

\*\*2017年10月改訂(第10版) D1  
\*2015年4月改訂



日本標準商品分類番号  
872259

貯 法：室温保存  
使用期限：外箱、容器に使用期限を表示

	錠3mg	散1%
承認番号	21900AMX00257	21900AMX00232
薬価収載	2007年6月	
販売開始	1969年2月	1974年5月

気管支拡張剤

**イリン<sup>®</sup>錠3mg**

**イリン<sup>®</sup>散1%**

**INOLIN<sup>®</sup> Tablets 3mg・Powder 1%**

(トリメトキノール塩酸塩水和物製剤)

**【組成・性状】**

販 売 名	イノリン錠3mg	イノリン散1%
成分・含量	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 物	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
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	

**【効能・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

**【用法・用量】**

通常成人にはトリメトキノール塩酸塩水和物として1回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】**

**1. 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。〕

**2. 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。 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。 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(プレドニゾロン)		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)		

**4. 副作用**

トリメトキノール塩酸塩水和物の経口剤として、総症例14,415例中、副作用が報告されたのは431例(3.0%)で、主な副作用は心悸亢進(1.8%)、悪心(0.4%)、食欲不振(0.3%)であった。(承認時~1981年8月迄の集計)

**(1) 重大な副作用**

$\beta_2$ 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、 $\beta_2$ 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。

種類	頻度	5%以上又は頻度不明	0.1~5%未満	0.1%未満
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婦人には、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) 授乳中の婦人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。〕

### 【薬物動態】

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。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>

### 【臨床成績】

#### 臨床効果

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。

### 【薬効薬理】

#### 1. 気管支拡張作用

- 1) 各種スパasmオーゲン(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>
- 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>

#### 2. 気管支β<sub>2</sub>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(β<sub>2</sub>刺激作用)は心拍数増加作用(β<sub>1</sub>刺激作用)、拡張期血圧低下作用(β<sub>2</sub>刺激作用)、及びヒラメ筋に対する作用(β<sub>2</sub>刺激作用、振戦の実験的モデル)より強く、気管支β<sub>2</sub>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>

#### 3. 抗アレルギー作用

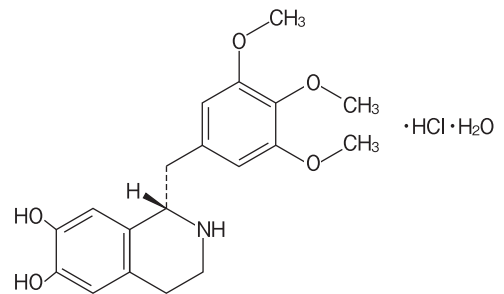
ヒスタミン遊離抑制作用(in vitro：モルモット肺臓細片)及びPCA反応抑制作用(in vivo：ラット)を有することが認められている。<sup>5)</sup>

### 【有効成分に関する理化学的知見】

○一般名：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



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

### 【包装】

イノリン錠3mg：100錠(10錠×10)、  
1,000錠(10錠×100)

イノリン散1%：100g

### 【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

### \*\*【文献請求先】

ニプロ株式会社 医薬品情報室  
〒531-8510 大阪市北区本庄西3丁目9番3号  
TEL：0120-226-898  
FAX：06-6375-0177



製造販売

ニプロESファーマ株式会社  
大阪市北区本庄西3丁目9番3号

000000