

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%貯 法：冷所保存
有効期間：3年注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

承認番号	21900AMX01214
販売開始	1964年11月

2. 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。〕

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	有効成分	添加剤
トリクロリールシロップ10%	1mL中トリクロホスナトリウム(日局)100mg	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

3.2 製剤の性状

販売名	色・剤形	におい	pH
トリクロリールシロップ10%	橙色澄明のやや粘稠な液	バニラのようなにおいを有する	6.0~6.5

4. 効能又は効果

- 脳波・心電図検査等における睡眠
- 不眠症

6. 用法及び用量

トリクロホスナトリウムとして、通常成人1回1~2g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を標準とし、総量2gを超えないようにする。

7. 用法及び用量に関連する注意

患者の年齢及び状態、目的等を考慮した体重あたりの製剤1回量は以下のとおりである。なお、体重25kg未満の患者においては、総量として体重に80mg/kgを乗じた量を超えないこと。

体重(kg)	トリクロホスナトリウム	トリクロリールシロップ10%
5	100~400mg	1~4mL
10	200~800mg	2~8mL
15	300~1200mg	3~12mL
20	400~1600mg	4~16mL
25	500~2000mg	5~20mL*
30	600~2000mg	6~20mL*

*本剤の総量は20mLを超えないこと。

8. 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。〔9.7.1、9.8、11.1.1参照〕
- 2 抱水クロラルは、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ので注意すること。〔13.1参照〕
- 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。〔11.1.3参照〕

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 虚弱者

呼吸抑制を起こすおそれがある。

9.1.2 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。

9.1.3 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。

9.2 腎機能障害患者

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、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。

9.3 肝機能障害患者

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、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。

9.5 妊婦

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回ると判断される場合にのみ投与すること。

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。

9.7 小児等

9.7.1 以下の点を考慮し、少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。一般に成人に比し、薬物感受性が高い。〔8.1、11.1.1参照〕

・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。

・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。

・痙攣(間代性痙攣、部分発作等)が起こることがある。

9.8 高齢者

少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。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。〔8.1、11.1.1参照〕

10. 相互作用

10.2 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ロ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。

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 無呼吸、呼吸抑制（いずれも頻度不明）

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うこと。[8.1、9.7.1、9.8参照]

11.1.2 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

そう痒感、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。

11.1.3 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。[8.4参照]

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	発疹、紅斑、水疱、固定薬疹、そう痒感、発熱
循環器	徐脈
肝臓	AST、ALT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

13. 過量投与

13.1 症状

呼吸抑制、徐脈、血圧低下が認められることがある。[8.2参照]

13.2 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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

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)¹⁾。

16.3 分布

血漿蛋白結合率(外国人のデータ): 35%¹⁾

16.5 排泄

代謝物のトリクロロエタノールは、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)²⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

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)。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

抱水クローラルと同様に、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ーラルより低い³⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

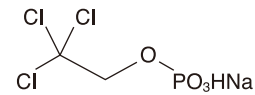
一般的名称：トリクロロスナトリウム(Triclofos Sodium)

化学名：Monosodium 2,2,2-trichloroethyl monohydrogen phosphate

分子式：C₂H₃Cl₃NaO₄P

分子量：251.37

化学構造式：



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。

20. 取扱い上の注意

凍結を避け、冷所保存(1~15℃)すること。

22. 包装

500mL [ガラス瓶(褐色)]

23. 主要文献

- 1) Sellers, E. M. et al. : J Clin Pharmacol. 1978 ; 18 : 457-461
- 2) 赤木満洲雄：薬物代謝の生化学 南山堂. 1965 ; 116-117
- 3) 第十八改正 日本薬局方解説書 廣川書店. 2021 : C3646-3650

24. 文献請求先及び問い合わせ先

アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部
〒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

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

alfresa 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