

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018（2019年更新版）に準拠して作成

気管支拡張剤
トリメトキノール塩酸塩水和物吸入液
イノリン吸入液 0.5%
INOLIN for Inhalation

| | |
|---------------------------------|---|
| 剤形 | 吸入液剤 |
| 製剤の規制区分 | 処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること） |
| 規格・含量 | 100mL中 日本薬局方 トリメトキノール塩酸塩水和物 500mg |
| 一般名 | 和名：トリメトキノール塩酸塩水和物（JAN） 洋名：Trimetoquinol Hydrochloride Hydrate（JAN） |
| 製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日 | 製造販売承認年月日：2008年2月26日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2008年6月20日（販売名変更による） 販売開始年月日：1969年2月15日 |
| 製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名 | 製造販売元：ニプロ株式会社 |
| 医薬情報担当者の連絡先 | |
| 問い合わせ窓口 | ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL：0120-226-898 FAX：050-3535-8939 医療関係者向けホームページ： https://www.nipro.co.jp/ |

本IFは2026年4月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

| | | |
|------------------------|---------------------------------|----|
| I. 概要に関する項目 | 5. 臨床成績 | 7 |
| 1. 開発の経緯 | 1 | |
| 2. 製品の治療学的特性 | 1 | |
| 3. 製品の製剤学的特性 | 1 | |
| 4. 適正使用に関して周知すべき特性 | 1 | |
| 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 | 1 | |
| 6. RMPの概要 | 2 | |
| II. 名称に関する項目 | VI. 薬効薬理に関する項目 | |
| 1. 販売名 | 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 | 9 |
| 2. 一般名 | 2. 薬理作用 | 9 |
| 3. 構造式又は示性式 | VII. 薬物動態に関する項目 | |
| 4. 分子式及び分子量 | 1. 血中濃度の推移 | 10 |
| 5. 化学名（命名法）又は本質 | 2. 薬物速度論的パラメータ | 10 |
| 6. 慣用名，別名，略号，記号番号 | 3. 母集団（ポピュレーション）解析 | 10 |
| III. 有効成分に関する項目 | 4. 吸収 | 10 |
| 1. 物理化学的性質 | 5. 分布 | 11 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 | 6. 代謝 | 11 |
| 3. 有効成分の確認試験法，定量法 | 7. 排泄 | 12 |
| IV. 製剤に関する項目 | 8. トランスポーターに関する情報 | 12 |
| 1. 剤形 | 9. 透析等による除去率 | 12 |
| 2. 製剤の組成 | 10. 特定の背景を有する患者 | 12 |
| 3. 添付溶解液の組成及び容量 | 11. その他 | 12 |
| 4. 力価 | VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 | |
| 5. 混入する可能性のある夾雑物 | 1. 警告内容とその理由 | 13 |
| 6. 製剤の各種条件下における安定性 | 2. 禁忌内容とその理由 | 13 |
| 7. 調製法及び溶解後の安定性 | 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 | 13 |
| 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化） | 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 | 13 |
| 9. 溶出性 | 5. 重要な基本的注意とその理由 | 13 |
| 10. 容器・包装 | 6. 特定の背景を有する患者に関する注意 | 13 |
| 11. 別途提供される資材類 | 7. 相互作用 | 14 |
| 12. その他 | 8. 副作用 | 15 |
| V. 治療に関する項目 | 9. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 16 |
| 1. 効能又は効果 | 10. 過量投与 | 16 |
| 2. 効能又は効果に関連する注意 | 11. 適用上の注意 | 16 |
| 3. 用法及び用量 | 12. その他の注意 | 16 |
| 4. 用法及び用量に関連する注意 | IX. 非臨床試験に関する項目 | |
| | 1. 薬理試験 | 17 |
| | 2. 毒性試験 | 17 |
| | X. 管理的事項に関する項目 | |
| | 1. 規制区分 | 19 |
| | 2. 有効期間 | 19 |

| | | | |
|--|----|-------------------------------------|----|
| 3. 包装状態での貯法 | 19 | 14. 保険給付上の注意 | 20 |
| 4. 取扱い上の注意 | 19 | | |
| 5. 患者向け資材 | 19 | X I . 文献 | |
| 6. 同一成分・同効薬 | 19 | 1. 引用文献 | 21 |
| 7. 国際誕生年月日 | 19 | 2. その他の参考文献 | 21 |
| 8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価 基準収載年月日, 販売開始年月日 | 19 | X II . 参考資料 | |
| 9. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更 追加等の年月日及びその内容 | 20 | 1. 主な外国での発売状況 | 22 |
| 10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容 | 20 | 2. 海外における臨床支援情報 | 22 |
| 11. 再審査期間 | 20 | X III . 備考 | |
| 12. 投薬期間制限に関する情報 | 20 | 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行う にあたっての参考情報 | 23 |
| 13. 各種コード | 20 | 2. その他の関連資料 | 23 |

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

田辺製薬株式会社（現 田辺ファーマ株式会社）において、ある種のイソキノリン誘導体に強力な気管支拡張作用を有することを発見したことから系統的に誘導体を合成・検索の結果、気管支拡張作用が強く、循環系に対する作用が弱いトリメトキノールが見出された。

本剤は吸入液剤で、1969年2月より販売を開始した。その後2008年2月に「イノリン吸入液0.5%」として販売名変更に伴う再承認を受け、2008年6月に変更銘柄名で薬価収載された。2011年4月には田辺製薬販売株式会社（後のニプロ ES ファーマ株式会社（現 ニプロファーマ株式会社））が田辺三菱製薬株式会社（現 田辺ファーマ株式会社）より移管を受け販売を開始した。

2017年10月にニプロ ES ファーマ株式会社（現 ニプロファーマ株式会社）が田辺三菱製薬株式会社（現 田辺ファーマ株式会社）より製造販売承認を承継した。

2025年4月にニプロ株式会社がニプロ ES ファーマ株式会社（現 ニプロファーマ株式会社）より製造販売承認を承継した。

2. 製品の治療学的特性

(1) 気管支 β_2 受容体を選択的に作用する（ネコ）。

(2) 総症例689例中、副作用が報告されたのは47例（6.8%）で、主な副作用は心悸亢進（4.8%）、頭痛（1.2%）、熱感（0.6%）等であった。（承認時～1977年9月迄の集計）
なお、 β_2 刺激剤の重大な副作用として、重篤な血清カリウム値の低下が報告されている。

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

4. 適正使用に関して周知すべき特性

| 適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等 | 有無 | タイトル、参照先 |
|------------------------------|----|----------|
| RMP | 無 | |
| 追加のリスク最小化活動として 作成されている資料 | 無 | |
| 最適使用推進ガイドライン | 無 | |
| 保険適用上の留意事項通知 | 無 | |

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

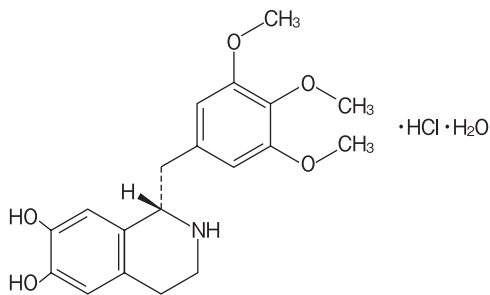
1. 販売名

- (1) 和 名：イノリン吸入液 0.5%
- (2) 洋 名：INOLIN for Inhalation
- (3) 名称の由来：化学名の Tetrahydro-----isoquinoline による。

2. 一般名

- (1) 和 名(命名法)：トリメトキノール塩酸塩水和物 (JAN)
- (2) 洋 名(命名法)：Trimetoquinol Hydrochloride Hydrate (JAN)
- (3) ステム (stem)：不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $\text{C}_{19}\text{H}_{23}\text{NO}_5 \cdot \text{HCl} \cdot \text{H}_2\text{O}$

分子量：399.87

5. 化学名(命名法)又は本質

(1*S*)-1-(3,4,5-Trimethoxybenzyl)-1,2,3,4-tetrahydroisoquinoline-6,7-diol
monohydrochloride monohydrate (IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点

融点: 約 151°C (分解、ただし 105°C で 4 時間減圧乾燥後)。

(5) 酸塩基解離定数^{a)}

pKa₁: 8.33 (第二アミノ基、滴定法)

pKa₂: 9.58 (フェノール性水酸基、滴定法)

pKa₃: 11.06 (フェノール性水酸基、滴定法)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値^{b)}

旋光度: $[\alpha]_D^{20}$: -16~-19° (脱水物に換算したもの 0.25g、水、加温、冷後、25mL、100mm)

2. 有効成分の各種条件下における安定性

- ・室温、気密容器、遮光、12 ヶ月保存で、外観、含量に異常なし。
- ・苛酷試験 (40°C、79%RH、遮光) で 12 ヶ月保存で、外観、含量に異常なし。
- ・太陽光線下、20 日間でわずかに変色した。

3. 有効成分の確認試験法, 定量法

確認試験法

日局「トリメトキノール塩酸塩水和物」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法

(3) 塩化物の定性反応 (1) (硫酸および過マンガン酸カリウムによる塩素ガスの発生および発生した塩素ガスによるヨウ化カリウムデンプン紙の青変)

定量法

日局「トリメトキノール塩酸塩水和物」の定量法による。

電位差滴定法 (0.1mol/L 水酸化カリウム・エタノール液)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

吸入液剤

(2) 製剤の外観及び性状

| 販売名 | pH | 性状 |
|--------------|---------|--------|
| イノリン吸入液 0.5% | 2.3~4.5 | 無色澄明の液 |

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

| 販売名 | 有効成分 | 添加剤 |
|--------------|---|---|
| イノリン吸入液 0.5% | 100mL 中 日本薬局方 トリメトキノール塩酸塩水和物 500mg | 塩化ナトリウム、サッカリンナ トリウム水和物、ピロ亜硫酸ナ トリウム、メチルパラベン その他の添加剤として pH 調整剤 (塩酸) を含有する |

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

- ・ 冷所保存：褐色ガラス瓶/カートン包装で 36 ヶ月間、外観及び含量に異常は認められなかった。
- ・ 室温（褐色ガラス瓶）保存：12 ヶ月間、外観、含量に異常は認められなかった。
- ・ 苛酷試験（褐色ガラス瓶）：室温、光 60 万 lx・hr（1000lx 蛍光灯照射：室内散光下 6 ヶ月間保存に相当）で、外観、pH 及び含量に異常は認められなかった。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

(2) 包装

22. 包装

50mL [瓶]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

褐色ガラス瓶、ポリプロピレンキャップ+紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 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

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法・用量

吸入器を用い、通常1回0.25～0.5mLを深呼吸しながら吸入させる。症状に応じて適宜吸入させる。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17施設133例についての臨床試験の結果、気管支喘息に対して有用性が認められている。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

アドレナリン作動性 β -受容体刺激剤（イソプレナリン等）

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

β 受容体の刺激作用により選択的に気管支筋を拡張させる。(ネコ¹⁾、モルモット²⁾)

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 気管支拡張作用

18.2.1 各種スパスモージェン（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¹⁾。

18.2.2 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²⁾。

18.3 気管支 β_2 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_2 刺激作用）は心拍数増加作用（ β_1 刺激作用）、拡張期血圧低下作用（ β_2 刺激作用）、及びヒラメ筋に対する作用（ β_2 刺激作用、振戦の実験的モデル）より強く、気管支 β_2 受容体に対し作用選択性の高いことが認められている^{1)、3)}。

18.4 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⁴⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

ヒスタミ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0.4mg/kg 経口投与5時間後でも緩解作用が認められる²⁾。

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

ラットに³H-トリメトキノールを経口投与した時の消化管からの吸収半減期は190分であり、投与後3時間以内に49%が消化管より消失した⁵⁾。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

マウスに³H-トリメトキノールを経口投与した時の生体内分布（全身オートラジオグラフィ）の検討の結果、血液-脳関門の通過はきわめて少なかった⁶⁾。

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

妊娠マウスに³H-トリメトキノールを静脈内投与したところ、胎盤を通り、胎児への移行が認められた。胎児の各臓器への移行量は親のそれより少なく、かつ母体よりも早く減少した⁷⁾。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

ラットに³H-トリメトキノールを経口投与した時の臓器中の放射能濃度は投与後60分でピークに達し、肝臓、腎臓、気管、肺臓、心臓の順に高く、脳にはほとんど移行がみられなかった⁵⁾。

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

主代謝経路は肝臓におけるメチル化及びその後直ちに受けるグルクロン酸抱合であると考えられた⁸⁾。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種，寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比，存在比率

該当資料なし

7. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

〈参考〉動物でのデータ

ラットに³H-トリメトキノールを経口投与した場合、投与後48時間で放射活性の46%が尿中に、49%が糞中に排泄された。また、投与後7時間で3.3%が胆汁中に排泄された⁵⁾。

モルモットに³H-トリメトキノールを静脈内投与した場合、投与後48時間で放射活性の42%が尿中に、49%が糞中に排泄された。また、投与後2時間でおおよそ60%が胆汁中に排泄された⁹⁾。

(2) 排泄率

該当資料なし

〈参考〉経口剤でのデータ

健康成人男子6名にイノリン錠3mgの2錠(6mg)を経口投与した場合、投与後24時間以内に投与量の13~33%が尿中に排泄された⁸⁾。

※錠剤の承認を受けた用法・用量は「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。」である。

(3) 排泄速度

上記(2)の項を参照

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

設定されていない

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 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。

8.2 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注意すること。また、患者に対し、本剤の過度の使用による危険性があることを理解させ、次の事項及びその他必要と考えられる注意を与えること。

- ・用法・用量を守ること。
- ・発作が重篤で吸入液の効果が不十分な場合には、可及的速やかに医療機関を受診し治療を求めること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。

9.1.2 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。

9.1.3 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。

9.1.4 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。

9.1.5 低酸素血症のある患者

定期的に血清カリウム値を観察することが望ましい。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。[11.1.1 参照]

9.1.6 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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。

(6) 授乳婦

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。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

| 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 |
| 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。 |
| β 刺激剤 | | |
| キササンチン誘導体 テオフィリン [11.1.1 参照] | 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。 本剤は cAMP を活性化 し、Na-K ポンプを刺激 する。 |
| ステロイド剤 プレドニゾロン [11.1.1 参照] | | |
| 利尿剤 アミノフィリン [11.1.1 参照] | | |

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 重篤な血清カリウム値の低下（頻度不明）

キササンチン誘導体、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。[9.1.5、10.2 参照]

(2) その他の副作用

| 11.2 その他の副作用 | | |
|--------------|----------|------|
| | 0.1～5%未満 | 頻度不明 |
| 循環器 | 心悸亢進 | |
| 精神神経系 | 頭痛、熱感 | |
| 消化器 | 悪心 | |
| 過敏症 | | 発疹 |

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

〈参考資料〉

症状：一般に交感神経刺激作用による心悸亢進、頻脈等の症状の発現の可能性が考えられる。

処置法：薬理的に拮抗するものとして β 遮断薬があるが、喘息の場合は、激しい発作を誘発する危険性があり、慎重に用いる必要がある¹⁰⁾、^{c)}。

頻脈があまりにも高度であったり、心拍異常、胸部苦悶感等の症状が強ければ、症状に応じてジギタリス製剤、冠血管拡張剤等の注射、更に状況により心室性不整脈に有効とされているリドカイン塩酸塩の注射を試みる^{c)}。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

開栓後は汚染防止のため、清潔に取扱うこと。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

本剤は添加剤として亜硫酸塩を含有している。喘息患者では非喘息患者よりも亜硫酸塩に対する過敏症が多く認められるとの報告がある。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照。

(2) 安全性薬理試験

1) 中枢神経系に対する作用

マウスにおいて100mg/kgの腹腔内投与または1,000mg/kgの経口投与で睡眠時間に影響を与えず、協調運動障害、鎮痛、抗痙攣、抗鬱などの作用を示さない。

2) 心循環系に対する作用

イヌにおいて0.25 μ g/kg以上の静脈内投与で用量依存的な降圧作用と心拍数増加作用を示し、0.025 μ g/kgの動脈内投与で末梢血流増加作用を示す¹¹⁾、¹²⁾。イヌ、ラットおよびモルモットにおいて静脈内投与で心電図のST波およびT波の変化を生じるが、その変化はイソプレナリンに比べて軽度である¹¹⁾。

3) 消化器系に対する作用

マウスの消化管運動に対して0.25mg/kgの皮下投与では影響を与えず、5mg/kg（抗喘息作用を示す量の100倍）で抑制する²⁾、¹²⁾。

4) 生殖・泌尿器系に対する作用

モルモット摘出輸精管標本において100 μ Mでも影響を与えない²⁾。

5) その他の作用

・抗血液凝固作用

マウスにおいて50mg/kgの静脈内投与または1000mg/kgの経口投与で血液凝固時間に影響を与えない¹¹⁾。

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

ラット及びマウスを用いてトリメトキノールの急性毒性を経口及び静脈内投与で検討したところ、表に示す結果が得られた¹²⁾。

LD₅₀ (mg/kg)

| 動物 | 投与方法 | |
|-----|------|--------|
| | 静脈内 | 経口 |
| マウス | 120 | 2250 |
| ラット | 173 | > 2000 |

(2) 反復投与毒性試験

- 1) ラット、イヌにそれぞれ 800 および 100mg/kg/日 30 日間経口投与したところ、気管支環状筋の弛緩、各臓器における末梢血管拡張、門脈系の拡張心臓における変化など、薬理作用との関係が十分考えられる変化が見られたが、イソプロテレノールのそれより弱かった。
- 2) モルモットに 200～800mg/kg/日 30 日間経口投与したところ、200mg/kg/日で死亡率、血液所見及び臓器重量について対照群と比べて有意差はみられなかった。病理組織学的所見では、イソプロテレノール投与群と同様に気管支環状筋線維の弛緩と肺中小静脈及び肝門脈の拡張がみられた。
- 3) ラットに 0.2～20mg/kg/日 6 ヶ月間経口投与した場合、5mg/kg/日以上で一般症状及び病理組織学的検査に、20mg/kg/日で血液検査に所見が得られた。なお、死亡した動物はいなかった¹³⁾。
- 4) モルモットに 1mg/kg/日 6 ヶ月間皮下投与、20mg/kg/日 6 ヶ月間経口投与したところ、一般症状及び血液、尿、病理組織学的所見において対照群と比べて有意な変化はみられなかった¹³⁾。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

マウス及びラットにトリメトキノールを経口投与（マウス：500、1000mg/kg、ラット：250、500mg/kg）及び皮下投与（マウス：50、75、250mg/kg、ラット：125、250mg/kg）して検討した結果、催奇形作用は認められなかった¹⁴⁾。

(6) 局所刺激性試験

- 1) モルモットを用いて Evans blue 法により局所刺激作用を検討したところ、刺激作用はほとんど認められなかった¹¹⁾。
- 2) ウサギの眼を用いて粘膜に対する刺激作用を検討したところ、刺激作用は認められなかった¹¹⁾。

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：イノリン吸入液 0.5% 処方箋医薬品^{注)}
有効成分：日本薬局方 トリメトキノール塩酸塩水和物 劇薬
注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

冷所保存

4. 取扱い上の注意

薬局での取り扱い上の留意点について
冷所保存するよう注意すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド : あり
くすりのしおり : あり
その他の患者向け資材 : なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬 : 該当なし
同 効 薬 : イソプロテレノール等の β -受容体刺激剤

7. 国際誕生年月日

1968年12月12日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準収載年月日, 販売開始年月日

製造販売承認年月日及び承認番号

| 販売名 | 製造販売承認年月日 | 承認番号 |
|-------------------|--------------------------|------------------|
| イノリン吸入液 0.5% | 2008年2月26日 (販売名変更による) | 22000AMX00092000 |
| イノリン吸入液 (旧販売名) | 1968年12月12日 | (43AM) 第1773号 |

薬価基準収載年月日

イノリン吸入液 0.5% : 2008年6月20日(販売名変更による)

イノリン吸入液(旧販売名): 1970年8月1日

(2009年3月31日経過措置期間終了)

販売開始年月日

1969年2月15日

[注1] 2017年10月にニプロESファーマ株式会社が田辺三菱製薬株式会社より製造販売承認を承継

[注2] 2025年4月にニプロ株式会社がニプロESファーマ株式会社より製造販売承認を承継

9. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

| 販売名 | 厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード | 個別医薬品コード (YJコード) | HOT(9桁)番号 | レセプト電算処理 システム用コード |
|-----------------|-----------------------|---------------------|-----------|----------------------|
| イノリン吸入液 0.5% | 2259700G1034 | 2259700G1034 | 104102603 | 620007594 |

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 佐藤匡徳 他 : 応用薬理 1980 ; 19 (2) : 269-276 (L20240049)
- 2) Kiyomoto, A. et al. : Arzneimittelforschung 1970 ; 20 : 46-52 (L20240050)
- 3) 池沢一郎 他 : 応用薬理 1981 ; 21 (5) : 847-854 (L20240051)
- 4) Tsuzurahara, K. et al. : Chem. Pharm. Bull (Tokyo). 1979; 27(8) : 1715-1724 (L20240052)
- 5) Sugihara J. et al. : Radioisotopes 1971 ; 20 (10) : 525-531
- 6) Otsuka M. et al. : Radioisotopes 1972 ; 21 (2) : 102-109
- 7) Takahashi T. et al : Radioisotopes 1968 ; 17 (8) : 374-381
- 8) 鈴木利一 他 : 田辺製薬研究報告 1983 : 1-9
- 9) Meshi T. et al. : Biochem. Pharmacol. 1970 ; 19 (12) : 2937-2948
- 10) 萩原忠文 他 : 総合臨床 1972 ; 21 (13) : 3019-3024
- 11) Kiyomoto A. et al. : Europ. J. Pharmacol. 1969 ; 5 : 303-312
- 12) 佐藤匡徳 他 : 日薬理誌 1968 ; 64 : 268-278
- 13) 藤田哲男 他 : 田辺製薬研究報告 1977 : 197-217
- 14) 甲和良夫 他 : 応用薬理 1968 ; 2 (4) : 383-396

2. その他の参考文献

- a) 日本公定書協会 編 : 医療用医薬品 品質情報集 (オレンジブック), 薬業日報社 2003 ; 15 : 151-151
- b) 第十八改正 日本薬局方解説書, 東京廣川書店 2021 : C3701-C3705
- c) 荒木英斉 他 : 日本医事新報 1972 (No. 2537) : 139-140

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない（本剤は外国では発売していない）

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし

【MEMO】

【MEMO】

【MEMO】

ニフ.オ株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号