

催眠剤

日本薬局方 トリクロホスナトリウムシロップ

劇薬、習慣性医薬品^{注1)}
処方箋医薬品^{注2)}トリクロリール[®]シロップ10%TRICLORYL[®] Syrup 10%

承認番号	21900AMX01214000
薬価収載	2007年12月
販売開始	1964年11月
再評価結果	1976年7月

貯法：気密容器
凍結を避け、冷所保存(1~15℃)
使用期限：外箱等に表示

注1) 注意—習慣性あり

注2) 注意—医師等の処方箋により使用すること

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1) 本剤の成分又は抱水クロラールに対して過敏症の既往歴のある患者[本剤は、抱水クロラールと同様に生体内でトリクロロエタノールとなる。]
- (2) 急性間けつ性ポルフィリン症の患者[ポルフィリン症の症状を増悪させる。]

【組成・性状】

トリクロリールシロップ 10%	
成分・含量	1mL中「日本薬局方」トリクロホスナトリウム 100mg
添加物	白糖、バニリン、水酸化ナトリウム、パラオキシ安息香酸メチル、黄色5号、香料、エタノール
性状	橙色澄明でバニリン様のおいさを有するシロップ剤である。
pH	6.0~6.5

【効能・効果】

不眠症
脳波・心電図検査等における睡眠

【用法・用量】

トリクロホスナトリウムとして、通常成人1回1~2g(シロップとして10~20mL)を就寝前又は検査前に経口投与する。幼小児は年齢により適宜減量する。なお、患者の年齢及び状態、目的等を考慮して、20~80mg/kg(シロップとして0.2~0.8mL/kg)を標準とし、総量2g(シロップとして20mL)を超えないようにする。

【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)
 - (1) 肝障害、腎障害のある患者[本剤は肝臓において加水分解され、トリクロロエタノールとなり、また腎臓より排泄されるため、これらの患者では血中濃度の持続・上昇により副作用を増強するおそれがある。]
 - (2) 小児〔7. 小児等への投与〕の項参照)
 - (3) 虚弱者[呼吸抑制を起こすおそれがある。]
 - (4) 呼吸機能の低下している患者[呼吸抑制を起こすおそれがある。]
 - (5) 重篤な心疾患又は不整脈のある患者[心機能抑制により症状を増悪させるおそれがある。]
 - (6) 高齢者〔5. 高齢者への投与〕の項参照)
2. 重要な基本的注意
 - (1) 呼吸抑制等が起こることがあるので患者の状態を十分観察すること。特に小児では呼吸数、心拍数、経皮的動脈血酸素飽和度等をモニタリングするなど、十分に注意すること。(「1. 慎重投与」、 「4. 副作用(1) 重大な副作用」、 「7. 小児等への投与」の項参照)
 - (2) 抱水クロラールは、本剤と同様に生体内で活性代謝物であるトリクロロエタノールとなるため、併用により過量投与になるおそれがあるため注意すること。(「8. 過量投与」の項参照)
 - (3) 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は従事させないよう注意すること。

* (4) 連用により薬物依存を生じることがあるので、漫然とした継続投与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続する場合には、治療上の必要性を十分に検討すること。(「4. 副作用(1) 重大な副作用」の項参照)

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
中枢神経抑制剤 フェノチアジン誘導体 バルビツール酸誘導体等 モノアミン酸化酵素阻害剤	これらの作用を増強することがあるので、やむを得ず投与する場合には減量するなど慎重に投与すること。	中枢抑制作用が増強する可能性がある。
アルコール		アルコール脱水素酵素を競合的に阻害し、アルコールの血中濃度が高くなる。
クマリン系抗凝血剤 ワルファリン等	これらの作用を増強することがあるので、併用する場合には通常より頻回にプロトロンビン値の測定を行うなど慎重に投与すること。	主代謝産物であるトリクロル酢酸は血漿蛋白結合部位からワルファリンを遊離置換し、遊離型ワルファリン濃度を増加させる。

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

- 1) 無呼吸、呼吸抑制(頻度不明)：無呼吸、呼吸抑制が起こることがあり、心肺停止に至った症例も報告されているので、呼吸状態の観察を十分に行い、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。
 - 2) ショック、アナフィラキシー(頻度不明)：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、痒痒感、浮腫、呼吸困難、血圧低下、チアノーゼ等があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- * (3) 依存性(頻度不明)：連用により薬物依存を生じることがあるので観察を十分に行い、用量及び使用期間に注意し慎重に投与すること。また、連用中の投与量の急激な減少ないし投与の中止により、痙攣発作、せん妄、振戦、不安等の離脱症状があらわれることがあるので投与を中止する場合には、徐々に減量するなど慎重に行うこと。

(2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症 ^{※)}	発疹、紅斑、水疱、固定薬疹、痒痒感、発熱
循環器	徐脈
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇
血液 ^{※)}	好酸球増多、白血球減少
消化器	悪心・嘔吐、鼓腸、胃痛
精神神経系	頭痛、めまい、ふらつき、運動失調、興奮、抑うつ、構音障害、覚醒遅延
その他	浮腫、尿量減少、ケトン尿症

注)このような場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では呼吸抑制を起こすおそれがある。また、一般に副作用があらわれやすいので、少量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

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。[妊娠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

- (1) 一般に成人に比し、薬物感受性が高いので、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること(無呼吸、呼吸抑制、痙攣は低出生体重児、新生児、乳幼児での報告が多い)。
- (2) 無呼吸、呼吸抑制が起こり、心肺停止に至った症例も報告されているので、特に慎重に投与および観察をすること。
〔2. 重要な基本的注意〕の項参照)
- (3) 痙攣(間代性痙攣、部分発作等)が起こることがあるので、慎重に投与すること。

8. 過量投与

徴候、症状：呼吸抑制、徐脈、血圧低下が認められることがある。(〔2. 重要な基本的注意〕の項参照)

処置：呼吸、脈拍、血圧、経皮的動脈血酸素飽和度の監視を行うとともに、気道の確保等の適切な処置を行うこと。血液透析、血液灌流が有効であったとの報告もある。

【薬物動態】

1. 血中濃度¹⁾

健康成人(n=7)に22.5mg/kgを経口投与した場合の血中トリクロロエタノール濃度は投与1時間後に最高血中濃度8.2±0.6μg/mLに達し、半減期(T_{1/2β})は8.2時間であった。
(外国人のデータ)

2. 尿中排泄²⁾

投与後24時間で用量(15mg/kg)の4.6%(0.5~19%)が未変化体として、グルクロン酸抱合体と合わせて17~40%が尿中に排泄される。トリクロロ酢酸の排泄は遅く、初めの2時間では10%以下、次の6時間で25%以下で、24時間で38%に達する(排泄が遅く、3日後でも血液中に残留)。

3. その他の薬物速度論的パラメータ

血漿蛋白結合率：35%¹⁾

(外国人のデータ)

【臨床成績】

効果の判定を睡眠においたものの臨床成績は84.3%(321/381)であった(再評価結果)。

【薬効薬理】

作用機序：

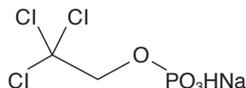
抱水クロラルと同様に、体内で活性代謝物のトリクロロエタノールとなり、鎮静・催眠作用を現す。消化管刺激性は抱水クロラルより低い^{3,4)}。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：トリクロホスナトリウム(Triclofos Sodium)

化学名：Monosodium 2,2,2-trichloroethyl monohydrogenphosphate

構造式：



分子式：C₂H₃Cl₃NaO₄P

分子量：251.37

性状：白色の結晶性の粉末である。

水に溶けやすく、エタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

吸湿性である。

【包装】

500mL(褐色瓶入り)

【主要文献】

- 1) Sellers, E.M. et al. : J Clin Pharmacol, 18, 457(1978)
- 2) 赤木満洲雄：薬物代謝の生化学, 116, 南山堂(1965)
- 3) Glaxo Laboratories Ltd. : 作用機序に関する検討(社内資料)
- ※4) 第十七改正 日本薬局方 解説書, C-3497(2016)

【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。

アルフレッサ ファーマ株式会社 学術情報部
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

alfresa

製造販売元 アルフレッサ ファーマ株式会社
大阪市中央区石町二丁目2番9号

®登録商標