

貯 法：室温保存
有効期間：5年

鎮咳・気道粘液溶解剤

エブラジノン塩酸塩錠

レスプレ[®]錠5mgレスプレ[®]錠20mgレスプレ[®]錠30mgRESPLEN[®] Tablets

	錠5mg	錠20mg
承認番号	21300AMZ00456	21300AMZ00457
販売開始	1974年2月	1974年2月
	錠30mg	
承認番号	15300AMZ00856	
販売開始	1981年9月	






3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	レスプレ錠5mg	レスプレ錠20mg	レスプレ錠30mg
有効成分	1錠中 エブラジノン 塩酸塩 5mg	1錠中 エブラジノン 塩酸塩 20mg	1錠中 エブラジノン 塩酸塩 30mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、タルク、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、メタクリル酸コポリマーLD、ラウリル硫酸ナトリウム、ポリソルベート80、マクロゴール6000、酸化チタン、グリセリン、白色セラック、カルナウバロウ、ステアリン酸	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、タルク、ステアリン酸カルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、エチルセルロース、酸化チタン、グリセリン、白色セラック、カルナウバロウ、ステアリン酸	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、タルク、ステアリン酸カルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、エチルセルロース、酸化チタン、グリセリン、白色セラック、カルナウバロウ、ステアリン酸

3.2 製剤の性状

販売名	レスプレ錠5mg	レスプレ錠20mg	レスプレ錠30mg
色・剤形	白色フィルムコーティング錠		
外形			
識別コード	C-22B 5	C-22B 20	C-22B 30
直径	5.1mm	8.1mm	8.1mm
厚さ	2.4mm	4.3mm	4.3mm
重量	約54mg	約209mg	約208mg

4. 効能又は効果

○下記の呼吸器疾患時の鎮咳及び去痰

肺結核、肺炎、気管支拡張症、気管支喘息、急・慢性気管支炎、上気道炎、感冒

6. 用法及び用量

(5mg錠・20mg錠)

通常、成人1日量エブラジノン塩酸塩として60～90mgを3回に分けて経口投与する。

年齢・症状により適宜増減する。

幼・小児においてはエブラジノン塩酸塩として下記量を1日量として3回に分けて経口投与する。

6歳以上 10歳未満 30～45mg

3歳以上 6歳未満 20～30mg

(30mg錠)

通常成人1回1錠（エブラジノン塩酸塩として30mg）を1日3回経口投与する。年齢・症状により適宜増減する。

なお、エブラジノン塩酸塩としての通常の用法・用量は、成人1日60～90mgを3回の分割経口投与である。

7. 用法及び用量に関連する注意

1日あたりの錠数は下記を参考とする。下記量を3回に分けて経口投与する。

	成人1日量	幼・小児1日量	
		3歳以上6歳未満	6歳以上10歳未満
5mg錠	12～18錠	4～6錠	6～9錠
20mg錠	3～4錠		
30mg錠	3錠		

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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まわると判断される場合にのみ投与すること。

9.6 授乳婦

授乳中の女性には、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。

9.8 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。

11.2 その他の副作用

	1～5%未満	0.1～1%未満	頻度不明
過敏症			過敏症状
消化器	食欲不振・悪心、 下痢	嘔気・嘔吐、胃部 不快感、腹痛	
その他		頭痛	

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

³H-エブラジノン塩酸塩10mg/匹をラットに経口投与した際の血中標識物質は、投与2時間後に最高となり、48時間後にはほぼ消失した。

16.4 代謝

非標識エブラジノン塩酸塩を経口投与した検討から、ラット尿、胆汁中、ウサギ及びヒトの尿中から共通の代謝物として1-(2-phenyl-2-ethoxy) ethyl piperazine、1-(2-phenyl-2-hydroxy) ethyl piperazine及びその抱合体が検出された。²⁾

16.5 排泄

16.5.1 健康成人男子5人（平均29歳、57kg）にエブラジノン塩酸塩30mg（0.53mg/kg）を経口投与し、経時的に尿中回収率を求めた。0-24時間の尿中回収率は未変化体が4.22%、代謝物が2.10%、計6.32%で未変化体の方が若干多く排泄された。各2時間毎の回収率には、有意のピークが認められず同程度の排泄が続いた¹⁾。

時間 (h)	尿中回収率 (%)	
	未変化体	代謝物
0-2	0.39	0.28
2-4	0.83	0.42
4-6	0.82	0.39
6-8	0.65	0.32
8-10	0.54	0.34
10-12	0.54	0.35
12-24	0.45	0
0-24	4.22	2.10

6.32

16.5.2 ³H-エブラジノン塩酸塩10mg/匹をラットに経口投与した際の血中標識物質は、48時間後までの間、尿中には約14%、糞中には36%、胆汁中には23%が排泄された²⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験³⁾⁻²⁰⁾

国内で実施された臨床試験において本剤が投与された総症例605例における総有効率は79.0%（478例/605例）であった。かぜ症候群、急性気管支炎、肺炎等の急性呼吸器疾患に対する有効率は83.4%（266例/319例）であり、慢性気管支炎、気管支拡張症、肺結核症等の慢性呼吸器疾患に対する有効率は71.5%（176例/246例）であった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

鎮咳作用は中枢性・非麻薬性であり、また、去痰作用は気道粘液溶解を主とする。

18.2 去痰作用

18.2.1 酸性ムコ多糖類線維・DNA高含有線維溶解作用

慢性呼吸器疾患患者から採取した喀痰にエブラジノン塩酸塩を添加し、細胞学的に検討した結果、酸性ムコ多糖類線維・DNA高含有線維の性状を変化させ、膨化・離断する作用により強い粘液溶解作用を示した（*in vitro*）。²¹⁾

18.2.2 喀痰粘稠度低下作用

慢性呼吸器疾患患者から採取した喀痰に*in vitro*でエブラジノン塩酸塩を添加し、回転粘度計法、Ostwald粘度計法、Hirsch変法、斜面法で検討した結果、明らかに粘稠度低下作用を示した。²²⁾⁻²⁵⁾

18.2.3 気道内分泌液増加作用²⁶⁾

マウスを用いて気道分泌液に対するエブラジノン塩酸塩の作用を検討した結果、明らかな気道分泌液増加作用が投与3時間後まで認められ、気道内に障害を惹起させた場合でも分泌液を増加させた。

18.3 鎮咳作用

モルモット、ネコ、イヌ等を用いた電氣的刺激、機械的刺激、化学的刺激性実験においてコデインリン酸塩水和物に匹敵する鎮咳作用を示した。²⁷⁾⁻²⁹⁾

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：エブラジノン塩酸塩 (Eprazinone Hydrochloride) (JAN)
化学名：1-(2-Phenyl-2-ethoxy)ethyl-4-(2-benzoyl)

propylpiperazine dihydrochloride

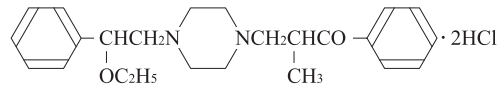
分子式：C₂₄H₃₂N₂O₂ · 2HCl

分子量：453.45

性状：白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦く、舌をわずかに麻痺する。

熱湯にやや溶けやすく、水又は酢酸(100)にやや溶けにくく、メタノール、無水酢酸又はエタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

構造式：



融点：約197℃（分解）

22. 包装

〈レスプレ錠5mg〉

(PTP：乾燥剤入り) 500錠 (10錠×50)

〈レスプレ錠20mg〉

(PTP：乾燥剤入り) 500錠 (10錠×50)

1000錠 (10錠×100)

(バラ：乾燥剤入り) 1000錠

〈レスプレ錠30mg〉

(PTP：乾燥剤入り) 500錠 (10錠×50)

1000錠 (10錠×100)

23. 主要文献

- 1) 高梨 茂, 他: 薬学雑誌. 1975; 1002-
- 2) 社内資料: 日野原好和, 他: レスプレンの吸収・分布・代謝・排泄 (1974)
- 3) 坂井英一, 他: 診療と新薬. 1972; 585-587
- 4) 清水辰典, 他: 診療と新薬. 1970; 1681-1683
- 5) 社内資料: 川村芳弘, 他: 鎮咳剤CG-B6K顆粒の試用成績(1971)
- 6) 社内資料: 西川隆久: CG-B6Kの使用経験 (1972)
- 7) 社内資料: 光井庄太郎, 他: 鎮咳剤レスプレ錠の使用経験(1972)
- 8) 木村 仁, 他: 薬物療法. 1971; 1301-1303
- 9) 塩野 哲: 新薬と臨牀. 1972; 265-267
- 10) 石田尚之, 他: 新薬と臨牀. 1972; 269-272
- 11) 吉田良一: 基礎と臨牀. 1972; 876-878
- 12) 社内資料: 国分義行, 他: 小児の咳嗽に対するCG-B6Kの使用成績 (1972)
- 13) 社内資料: 山本正彦, 他: 1-(2-Phenyl-2-ethoxy) ethyl-4-(2-benzoyl)propyl piperazine Dihydrochlorideの鎮咳作用(1972)
- 14) 原 一夫, 他: 診療と新薬. 1971; 441-445
- 15) 社内資料: 鈴木浩一, 他: CG-B6K治験報告 (1971)
- 16) 宮村守人, 他: 薬物療法. 1971; 1061-1062
- 17) 鈴木信也, 他: 新薬と臨牀. 1972; 273-275
- 18) 社内資料: 増田忠司: CG-B6Kの使用経験 (1972)
- 19) 社内資料: 副島林造, 他: 1-(2-phenyl-2-ethoxy) ethyl-4-(2-benzoyl) propylpiperazine [CG-B6K]の鎮咳効果 (1972)
- 20) 社内資料: 志摩 清, 他: 塩酸エブラジノン [1-(2-Phenyl-2-ethoxy) -ethyl-4-(2-benzoyl) propyl piperazine Dihydrochloride] の喀痰融解作用 (1972)
- 21) 長岡 滋, 他: 現代の診療. 1974;
- 22) Bürgi, H.: Personal communication (1969)
- 23) 志摩 清, 他: 新薬と臨牀. 1972; 1667-1668
- 24) 宮川智秀, 他: 臨牀と研究. 1973; 3065-3067
- 25) 山木戸道郎, 他: 咳と痰: 69 (1982) 羊土社
- 26) 社内資料: 小島喜久男: 気道内分泌液増加作用 (1974)
- 27) 高山聰明, 他: 応用薬理. 1968; 314-322
- 28) Vacher, J. et al.: Arch. Int. Pharmacodyn.: 1967; 1-13
- 29) 社内資料: 菅野 茂, 他: 鎮咳作用 (1974)

24. 文献請求先及び問い合わせ先

太陽ファルマ株式会社 お客様相談室

〒100-0005 東京都千代田区丸の内1-6-5

電話: 0120-533-030

https://www.taiyo-pharma.co.jp

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

太陽ファルマ株式会社

〒100-0005 東京都千代田区丸の内1-6-5

®登録商標