

気管支拡張剤




※ トスメリアン®錠3mg

《トリメトキノール塩酸塩錠》
 TOSMERIAN® TABLETS 3mg

貯 法：遮光・室温保存
 使用期限：外箱に記載

日本標準商品分類番号 872259			
承認番号	薬価収載	販売開始	再評価(品質)
22000AMX00944	2008年6月	1984年9月	2003年2月

※【組成・性状】

1錠中の有効成分	日局 トリメトキノール塩酸塩水和物…………… 3mg		
添加物	乳糖水和物、クエン酸Ca、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースCa、ステアリン酸Mg		
性状	白色の片面割線入りの素錠		
識別コード	本体	TwTMT	
	包装	Tw. TMT	
※ 外形	表	裏	側面
			
※ 錠径(mm)	6.0		
※ 厚さ(mm)	2.4		
質量(mg)	90		

【効能・効果】

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

【用法・用量】

通常成人は1回トリメトキノール塩酸塩水和物として2～4mg、
 1日2～3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）
 - 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。]
 - 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。]
 - 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。]
 - 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。]
- 重要な基本的注意
 - 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。
 - 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り、特に発作発現時の吸入投与の場合には使用が過度になりやすいので十分に注意すること。

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
カテコールアミン製剤 アドレナリン 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。 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 テオフィリン	血清カリウム値が低下するおそれがある。	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 プレドニゾロン	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。	本剤はcAMPを活性化し、Na-Kポンプを刺激する。
利尿剤 アミノフィリン	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。	

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）

β₂刺激剤により重篤な血清カリウム値の低下が報告されている。また、β₂刺激剤による血清カリウム値の低下作用は、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。特に、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。このような場合には定期的に血清カリウム値を観察することが望ましい。

2) その他の副作用

副作用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。

	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

5. 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。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 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。]

2) 授乳中の女性には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。[授乳中の投与に関する安全性は確立していない。]

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。(使用経験が少ない)

8. 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、更には穿孔を起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。]

※【薬物動態】

※ 1. 生物学的同等性試験

<参考資料>

トスメリアン錠 3mg と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 4錠(トリメトキノール塩酸塩水和物として12mg) 雄性ビーグル犬(n=10)に絶食単回経口投与し、血漿中未変化体濃度について比較検討した結果、両製剤には推計学的に有意差のないことが認められた¹⁾。

※ 2. 溶出挙動

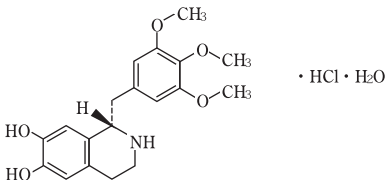
トスメリアン錠 3mg は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた塩酸トリメトキノール錠の溶出規格に適合していることが確認されている²⁾。

※※【薬効薬理】

アドレナリン β_2 受容体に比較的選択的な作用薬である。気管支拡張作用はイソプレナリンよりもやや強く、作用持続も長い。心拍数増加などの心臓刺激作用 (β_1 作用) や拡張期血圧低下作用 (β_2 作用) などは、選択的 β_2 作用薬サルブタモールよりやや強いが、イソプレナリンよりは弱い。ヒスタミン遊離抑制作用などによる抗アレルギー作用を有する³⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：トリメトキノール塩酸塩水和物

(Trimetoquinol Hydrochloride Hydrate)

別名：塩酸トリメトキノール

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

分子式：C₁₉H₂₃NO₅ · HCl · H₂O

分子量：399.87

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)

※※【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(遮光・室温、4年)の結果、トスメリアン錠 3mg は規定条件の市場流通下において4年間安定であることが確認された⁴⁾。

※【包装】

トスメリアン錠 3mg：100錠、1000錠 (PTP)

※※【主要文献】

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験
- ※※ 3) 第十五改正日本薬局方解説書、C-2821、2006
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター (24時間受付対応)

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>

製造販売元



東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号