

鎮咳・気道粘液溶解剤

貯 法：気密容器（バラ包装の場合）、室温保存
使用期限：5年（外箱、ラベルに表示の使用期限内に使用すること）

レスプレ[®]錠5mg
レスプレ[®]錠20mg
レスプレ[®]錠30mg
RESPLEN[®]
エブラジノン塩酸塩錠

| | 錠5mg | 錠20mg |
|------|---------------|---------------|
| 承認番号 | 21300AMZ00456 | 21300AMZ00457 |
| 薬価収載 | 2002年7月 | 2002年7月 |
| 販売開始 | 1974年2月 | 1974年2月 |

| | 錠30mg |
|------|---------------|
| 承認番号 | 15300AMZ00856 |
| 薬価収載 | 1981年8月 |
| 販売開始 | 1981年9月 |



【組成・性状】

| 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・含有量 | エブラジノン塩酸塩 5mg | エブラジノン塩酸塩 20mg | エブラジノン塩酸塩 30mg |
| 成分（1錠中） 添加物 | 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 | | |
| 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 |
| 総重量 | 約54mg | 約209mg | 約208mg |

（参考）下記量を3回に分けて経口投与する。

| | 成人1日量 (分3) | 幼・小児1日量(分3) | |
|-------|---------------|-------------|-----------|
| | | 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 | | |

【使用上の注意】

1. 副作用

総症例4,155例中、114例（2.74%）120件に副作用が認められた。主な副作用は、食欲不振・悪心55件（1.32%）、嘔気・嘔吐15件（0.36%）、胃部不快感11件（0.26%）、下痢（軟便を含む）11件（0.26%）であった。（副作用頻度報告時：1977.3）以下のような副作用が認められた場合には、減量・休薬など適切な処置を行うこと。

| | 頻度不明 | 0.1~5%未満 |
|--------------------|------|----------------------------|
| 過敏症 ^{注1)} | 過敏症状 | |
| 消化器 | | 食欲不振・悪心、嘔気・嘔吐、胃部不快感、下痢、腹痛等 |
| その他 | | 頭痛 |

注1) 副作用があらわれた場合には投与を中止すること。

2. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため減量するなど注意すること。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳中の婦人には、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。〔妊娠中及び授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

4. 適用上の注意

薬剤交付時：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】

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%で未変化物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⁾。

【効能・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

【用法・用量】

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。

30mg錠の場合：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。

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。

3歳以上 6歳未満 20~30mg

6歳以上 10歳未満 30~45mg

| 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 | | |

(参考)²⁾

³H-エプラジノン塩酸塩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。この間、尿中には約14%、糞中には36%、胆汁中には23%が排泄された。

また、非標識エプ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。

【臨床成績】

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79.4% (85例/107例)であった。また、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50.6% (41例/81例)であった³⁾。

【薬効薬理】

1. 去痰作用

(1)酸性ムコ多糖類線維・DNA高含有線維溶解作用⁴⁾

慢性呼吸器疾患患者から採取した喀痰にエプ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*)。

(2)喀痰粘稠度低下作用⁵⁻⁸⁾

慢性呼吸器疾患患者から採取した喀痰に *in vitro* でエプ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。

(3)気道内分泌液増加作用⁹⁾

マウスを用いて気道分泌液に対するエプ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。

2. 鎮咳作用¹⁰⁻¹²⁾

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。

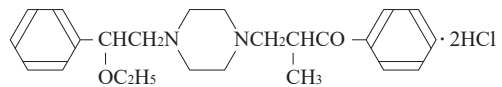
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エプラジノン塩酸塩 (Eprazinone Hydrochloride)

(JAN)

化学名：1-(2-Phenyl-2-ethoxy)ethyl-4-(2-benzoyl)propylpiperazine dihydrochloride

構造式：



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。

融点：約197℃ (分解)

【包装】

- * 5 mg錠：500錠 (PTP)
- 20mg錠：500錠 (PTP)、1000錠 (PTP、バラ)
- 30mg錠：500錠 (PTP)、1000錠 (PTP)

【主要文献】

- 1) 高梨 茂, 他：薬学雑誌, 95(8)：1002(1975)
- 2) 社内資料：日野原好和, 他：レスブレンの吸収・分布・代謝・排泄(1974)
- 3) 岡安大仁, 他：臨牀と研究, 57(7)：2323(1980)
- 4) 長岡 滋, 他：現代の診療, 16(11)：79(1974)
- 5) Bürgi, H.: Personal communication(1969)
- 6) 志摩 清, 他：新薬と臨牀, 21(9)：1667(1972)
- 7) 宮川智秀, 他：臨牀と研究, 50(10)：3065(1973)
- 8) 山木戸道郎, 他：咳と痰：69(1982)羊土社
- 9) 社内資料：小島喜久男：気道内分泌液増加作用(1974)
- 10) 高山聰明, 他：応用薬理, 2(3)：314(1968)
- 11) Vacher, J. et al.: Arch. Int. Pharmacodyn., 165(1)：1(1967)
- 12) 社内資料：菅野 茂, 他：鎮咳作用(1974)

**【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

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>

** 製造販売元



太陽ファルマ株式会社
東京都千代田区丸の内 1-6-5

® 登録商標
TYBWA02
RES 010.02