

## 循環機能改善剤

処方箋医薬品<sup>注</sup>

トラピジル錠

# トラピジル錠50mg「トーフ」

# トラピジル錠100mg「トーフ」

TRAPIDIL TABLETS 50mg “TOWA”/ TABLETS 100mg “TOWA”

貯 法：室温保存

有効期間：3年（錠50mg）

5年（錠100mg）

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

	錠50mg	錠100mg
承認番号	22100AMX00106	21900AMX01311
販売開始	2009年6月	1987年10月

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）




- 2.1 頭蓋内出血発作後、止血が完成していないと考えられる患者  
〔本剤は血小板凝集抑制作用を有する。〕
- 2.2 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

## 3. 組成・性状

## 3.1 組成

販売名	トラピジル錠50mg「トーフ」	トラピジル錠100mg「トーフ」
1錠中の有効成分	日局 トラピジル ……50mg	日局 トラピジル ……100mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、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、ヒプロメロース、マクロゴール6000、軽質無水ケイ酸、酸化チタン、カルナウバロウ、サラシミツロウ	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、カルメロースカルシウム、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、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、タルク

## 3.2 製剤の性状

販売名	トラピジル錠50mg「トーフ」	トラピジル錠100mg「トーフ」
性状・剤形	白色のフィルムコーティング錠	
識別コード	本体	Tw/AA（表/裏）
	包装	Tw. AA
外形	表	
	裏	
	側面	
直径(mm)	6.1	7.1
厚さ(mm)	3.7	3.6
質量(mg)	93	145

## 4. 効能又は効果

狭心症

## 6. 用法及び用量

〈トラピジル錠50mg「トーフ」〉

通常、成人1回2錠（トラピジルとして100mg）、1日3回経口投与する。なお、症状により適宜増減する。

〈トラピジル錠100mg「トーフ」〉

トラピジルとして、通常、成人には1回100mg、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。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

## 9.3 肝機能障害患者

副作用が発現しやすくなる。

## 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。動物実験（マウス）で、高用量において胎児の発育遅延が認められている。

## 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で、乳汁中への移行が認められている。

## 9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

## 9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

## 11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

## 11.1 重大な副作用

## 11.1.1 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）（頻度不明）

## 11.1.2 肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）

AST・ALT・ $\gamma$ -GTP上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

## 11.2 その他の副作用

	1%以上	1%未満	頻度不明
過敏症			発疹・発赤、そう痒感等
肝臓			AST・ALTの上昇、総ビリルビンの上昇等
消化器	嘔気、食欲不振	胃重感、胃部不快感、便秘	胃部膨満感、嘔吐、腹痛、下痢、口渇、口内炎等
精神神経系		頭痛、めまい、頭部不快感	眠気、しびれ感、不眠、筋肉・関節痛等
循環器			胸部圧迫感、心悸亢進、頻脈、徐脈、血圧低下、胸部不快感、不整脈等
血液			白血球減少、赤血球減少、血小板減少、好酸球増多、出血傾向等
その他			味覚異常、顔面潮紅、発熱、悪寒・戦慄、倦怠感、気分不良、発汗、女性化乳房、呼吸困難、リンパ節腫脹、疼痛、浮腫

## 13. 過量投与

## 13.1 症状

本剤の大量服用（トラピジルとして15g）で、重症ショック（昏睡状態、頻回の嘔吐、全身痙攣、血圧低下、呼吸困難、四肢冷感等）があらわれたとの報告がある<sup>1)</sup>。

## 13.2 処置

直ちに胃腸洗浄、強制利尿等の医薬品中毒に対する一般処置を行った後、吸着型血液浄化法（DHP）と血液透析を併用して行ったところ、臨床所見の急速な改善が認められたとの報告がある。また、本剤では、循環虚脱に対する処置が重要と考えられている<sup>1)</sup>。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

膠原病及び類似の疾患の患者に本剤を投与したところ、副作用の発現頻度が高かったため、これらの患者には投与しないことが望ましいとの報告がある。

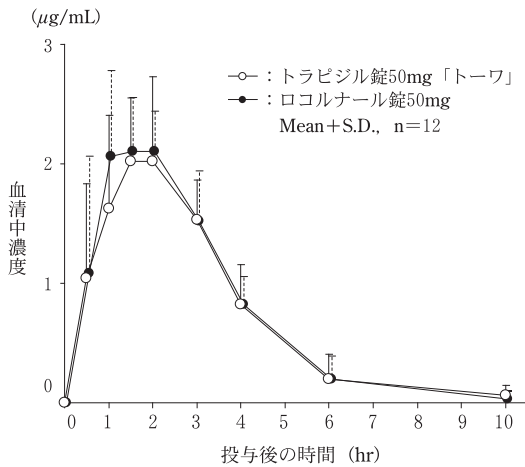
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

〈トラピジル錠50mg「トーワ」〉

トラピジル錠50mg「トーワ」とロコルナル錠50mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（トラピジルとして100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、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。<sup>2)</sup>



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-10</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
トラピジル錠50mg「トーワ」	7.34 ± 1.47	2.57 ± 0.35	1.4 ± 0.6	1.3 ± 0.7
ロコルナル錠50mg	7.61 ± 1.71	2.48 ± 0.38	1.3 ± 0.5	1.3 ± 0.6

(Mean ± S.D., n=12)

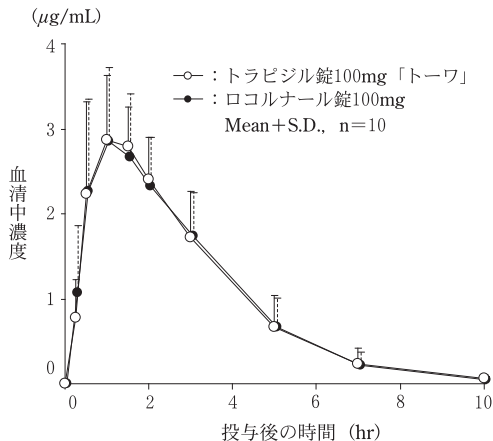
血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

〈トラピジル錠100mg「トーワ」〉

トラピジル錠100mg「トーワ」とロコルナル錠100mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（トラピジルとして100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度及び活性代謝物であるTP-1※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。<sup>3)</sup>

※TP-1：トラピジルの活性代謝物（モノ脱エチル体）であり、トラピジルと同程度の冠血流増加作用を有する。

(1) 未変化体（トラピジル）

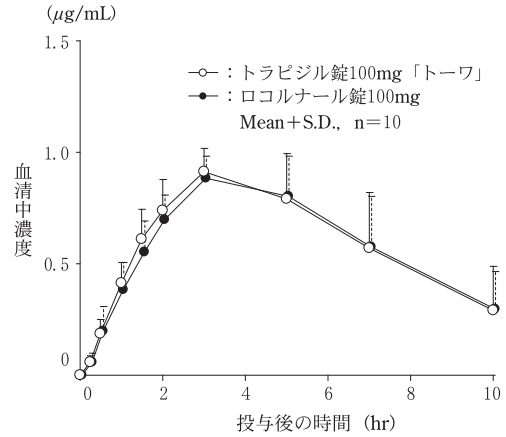


	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-10</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
トラピジル錠100mg「トーワ」	10.25 ± 2.87	3.19 ± 0.64	1.10 ± 0.46	1.27 ± 0.32
ロコルナル錠100mg	10.15 ± 3.00	3.11 ± 0.69	1.05 ± 0.50	1.24 ± 0.23

(Mean ± S.D., n=10)

血清中濃度並びに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) 活性代謝物（TP-1）



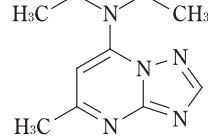
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-10</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
トラピジル錠100mg「トーワ」	5.95 ± 1.25	0.94 ± 0.08	3.30 ± 0.95	3.53 ± 2.01
ロコルナル錠100mg	5.90 ± 1.04	0.93 ± 0.08	4.00 ± 1.05	3.48 ± 1.56

(Mean ± S.D., n=10)

血清中濃度並びに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。

19. 有効成分に関する理化学的見聞

構造式：



一般名：トラピジル（Trapidil）

化学名：7-Diethylamino-5-methyl[1, 2, 4] triazolo[1, 5-a] pyrimidine

分子式：C<sub>10</sub>H<sub>15</sub>N<sub>5</sub>

分子量：205.26

性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末である。水又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール（95）、無水酢酸又は酢酸（100）に溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくい。1.0gを水100mLに溶かした液のpHは6.5～7.5である。

融点：101～105℃

22. 包装

〈トラピジル錠50mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

〈トラピジル錠100mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

1000錠 [バラ]

23. 主要文献

- 1) 斎藤 徹 他：日本救急医学会関東地方会雑誌，1984；5（2）：674-678
- 2) 社内資料：生物学的同等性試験（錠50mg）
- 3) 社内資料：生物学的同等性試験（錠100mg）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター  
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号

☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 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