

# 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 2013 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「わかもと」

MEQUITAZINE TABLETS 3mg「WAKAMOTO」

剤形	素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中に日局メキタジン3mgを含有
一般名	和名：メキタジン(JAN) 洋名：Mequitazine(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2018年7月9日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2018年12月14日（販売名変更による） 発売年月日：1990年12月17日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ダイト株式会社 販売元：わかもと製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問合せ窓口	わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション TEL 03-3279-0379 FAX 03-3279-1272

本IFは2019年8月改訂（第14版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

## I F 利用の手引きの概要 ー 日本病院薬剤師会 ー

### 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I F と略す）の位置付け並びに I F 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-I F）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-I F を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F 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 I F は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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。

#### 【I F の様式】

- ①規格は A 4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② I F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

#### [ I F の作成 ]

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [ I F の発行 ]

- ① 「I F 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「I F 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

### 3. I F の利用にあたって

「I F 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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」に従って作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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薬剤師等自らが内容を充実させ、I F 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、I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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

I F を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	14. その他	6
1. 開発の経緯	1	V. 治療に関する項目	7
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	1. 効能又は効果	7
II. 名称に関する項目	2	2. 用法及び用量	7
1. 販売名	2	3. 臨床成績	7
(1) 和名	2	(1) 臨床データパッケージ	7
(2) 洋名	2	(2) 臨床効果	7
(3) 名称の由来	2	(3) 臨床薬理試験	7
2. 一般名	2	(4) 探索的試験	7
(1) 和名(命名法)	2	(5) 検証的試験	7
(2) 洋名(命名法)	2	1) 無作為化並行用量反応試験	7
(3) ステム	2	2) 比較試験	7
3. 構造式又は示性式	2	3) 安全性試験	7
4. 分子式及び分子量	2	4) 患者・病態別試験	7
5. 化学名(命名法)	2	(6) 治療的使用	7
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2	1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・	
7. CAS登録番号	2	製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	7
III. 有効成分に関する項目	3	2) 承認条件として実施予定の内容又は	
1. 物理化学的性質	3	実施した試験の概要	7
(1) 外観・性状	3	VI. 薬効薬理に関する項目	8
(2) 溶解性	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	8
(3) 吸湿性	3	2. 薬理作用	8
(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点	3	(1) 作用部位・作用機序	8
(5) 酸塩基解離定数	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	8
(6) 分配係数	3	(3) 作用発現時間・持続時間	8
(7) その他の主な示性値	3	VII. 薬物動態に関する項目	9
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	1. 血中濃度の推移・測定法	9
3. 有効成分の確認試験法	3	(1) 治療上有効な血中濃度	9
4. 有効成分の定量法	3	(2) 最高血中濃度到達時間	9
IV. 製剤に関する項目	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	9
1. 剤形	4	(4) 中毒域	9
(1) 剤形の区別, 外観及び性状	4	(5) 食事・併用薬の影響	9
(2) 製剤の物性	4	(6) 母集団(ポピュレーション)解析により	
(3) 識別コード	4	判明した薬物体内動態変動要因	9
(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び		2. 薬物速度論のパラメータ	10
安定な pH 域等	4	(1) 解析方法	10
2. 製剤の組成	4	(2) 吸収速度定数	10
(1) 有効成分(活性成分)の含量	4	(3) バイオアベイラビリティ	10
(2) 添加物	4	(4) 消失速度定数	10
(3) その他	4	(5) クリアランス	10
3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意	4	(6) 分布容積	10
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	(7) 血漿蛋白結合率	10
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	3. 吸収	10
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	5	4. 分布	10
7. 溶出性	5	(1) 血液-脳関門通過性	10
8. 生物学的試験法	6	(2) 血液-胎盤関門通過性	10
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	6	(3) 乳汁への移行性	10
10. 製剤中の有効成分の定量法	6	(4) 髄液への移行性	10
11. 力価	6	(5) その他の組織への移行性	10
12. 混入する可能性のある夾雑物	6	5. 代謝	10
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器		(1) 代謝部位及び代謝経路	10
に関する情報	6	(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種	10

(3) 初回通過効果の有無及びその割合	10	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	16
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	11	(2) 薬剤交付時の取扱いについて	
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	11	(患者等に留意すべき必須事項等)	16
6. 排泄	11	(3) 調剤時の留意点について	16
(1) 排泄部位及び経路	11	5. 承認条件等	16
(2) 排泄率	11	6. 包装	16
(3) 排泄速度	11	7. 容器の材質	16
7. トランスポーターに関する情報	11	8. 同一成分・同効薬	17
8. 透析等による除去率	11	9. 国際誕生年月日	17
<b>VII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	12	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	17
1. 警告内容とその理由	12	11. 薬価基準収載年月日	17
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	12	12. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更	
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と		追加等の年月日及びその内容	17
その理由	12	13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日	
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と		及びその内容	17
その理由	12	14. 再審査期間	17
5. 慎重投与内容とその理由	12	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	17
6. 重要な基本的注意とその理由及び		16. 各種コード	17
処置方法	12	17. 保険給付上の注意	18
7. 相互作用	12	<b>XI. 文献</b>	19
(1) 併用禁忌とその理由	12	1. 引用文献	19
(2) 併用注意とその理由	12	2. その他の参考文献	19
8. 副作用	13	<b>XII. 参考資料</b>	20
(1) 副作用の概要	13	1. 主な外国での発売状況	20
(2) 重大な副作用と初期症状	13	2. 海外における臨床支援情報	20
(3) その他の副作用	13	<b>XIII. 備考</b>	21
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値		1. その他関連資料	21
異常一覧	13		
(5) 基礎疾患, 合併症, 重症度及び			
手術の有無等背景別の副作用発現頻度	14		
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	14		
9. 高齢者への投与	14		
10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与	14		
11. 小児等への投与	14		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	14		
13. 過量投与	14		
14. 適用上の注意	14		
15. その他の注意	14		
16. その他	14		
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	15		
1. 薬理試験	15		
(1) 薬効薬理試験	15		
(2) 副次的薬理試験	15		
(3) 安全性薬理試験	15		
(4) その他の薬理試験	15		
2. 毒性試験	15		
(1) 単回投与毒性試験	15		
(2) 反復投与毒性試験	15		
(3) 生殖発生毒性試験	15		
(4) その他の特殊毒性	15		
<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	16		
1. 規制区分	16		
2. 有効期間又は使用期限	16		
3. 貯法・保存条件	16		
4. 薬剤取扱い上の注意点	16		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

メキタジンは抗ヒスタミン剤であり、本邦では昭和 58 年に上市されている。

メキタジン錠 3mg「わかもと」はダイト株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、平成 2 年 3 月に承認取得、その後、平成 2 年 12 月にわかもと製薬株式会社より販売した。平成 20 年に医療事故防止のため販売名を変更した。更に平成 30 年に医療事故防止のため販売名変更を経て、現在に至っている。

また、第十六改正日本薬局方第二追補で日本薬局方製剤とされたことから、平成 26 年 3 月に規格等が日本薬局方に適合していることを確認し、「日本薬局方 メキタジン錠」としている。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1)メキタジン錠 3mg「わかもと」は割線入りの素錠であり、1 日 2 回投与の持続性抗ヒスタミン剤である。
- (2)生物学的同等性試験により、対照薬との同等性が確認されています。
- (3)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ません。  
重大な副作用（頻度不明）として、ショック、アナフィラキシー様症状、肝機能障害、黄疸、血小板減少があらわれることがある。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

メキタジン錠 3mg 「わかもと」

#### (2) 洋名

MEQUITAZINE TABLETS 3mg 「WAKAMOTO」

#### (3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」より命名

### 2. 一般名

#### (1) 和名(命名法)

メキタジン(JAN)

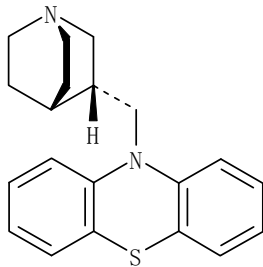
#### (2) 洋名(命名法)

Mequitazine(JAN)

#### (3) ステム

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

分子量：322.47

### 5. 化学名(命名法)

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

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

特になし

### 7. CAS登録番号

29216-28-2

### 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。

光によって徐々に着色する。

##### (2) 溶解性

溶媒	1g を溶かすのに要する溶媒量 (mL)	日本薬局方の溶解度表記
メタノール、酢酸 (100)	1mL 以上 10mL 未満	溶けやすい
エタノール (95)	10mL 以上 30mL 未満	やや溶けやすい
水	10000mL 以上	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

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「メキタジン」による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法

#### 4. 有効成分の定量法

日局「メキタジン」による。

電位差滴定法



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

販売名	メキタジン錠 3mg 「わかもと」
色・剤形	白色の素錠（片面割線入り）
外形	
直径	8.0mm
厚さ	2.7mm
質量	0.170g

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

本体：DK043

PTP：DK043

#### (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分(活性成分)の含量

1錠中に日局メキタジン 3mg を含有する。

#### (2) 添加物

D-マンニトール、トウモロコシデンプン、アルファー化デンプン、ステアリン酸マグネシウム

#### (3) その他

該当しない

### 3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

試験項目：性状、確認試験、溶出性、定量及び硬度

試験	保存条件	包装形態	保存期間	結果
加速試験 <sup>1)</sup>	40±1□・75±5%RH	PTP 包装品	6 ヶ月	いずれの項目も規格内であった。
長期保存試験 <sup>1)</sup>	25±2□・60±5%RH	PTP 包装品	48 ヶ月	いずれの項目も規格内であった。

#### <参考>無包装安定性試験<sup>2)</sup>

試験項目：性状、溶出性、定量及び硬度（参考値）

試験	保存条件	包装形態	保存期間	結果
無包装安定性試験	温度 (40℃)	遮光・気密	3 ヶ月	いずれの項目も規格内であった。
	湿度 (25□・75%RH)	遮光・開放	3 ヶ月	2 ヶ月後で硬度が低下したが、その他の項目は規格内であった。
	光 (2500lux、25□・45%RH)	開放	20 万 lux・hr	5 万 lux・hr で着色を認め、設定規格を外れた。

#### 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

#### 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

#### 7. 溶出性<sup>3)</sup>

##### (1) 溶出挙動における類似性

（「後発医薬品の生物学的同等性ガイドライン（平成9年12月22日 医薬審第487号）」）

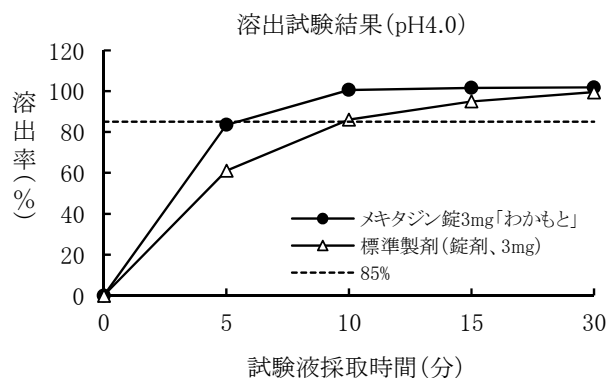
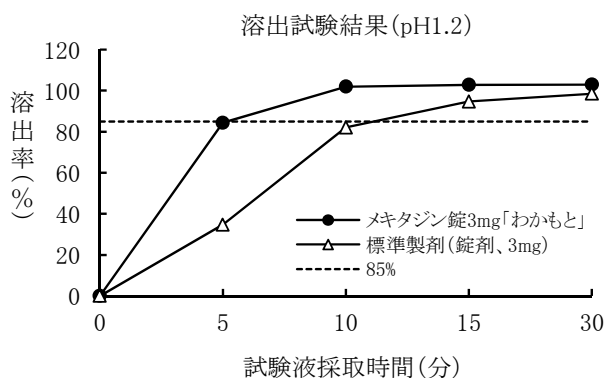
試験方法：日本薬局方一般試験法 溶出試験

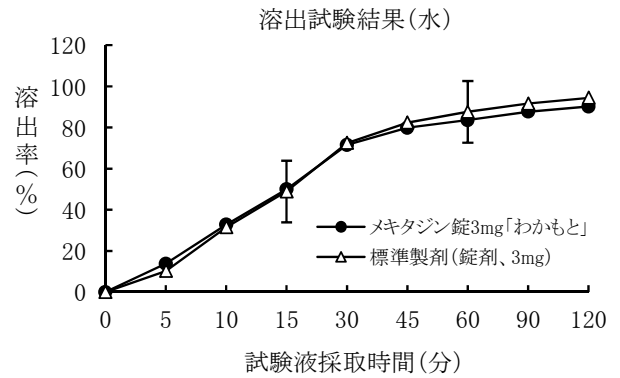
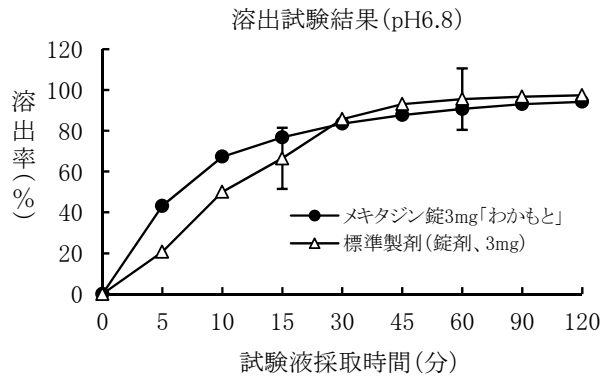
標準製剤：メキタジン錠3mg

試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

回転数：50rpm

界面活性剤：なし





(2) 公的溶出規格への適合性

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。

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「メキタジン錠」による。

- (1) 呈色反応
- (2) 紫外吸収スペクトル
- (3) 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「メキタジン錠」による。

吸光度測定法

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当資料なし

## 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

皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎、皮膚瘙痒症）

### 2. 用法及び用量

[気管支喘息の場合]

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、皮膚疾患に伴う瘙痒（湿疹・皮膚炎、皮膚瘙痒症）の場合]

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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

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

#### 抗ヒスタミン剤

ジフェンヒドラミン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、ヒベンズ酸プロメタジン、プロメタジン塩酸塩、プロメタジンメチレンジサリチル酸塩、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、シプロヘプタジン塩酸塩水和物、ホモクロルシクリジン塩酸塩 など

#### 抗アレルギー剤

アゼラスチン塩酸塩、アンレキサノクス、イブジラスト、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、オザグレル塩酸塩水和物、オロパタジン塩酸塩、クロモグリク酸ナトリウム、ケトチフェンフマル酸塩、スプラタストトシル酸塩、セチリジン塩酸塩、セラトロダスト、トラニラスト、フェキソフェナジン塩酸塩、プランルカスト水和物、ベポタスチンベシル酸塩、ペミロラストカリウム、モンテルカストナトリウム、ラマトロバン、ルパタジンフマル酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ロラタジン など

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>4)</sup>

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。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

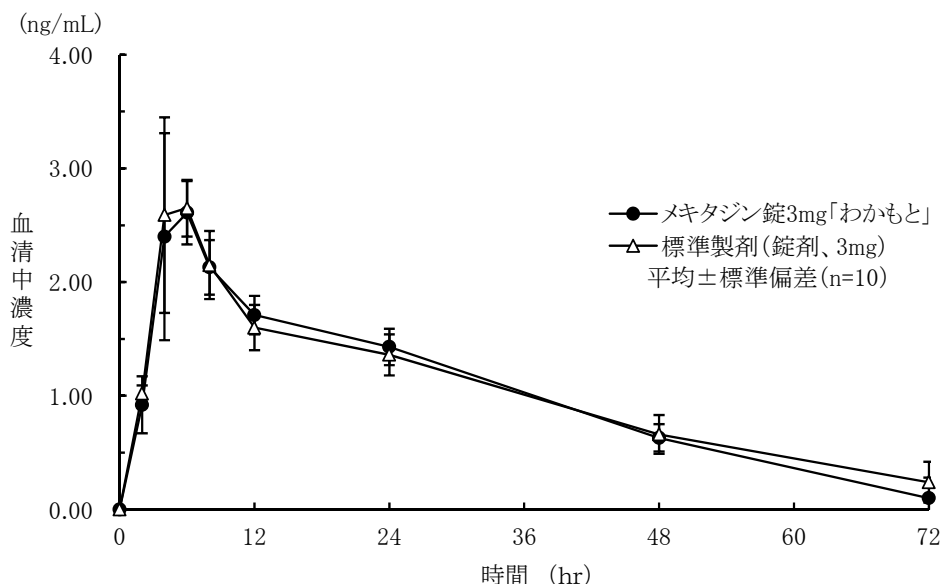
#### (2) 最高血中濃度到達時間<sup>5)</sup>

5.0±1.1 時間 (平均±標準偏差、n=10)

メキタジン錠 3mg 「わかもと」を 2 錠 (メキタジンとして 6mg) 絶食経口投与時

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>5)</sup>

メキタジン錠 3mg 「わかもと」と標準製剤を、生物学的同等性試験ガイドラインに準じ、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) を健康成人男子に絶食時単回経口投与して血清中のメキタジン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータについて分散分析にて統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。



製剤名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	Cmax(ng/mL)	AUC <sub>0→∞</sub> (ng・hr/mL)	Tmax(hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
メキタジン錠 3mg「わかもと」	2.88±0.28	73.81±5.11	5.0±1.1	22.5±3.8
標準製剤 (錠剤、3mg)	2.97±0.35	74.90±9.66	5.0±1.1	23.5±5.7

(平均±標準偏差、n=10)

血清中濃度並びに Cmax、AUC 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。

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

「VIII-7. 相互作用」の項参照

#### (6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬体内動態変動要因

該当資料なし

## 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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

### (4) 消失速度定数

健康成人男子

投与量	投与方法	kel (hr <sup>-1</sup> )
2錠 (メキタジンとして6mg)	絶食単回 経口投与	0.032±0.005hr <sup>-1</sup>

(平均±標準偏差、n=10)

### (5) クリアランス

該当資料なし

### (6) 分布容積

該当資料なし

### (7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 3. 吸収

該当資料なし

## 4. 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

該当資料なし

### (3) 乳汁への移行性

Ⅷ-10「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」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

該当資料なし

## 5. 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(CYP450等)の分子種

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比率**

該当資料なし

**(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ**

該当資料なし

**6. 排泄**

**(1) 排泄部位及び経路**

該当資料なし

**(2) 排泄率**

該当資料なし

**(3) 排泄速度**

該当資料なし

**7. トランスポーターに関する情報**

該当資料なし

**8. 透析等による除去率**

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

#### 【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。]

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 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 [Ⅷ-9「高齢者への投与」の項参照]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

#### (2) 併用注意とその理由

#### 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。

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
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。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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。

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### 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)、Al-P 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。

### (3) その他の副作用

#### 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)、ALT(GPT)の上昇、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
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。

### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

VIII-2「禁忌」、VIII-8「副作用」の項参照

9. 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の口渴等の副作用の発現率が高い傾向が認められている。

10. 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。]

11. 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)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 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。

14. 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。)

15. 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。

16. その他

該当しない

## 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」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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：該当しない

有効成分：劇薬

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：4年（安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

遮光、気密、室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

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。）

くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

PTP：1000錠（10錠×100）

### 7. 容器の材質

P T P：着色ポリ塩化ビニル・アルミニウム

ピロー：ポリエチレンフィルム・ポリプロピレンフィルム

個装箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ゼスラン錠 3mg・小児用シロップ 0.03%・小児用細粒 0.6%、ニポラジン錠 3mg・小児用シロップ 0.03%・小児用細粒 0.6%

同効薬：ジフェンヒドラミン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、ヒベンズ酸プロメタジン、プロメタジン塩酸塩、プロメタジンメチレンジサリチル酸塩、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、シプロヘプタジン塩酸塩水和物、ホモクロルシクリジン塩酸塩、アゼラスチン塩酸塩、アンレキサノクス、イブジラスト、エバスチン、エピナスチン塩酸塩、エメダスチンフマル酸塩、オキサトミド、オザグレル塩酸塩水和物、オロパタジン塩酸塩、クロモグリク酸ナトリウム、ケトチフェンフマル酸塩、スプラタストトシル酸塩、セチリジン塩酸塩、セラトロダスト、トラニラスト、フェキソフェナジン塩酸塩、プラナルカスト水和物、ベポタスチンベシル酸塩、ペミロラストカリウム、モンテルカストナトリウム、ラマトロバン、ルパタジンフマル酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ロラタジン など

9. 国際誕生年月日

1970年1月31日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
メキタジン錠 3mg 「わかもと」	2018年7月9日	23000AMX00510000

注：旧販売名：メキタミン錠 3mg 承認年月日：2008年9月4日

11. 薬価基準収載年月日

2018年12月14日（旧販売名：2008年12月19日、経過措置：2019年9月30日迄）

12. 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

1995年8月14日：効能追加（気管支喘息）

13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

製品名	HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
メキタジン錠 3mg 「わかもと」	109330801	4413004F1324	620933001

## 17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) ダイト株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) ダイト株式会社 社内資料 (無包装状態での安定性試験)
- 3) ダイト株式会社 社内資料 (溶出挙動)
- 4) 第十七改正日本薬局方 C-5348, 廣川書店
- 5) ダイト株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし



## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

### XIII. 備考

#### 1. その他関連資料

該当資料なし