

**2009年12月改訂（第8版、薬事法改正に伴う指定医薬品削除等）
*2008年6月改訂（第7版、販売名変更に伴う改訂）

貯法：室温保存
使用期限：表示の使用期限内に使用すること。（使用期限内であっても開封後はなるべく速やかに使用すること。）

膵・胆道疾患治療剤
* **スパカール錠40mg**
* **スパカール細粒10%**
* **SUPACAL[®] TABLETS 40mg**
* **SUPACAL[®] FINE GRANULES 10%**
(トレピブトン製剤)

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

*【組成・性状】

販売名	スパカール錠40mg		
成分・含量	1錠中日局トレピブトン40mgを含有		
添加物	結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物		
色調・剤形	白色～帯黄白色・素錠		
外形	表面	裏面	側面
	直径：7.6mm		厚さ：2.9mm
重量	155mg		
識別コード	OH-251		

販売名	スパカール細粒10%		
成分・含量	1g中日局トレピブトン100mgを含有		
添加物	ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、トウモロコシデンプン、乳糖水和物		
色調・剤形	白色～帯黄白色・細粒		
識別コード	—		

【効能・効果】

下記疾患に伴う鎮痙・利胆
胆石症、胆のう炎、胆管炎、胆道ジスキネジー、胆のう切除後症候群
慢性膵炎に伴う疼痛並びに胃腸症状の改善

*【用法・用量】

スパカール錠40mg：
通常成人には1回1錠（トレピブトンとして40mg）を1日3回食後直ちに経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

スパカール細粒10%：
通常成人には1回400mg（トレピブトンとして40mg）を1日3回食後直ちに経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 副作用

本剤の副作用集計対象となった10,648例中、161例（1.51%）に臨床検査値の異常を含む副作用が認められた。その主なものは、悪心（0.25%）、便秘（0.20%）、膨満感（0.18%）、下痢（0.17%）等の消化器症状及び発疹（0.18%）等であった。

〔再審査終了時の集計〕

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	副作用の頻度	
	0.1～1%未満	0.1%未満
過敏症 ^{※1)}	発疹、痒痒	
消化器	悪心、便秘、膨満感、下痢、胃部不快感、食欲不振、嘔吐	口渇、唾液分泌過多
肝臓		AST（GOT）、ALT（GPT）の上昇等肝機能検査値の異常

*	日本標準商品分類番号	
	8 7 2 3 6 9	
	スパカール錠40mg	スパカール細粒10%
承認番号	22000AMX00962000	22000AMX00963000
薬価収載	2008年6月	2008年6月
販売開始	1981年2月	1981年2月
再審査結果	1988年1月	1988年1月
効能追加	1985年8月	1985年8月

	副作用の頻度	
	0.1～1%未満	0.1%未満
その他		めまい、頭重感、倦怠感

注1) 投与を中止すること。

2. 高齢者への投与

高齢者では生理機能が低下していることが多く、副作用があらわれやすいので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

3. 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。〕

(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中止させること。
〔授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。（使用経験が少ない。）

5. 適用上の注意

薬剤交付時（錠剤）

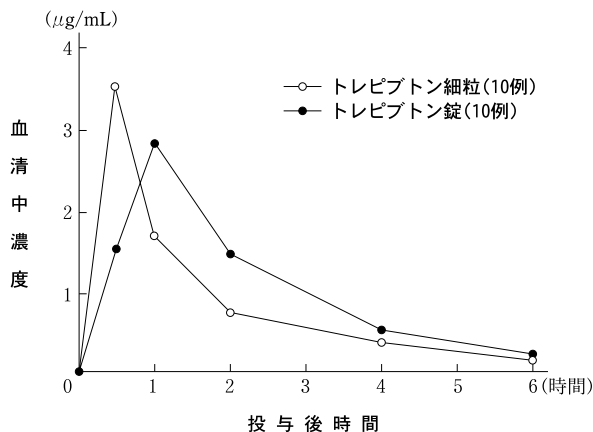
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

*【薬物動態】

1. 血清中濃度²⁾

スパカール錠40mg 1錠あるいはスパカール細粒10% 0.4g（トレピブトンとして40mg）を、それぞれ健常成人男子10例に単回経口投与したときの血清中トレピブトン濃度は、下図のような推移を示す。

図 トレピブトン40mg経口投与後の血清中濃度



	錠	細粒
Tmax (hr.)	0.95	0.5
Cmax (µg/mL)	2.9	3.6
AUC (µg・hr/mL)	6.45	5.10
T _{1/2} (hr.)	1.40	1.79

2. 代謝・排泄 (参考)³⁾

トレピブトン・ナトリウム塩40mgを健常成人男子2例に空腹時単回経口投与したとき、投与後23時間以内に投与量の66.7%が尿中に排泄される。そのうちグルクロン酸抱合体が52.4% (投与量に対して)、脱アルキル化されたフェノール体が8.8% (投与量に対して)、未変化体は5.6% (投与量に対して) である。

【臨床成績】

錠剤・細粒剤の国内で実施された二重盲検比較試験を含む臨床試験で全般改善度評価がされた総症例3,290例の成績の概要は以下のとおりである。[再審査終了時の集計⁴⁾]

これらの試験における1日投与量及び投与期間は、大部分の症例において、トレピブトンとして120mg/日及び2～4週間である。

疾患	「中等度改善」以上 (%)
胆石症	996/1,538 (64.8)
胆のう炎・胆管炎	285/ 367 (77.7)
胆道ジスキネジー	445/ 649 (68.6)
胆のう切除後症候群	207/ 306 (67.6)
慢性膵炎	247/ 430 (57.4)
計	2,180/3,290 (66.3)

【薬効薬理】

1. Oddi括約筋弛緩作用

トレピブトンは、摘出腸管平滑筋標本のOddi括約筋に比較的に選択的に作用する (ウサギ)⁵⁾。

トレピブトンは、用量依存性かつ持続的に総胆管、十二指腸接合部 (含Oddi括約筋) の通過抵抗を減少させる (イヌ)^{6,7)}。この作用はヒメクロモン及びフロプロピオンより強い (イヌ)⁷⁾。本剤のOddi括約筋弛緩作用は細胞内Ca²⁺のCa-store siteへの取り込みを促進させることによると考えられている⁸⁾。

2. 胆嚢・胆管内圧低下作用

トレピブトンは、胆嚢・胆管内圧を低下させる。その作用は用量依存性かつ持続的である (イヌ・ウサギ)^{6,9)}。

3. 胆汁分泌促進作用

トレピブトンは、肝細胞から毛細胆管への胆汁分泌量を胆汁酸に非依存的に増加させる (イヌ)¹⁰⁾。その作用は、ヒメクロモン、フロプロピオンより強力で持続性がある (イヌ)⁷⁾。

4. 膵液分泌促進作用

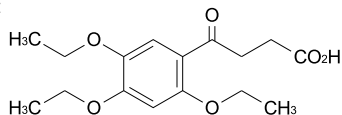
トレピブトンは、高用量で膵液分泌促進作用を示す (イヌ・ラット)^{11,12)}。これは膵管におけるセクレチン様の水分分泌作用によりもたらされると考えられている¹²⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：トレピブトン (Trepibutone)

化学名：4-Oxo-4-(2,4,5-triethoxyphenyl)butanoic acid

構造式：



分子式：C₁₆H₂₂O₆

分子量：310.34

性状：本品は白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はないか、又はわずかに特異なあと味がある。本品はアセトンにやや溶けやすく、エタノール (95) にやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。本品は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

融点：146～150℃

*【包装】

スパカール錠40mg：(PTP) 100錠 (10錠×10)
105錠 (21錠×5)
1000錠 (10錠×100)
1050錠 (21錠×50)
(バラ) 1000錠 (500錠×2)

スパカール細粒10%：(バラ) 100g

【主要文献】

- 社内資料
- 社内資料
- 関 隆：臨床薬理，8(4)：485(1977)
- 社内資料
- 佐藤 宏，他：武田研究所報，36(3/4)：233(1977)
- Satoh, H., et al.：Eur. J. Pharmacol., 48：309(1978)
- 佐藤 宏，他：武田研究所報，36(3/4)：225(1977)
- 佐藤 宏，他：第51回日本薬理学会総会プログラム要旨集：P.132(1978)
- 村田悦男，他：日平滑筋誌，12：238(1976)
- Satoh, H., et al.：Eur. J. Pharmacol., 48：125(1978)
- 玉沢佳己，他：薬理と治療，5(12)：55(1977)
- 佐藤 宏，他：武田研究所報，36(3/4)：239(1977)

**【文献請求先】

大原薬品工業株式会社 学術部
〒520-3403 滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121-15
TEL 0748-88-2200(代) FAX 0748-88-2300

【問い合わせ先】

大原薬品工業株式会社 安全管理部
お客様相談室 ☎0120-419-363

URL <http://www.ohara-ch.co.jp>



製造販売元 大原薬品工業株式会社
滋賀県甲賀市甲賀町鳥居野121-15