

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「トーフ」

MEQUITAZINE TABLETS 3mg "TOWA"

貯法：室温保存

有効期間：3年

承認番号	22900AMX00094
販売開始	1992年7月

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。〕

3. 組成・性状

3.1 組成

1錠中の有効成分	日局 メキタジン3mg
添加剤	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム

3.2 製剤の性状

性状・剤形	白色の割線入り素錠		
識別コード	本体	TwHP	
	包装	Tw. HP	
外形	表	裏	側面
			
直径(mm)	8.0		
厚さ(mm)	2.6		
質量(mg)	170		

4. 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）

6. 用法及び用量

〈気管支喘息〉

通常成人1回2錠（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1錠（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。

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

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。

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。

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。

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。

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。

10. 相互作用

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。

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。

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）

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	

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
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。

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。

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。

15. その他の注意

15.2 非臨床試験に基づく情報

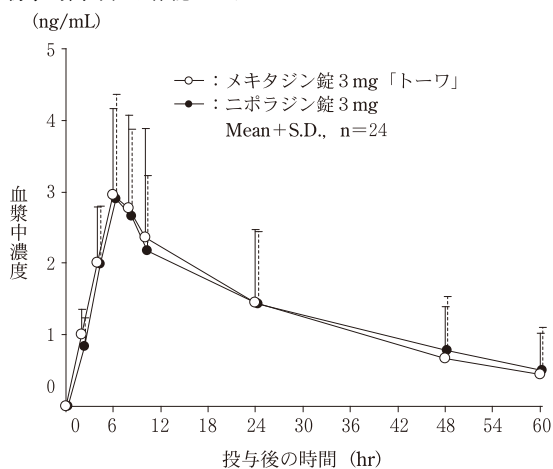
動物実験（ラット）でメラニンに対する親和性が認められている。また、他のフェノチアジン系化合物の長期投与又は大量投与により角膜・水晶体の混濁、網膜・角膜の色素沈着が報告されているので注意すること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

メキタジン錠3mg「トーワ」とニボラジン錠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漿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）についての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。¹⁾



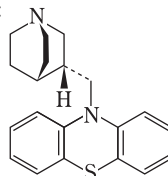
	製剤投与量 (メキタジン として)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₆₀ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
メキタジン錠3mg 「トーワ」	2錠 (6mg)	78.62±51.65	3.29±1.39	6.92±1.67	19.04±8.01
ニボラジン錠3mg	2錠 (6mg)	78.46±50.71	3.07±1.45	6.33±1.27	21.17±9.68

(Mean ± S. D., n=24)

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。

19. 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



及び鏡像異性体

一般名：メキタジン (Mequitazine)

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

分子式：C₂₀H₂₂N₂S

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℃

20. 取扱い上の注意

外箱開封後は遮光して保存すること。

22. 包装

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

23. 主要文献

1) 社内資料：生物学的同等性試験

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号

☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号