等<br>ブチロフェノン系薬剤<br>ハロペリドール等 | 内分泌機能異常、錐体外路症状が発現しやすくなる。 | 本剤及びこれらの薬剤は抗ドパミン作用を有するため、併用により抗ドパミン作用が強くあらわれる。 |
| ドパミン作動薬<br>レボドパ等 | 相互に作用を減弱させることがある。 | 本剤は抗ドパミン作用を有するため、作用が拮抗する。 |
| 中枢神経抑制剤<br>バルビツール酸誘導体<br>麻酔剤等 | 相互に中枢神経抑制作用を増強させることがある。 | 本剤及びこれらの薬剤は中枢神経抑制作用を有する。 |
| アルコール<br>飲酒 | | ともに中枢神経抑制作用を有する。 |

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

## 4. 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。

(1)**重大な副作用**（頻度不明）

1)**悪性症候群（Syndrome malin）**：悪性症候群（Syndrome malin）があらわれることがあるので、無動緘黙、強度の筋強剛、嚥下困難、頻脈、血圧の変動、発汗等が発現し、それに引き続き発熱がみられる場合は、投与を中止し、体冷却、水分補給等の全身管理とともに適切な処置を行うこと。本症発症時には、白血球の増加や血清CK（CPK）の上昇がみられることが多く、また、ミオグロビン尿を伴う腎機能の低下がみられることがある。
なお、高熱が持続し、意識障害、呼吸困難、循環虚脱、脱水症状、急性腎不全へと移行し、死亡した例が報告されている。

2)**昏睡**：昏睡があらわれることがある。このような症状が発現した場合には投与を中止すること。

3)**痙攣**：痙攣があらわれることがある。このような症状が発現した場合には投与を中止すること。

4)**QT延長、心室頻拍**：QT延長、心室頻拍（Torsades de Pointesを含む）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し、適切な処置を行うこと。

(2)**その他の副作用**

| | 頻度不明 |
|---|---|
| **循環器**[注1] | 不整脈、頻脈、胸内苦悶、血圧上昇、血圧低下 |
| **錐体外路症状**[注2] | パーキンソン症候群（振戦、筋強剛、運動減少、流涎、姿勢・歩行障害等）、ジスキネジア、言語障害、咬痙、アカシジア、ジストニア、嚥下障害 |
| **内分泌**[注1] | 乳汁分泌、女性化乳房、月経異常 |
| **精神神経系** | 眠気、不眠、不安・焦燥、抑うつ、ぼんやり、性欲亢進 |
| **自律神経系** | めまい・ふらつき、口渇、頭痛・頭重、脱力・倦怠感、しびれ、排尿障害、尿失禁、耳鳴 |
| **消化器** | 悪心・嘔吐、腹痛・胃部不快感、食欲不振、便秘、口内炎、下痢、食欲亢進、腹部膨満感 |
| **肝臓** | AST（GOT）上昇、ALT（GPT）上昇、Al-P上昇、黄疸 |
| **過敏症**[注3] | 発疹、そう痒感 |
| **その他** | 発熱、眼調節障害、ほてり、貧血 |

注1）このような症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、慎重に投与すること。

注2）このような症状があらわれた場合には、減量又は抗パーキンソン剤の併用等適切な処置をとること。

注3）このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

## 5. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、副作用（錐体外路症状等）の発現に注意し、低用量（例えば1回25mg、1日1～2回）から投与を開始するなど慎重に投与すること。

## 6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)**妊婦等**：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回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。]

(2)**授乳婦**：授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。[動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている。]

## 7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない（使用経験がない）。

## 8. 過量投与

**症状**：パーキンソン症候群等の錐体外路症状、昏睡等があらわれることがある。

**処置**：主として対症療法及び維持療法を行う。なお、本剤は血液透析ではわずかしか除去されないため、血液透析は有効ではない。

## 9. 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。)

## 10. その他の注意

(1)動物（ラット）の亜急性及び慢性毒性試験で子宮及び精巣の萎縮を、また、生殖試験で交尾までの期間の延長を起こすとの報告がある。

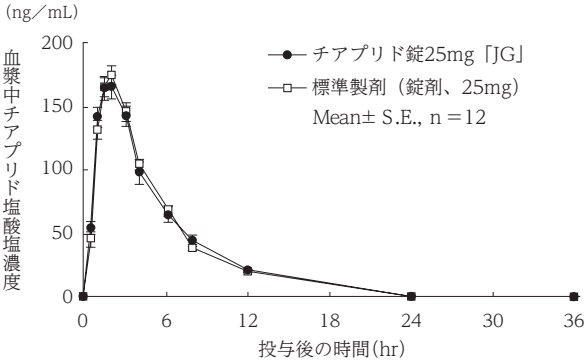
(2)ラットに長期間経口投与した試験において、臨床最大用量の30倍（75mg/kg/日）以上の投与量で乳腺の、また、60倍（150mg/kg/日）で下垂体の腫瘍発生頻度が対照群に比し高いとの報告がある。

## 【薬物動態】

### 1. 生物学的同等性試験

(1)チアプリド錠25mg「JG」

チアプリド錠25mg「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（チアプリド塩酸塩として27.8mg（チアプリドとして25mg））を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中チアプリド塩酸塩濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。[1)]



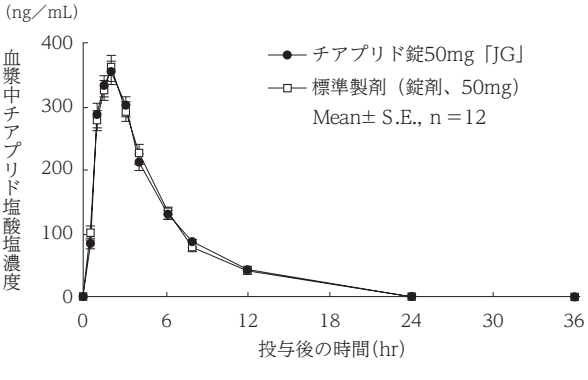

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ |
|---|---|---|---|
| | $AUC_{0\text{-}36}$ (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) |
| チアプリド錠25mg「JG」 | 1020.7±51.1 | 187.72±7.96 | 1.9±0.1 |
| 標準製剤（錠剤、25mg） | 1016.1±25.6 | 186.63±6.76 | 2.0±0.1 |

(Mean±S.E., n=12)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2)チアプリド錠50mg「JG」

チアプリド錠50mg「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（チアプリド塩酸塩として55.6mg（チアプリドとして50mg））を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中チアプリド塩酸塩濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。[2)]



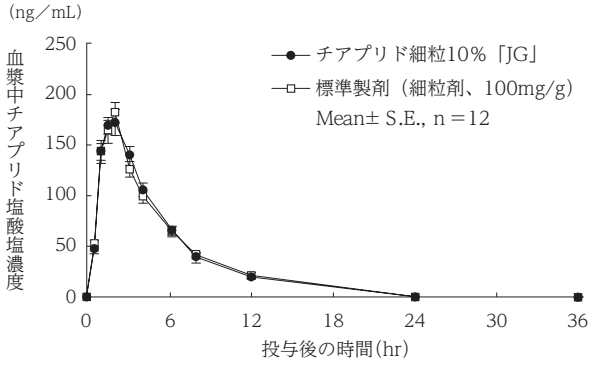
| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ |
|---|---|---|---|
| | $AUC_{0\text{-}36}$ (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) |
| チアプリド錠50mg「JG」 | 2059.8±61.0 | 376.14±16.61 | 1.9±0.1 |
| 標準製剤（錠剤、50mg） | 2046.8±69.0 | 376.94±18.46 | 2.0±0.2 |

（Mean±S.E., n=12）

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3)チアプリド細粒10%「JG」

チアプリド細粒10%「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ0.25g（チアプリド塩酸塩として27.8mg（チアプリドとして25mg））を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中チアプリド塩酸塩濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。[3)]




| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ |
|---|---|---|---|
| | $AUC_{0\text{-}36}$ (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) |
| チアプリド細粒10%「JG」 | 990.2±44.1 | 187.91±9.78 | 1.9±0.1 |
| 標準製剤（細粒剤、100mg/g） | 992.9±37.4 | 188.37±11.04 | 1.9±0.1 |

（Mean±S.E., n=12）

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

**2.溶出挙動**

チアプリド錠25mg「JG」、チアプリド錠50mg「JG」及びチアプリド細粒10%「JG」は、日本薬局方外医薬品規格第３部に定められたチアプリド塩酸塩25mg錠、チアプリド塩酸塩50mg錠及び塩酸チアプリド100mg/g細粒の溶出規格に適合していることが確認されている。[4)]

**【薬効薬理】**

ドパミン$D_2$受容体を遮断しアセチルコリン遊離を促進することにより神経伝達機能を改善させる。[5)]

**【有効成分に関する理化学的知見】**

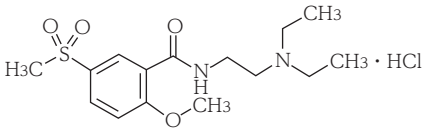
一般名：チアプリド塩酸塩（Tiapride Hydrochloride）

化学名：*N*-[2-(Diethylamino)ethyl]-2-methoxy-5-(methylsulfonyl)benzamide monohydrochloride

分子式：$C_{15}H_{24}N_2O_4S \cdot HCl$

分子量：364.89

構造式：




性　状：チアプリド塩酸塩は白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく、酢酸（100）に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール（99.5）に溶けにくく、無水酢酸に極めて溶けにくい。
0.1mol/L塩酸試液に溶ける。

**【取扱い上の注意】**

**安定性試験**

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、チアプリド錠25mg「JG」、チアプリド錠50mg「JG」及びチアプリド細粒10%「JG」の室温保存における３年間の安定性が確認された。[6)]

**【包装】**

チアプリド錠25mg「JG」
PTP：100錠（10錠×10）、1000錠（10錠×100）
バラ：1000錠
チアプリド錠50mg「JG」
PTP：100錠（10錠×10）、1000錠（10錠×100）
バラ：1000錠
チアプリド細粒10%「JG」
バラ：500g

**＊【主要文献】**


1)長生堂製薬株式会社　社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
2)長生堂製薬株式会社　社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
3)長生堂製薬株式会社　社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
4)長生堂製薬株式会社　社内資料（溶出試験に関する資料）
5)第十七改正日本薬局方解説書
6)長生堂製薬株式会社　社内資料（安定性試験に関する資料）


**【文献請求先】**

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

日本ジェネリック株式会社　お客さま相談室
〒100-6739　東京都千代田区丸の内一丁目９番１号
TEL　0120-893-170　FAX　0120-893-172



販売元
日本ジェネリック株式会社
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号

製造販売元
長生堂製薬株式会社
徳島市国府町府中92番地