

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

鎮咳・気道粘液溶解剤
エプラジノン塩酸塩錠

レスプレ[®]ン錠 5mg
レスプレ[®]ン錠 20mg
レスプレ[®]ン錠 30mg
RESPLEN[®] Tablets

剤形	白色フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1 錠中：エプラジノン塩酸塩 レスプレ [®] ン錠 5mg …………… 5mg 含有 レスプレ [®] ン錠 20mg……………20mg 含有 レスプレ [®] ン錠 30mg……………30mg 含有
一般名	和名：エプラジノン塩酸塩（JAN） 洋名：Eprazinone Hydrochloride（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：錠 5mg：2001 年 6 月 8 日(販売名変更による) ：錠 20mg：2001 年 6 月 8 日(販売名変更による) ：錠 30mg：1978 年 8 月 1 日 薬価基準収載年月日：錠 5mg：2002 年 7 月 5 日(販売名変更による) ：錠 20mg：2002 年 7 月 5 日(販売名変更による) ：錠 30mg：1981 年 8 月 31 日 販売開始年月日：錠 5mg：1974 年 2 月 1 日 ：錠 20mg：1974 年 2 月 1 日 ：錠 30mg：1981 年 9 月 1 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	太陽ファルマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問合せ窓口	太陽ファルマ株式会社 お客様相談室 TEL：0120-533-030 医療関係者向けホームページ https://www.taiyo-pharma.co.jp

本 IF は 2025 年 10 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。
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 ー日本病院薬剤師会ー

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 P D F 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、P M D A）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に審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、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・表現には薬機法の広告規則や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、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 を活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。

(2020 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	5. 混入する可能性のある夾雑物	5
1. 開発の経緯	1	6. 製剤の各種条件下における安定性	5
2. 製品の治療学的特性	1	7. 調製法及び溶解後の安定性	5
3. 製品の製剤学的特性	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	9. 溶出性	5
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	10. 容器・包装	5
(1) 承認条件	1	(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	5
(2) 流通・使用上の制限事項	1	(2) 包装	5
6. RMPの概要	1	(3) 予備容量	6
II. 名称に関する項目	2	(4) 容器の材質	6
1. 販売名	2	11. 別途提供される資材類	6
(1) 和名	2	12. その他	6
(2) 洋名	2	V. 治療に関する項目	7
(3) 名称の由来	2	1. 効能又は効果	7
2. 一般名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	7
(1) 和名（命名法）	2	3. 用法及び用量	7
(2) 洋名（命名法）	2	(1) 用法及び用量の解説	7
(3) ステム（stem）	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	7
3. 構造式又は示性式	2	4. 用法及び用量に関連する注意	7
4. 分子式及び分子量	2	5. 臨床成績	7
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(1) 臨床データパッケージ	7
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(2) 臨床薬理試験	7
III. 有効成分に関する項目	3	(3) 用量反応探索試験	8
1. 物理化学的性質	3	(4) 検証的試験	8
(1) 外観・性状	3	(5) 患者・病態別試験	8
(2) 溶解性	3	(6) 治療的使用	8
(3) 吸湿性	3	(7) その他	8
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	3	VI. 薬効薬理に関する項目	9
(5) 酸塩基解離定数	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	9
(6) 分配係数	3	2. 薬理作用	9
(7) その他の主な示性値	3	(1) 作用部位・作用機序	9
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	9
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	(3) 作用発現時間・持続時間	9
IV. 製剤に関する項目	4	VII. 薬物動態に関する項目	10
1. 剤形	4	1. 血中濃度の推移	10
(1) 剤形の区別	4	(1) 治療上有効な血中濃度	10
(2) 製剤の外観及び性状	4	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	10
(3) 識別コード	4	(3) 中毒域	10
(4) 製剤の物性	4	(4) 食事・併用薬の影響	10
(5) その他	4	2. 薬物速度論的パラメータ	10
2. 製剤の組成	4	(1) 解析方法	10
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	4	(2) 吸収速度定数	10
(2) 電解質等の濃度	5	(3) 消失速度定数	10
(3) 熱量	5	(4) クリアランス	10
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	(5) 分布容積	10
4. 力価	5		

(6) その他	10	(1) 臨床使用に基づく情報	16
3. 母集団 (ポピュレーション) 解析	11	(2) 非臨床試験に基づく情報	16
(1) 解析方法	11	IX. 非臨床試験に関する項目	17
(2) パラメータ変動要因	11	1. 薬理試験	17
4. 吸収	11	(1) 薬効薬理試験	17
5. 分布	11	(2) 安全性薬理試験	17
(1) 血液－脳関門通過性	11	(3) その他の薬理試験	17
(2) 血液－胎盤関門通過性	11	2. 毒性試験	17
(3) 乳汁への移行性	11	(1) 単回投与毒性試験	17
(4) 髄液への移行性	11	(2) 反復投与毒性試験	17
(5) その他の組織への移行性	11	(3) 遺伝毒性試験	17
(6) 血漿蛋白結合率	11	(4) がん原性試験	17
6. 代謝	12	(5) 生殖発生毒性試験	17
(1) 代謝部位及び代謝経路	12	(6) 局所刺激性試験	17
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP等) の分子種、寄与率	12	(7) その他の特殊毒性	17
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	12	X. 管理的事項に関する項目	18
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	12	1. 規制区分	18
7. 排泄	12	2. 有効期間	18
8. トランスポーターに関する情報	13	3. 包装状態での貯法	18
9. 透析等による除去率	13	4. 取扱い上の注意	18
10. 特定の背景を有する患者	13	5. 患者向け資材	18
11. その他	13	6. 同一成分・同効薬	18
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目	14	7. 国際誕生年月日	18
1. 警告内容とその理由	14	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	18
2. 禁忌内容とその理由	14	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	18
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	14	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	18
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14	11. 再審査期間	18
5. 重要な基本的注意とその理由	14	12. 投薬期間制限に関する情報	18
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14	13. 各種コード	19
(1) 合併症・既往歴等のある患者	14	14. 保険給付上の注意	19
(2) 腎機能障害患者	14	XI. 文献	20
(3) 肝機能障害患者	14	1. 引用文献	20
(4) 生殖能を有する者	14	2. その他の参考文献	20
(5) 妊婦	14	XII. 参考資料	21
(6) 授乳婦	14	1. 主な外国での発売状況	21
(7) 小児等	14	2. 海外における臨床支援情報	21
(8) 高齢者	15	XIII. 備考	22
7. 相互作用	15	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	22
(1) 併用禁忌とその理由	15	(1) 粉碎	22
(2) 併用注意とその理由	15	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	22
8. 副作用	15	2. その他の関連資料	22
(1) 重大な副作用と初期症状	15		
(2) その他の副作用	15		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	16		
10. 過量投与	16		
11. 適用上の注意	16		
12. その他の注意	16		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レスプレンの成分は Piperazine 誘導体のエブラジノン塩酸塩で、フランス Centre Européen de Recherches Mauvernay 社において開発された。

本邦においては、1973 年 10 月 11 日にレスプレ錠（5mg、20mg）、1978 年 8 月 1 日にレスプレ錠 30mg が承認された。2001 年 6 月 8 日にはレスプレ錠（5mg、20mg）がレスプレ錠 5mg、レスプレ錠 20mg に販売名が変更された。

2018 年 7 月、太陽ファルマ株式会社は中外製薬株式会社から製造販売承認を承継した。

2. 製品の治療学的特性

1. レスプレンは鎮咳作用と去痰作用の両作用を合わせ持つ薬剤である。その鎮咳作用は中枢性・非麻薬性であり、また、去痰作用は気道粘液溶解を主としていることが基礎試験で報告されている。

「VI-2. 薬理作用」の項参照

2. 副作用は 4,155 例中、114 例（2.74%）120 件に認められた。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）

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	該当しない	—
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

レスプレン[®]錠 5mg
レスプレン[®]錠 20mg
レスプレン[®]錠 30mg

(2) 洋名

RESPLEN[®] Tablets 5mg
RESPLEN[®] Tablets 20mg
RESPLEN[®] Tablets 30mg

(3) 名称の由来

Respiration (呼吸) + Lenitive (鎮静、緩和) による。

2．一般名

(1) 和名 (命名法)

エプラジノン塩酸塩 (JAN)

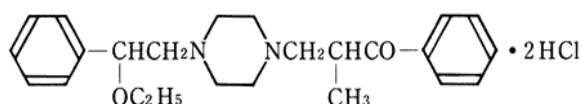
(2) 洋名 (命名法)

Eprazinone Hydrochloride (JAN)

(3) ステム (s t e m)

不明

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：C₂₄H₃₂N₂O₂・2HCl

分子量：453.45

5．化学名 (命名法) 又は本質

1-(2-Phenyl-2-ethoxy)ethyl-4-(2-benzoyl)propylpiperazine dihydrochloride (IUPAC)

6．慣用名、別名、略号、記号番号

治験番号：CG-B6K (中外製薬株式会社)

<参考>

治験番号：746CERM (Centre Européen de Recherches Mauvernay 社)

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。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 197℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

0.1mol/L 塩酸溶液（1→50000）につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 248～252nm に吸収の極大を示す。

（日本薬局方外医薬品規格「エプラジノン塩酸塩確認試験」による）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

高温（50℃、90 日間）あるいは直射日光下（1 日平均 5 時間曝露、30 日間）保存、また室温 2 年間保存でも経時変化は認められなかった。加湿条件下（90 日間）では 40℃－70%RH で経時変化は認められなかった。40℃－90%RH では含量の低下が約 5%認められた。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

日本薬局方外医薬品規格「エプラジノン塩酸塩確認試験」による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

販売名	レスプレン錠 5mg	レスプレン錠 20mg	レスプレン錠 30mg
色・剤形	白色フィルムコーティング錠		
外形	表 	表 	表 
	裏 	裏 	裏 
	側面 	側面 	側面 
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

(2) 製剤の外観及び性状

「IV. 1. 剤形」の項参照

(3) 識別コード

販売名	レスプレン錠 5mg	レスプレン錠 20mg	レスプレン錠 30mg
識別コード	C-22B 5	C-22B 20	C-22B 30

(4) 製剤の物性

崩壊性：補助盤を使用して試験を行うとき、適合する。

(5) その他

該当しない

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	レスプレン錠 5mg	レスプレン錠 20mg	レスプレン錠 30mg
有効成分 (1錠中)	エプラジノン塩酸塩 5mg	エプラジノン塩酸塩 20mg	エプラジノン塩酸塩 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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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

40℃・75%RH・3 カ月までの相対比較試験（試験項目：性状、確認試験、純度試験、崩壊試験、定量）から、本製剤（PTP 包装）と旧製剤（ヒートシール包装）の安定性は同等であることが確認された。

〈ヒートシール包装〉

5 mg 錠：本品の最終製品を室温保存し、5 年まで調べたところ、性状、エプラジノン塩酸塩の含量、崩壊試験ともに異常を認めなかった。

20mg 錠：本品の最終製品を室温保存し、5 年まで調べたところ、性状、エプラジノン塩酸塩の含量、崩壊試験ともに異常を認めなかった。

30mg 錠：本品の最終製品を室温保存し、5 年まで調べたところ、性状、エプラジノン塩酸塩の含量、崩壊試験ともに異常を認めなかった。

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（フィルムコーティング錠のため）

9. 溶出性

該当資料なし

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

該当しない

(2) 包装

〈レスプレレン錠 5mg〉	(PTP：乾燥剤入り)	500 錠 (10 錠×50)
〈レスプレレン錠 20mg〉	(PTP：乾燥剤入り)	500 錠 (10 錠×50)
		1000 錠 (10 錠×100)
〈レスプレレン錠 30mg〉	(PTP：乾燥剤入り)	500 錠 (10 錠×50)
		1000 錠 (10 錠×100)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

〈PTP 包装〉

PTP：ポリプロピレン、アルミニウム

袋：ポリエチレン、アルミニウム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

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

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。

(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

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		

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

該当資料なし

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

該当しない

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

該当しない

(7) その他

国内で実施された臨床試験において、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¹⁾。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

特になし

2. 薬理作用

(1) 作用部位・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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

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²⁾

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*)。

②喀痰粘稠度低下作用^{3)・6)}

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。

③気道内分泌液増加作用⁷⁾

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。

2) 鎮咳作用^{8)・10)}

モルモット、ネコ、イヌ等を用いた電氣的刺激、機械的刺激、化学的刺激実験においてリン酸コデインに匹敵する鎮咳作用を示した。

(3) 作用発現時間・持続時間

1) 作用発現時間

臨床効果発現までの期間として、有効例では、投薬後 2～3 日目から咳嗽の減少あるいは消失する例が多くみられる。中には、2～3 日目より減少しはじめ 5 日目に消失した例、又は 7 日目に軽快した症例も見受けられることから、少なくとも 5 日間から 1 週間位は投与すべきであるとする報告もあった^{11),12)}。なお、咳嗽発作時、本剤の頓用で高率な効果も認められており^{12)・14)}、作用発現時間はおおむね 30 分以内が最も多く、1 時間以内を含め、症状の消失が過半数に見られた¹⁴⁾。

2) 作用持続時間

小児気管支喘息に 1 回頓用させた際、発作の症状が少なくとも 24 時間ないしそれ以上消失していた症例が過半数を占め、次いで、2～6 時間消失していた症例の報告がある¹⁴⁾。

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

〈参考：ラット〉¹⁵⁾

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。

(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

該当しない

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

5. 分布

（1）血液－脳関門通過性

該当資料なし

（2）血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

（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

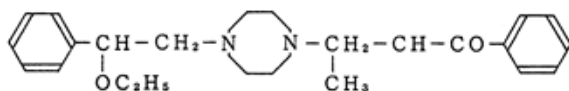
（6）血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路¹⁶⁾

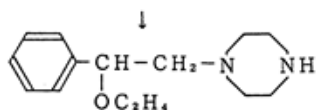
〔推 定〕



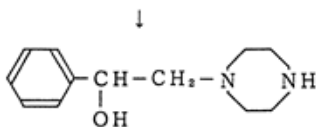
1-(2-phenyl-2-ethoxy)ethyl-4-(2-benzoyl)

propylpiperazine dihydrochloride

(eprazinone)



1-(2-ethoxy-2-phenylethyl)piperazine



1-(2-hydroxy-2-phenylethyl)piperazine

(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

健康成人男子 5 人（平均 29 歳、57kg）にエプラジノン塩酸塩 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。2 時間ごとの回収率には、有意のピークが認められず同程度の排泄が続いた¹⁷⁾。

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	

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

該当しない

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

「Ⅴ. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

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

設定されていない

（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まわ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

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。

（7）小児等

設定されていない

(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

設定されていない

(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

設定されていない

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

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

種類\頻度	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	

【項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧】

対象 \ 時期	承認時までの調査		承認時以降の調査 (1973 年 10 月 12 日～ 1977 年 3 月 31 日)	
調査施設数	17		279	
調査症例数	605		3,550	
副作用発現症例数	52		62	
副作用発現件数	52		68	
副作用発現症例率 (%)	8.60		1.75	
副作用の種類	副作用の発現件数 (%)			
消化器	44	(7.27)	64	(1.80)
胃腸障害	0		6	(0.17)
食欲不振・悪心	25	(4.13)	30	(0.85)
嘔気・嘔吐	6	(0.99)	9	(0.25)
胃部不快感	2	(0.33)	9	(0.25)
胃のもたれ	0		1	(0.03)
上腹部痛	2	(0.33)	4	(0.11)

対象	時期	承認時以降の調査 (1973 年 10 月 12 日～ 1977 年 3 月 31 日)			
		承認時までの調査			
下痢 (軟便を含む)		9	(1.49)	2	(0.06)
口渇		0		1	(0.03)
舌の異常感		0		2	(0.06)
その他		8	(1.32)	4	(0.11)
頭痛		3	(0.50)	3	(0.08)
頭のふらつき		0		1	(0.03)
心悸亢進		1	(0.17)	0	
蛋白尿		2	(0.33)	0	
皮膚そう痒感		2	(0.33)	0	

レスプレレン錠 5mg、同錠 20mg、同顆粒 (販売中止) の合算

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

11. 適用上の注意

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。

(解説)

PTP 包装の誤飲事故防止のため、「PTP 誤飲対策について」(平成 8 年 3 月 27 日 日薬連発第 240 号) に則り設定した。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(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

レスブレンは、下位脳幹部に対してある程度の選択的な抑制作用を有するが、一般的な中枢作用は極めて弱く（マウス、イヌ）、各種平滑筋摘出臓器に対する単独作用もほとんど示さなかった（モルモット、ウサギ、ラット）。一方、生体位標本では一過性血圧下降と、それに対応する呼吸興奮、心拍数増加、心電図変化、末梢血管拡張、腸管（イヌ、ウサギ）及び子宮運動（ウサギ）の抑制などが認められたが、総じてそれらの作用は軽度で持続時間が短かった。さらに、腸管内容輸送抑制（臨床上の便秘作用をよく表現するといわれる）が、リン酸コデインに比べて弱かった¹⁸⁾（マウス）。

(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

経口投与による LD₅₀ 値はマウス雄性 486mg/kg、雌性 461mg/kg であり、ラット雄性 825mg/kg、雌性 763mg/kg であった¹⁹⁾。

(2) 反復投与毒性試験

ラットに 14～412mg/kg を 90 日間連続経口投与した結果、412mg/kg 投与群で短期間の間に多くの死亡例がみられたが、その他の群では肝、腎、脾のうっ血、消化管の軽度炎症がみられたほかは体重増加、血液所見、生化学的検査ともに異常はみられなかった。

ラットに 5～138mg/kg を 180 日間連続経口投与した結果、若干の体重増加抑制傾向がみられたが、その他特異な症状、所見はみられなかった²⁰⁾。

(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

妊娠ラットに 15mg/kg と 240mg/kg、妊娠マウスに 15mg/kg と 150mg/kg を 6 日間連続投与した結果、妊娠マウスの 150mg/kg 投与群でわずかに化骨遅延がみられた。ウサギに 25mg/kg を交配前 8～10 日から全妊娠期間を通じて投与した結果、障害を与えないことが認められた²¹⁾。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(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

該当しない

2. 有効期間

有効期間：5年（包装に表示の使用期限内に使用すること）

3. 包装状態での貯法

貯法：室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

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：なし

同 効 薬：チペピジンヒベンズ酸塩、デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物、ジメモルファンリン酸塩、ペントキシベリンクエン酸塩、クロペラスチン、クロフェダノール塩酸塩等

7. 国際誕生年月日

1969年10月

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

販売名	承認年月日	承認番号
レスプレンド錠 5mg*	2001年6月8日（販売名変更による）	21300AMZ00456
レスプレンド錠 20mg*	2001年6月8日（販売名変更による）	21300AMZ00457
レスプレンド錠 30mg	1978年8月1日	15300AMZ00856

*旧販売名「レスプレンド錠（5mg、20mg）」：1973年10月11日（14800AMZ00709）

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	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
レスプレン錠 5mg	103928302	2249001F1030	610463218
レスプレン錠 20mg	103929002	2249001F2079	610463219
レスプレン錠 30mg	103931302	2249001F3032	612220347

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 岡安大仁 他：臨牀と研究. 1980 ; 57(7) : 2323-2331
- 2) 長岡 滋 他：現代の診療. 1974 ; 16(11) : 79-90
- 3) 社内資料：Bürgi, H. : 粘液溶解性の検討. 1969
- 4) 志摩 清 他：新薬と臨牀. 1972 ; 21(9) : 1667-1668
- 5) 宮川智秀 他：臨牀と研究. 1973 ; 50(10) : 3065-3067
- 6) 山木戸道郎 他：咳と痰：基礎と臨床. 1982 : 69
- 7) 社内資料：小島喜久男：気道内分泌液作用. 1974
- 8) 高山聰明 他：応用薬理. 1968 ; 2(3) : 314-322
- 9) Vacher, J. et al. : Arch. Int. Pharmacodyn.. 1967 ; 165(1) : 1-13
- 10) 社内資料：菅野 茂 他：鎮咳作用. 1974
- 11) 石田尚之 他：新薬と臨牀. 1972 ; 21(2) : 269-272
- 12) 原 一夫 他：診療と新薬. 1971 ; 8(3) : 441-445
- 13) 清水辰典 他：診療と新薬. 1970 ; 7(9) : 1681-1683
- 14) 中島春美：小児科臨床. 1973 ; 26(12) : 1638-1649
- 15) 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
- 16) 高梨 茂 他：薬学雑誌. 1975 ; 95(8) : 897-900
- 17) 高梨 茂 他：薬学雑誌. 1975 ; 95(8) : 1002-1009
- 18) 社内資料：菅野 茂 他：一般薬理作用. 1974
- 19) 社内資料：伊藤隆太：急性毒性試験. 1972
- 20) 社内資料：伊藤隆太：亜急性及び慢性毒性試験. 1974
- 21) 社内資料：塩田尚三 他：胎仔及び出生仔発育におよぼす影響. 1974

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

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

該当しない

