

貯 法：気密容器で室温保存，遮光保存  
使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること




承認番号	22500AMX01297000
薬価収載	2013年12月
販売開始	2013年12月

持続性抗ヒスタミン剤  
\*日本薬局方 メキタジン錠  
メキタジン錠 3 mg 「日医工」  
Mequitazine

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤の成分，フェノチアジン系化合物及びその類似化合物に対し過敏症の既往歴のある患者
- \*\* 2. 閉塞隅角緑内障の患者 [抗コリン作用により眼圧が上昇し，症状を悪化させることがある。]
3. 前立腺肥大等下部尿路に閉塞性疾患のある患者 [抗コリン作用により排尿困難等を起こすことがある。]

【組成・性状】

販売名	メキタジン錠 3 mg 「日医工」	
剤形・色調	白色，素錠	
有効成分の名称	日局 メキタジン	
含量（1錠中）	3 mg	
添加物	D-マンニトール，トウモロコシデンブ，アルファー化デンブ，ヒドロキシプロピルセルロース，セルロース，ステアリン酸 Mg	
外形	表面	 質量：約115mg
	裏面	 直径：約7.0mm
	側面	 厚さ：約2.3mm
シート	PTP	
識別コード	O.S-MZ	

【効能・効果】

気管支喘息，アレルギー性鼻炎，じん麻疹，皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎，皮膚痒痒症）

【用法・用量】

[気管支喘息の場合]  
通常成人1回メキタジンとして6 mgを1日2回経口投与する。なお，年齢，症状に応じて適宜増減する。  
[アレルギー性鼻炎，じん麻疹，皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎，皮膚痒痒症）の場合]  
通常成人1回メキタジンとして3 mgを1日2回経口投与する。なお，年齢，症状に応じて適宜増減する。

【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) 腎障害のある患者 [長期投与例で臨床検査値異常としてBUN上昇がみられることがある。]

\*\* (2) 開放隅角緑内障の患者 [抗コリン作用により眼圧が上昇し，症状を悪化させることがある。]

(3) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

2. 重要な基本的注意

眠気を催すことがあるので，本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械操作には従事させないよう十分注意すること。

3. 相互作用

併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
中枢神経抑制剤（バルビツール酸誘導体，麻酔剤，麻薬性鎮痛剤，鎮静剤，精神安定剤等） フェノバルビタール等	眠気等があらわれることがあるので，減量するなど注意すること。	本剤の中枢神経抑制作用により，作用が増強されることがある。
抗コリン作用を有する薬剤（三環系抗うつ剤，MAO阻害剤等） イミプラミン塩酸塩，ブチルスコポラミン臭化物等	口渇，排尿困難等があらわれることがあるので，減量するなど注意すること。	本剤の抗コリン作用により，作用が増強されることがある。
メトキサレン	光線過敏症を起こすおそれがある。	これらの薬剤は光線感受性を高める作用を有する。
アルコール	眠気等があらわれることがあるので，アルコール含有清涼飲料水等の摂取に注意すること。	本剤の中枢神経抑制作用により，作用が増強されることがある。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用（頻度不明）

\*\* 1) ショック，アナフィラキシー

ショック，アナフィラキシーを起こすことがあるので，観察を十分に行い，血圧低下，呼吸困難，咽頭浮腫，蕁麻疹，嘔気等の症状があらわれた場合には投与を中止し，適切な処置を行うこと。

2) 肝機能障害，黄疸

AST (GOT)，ALT (GPT)，ALP等の上昇を伴う肝機能障害，黄疸があらわれることがある。また，劇症肝炎の報告がある。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。

3) 血小板減少

血小板減少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。

(2) その他の副作用

	頻度不明
過 敏 症 <sup>注1)</sup>	発疹，光線過敏症
肝 臓 <sup>注2)</sup>	AST (GOT) 上昇，ALT (GPT) 上昇，黄疸
血 液 <sup>注1)</sup>	血小板減少
精神神経系	眠気，倦怠感，ふらふら感，頭痛，めまい，興奮

	頻度不明
消化器	口渇、胃部不快感、下痢、便秘、食欲不振、嘔吐、胃痛、腹痛
循環器	胸部苦悶感、心悸亢進
泌尿器	排尿困難
その他	咽頭痛、浮腫、顔面潮紅、視調節障害、月経異常、味覚異常、口内しびれ感

注1) 発現した場合には投与を中止すること。

注2) 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し、適切な処置を行うこと。

#### 5. 高齢者への投与

高齢者では副作用があらわれやすいので、注意すること。臨床試験において高齢者に口渇等の副作用の発現率が高い傾向が認められている。

#### 6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- (2) 授乳婦に投与する場合には授乳を中止させること。[動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。]

#### 7. 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(使用経験が少ない)。

#### 8. 過量投与

##### (1) 徴候・症状

誤って過量服用したときに眠気、悪心、嘔吐、軽度の抗コリン作用性障害がみられる。

##### (2) 処置

通常、早期には催吐、胃洗浄を行う。必要に応じ補助呼吸又は人工呼吸、抗痙攣剤を投与する。

#### 9. 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。)

#### 10. その他の注意

動物実験(ラット)でメラニンに対する親和性が認められている。また、他のフェノチアジン系化合物の長期投与又は大量投与により角膜・水晶体の混濁、網膜・角膜の色素沈着が報告されているので注意すること。

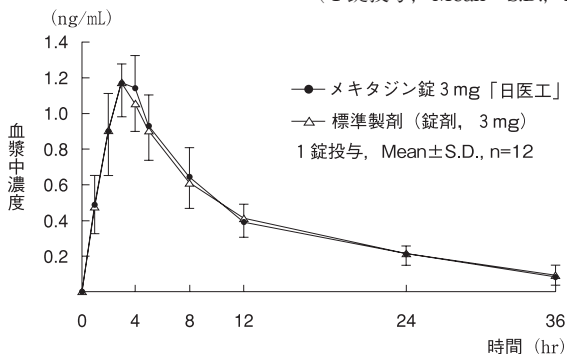
### 【薬物動態】

#### 1. 生物学的同等性試験

メキタジン錠3mg「日医工」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(メキタジンとして3mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中メキタジン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について分散分析法にて統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-36</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
メキタジン錠3mg 「日医工」	13.80±2.12	1.25±0.12	3.17±0.72	11.48±3.71
標準製剤 (錠剤, 3mg)	13.87±1.68	1.25±0.11	3.25±0.75	11.88±2.77

(1錠投与, Mean±S.D., n=12)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

#### \* 2. 溶出挙動

メキタジン錠3mg「日医工」は、日本薬局方医薬品各条に定められたメキタジン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>2)</sup>

### 【薬効薬理】

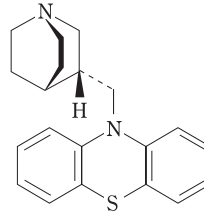
抗アレルギー薬である。ヒスタミンH<sub>1</sub>受容体拮抗作用を主体とし、ケミカルメディエーター(ロイコトリエン、トロンボキサン、PAF等)の産生・遊離抑制作用を現す。<sup>3)</sup>

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: メキタジン (Mequitazine)

化学名: 10-[(3RS)-1-Azabicyclo[2.2.2]oct-3-ylmethyl]-10H-phenothiazine

構造式:



及び鏡像異性体

分子式: C<sub>20</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>S

分子量: 322.47

性状: 白色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノール又は酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

メタノール溶液(1→50)は旋光性を示さない。

光によって徐々に着色する。

融点: 146~150°C

### 【取扱い上の注意】

#### 安定性試験

本品につき加速試験(40°C, 相対湿度75%, 6ヵ月)を行った結果、メキタジン錠3mg「日医工」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。<sup>4)</sup>

### 【包装】

メキタジン錠3mg「日医工」

100錠(10錠×10; PTP)

### 【主要文献】

- 1) 日医工株式会社 社内資料: 生物学的同等性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料: 溶出性試験
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書 C-5349, 廣川書店, 東京(2016)
- 4) 日医工株式会社 社内資料: 安定性試験

### 【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎(0120) 517-215

Fax (076) 442-8948