

虚血性心疾患治療剤

日本薬局方 トリメタジジン塩酸塩錠


バスタレル® F錠 3mg

VASTAREL®

承認番号	21900AMX01622
薬価収載	2007年12月
販売開始	1968年6月
再評価結果	2001年8月

貯法：気密容器・室温保存  
使用期限：外箱等に記載

■組成・性状

販売名	バスタレルF錠 3mg
有効成分	1錠中トリメタジジン塩酸塩 3mgを含有する。
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、バレイショデンブ、アラビアゴム末、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、カルナウバロウ
色・剤形	白色のフィルムコーティング錠
外形	
大きさ	直径約5.5mm
識別コード	KYO202

■効能・効果

狭心症、心筋梗塞（急性期を除く）、その他の虚血性心疾患

■用法・用量

トリメタジジン塩酸塩として、通常成人1回3mgを1日3回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

■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）

腎機能障害のある患者 [本剤のAUCが増大するおそれがある。]

2. 副作用

調査例数13991例中170例に副作用がみられ、その主なものは、悪心、胃部不快感、食欲不振等の消化器症状99件（0.7%）、頭痛、倦怠感、ふらつき等の精神・神経症状41件（0.3%）、発疹等の皮膚症状12件（0.1%）であった。次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	0.1%～5%未満	0.1%未満
肝臓		AST (GOT)、ALT (GPT)の上昇
精神神経系	頭痛、倦怠感	ふらつき
消化器	悪心、胃部不快感、食欲不振	
過敏症*	発疹	

※ 症状があらわれた場合には投与を中止すること。

3. 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。

4. 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。]

5. 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）。

6. 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。]

7. その他の注意

海外において、本剤を1日60～70mg投与中の患者に、パーキンソン病、パーキンソン病様症状、振戦、下肢静止不能症候群等の運動障害の症状があらわれたとの報告があるので、このような症状が認められた場合には投与を中止すること。投与を中止してもこのような症状が持続する場合には専門医を受診するよう指導すること。

■薬物動態

健康成人に6mg<sup>(\*)</sup>を単回経口投与した時の血中濃度は、2時間後に最高値（約17ng/mL）に達し、血中からの消失半減期は11.5時間であった。また、尿中排泄率は投与48時間で、未変化体として約60%を示すことが認められている。（注：本剤の承認された1回用量は、通常成人3mgである。）

■臨床成績

臨床効果<sup>1-4)</sup>

(1)狭心症

狭心症を対象とする二重盲検試験を含む臨床試験で、有効率は60.6%（189/312）を示した。

(2)心筋梗塞

急性期を除く心筋梗塞に対する有効率は43.9%（25/57）を示した。

(3)その他の虚血性心疾患

その他の虚血性心疾患に対する有効率は55.7%（107/192）を示した。

■薬効薬理

1. 血管拡張作用

イヌより摘出した動脈及び静脈を用いたin vitroの実験で、プロスタグランジンF<sub>2α</sub>による収縮を弛緩させることが認められている。<sup>5)</sup>

2. 心仕事量減少作用

開胸麻酔イヌを用いた実験で、拡張期血圧の下降、心拍出量及び心拍数の減少が認められ、<sup>6)</sup> また、オープンループ法（イヌ）による実験で静脈還流量の減少が認められている。<sup>7)</sup>

3. 副血行路形成促進作用

実験的心筋梗塞イヌを用いた実験で、虚血部位へ向う冠状動脈間の口径の大きな吻合数の増加及び梗塞巣の修復縮小を促すことが認められている。<sup>8)</sup>

4. 心筋代謝改善作用

実験の大動脈弁閉鎖不全イヌを用いた実験で、心筋での酸素、乳酸、焦性ブドウ酸の摂取率の増加が認められている。<sup>9,10)</sup>

## 5. 心筋保護作用

モルモットの摘出心房を用いたin vitroの実験で、無カリウム液、ジギタリス配糖体及びニコチンによる不整律動に対して、心筋細胞内カリウムイオンの喪失抑制に基づく拮抗作用を示すことが認められている。<sup>11,12)</sup>

## 6. 血小板凝集抑制作用

健康成人血液を用いたin vitroの実験で、血小板のコラーゲン、ADP、アラキドン酸による凝集に対して、血小板膜安定化に基づく抑制作用を示すことが認められている。<sup>13,14)</sup>

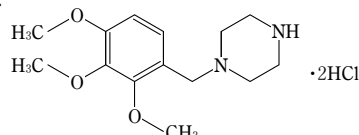
### ■有効成分に関する理化学的知見

一般名：トリメタジジン塩酸塩

(Trimetazidine Hydrochloride)

化学名：1-(2,3,4-Trimethoxybenzyl) piperazine dihydrochloride

構造式：



分子式：C<sub>14</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub> · 2HCl (339.26)

性状：白色の結晶性の粉末である。水又は胃酸に極めて溶解やすく、メタノールにやや溶解やすく、エタノール(99.5)に溶けにくい。1.0gを水20mLに溶かした液のpHは2.3~3.3である。

融点：約227°C(分解)。

### \*\* ■包装

バスタレルF錠3mg：

[PTP] 120錠(10錠×12)、600錠(10錠×60)

[バラ] 600錠

### ■主要文献

- 1) 沢田 恂ほか：臨牀と研究，53：870，1976.
- 2) 板津英孝ほか：基礎と臨床，18：5874，1984.
- 3) 阿部 健ほか：薬理と治療，5：3587，1977.
- 4) 宮城建雄ほか：薬理と治療，6：3081，1978.
- 5) Toda, N., et al.: Arch. Int. Pharmacodyn. Ther., 260：230, 1982.
- 6) Imai, Y., et al.: Jap. Heart J., 18：120，1977.
- 7) Taira, N., et al.: Jap. J. Pharmacol., 30：449，1980.
- 8) 金沢知博ほか：心臓，3：235，1971.
- 9) 中山裕熙：久留米医学会雑誌，28：1488，1965.
- 10) 冬野喜郎：久留米医学会雑誌，29：373，1966.
- 11) 今村一輝：関西医科大学雑誌，24：33，1972.
- 12) 小谷雅子：関西医科大学雑誌，23：132，1971.
- 13) 安永幸二郎ほか：内科宝函，27：1，1980.
- 14) 磯部淳一ほか：臨牀と研究，60：3051，1983.

### ■文献請求先、製品に関するお問い合わせ先

大日本住友製薬株式会社

〒541-0045 大阪市中央区道修町2-6-8

くすり情報センター

TEL 0120-034-389

販売元

大日本住友製薬株式会社

大阪市中央区道修町2-6-8

発売元

日本セルヴィエ株式会社

東京都文京区本郷1-28-34

製造販売元

京都薬品工業株式会社

京都市中京区西ノ京月輪町38