

中枢神経賦活剤

ルシドロール[®]錠100mg

LUCIDRIL[®]

〈メクロフェノキサート塩酸塩製剤〉

| | |
|-------|---------------|
| 承認番号 | 21500AMZ00515 |
| 薬価収載 | 2003年11月 |
| 販売開始 | 2003年12月 |
| 再評価結果 | 1999年6月 |
| 効能追加 | 1977年9月 |

貯法:
室温保存、開封後は吸湿に注意すること。
使用期限:
包装箱に表示。
使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。

【組成・性状】

1. 組成

| | |
|------|---|
| 販売名 | ルシドロール錠100mg |
| 有効成分 | 1錠中、日局メクロフェノキサート塩酸塩100mgを含有する。 |
| 添加物 | 結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、タルク、硬化油、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、エチルセルロース、マクロゴール6000、プロピレングリコール、ヒマシ油、ソルビタン脂肪酸エステル、酸化チタン |

2. 製剤の性状

| 販売名 | 剤形 | 色 | 外形・大きさ等 | 識別コード |
|--------------|-------------|----|---|-------|
| ルシドロール錠100mg | フィルムコーティング錠 | 白色 | 直径：約 8.1mm 厚さ：約 4.0mm 質量：約188.0mg | KW827 |

【効能・効果】

頭部外傷後遺症におけるめまい

【用法・用量】

通常、成人にはメクロフェノキサート塩酸塩として1回100～300mgを1日3回経口投与する。
症状により適宜増減してよい。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤を4週間投与しても効果が認められない場合は、本剤の投与を中止すること。

【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)過度の興奮性のある患者
〔副作用として興奮が報告されている。〕
- (2)痙れんのある患者
〔副作用として痙れん発作の増強が報告されている。〕

2. 副作用

10,470例中274例(2.6%)に副作用がみられ、主なものは不眠(0.4%)、悪心(0.4%)、食欲不振(0.3%)であった。(再評価結果)

| | 0.1～5%未満 | 0.1%未満 |
|--------------------|----------------------|-------------|
| 過敏症 ^(注) | | 発疹 |
| 精神神経系 | 不眠、頭痛、焦躁感 | 興奮、痙れん発作の増強 |
| 消化器 | 悪心、食欲不振、胃痛 | |
| 肝臓 | AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇 | Al-Pの上昇 |

注)このような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

3. 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、更には穿孔を起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. 血漿中濃度⁽¹⁾

(健康成人、300mg14日間投与)

n = 6

| 測定対象(活性代謝物) | T _{max} (h) | C _{max} (μg/mL) | T _{1/2β} (h) |
|--------------|----------------------|--------------------------|-----------------------|
| パラクロルフェノキシ酢酸 | 2.1 | 23.2 | 8.4 |

2. 主な代謝産物及び代謝経路⁽²⁾⁽³⁾(参考)

メクロフェノキサートは体内で加水分解され、パラクロルフェノキシ酢酸(活性あり)及びジメチルアミノエタノール(活性あり)になる。(マウス)

3. 排泄経路及び排泄率⁽⁴⁾

排泄経路:主として尿中

排泄率:経口投与後24時間までに投与量の約85%がその代謝物であるパラクロルフェノキシ酢酸として尿中排泄される。(健康成人、300mg1回投与)

【臨床成績】

二重盲検比較試験(対照薬:プラセボ)を含む総計67例についての臨床成績は次のとおりである。⁽⁵⁾

| 対象疾患 | 有効率 | |
|----------------|-------------|-------------|
| | 有効以上 | やや有効以上 |
| 頭部外傷後遺症におけるめまい | 60% (40/67) | 72% (48/67) |

【薬効薬理】

1. 中枢神経賦活作用⁶⁾⁷⁾

無麻醉家兎を用いた実験で、脳幹網様体の単位放電の増加、脳幹網様体刺激による覚醒反応閾値の下降及び知覚求心路・錐体路系の促進が、また麻醉家兎を用いた実験で、脳波の覚醒波への移行が認められている。

2. 抗低酸素作用⁸⁾⁹⁾

ラットを用いた実験で、脳の低酸素状態に対する抵抗性を増加させることが脳波上認められており、またマウスを用いた実験で、低酸素ガス負荷による酸素欠乏及びシアン化カリウムによる組織低酸素状態における抗低酸素作用が認められている。

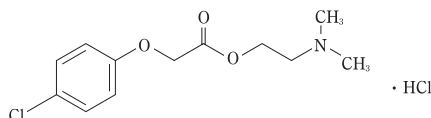
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：メクロフェノキサート塩酸塩
(Meclofenoxate Hydrochloride)

分子式：C₁₂H₁₆ClNO₃ · HCl

分子量：294.17

構造式：



化学名：2-(Dimethylaminoethyl) ethyl (4-chlorophenoxy) acetate monohydrochloride

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、わずかに特異なおいがあり、味は苦い。

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

1.0gを水20mLに溶かした液のpHは3.5～4.5である。

融点：139～143℃

*【包装】

PTP100錠(10錠×10)

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) 共和薬品工業株式会社 社内資料
- 2) 三田幸範, ほか：RADIOISOTOPES, 16：29, 1967
- 3) Miyazaki, H., et al.：Chem. Pharm. Bull., 19：1681, 1971
- 4) 共和薬品工業株式会社 社内資料
- 5) 福田 精, ほか：耳鼻咽喉科臨床, 60：943, 1967
- 6) 安原基弘, ほか：脳と神経, 26：717, 1974
- 7) 藤城保男, ほか：脳と神経, 16：353, 1964
- 8) Nickel, J., et al.：Arzneim.-Forsch., 13：881, 1963
- 9) 共和薬品工業株式会社 社内資料

**〈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下さい。

共和薬品工業株式会社 学術情報課

〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

** 製造販売元

 **共和薬品工業株式会社**
大阪市北区中之島3-2-4