

鎮咳剤〈非麻薬〉

アストミン[®]シロップ0.25%

ジメモルファンリン酸塩シロップ

Astomin[®] Syrup 0.25%

日本標準商品分類番号

872229

承認番号	21800AMX10559
薬価収載	2006年12月
販売開始	1976年8月
国際誕生	1974年5月

貯法：遮光、気密容器、室温保存

使用期限：ケース等に表示

【組成・性状】

1.組成

有効成分（1mL中）	添加物
日局 ジメモルファンリン酸塩 2.5mg	精製白糖、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、プロピレングリコール、エタノール、クエン酸水和物、クエン酸ナトリウム水和物、黄色5号、香料

2.製剤の性状

剤形	色・形状	におい	味	pH	比重 (d_{20}^{20})
シロップ 剤	だいたい色澄明 の粘稠液	芳香を 有する	甘味を 有する	3.0~4.5	約1.19

【効能・効果】

下記疾患に伴う鎮咳

上気道炎、急性気管支炎、肺炎

【用法・用量】

通常下記1日量を3回に分けて経口投与する。

2才未満	3.0~4.5mL (ジメモルファンリン酸塩として7.5~11.25mg)
2~3才	5.0~8.0mL (ジメモルファンリン酸塩として12.5~20.0mg)
4~6才	8.0~11.0mL (ジメモルファンリン酸塩として20.0~27.5mg)
7~14才	12.0~14.0mL (ジメモルファンリン酸塩として30.0~35.0mg)

但し年齢症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1.慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

(1)糖尿病又はその疑いのある患者〔耐糖能に軽度の変化を来すことがある。〕

(2)薬物過敏症の患者

2.副作用

承認時及び承認後の全調査症例2,328例中、本剤との関連が疑われる副作用発現症例数は43例（1.8%）であった。そのうち主なものは、下痢、食欲不振等であった。

	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注)}			発疹等
精神神経系	めまい、眠気、頭痛、頭重	脱力感、倦怠感	

	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器	口渇、食欲不振、悪心、嘔吐、下痢等		
循環器		頰脈、動悸、顔面潮紅	

注)このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

3.高齢者への投与

高齢者では減量するなど注意すること。〔一般に高齢者では生理機能が低下している。〕

4.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。〕

5.適用上の注意

調製時：

(1)プロチンコデインシロップとの配合を避ける。〔配合すると沈殿を析出する。〕

(2)エリスロマイシンのドライシロップ又はジョサマイシンシロップと配合すると苦くなるが、抗生物質の力価低下などの本質的な変化は認められない。

【薬物動態】

1.血中濃度¹⁾健康成人男性にジメモルファンリン酸塩90mgを経口投与したとき、速やかに吸収されて1~2時間で血中濃度は最高に達し、その濃度は0.007~0.008 μ g/mLであった。

(注)本剤の承認された1日用量は、14才以下の小児に対して最大14.0mL（ジメモルファンリン酸塩として35.0mg）である。

2.代謝、排泄²⁾

健康成人男性に12時間絶食させた後、ジメモルファンリン酸塩30mgを経口投与した場合、尿中排泄率は、24時間後に約60%であった。尿中に検出同定し得た代謝物は3種でいずれも酸化的脱アルキル化反応による生成物で、未変化体は2%以下検出されるにすぎなかった。

なお、いずれの代謝物もほとんど鎮咳作用を有しないものであった。

(注)本剤の承認された1日用量は、14才以下の小児に対して最大14.0mL（ジメモルファンリン酸塩として35.0mg）である。

【臨床成績】

乳児、幼児、小児の急性呼吸器疾患に伴う咳嗽に対する一般臨床試験では、有効率81.0%（260/321）の成績であった。また、Cough Recorderにより咳の頻度を薬物投与前後に記録して、その解析結果にもとづく客観的効果判定基準を設定した上で、本剤の頓用効果に関する比較対照試験により、有用性が認められた³⁾。

【薬効薬理】

1.鎮咳作用⁴⁾⁵⁾

ジメモルファンリン酸塩は、延髄の咳中枢に直接作用して鎮咳作用をあらわし、イヌ、ネコ及びモルモットを用いた薬理実験では、コデインリン酸塩水和物やデキストロメトルファンよりも優れた鎮咳効果を発揮する。

2.非麻薬性⁶⁾

ジメモルファンリン酸塩をサルに1カ月投与して検討した薬物依存性試験の結果、身体依存性及び精神依存性は認められず、非麻薬性であることが証明されている。

3.腸管輸送能の抑制作用⁴⁾

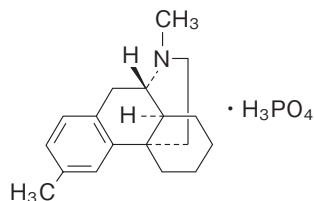
ジメモルファンリン酸塩はマウスを用いた動物実験で、コデインリン酸塩水和物投与時にみられるような腸管輸送能の抑制作用（便秘作用）を示さない。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ジメモルファンリン酸塩（Dimemorfan Phosphate）

化学名：(9*S*,13*S*,14*S*)-3,17-Dimethylmorphinan monophosphate

構造式：



分子式：C₁₈H₂₅N · H₃PO₄

分子量：353.39

融点：約265℃（分解）

性状：ジメモルファンリン酸塩は白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。酢酸（100）に溶けやすく、水又はメタノールにやや溶けにくく、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。

【包装】

500mL

【主要文献及び文献請求先】

1.主要文献

- 1) 関 隆：臨床薬理 **3**(4)：302, 1972 [AS-011]
- 2) 社内報告書（健康成人・薬物動態）
(D199701744-02.00, 1972)
- 3) 鈴木 栄 他：医学のあゆみ **101**(7)：564, 1977 [AS-017]
- 4) 井田 昶 他：応用薬理 **6**(6)：1207, 1972 [AS-008]
- 5) Kasé, Y. et al.: Arzneimittel-Forschung **26**(3)：361, 1976 [AS-009]
- 6) 柳田知司 他：実中研・前臨床研究報 **1**(1)：35, 1975 [AS-010]

**2.文献請求先・製品情報お問い合わせ先

主要文献に記載の社内報告書につきましても下記にご請求下さい。

株式会社オーファンパシフィック DIセンター

〒105-0023 東京都港区芝浦1-1-1

TEL 0120-889-009

受付時間 9：00～17：30（土・日・祝日・年末年始を除く）

製造販売
**株式会社 オーファンパシフィック
* 東京都港区芝浦1-1-1