

医薬品インタビューフォーム

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

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 3mg 「NIG」
Mequitazine Tablets

剤形	素錠
製剤の規制区分	なし
規格・含量	1 錠中：メキタジン 3mg 含有
一般名	和名：メキタジン 洋名：Mequitazine
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：2007 年 7 月 17 日 薬価基準収載：2023 年 6 月 16 日 販売開始：1990 年 9 月 1 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工岐阜工場株式会社 発売元：日医工株式会社 販売：武田薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ https://www.nichiiko.co.jp/

本 IF は 2023 年 12 月改訂（第 1 版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

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 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

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PDF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、PMDA）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か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、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。

目 次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目	13
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ...	13
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 薬理作用.....	13
3. 製品の製剤学的特性.....	1	VII. 薬物動態に関する項目	18
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	1. 血中濃度の推移.....	18
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	2. 薬物速度論的パラメータ.....	19
6. RMP の概要.....	2	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	19
II. 名称に関する項目	3	4. 吸収.....	19
1. 販売名.....	3	5. 分布.....	19
2. 一般名.....	3	6. 代謝.....	20
3. 構造式又は示性式.....	3	7. 排泄.....	20
4. 分子式及び分子量.....	3	8. トランスポーターに関する情報.....	20
5. 化学名（命名法）又は本質.....	3	9. 透析等による除去率.....	20
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	10. 特定の背景を有する患者.....	20
III. 有効成分に関する項目	4	11. その他.....	20
1. 物理化学的性質.....	4	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	21
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	4	1. 警告内容とその理由.....	21
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	4	2. 禁忌内容とその理由.....	21
IV. 製剤に関する項目	5	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	21
1. 剤形.....	5	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	21
2. 製剤の組成.....	5	5. 重要な基本的注意とその理由.....	21
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	5	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	21
4. 力価.....	5	7. 相互作用.....	22
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	5	8. 副作用.....	23
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	6	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	24
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	7	10. 過量投与.....	24
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	7	11. 適用上の注意.....	24
9. 溶出性.....	7	12. その他の注意.....	24
10. 容器・包装.....	9	IX. 非臨床試験に関する項目	25
11. 別途提供される資材類.....	9	1. 薬理試験.....	25
12. その他.....	9	2. 毒性試験.....	25
V. 治療に関する項目	10	X. 管理的事項に関する項目	26
1. 効能又は効果.....	10	1. 規制区分.....	26
2. 効能又は効果に関連する注意.....	10	2. 有効期間.....	26
3. 用法及び用量.....	10	3. 包装状態での貯法.....	26
4. 用法及び用量に関連する注意.....	10	4. 取扱い上の注意点.....	26
5. 臨床成績.....	10	5. 患者向け資材.....	26

略 語 表

6.	同一成分・同効薬.....	26
7.	国際誕生年月日	26
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.....	26
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.....	26
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	26
11.	再審査期間	27
12.	投薬期間制限に関する情報.....	27
13.	各種コード	27
14.	保険給付上の注意	27
X I.	文献	28
1.	引用文献	28
2.	その他の参考文献.....	28
X II.	参考資料	29
1.	主な外国での発売状況.....	29
2.	海外における臨床支援情報	29
X III.	備考	29
1.	調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たつての参考情報.....	30
2.	その他の関連資料.....	31

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
Tmax	最高血中濃度到達時間
T _{1/2}	消失半減期

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、メキタジンを有効成分とする持続性抗ヒスタミン剤である。

「キタゼミン錠」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1990年3月8日に承認を取得、1990年9月1日に販売を開始した。（医薬発第481号（平成11年4月8日）に基づき承認申請）

1995年6月15日、「気管支喘息」の効能又は効果、用法及び用量の追加承認を得た。

再評価（品質再評価）の結果、2006年8月11日、薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの再評価結果を得た。

医療事故防止のため、2007年7月17日に販売名を「キタゼミン錠」から「メキタジン錠 3mg「タイヨー」」に変更の承認を得て、2007年12月21日に薬価基準収載された。

2023年6月1日、武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「タイヨー」から「NIG」に変更した。

2023年6月16日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、メキタジンを有効成分とする持続性抗ヒスタミン剤である。
- (2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、肝機能障害、黄疸、血小板減少が報告されている。（「Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

- (1) PTPシートは、ピッチコントロールを行い1錠ごとに成分名・含量・屋号を表示した。
- (2) PTPシートに、取扱い上の注意「しゃ光して保存」を表記した。

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	無	
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

メキタジン錠 3mg 「NIG」

(2) 洋名

Mequitazine Tablets

(3) 名称の由来

一般名より

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

メキタジン (JAN)

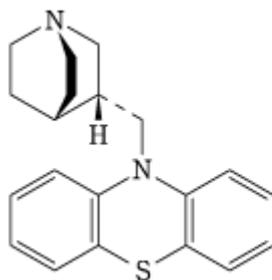
(2) 洋名 (命名法)

Mequitazine (JAN)

(3) ステム (stem)

不明

3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₀H₂₂N₂S

分子量：322.47

5. 化学名 (命名法) 又は本質

10- [(3*RS*) -1-Azabicyclo [2.2.2] oct-3-ylmethyl] -10*H*-phenothiazine (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。(無臭である。)

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点: 146~150℃

(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

メタノール溶液(1→50)は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に着色する。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

(1) 確認試験法

1) 紫外可視吸光度測定法

本品のエタノール溶液につき、吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに、同様の強度の吸収を認める。

2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

(2) 定量法

電位差滴定法

本品を酢酸に溶かし、過塩素酸で滴定する。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

素錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	メキタジン錠 3mg 「NIG」		
色・剤形	白色の片面 1/2 割線入り素錠		
外形			 直径：7.0mm 厚さ：2.5mm 質量：125mg
識別コード (PTP)	t 521 3mg		

(3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

(4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

(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	メキタジン錠 3mg 「NIG」
有効成分	1錠中：メキタジン 3mg
添加剤	軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

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¹⁾

(1) 加速試験

◇メキタジン錠 3mg「NIG」 加速試験 (40℃、75%RH) [最終包装形態]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <白色の片面 1/2 割線入り素錠>	LXYB	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 <45 分、70%以上>	LXYB	91.4~93.6	90.2~93.0	81.2~89.1
含量 (%) * n=3 <93.0~107.0%>	LXYB	98.0~101.2	99.0~99.8	95.4~97.0

※：表示量に対する含有率 (%)

(2) 無包装状態の安定性

◇メキタジン錠 3mg「NIG」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヶ月
性状 <白色の片面 1/2 割線入り素錠>	LXYB	白色の片面 1/2 割線入り素錠	白色の片面 1/2 割線入り素錠
溶出性 (%) <45 分、70%以上>	LXYB	91.4~93.6	90.2~93.0
残存率 (%)	LXYB	100	100.0
(参考値) 硬度 (kg)	LXYB	5.9	5.8

◇メキタジン錠 3mg「NIG」 無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヶ月
性状 <白色の片面 1/2 割線入り素錠>	LXYB	白色の片面 1/2 割線入り素錠	白色の片面 1/2 割線入り素錠
溶出性 (%) <45 分、70%以上>	LXYB	91.4~93.6	89.8~93.6
残存率 (%)	LXYB	100	100.3
(参考値) 硬度 (kg)	LXYB	5.9	3.6

◇メキタジン錠 3mg 「NIG」 無包装 曝光量 60 万 Lx·hr [気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx·hr
性状 <白色の片面 1/2 割線入り素錠>	LXYB	白色の片面 1/2 割線入り素錠	淡赤褐色の片面 1/2 割線入り素錠
溶出性 (%) <45 分、70%以上>	LXYB	91.4~93.6	89.8~92.6
残存率 (%)	LXYB	100	99.0
(参考値) 硬度 (kg)	LXYB	5.9	5.4

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（物理化学的変化）

該当しない

9. 溶出性

(1) 溶出規格

メキタジン錠 3mg 「NIG」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。

(試験液に溶出試験第 2 液 900mL を用い、パドル法により、50rpm で試験を行う)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
3mg	45 分	70%以上

(2) 溶出試験²⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成13年5月31日 医薬審発第786号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

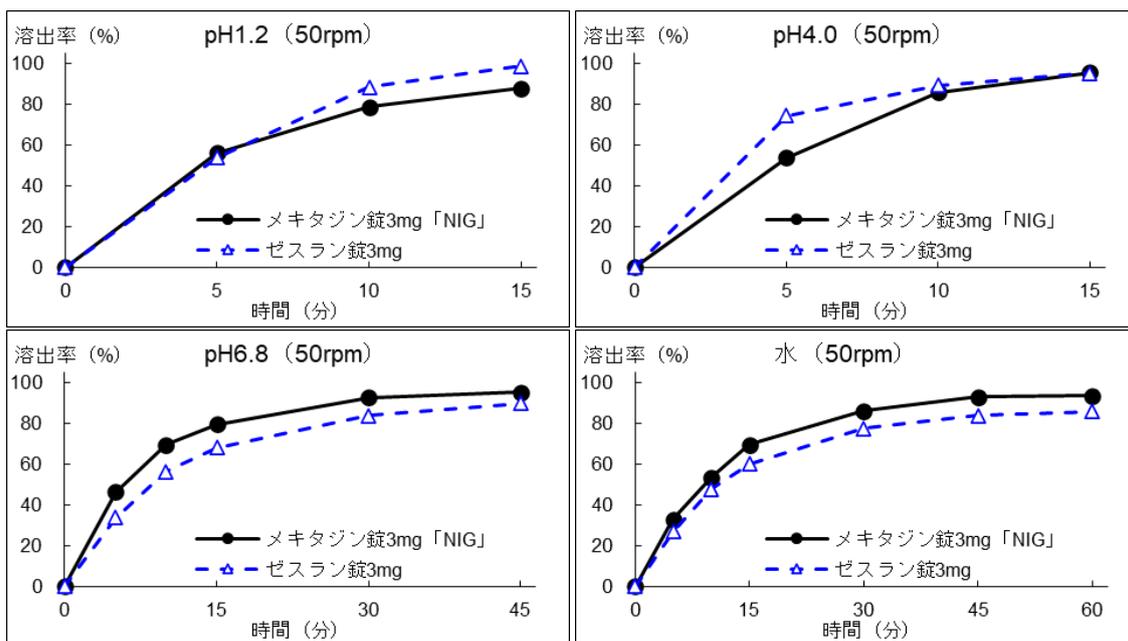
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近の2時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の2時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

以上、本品の溶出挙動と標準製剤（ゼスラン錠3mg）を比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



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

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

1000錠 [10錠 (PTP) ×100]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当記載事項なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- 気管支喘息
- アレルギー性鼻炎
- じん麻疹
- 皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）

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

〈気管支喘息〉

通常成人 1 回メキタジンとして 6mg 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、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）〉

通常成人 1 回メキタジンとして 3mg 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。

（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

設定されていない

5. 臨床成績

（1）臨床データパッケージ

該当資料なし

（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

〈気管支喘息〉

17.1.1 国内臨床試験（ケトチフェンを対照とした多施設二重盲検比較試験）

気管支喘息患者 211 例を対象にメキタジン 6mg 又はケトチフェン 1mg を 1 日 2 回、10 週間経口投与した結果、改善例数（中等度改善以上）は下表のとおりであった。メキタジン投与群の副作用は、眠気 7.1%（7/98 例）、口渇 4.1%（4/98 例）、フラフラ感、発疹、かゆみ、尿閉各 1.0%（1/98 例）であった³⁾。

投与群	有効性							安全性			
	著明改善	中等度改善	軽度改善	不変	軽度悪化	中等度悪化	著明悪化	解析対象例数 (179 例)	改善例数 (%) (中等度改善以上)	解析対象例数 195 例	副作用発現例数 (%)
メキタジン	9	34	30	14	2	2	0	91	43 (47.3)	98	11 (11.2)
ケトチフェン	9	22	28	25	3	1	0	88	31 (35.2)	97	10 (10.3)

〈アレルギー性鼻炎〉

17.1.2 国内臨床試験（クレマスチンを対照とした二重盲検群間比較試験）

通年性鼻アレルギー患者 185 例を対象にメキタジン 3mg 又はクレマスチン 1mg を 1 日 2 回、1 週間経口投与した結果、改善例数（有効以上）は下表のとおりであった。メキタジン投与群の副作用は、眠気 8.1%（7/86 例）、倦怠感 4.7%（4/86 例）、口渇、発疹 2.3%（2/86 例）、ふらふら感、胃痛、嘔気各 1.2%（1/86 例）であった⁴⁾。

投与群	有効性					安全性			
	著効	有効	やや有効	無効	悪化	解析対象例数 (157 例)	改善例数 (%) (有効以上)	解析対象例数 (174 例)	副作用発現例数 (%)
メキタジン	7	38	15	17	2	79	45 (57.0)	86	12 (14.0)
クレマスチン	5	35	24	14	0	78	40 (51.3)	88	19 (21.6)

〈蕁麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）〉

17.1.3 国内臨床試験（クレマスチンを対照とした二重盲検群間比較試験）

慢性蕁麻疹の患者 297 例を対象にメキタジン 3mg 又はクレマスチン 1mg を 1 日 2 回、1 週間経口投与した結果、改善例数（有効以上）は下表のとおりであった。メキタジン投与群の副作用は、眠気 18.8%（27/144 例）、倦怠感 10.4%（15/144 例）、便秘、口渇、吐気各 0.7%（1/144 例）であった⁵⁾。

投与群	有効性					安全性			
	著効	有効	やや有効	不変	悪化	解析対象例数 (285 例)	改善例数 (%) (有効以上)	解析対象例数 (286 例)	副作用発現例数 (%)
メキタジン	63	42	14	21	4	144	105 (72.9)	144	32 (22.2)
クレマスチン	53	37	29	11	11	141	90 (63.8)	142	48 (33.6)

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

該当資料なし

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

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

持続性抗ヒスタミン剤

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

抗原抗体反応に伴って起こる肥満細胞からのヒスタミンやロイコトリエン C₄・D₄などのケミカルメディエーターの遊離を抑制すると共に、これらの作用に拮抗することにより、アレルギー症状を緩和する⁶⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) ケミカルメディエーター拮抗作用 (*in vitro*)

18.2 ケミカルメディエーター拮抗作用

18.2.1 ヒスタミン、ロイコトリエン、アセチルコリンによるモルモット摘出回腸・気管筋・肺実質収縮、ブラジキニン、セロトニンによるモルモット摘出回腸収縮、PAF（血小板活性化因子）によるモルモット摘出気管筋収縮、プロスタグランジン F_{2α}によるモルモット摘出肺実質収縮を抑制する^{7) -10)} (*in vitro*)。

◇モルモット摘出回腸を用いたメキタジンの各種収縮物質に及ぼす影響¹¹⁾

[方法]

Hartley 系雌雄モルモットの回腸を摘出し、各薬物（メキタジン及びクレマスチンフマル酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、アトロピン）処置3分後に各種収縮物質（ヒスタミン、セロトニン、アセチルコリン及びブラジキニン）を添加し、メキタジンの各種収縮物質に対する拮抗作用を測定した。

[結果及び考察]

表1の結果より、メキタジンは、ヒスタミン、セロトニン、アセチルコリン及びブラジキニンで誘発した摘出モルモット回腸収縮反応に対し、クレマスチンフマル酸塩とほぼ同等又はそれ以上の収縮抑制作用を示した。

表 1. モルモット摘出回腸を用いたメキタジンの各種収縮物質に及ぼす影響の他剤との比較

収縮物質 (投与量)	薬物	投与量 (-log [M])	抑制率 (%)	IC ₅₀ (95%信頼区間)	効果比率
ヒスタミン 5×10 ⁻⁷ M	MQ	10	0.5	1.07×10 ⁻⁸ (2.68 - 42.73×10 ⁻⁹)	1.00
		9	9.8		
		8	47.3		
		7	90.4		
	CL	10	3.5	4.06×10 ⁻⁹ (9.18 - 179.71×10 ⁻¹⁰)	2.64
		9	25.4		
		8	65.2		
		7	95.6		
	CPM	11	2.0	5.70×10 ⁻¹⁰ (1.33 - 24.45×10 ⁻¹⁰)	18.77
10		18.0			
9		62.7			
8		92.4			
アセチルコリン 5×10 ⁻⁷ M	MQ	8	14.0	6.80×10 ⁻⁸ (1.37 - 33.71×10 ⁻⁸)	1.00
		7	64.1		
		6	87.2		
	CL	7	3.2	2.53×10 ⁻⁶ (5.25 - 122.27×10 ⁻⁷)	0.03
		6	35.4		
		5	74.1		
	CPM	7	1.3	>10 ⁻⁵	—
		6	12.4		
5	32.7				
AT	9	24.8	3.23×10 ⁻⁹ (7.36 - 141.60×10 ⁻¹⁰)	21.05	
	8	75.4			
	7	94.9			
セロトニン 2×10 ⁻⁷ M	MQ	6	10.2	3.03×10 ⁻⁵ (4.21 - 217.34×10 ⁻⁶)	1.00
		5	35.6		
		4	66.5		
	CL	6	0.2	>10 ⁻⁴	—
		5	25.4		
	4	40.8			
CPM	6	7.2	2.83×10 ⁻⁵ (4.92 - 162.26×10 ⁻⁶)	1.07	
	5	34.1			
	4	70.3			
ブラジキニン 10 ⁻⁷ M	MQ	6	5.0	3.57×10 ⁻⁵ (6.53 - 195.50×10 ⁻⁶)	1.00
		5	29.7		
		4	67.5		
	CL	6	5.4	2.91×10 ⁻⁵ (5.38 - 157.77×10 ⁻⁶)	1.23
		5	33.8		
		4	70.3		
	CPM	6	9.2	1.65×10 ⁻⁵ (3.19 - 85.03×10 ⁻⁶)	2.16
		5	42.3		
		4	79.3		

(n=5)

MQ : メキタジン、CL : クレマスチンフマル酸塩、CPM : クロルフェニラミンマレイン酸塩
AT : アトロピン

18.2.2 抗ヒスタミン作用

ヒスタミン致死を長時間防御する⁷⁾ (マウス)。

◇ヒスタミン致死防御作用¹¹⁾

[方法]

ddY 系雄性マウスを用いて、薬物投与の 1、3、5、8 時間後にヒスタミンの 700mg/kg を尾静脈内に注射し、メキタジンの経口投与における各時間の致死に対する防御効果をクレマスチンフマル酸塩と比較検討した。薬物の投与量は 5mg/kg とした。

[結果及び考察]

表 2 の結果より、メキタジン (5mg/kg、p.o.) は、マウスのヒスタミン致死に対しクレマスチンフマル酸塩よりも強力かつ持続的な防御作用を示した。

表 2. ヒスタミン致死防御へのメキタジン及びクレマスチンフマル酸塩の効果

薬物	防御率 (%)			
	1 時間後	3 時間後	5 時間後	8 時間後
メキタジン	100.0 (15/15)	86.7 (12/15)	46.7 (7/15)	20.0 (3/15)
クレマスチンフマル酸塩	100.0 (15/15)	60.0 (9/15)	13.3 ^a (2/15)	0.0 (0/15)

^a : P<0.05 対メキタジン (x²-test、x²₀=3.968)

() : 生存動物数/総動物数

2) ケミカルメディエーター遊離抑制作用 (*in vitro*)

18.3 ケミカルメディエーター遊離抑制作用

ラット腹腔細胞、ヒト肺、ヒト白血球からのヒスタミン及びヒト肺、ヒト白血球からのロイコトリエンの遊離を抑制する (*in vitro*)。これらの遊離抑制作用の機序の一部としてホスホジエステラーゼ活性の阻害 (*in vitro*)、Ca²⁺流入阻害 (*in vitro*) 等の関与が考えられている^{9)、10)}。

◇メキタジンの感作モルモット肺切片からの遊離メディエーターによる回腸収縮反応に及ぼす影響

¹¹⁾

[方法]

1. メディエーター液

Hartley 系雄性モルモットの臀筋及び腹腔内に卵白アルブミン (EA) 20mg/kg/mL を 0.5mL ずつ注射し、感作させ、3 日及び 5 日後に同様に追加感作させた。最終感作の 4 週間後にモルモットの肺切片より分離した総遊離メディエーター (TMed) から部分精製 SRS-A を Kohno and Parker の方法によって調製した。

2. TMed による回腸収縮反応

Hartley 系雌雄モルモットの回腸を摘出し、各薬物 (メキタジン、クレマスチンフマル酸塩) の TMed に対する拮抗作用を isotonic transducer を介して recticorder に記録した。

3. 部分精製 SRS-A による回腸収縮反応

Hartley 系雌雄モルモットの回腸を摘出し、各薬物 (メキタジン、クレマスチンフマル酸塩) の添加 3 分後に各種収縮物質の SRS-A に対する拮抗作用を isotonic transducer を介して recticorder に記録した。メキタジンの SRS-A による回腸収縮反応の抑制率は 5×10⁻⁷M のヒスタミンの収縮を基準にして算出した。

[結果及び考察]

表 3、表 4 の結果より、卵白アルブミン感作モルモット肺切片から抗原抗体反応により遊離した SRS-A を含む total mediator の摘出回腸収縮反応に対してクレマスチンフマル酸塩より強力な抑制作用を示した。

表 3. 総遊離メディエーター量に対するメキタジン及びクレマスチンフマル酸塩の影響

(*in vitro*, n=5)

薬物	遊離量 (M)	抑制率 (%)	IC ₅₀ (95%信頼区間)	効果比率
メキタジン	3×10 ⁻⁷	41.3	6.50×10 ⁻⁷ (7.69 - 549.46×10 ⁻⁸)	1.00
	10 ⁻⁶	62.7		
	3×10 ⁻⁶	70.8		
クレマスチンフマル酸塩	3×10 ⁻⁷	13.4	2.96×10 ⁻⁶ (5.91 - 148.23×10 ⁻⁷)	0.22
	10 ⁻⁶	41.2		
	3×10 ⁻⁶	55.3		

表 4. 遊離 SRS-A 量に対するメキタジン及びクレマスチンフマル酸塩の影響

(*in vitro*, n=5)

薬物	遊離量 (M)	抑制率 (%)	IC ₅₀ (95%信頼区間)	効果比率
メキタジン	3×10 ⁻⁷	9.0	3.36×10 ⁻⁶ (1.03 - 11.00×10 ⁻⁶)	1.00
	10 ⁻⁶	25.3		
	3×10 ⁻⁶	58.1		
クレマスチンフマル酸塩	3×10 ⁻⁷	8.2	3.69×10 ⁻⁶ (1.08 - 12.62×10 ⁻⁶)	0.91
	10 ⁻⁶	25.1		
	3×10 ⁻⁶	55.3		

3) 抗アレルギー作用

18.4 抗アレルギー作用

18.4.1 遊離メディエーターに対する作用

感作モルモット肺切片からの遊離メディエーターによる回腸収縮反応を抑制する⁸⁾ (*in vitro*)。

18.4.2 局所アナフィラキシー反応に対する作用

homologous PCA 反応を長時間抑制する^{8)、12)} (ラット)。

18.4.3 全身アナフィラキシー反応に対する作用

能動的及び受動的全身アナフィラキシー反応を抑制する⁸⁾ (モルモット)。

18.4.4 抗喘息作用

抗原の静注又は吸入により誘発される実験的喘息を抑制する¹²⁾ (モルモット)。

◇アレルギー反応抑制作用¹¹⁾

[方法]

ラットの背部に生理食塩水で 50 倍希釈した抗 DNP-As (48 時間 PCA 力価=256) 血清 0.1mL (コントロールとして、0.1mL) を皮内注射し、48 時間後、蛋白質量として 1mg の DNP-As 及び 2.5mg のエバンスブルーを含む生理食塩水 0.5mL/kg を尾静脈内に投与して PCA を惹起させた。30 分後に背部の青染部分の皮膚より色素を抽出し、620nm における吸光度を測定、色素量を算出した。

[結果及び考察]

表 5 の結果より、メキタジン (5mg/kg、p.o.) は、ラットの受身皮膚アナフィラキシー (PCA) 反応に対し、クレマスチンフマル酸塩及びクロルフェニラミンマレイン酸塩より強力かつ持続的な抑制作用を示した。

表 5. 抗 DNP-As 血清による PCA 惹起ラットに対するメキタジン、クレマスチンフマル酸塩及びクロルフェニラミンマレイン酸塩の効果 (n=8)

薬物	投与量 (mg/kg,p.o.)	色素量 (μg/site)	
		1 時間後	5 時間後
コントロール	—	12.6±1.05	12.2±1.16
メキタジン	5	6.3±0.64***	8.0±0.74**
クレマスチンフマル酸塩	5	6.2±0.37***	11.9±1.06
クロルフェニラミンマレイン酸塩	5	8.8±0.60**	15.3±0.96

** ; P<0.01、*** ; P<0.001 対コントロール

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

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

16.1.1 単回投与

健康成人に 3mg (n=4) 又は 6mg (n=4) を食後 1 回経口投与した場合の薬物動態パラメータは以下の通りであった^{6), 13)}。

投与量 (mg)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	T _{1/2} (α) (hr)	T _{1/2} (β) (hr)
3	2.00±0.10	6.70±0.62	99.40±29.16	5.43±0.71	32.7±3.2
6	5.36±0.23	6.74±0.91	252.38±14.60	6.65±1.61	38.6±3.7

2-コンパートメントモデルより算出 (平均±標準誤差)

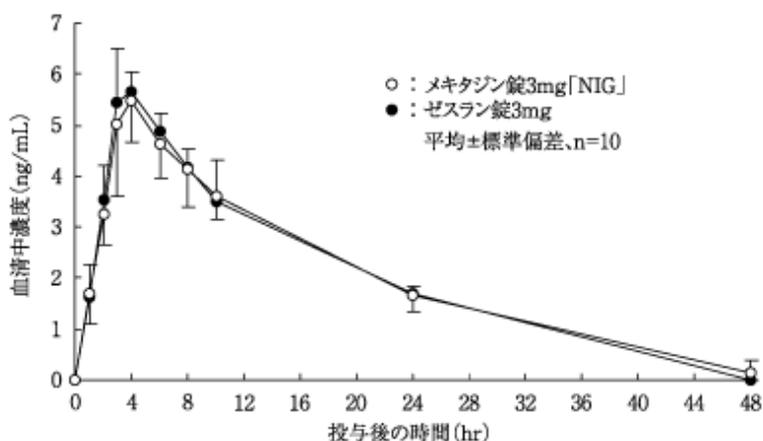
16.1.2 反復投与

健康成人に 3mg (n=4) 又は 6mg (n=4) を食後反復経口投与した場合、血中濃度は投与 7 日目までに定常状態に達し、その血中濃度は単回投与の最高血中濃度の 3~4 倍であり、生物学的半減期 T_{1/2} (β) は単回投与時とほぼ同程度であった¹³⁾。

16.1.3 生物学的同等性試験

生物学的同等性試験に関する試験基準 (昭和 55 年 5 月 30 日 薬審第 718 号)

メキタジン錠 3mg 「NIG」とゼスラン錠 3mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2 錠 (メキタジンとして 6mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、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¹⁴⁾。



薬物動態パラメータ

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
メキタジン錠 3mg 「NIG」	6	97.5±19.1	5.7±0.8	3.5±0.5	12.5±1.0
ゼスラン錠 3mg	6	97.7±5.2	5.9±0.5	3.6±0.5	12.9±1.4

(平均±標準偏差、n=10)

血清中濃度並びに 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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

(「VIII. 7. 相互作用」の項参照)

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

該当資料なし

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

(「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照)

(3) 乳汁への移行性

(「VIII. 6. (6) 授乳婦」の項参照)

(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

ラットに ^{14}C -メキタジンを経口投与した場合、小腸、胃、肺、肝に比較的多く分布し、1~4 時間でピークに達する^{15)、16)}。

(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

該当資料なし

(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

健康成人に経口投与した場合、尿からは未変化体の他に 3 種類の代謝物（SO、NO、モノ水酸化体）とグルクロン酸抱合体が確認されている¹³⁾。

7. 排泄

健康成人に経口投与した場合、48 時間以内に約 20%が尿中へ排泄される¹³⁾。

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

該当資料なし

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

2.禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 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

2.2 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。]

2.3 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。]

(解説)

2.1 本剤はフェノチアジン骨格を有する化合物であり、フェノチアジン系化合物あるいはその類似化合物に対して過敏症の既往を有する患者に本剤を投与した場合、過敏症を起こす可能性がある。

2.2 本剤には抗コリン作用があり、瞳孔括約筋弛緩による散瞳と共に房水通路が狭くなり眼圧を上昇させることにより閉塞隅角緑内障の病態を悪化させるおそれがある。

2.3 本剤には抗コリン作用があり、排尿筋の弛緩と尿道括約筋の収縮により排尿困難等の症状を起こすおそれがある。

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

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8.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。

(解説)

本剤には中枢抑制作用があり、眠気を催すことがあるため、危険を伴う作業等への従事について注意を促している。

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

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。

(解説)

開放隅角緑内障の患者に本剤を投与した場合における急性緑内障発作のリスクを完全には否定できない。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

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。

(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投与しないことが望ましい。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

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。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。

(解説)

動物実験（ラット）において、乳汁を介する乳仔（12匹）への移行が、経口投与24時間後に乳仔1匹当たり0.039%認められたが¹⁵⁾、ヒトの乳汁移行に関する報告はない。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

臨床試験において口渇等の副作用の発現率が高い傾向が認められている。

7. 相互作用

(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

10.2 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。

(解説)

- 1) 本剤及び中枢神経抑制剤やアルコールの併用により中枢神経抑制作用が相加的に増強されることがある。また、他の抗ヒスタミン剤でも同様の記載がなされている。
- 2) 本剤及び抗うつ剤、MAO 阻害剤、アトロピン様作用を有する薬剤の併用により抗コリン作用が相加的に増強されることがある。また、他の抗ヒスタミン剤でも同様の記載がなされている。
- 3) メトキサレンは尋常性白斑の治療薬で、光線感受性を高める薬理作用を有し、「相互作用」の項にフェノチアジン系薬剤等の光線過敏症を起こすことがある薬剤との併用注意の記載がある。なお、本剤では光線過敏症の報告はあるが、これらの薬剤との併用により、相互作用が発現したとの報告はない。

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

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー (いずれも頻度不明)

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。

11.1.2 肝機能障害、黄疸 (いずれも頻度不明)

AST、ALT、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。

11.1.3 血小板減少 (頻度不明)

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症		発疹、光線過敏症	
肝臓		AST、ALT の上昇	黄疸
血液		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
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) 発現頻度は使用成績調査を含む。

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

13. 過量投与

13.1 症状

眠気、悪心、嘔吐、軽度の抗コリン作用性障害がみられる。

13.2 処置

必要に応じ補助呼吸又は人工呼吸、抗痙攣剤を投与する。

(解説)

フランスの添付文書集 (DICTIONNAIRE VIDAL) に「大量誤飲の場合、眠気、嘔気、嘔吐、軽い抗コリン作用性障害があらわれる。対症療法としては補助呼吸、人工呼吸を行うとともに抗痙攣剤を投与する。」との記載がある。また、類薬 (クロルフェニラミンマレイン酸塩) の米国の添付文書集 (PDR) では、「過量投与：中枢抑制症状 (無呼吸等)、刺激症状 (痙攣等)、アトロピン様症状 (瞳孔の固定散大等) が発現することがある。処置としては催吐、胃洗浄を行い、透析は無効で興奮剤は禁忌である。」との記載がある。

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。

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

15.2 非臨床試験に基づく情報

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。

(解説)

メキタジン 5mg/kg を有色ラット (Long-Evans 系) に、経口投与した実験¹⁷⁾ において、メラニン含有組織 (眼など) に対する親和性が認められた。また、構造類似であるクロルプロマジン、レボプロマジン、塩酸チオリダジン (フェノチアジン系 Neuroleptics) は各々の使用上の注意の副作用の項に、長期又は大量投与により角膜・水晶体の混濁、網膜・角膜の色素沈着が発現する旨記載され、注意が喚起されている。しかし、メキタジン 5mg/kg/日を白色ラット (Wistar 系) に経口投与した実験¹⁵⁾ においては有色ラットで報告されたようなメラニン含有組織に対する親和性は認められていない。

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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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

製 剤	メキタジン錠 3mg「NIG」	なし
有効成分	メキタジン	劇薬 ^{注1)}

注1) 1個中3mg以下又は0.6%以下を含有する内用剤は除かれる。

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意点

20.取扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は遮光して保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ニポラジン錠 3mg、ゼスラン錠 3mg

7. 国際誕生年月日

不明

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

履歴	販売名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
販売 開始	キタゼミン錠	1990年 3月8日	20200AMZ00396000	1990年 7月13日	1990年 9月1日
販売名 変更	メキタジン錠 3mg 「タイヨー」	2007年 7月17日	21900AMX01027000	2007年 12月21日	2007年 12月21日
承継	メキタジン錠 3mg 「NIG」	〃	〃	2023年 6月16日	2023年 6月16日

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

＜効能又は効果、用法及び用量追加＞

効能又は効果、用法及び用量追加年月日：1995年6月15日

販売名：キタゼミン錠

気管支喘息：通常成人1回メキタジンとして6mg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。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

＜再評価結果（品質再評価）＞

結果公表日：2006年8月11日

販売名：キタゼミン錠

結果：薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない

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	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理 システム用コード
メキタジン錠 3mg 「NIG」	4413004F1014	4413004F1332	109326105	620932605

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品である。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) 長野準他：臨床医薬. 1988 ; 4 : 1013-1040
- 4) 武田一雄他：耳鼻臨床. 1981 ; 74 : 381-400
- 5) 久木田淳他：西日本皮膚科. 1981 ; 43 : 1346-1353
- 6) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店 ; 2021 : C-5606-C-5609
- 7) 藤村一他：日薬理誌. 1981 ; 78 : 279-289
- 8) 藤村一他：日薬理誌. 1981 ; 78 : 291-303
- 9) 河野茂勝他：日薬理誌. 1988 ; 92 : 145-157
- 10) K.Tasaka et al. : Arzneimittelforschung/Drug Res. 1990 ; 40 (II) 10 : 1092-1097
- 11) 社内資料：薬効薬理試験
- 12) 河野茂勝他：日薬理誌. 1988 ; 92 : 159-165
- 13) 第十八改正日本薬局方 医薬品情報 JPDI2021.じほう ; 2021 : 756-757
- 14) 社内資料：生物学的同等性試験
- 15) 宗田靖二他：医薬品研究. 1981 ; 12 (2) : 462-480
- 16) 横山信治他：医薬品研究. 1981 ; 12 (2) : 481-488
- 17) 横山信治他：医薬品研究. 1981 ; 12 (2) : 506

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

なし

2. 海外における臨床支援情報

なし

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

本項の情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。

試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。

医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉砕

粉砕物の安定性試験

メキタジン錠 3mg 「NIG」

粉砕物の安定性を曝光下の保存条件で検討した結果、性状は開始時白色の粉末、総曝光量 60 万 Lx・hr 照射後は淡紫白色の粉末であった。含量は規格内であった。

40℃及び 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

● 粉砕物 40℃ [遮光・気密容器]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	4 週
性状 n=3	990631	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	990631	103.0～103.1	101.2～101.7

※：表示量に対する含有率 (%)

● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光・気密容器]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間	
		開始時	4 週
性状 n=3	990631	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	990631	103.0～103.1	101.7～103.2

※：表示量に対する含有率 (%)

● 粉砕物 曝光量 60 万 Lx・hr [気密容器]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx・hr
性状 n=3	990631	白色の粉末	淡紫白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	990631	103.0～103.1	102.4～103.7

※：表示量に対する含有率 (%)

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

メキタジン錠 3mg 「NIG」

1) 試験方法

[崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

[通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施日：2010/8/6

ロット番号：990631

2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
メキタジン錠 3mg 「NIG」	5 分で崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

2. その他の関連資料

該当資料なし