

**2014年7月改訂(第4版)
*2007年10月改訂

日本標準商品分類番号
872259

使用期限 外箱、容器に使用期限を表示

承認番号 21600AMY00022000
薬価収載 2004年7月
販売開始 2004年10月

抗コリン性 気管支収縮抑制剤

**処方箋医薬品^{注)}

テルシガン® エロゾル 100 μ g Tersigan® Metered Aerosol 100 μ g

(オキシトロピウム臭化物製剤)

®=登録商標



**注) 注意-医師等の処方箋により使用すること

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- 緑内障の患者
[眼内圧を高め、症状を悪化させるおそれがある。]
- 前立腺肥大症の患者
[更に尿を出にくくすることがある。]
- スコポラミン系薬剤に対する過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

販売名	テルシガンエロゾル100 μ g
成分・分量	1g中オキシトロピウム臭化物 1.78mg (1回噴霧中0.1mg)
添加物	無水エタノール、無水クエン酸、1,1,1,2-テトラフルオロエタン
剤形	定量噴霧式エアゾール剤
内容物	無色～微黄色澄明の液
におい	特異なにおい

【効能・効果】

下記疾患の気道閉塞性障害に基づく呼吸困難など諸症状の緩解
気管支喘息、慢性気管支炎、肺気腫

【用法・用量】

通常1回1～2吸入(オキシトロピウム臭化物として0.1～0.2mg)を1日3回吸入投与する。
なお、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
高齢者など喀痰喀出困難を伴う患者
[喀痰喀出を困難にするおそれがある。]
- 重要な基本的注意
定められた用量を越えて投与する場合、副作用発現の可能性が増大するので、注意すること。
- 副作用
テルシガンエロゾルについて、調査症例9,393例(承認時620例、再審査終了時8,773例)中副作用が報告されたのは127例(1.35%)であった。主な副作用は口渇24件(0.26%)、嘔気19件(0.20%)、咳嗽14件(0.15%)、咽頭炎11件(0.12%)、苦味8件(0.09%)等であった。また、臨床検査値においては特に一定の傾向を示す変動は認められていない。以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満
精神神経系		頭痛、振戦、眩暈、めまい
消化器	嘔気	腹痛、便秘、嘔吐、舌炎
循環器		心悸亢進
皮膚 ^{注)}		発疹
口腔・呼吸器	口渇、咽頭炎、咳嗽	口腔不快感、苦味

	0.1～5%未満	0.1%未満
泌尿器		排尿困難
その他		倦怠感、目のかすみ、羞明、胸痛

注)発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4. 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ので低用量(例えば1回1吸入(0.1mg)を1日3回)から用いる等慎重に投与すること。

5. 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回ると判断される場合にのみ投与すること。

[妊娠中あるいは授乳中の投与に関する安全性は確立していない。]

6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

7. 適用上の注意

(使用法)

(1)本剤の効果を十分にあらわすためには正しい使い方をすることが大切である。初めてエロゾルを使用する場合には、鏡の前で試みるのが望ましい。

次の順序で使用する。

①キャップをはずす。

なお、初めて使用する場合及び前回使用から3日間(72時間)使用していない場合には、2回噴霧し、正しく噴霧されるか確かめる。ただし、このとき顔に向け噴霧しないこと。

②息をはき出す。

③容器を右図のように持ち、吸入口を歯で軽くくわえる。このとき、容器の底は上を向く。

④できるだけ深く息を吸い込みながら、容器の底を1回垂直に強く押す。数秒間息をとめ、その後、口からアダプターをはずしゆっくり息をはき出す。

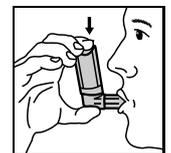
⑤2吸入する場合は②～④の手順を繰り返す。

⑥使用後はキャップをつける。

⑦吸入終了後はうがいをする。

本剤の効果を十分に発揮するため、痰がからんでいるようなときは、使用前にできるだけ出しておくこと。この装置は指でおさえ圧を加えることにより何回も使用でき、一定量が噴霧された後、自動的にもとの状態にもどるようになっている。なお、容器の底を上にして圧を加えないと薬剤が噴霧されないので、注意すること。容器1ポンベ(5mL)で84回以上吸入できるが、内容物が外から見えないので、時々容器を振って中に液があるか否かを確かめておく必要がある。

(2)本剤には散瞳作用があるので、眼に向けて噴霧しないこと。



【薬物動態】

1. 吸収・代謝・排泄

健康成人にオキシトロピウム臭化物1.25mgを吸入投与した場合、2.5時間で最高血中濃度0.8ng/mLに達する。血中濃度半減期は2.4時間であり、吸収率は約15%である。
また、主代謝産物は加水分解物であり、96時間までの尿中及び糞中への排泄率はそれぞれ11%、88%である。¹⁾
[参考：1)は外国人でのデータ]

2. 分布(参考)

吸入投与した場合の肺、食道及び胃内濃度は投与直後が最大であり、血中濃度は投与直後で肺の濃度の1/260程度、1時間後で1/290程度である。経口及び吸入投与によりそれぞれ乳汁及び胎児への移行が認められる。静脈内及び経口投与した場合、中枢神経系へはほとんど移行しない(ラット²⁻⁴⁾)。

【臨床成績】

テルシガンエロゾルについて、気管支喘息、慢性気管支炎、肺気腫を対象とした二重盲検法及び封筒法による比較試験の結果、本剤の有効性が認められた。⁵⁻⁷⁾

これらの二重盲検比較試験を含む国内延べ160施設、総計649例について臨床試験が実施された。承認された効能・効果において、効果判定のなされた542例での有効率(有効以上)は42.6%であった。⁵⁻¹⁸⁾

【薬効薬理】

1. 気管支収縮抑制作用

摘出標本(モルモット¹⁹⁾)及び生体位(イヌ²⁰⁾)において、アセチルコリン、ヒスタミンによる刺激に対してイプラトロピウム臭化物より強い気管支収縮抑制作用を示す。

2. 臨床薬理

- (1) COPD患者に投与した場合、イソプロテレノールより強い気管支収縮抑制作用を示し、その作用は8時間にわたり持続した。²¹⁾
- (2) COPD患者に投与した場合、肺機能、運動耐応能及び呼吸困難感が、プラセボ投与時と比較し有意に改善された。²²⁾
- (3) COPD患者に投与した場合、夜間及び早朝の肺機能の低下が10時間にわたり抑制された。²³⁾

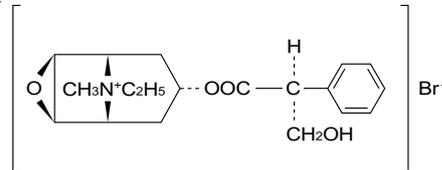
【有効成分に関する理化学的知見】

一般的名称：オキシトロピウム臭化物(JAN)

Oxitropium Bromide(JAN)

化学名：(-)-(1*R**,2*R**,4*S**,5*S**,7*S**,9*S**)-9-ethyl-9-methyl-7-[(*S*)-tropyloxy]-3-oxa-9-azoniatricyclo[3.3.1.0^{2,4}]nonane bromide

化学構造式：



分子式：C₁₉H₂₆BrNO₄

分子量：412.32

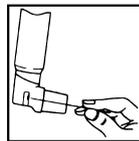
性状：

- ・白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。
- ・水に極めて溶けやすく、メタノールに溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、酢酸(100)に溶けにくく、無水酢酸又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。
- ・本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは4.5~7.0である。

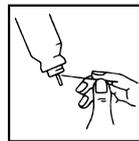
融点：約197℃(分解)

【取扱い上の注意】

- ・まれにゴミがつまり噴射しない場合があるので、その場合は、よく消毒した針で右図のごとく噴射孔やステム孔を掃除すること。また、アダプターの噴射孔にゴミがつまり噴射しない場合には、アダプターを水でよく洗い、乾燥してから用いること。
- ・使用後火中に投じないこと。
- ・地方自治体により定められたポンペの廃棄処理法にしたがうこと。



(噴射孔)



(ステム孔)

【包装】

テルシガンエロゾル100µg：1ポンペ 5mL(0.178% 9.5g)×5
1ポンペ 5mL(0.178% 9.5g)×10

【主要文献】

- 1) Wahl D et al : Arzneimittelforschung 35(I) : 266, 1985
- 2) 柴田 勉ほか：薬理と治療 16 : 4795, 1988
- 3) 大岩陽子ほか：薬理と治療 16 : 4785, 1988
- 4) Wahl D et al : Arzneimittelforschung 35(I) : 255, 1985
- 5) 滝島 任ほか：Therapeutic Research 9 : 443, 1988
- 6) 滝島 任ほか：医学のあゆみ 147 : 789, 1988
- 7) 長野 準ほか：薬理と治療 16 : 3981, 1988
- 8) 田中孝夫ほか：基礎と臨床 20 : 8246, 1986
- 9) 井上洋西ほか：Therapeutic Research 5 : 1175, 1986
- 10) 滝島 任ほか：新薬と臨床 36 : 1735, 1987
- 11) 長野 準ほか：臨床と研究 65 : 1599, 1988
- 12) 滝島 任ほか：臨床医薬 4 : 713, 1988
- 13) 濱田朝夫ほか：薬理と治療 16 : 3967, 1988
- 14) 末次 勸ほか：新薬と臨床 37 : 1630, 1988
- 15) 黒沢元博ほか：Therapeutic Research 9 : 1317, 1988
- 16) 野田康信ほか：薬理と治療 16 : 4547, 1988
- 17) 長野 準ほか：薬理と治療 16 : 1807, 1988
- 18) 山本健市ほか：臨床と研究 65 : 2345, 1988
- 19) Kohno S W et al : Jpn J Pharmacol 50 : 207, 1989
- 20) Bauer R : Arzneimittelforschung 35(I) : 435, 1985
- 21) Skorodin MS et al : Ann Allergy 56 : 229, 1986
- 22) Hay J et al : Thorax 43 : abstr 857, 1988
- 23) Kneubuhler HR et al : Schweiz med Wschr 110 : 812, 1980

*【文献請求先】

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社

DIセンター

〒141-6017 東京都品川区大崎2丁目1番1号

ThinkPark Tower

フリーダイヤル：0120-189-779

(受付時間) 9:00~18:00

(土・日・祝日・弊社休業日を除く)

製造販売元(輸入発売元)

* 日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社

東京都品川区大崎2丁目1番1号

06-27 ①②

0776

012421-A