

貯 法：遮光保存、室温保存
使用期限：外箱及びラベルに表示

アレルギー性疾患治療剤

承認番号	21500AMZ00297000
薬価収載	2003年7月
販売開始	2003年7月

*注 意：「取扱い上の注意」の項参照

メキタジンDS 0.6%「KN」

MEQUITAZINE DS 0.6%「KN」
メキタジンドライシロップ

【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) 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】

品名	メキタジンDS 0.6%「KN」
成分・含量	1g中、日局メキタジン6mg含有
添加物	白糖、サッカリンナトリウム水和物、ポビドン、アジピン酸、リン酸水素ナトリウム水和物、ラウリル硫酸ナトリウム、シリコーン樹脂、ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、カルメロースナトリウム、香料
性状	白色から微黄白色の散剤(細粒)で、芳香があり、味は甘い。

【効能・効果】

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

【用法・用量】

【気管支喘息の場合】

通常小児1回メキタジンとして0.12mg/kgを1日2回、用時溶解して経口投与する。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、皮膚疾患に伴う痒痒(湿疹・皮膚炎、皮膚痒痒症)の場合】

通常小児1回メキタジンとして0.06mg/kgを1日2回、用時溶解して経口投与する。なお、年齢、症状に応じて適宜増減する。
年齢別の標準投与量は、通常、下記の用量を1回量とする。

年齢	標準体重	ドライシロップ1回投与量g (メキタジンとしてmg)	
		気管支喘息	アレルギー性鼻炎、じん麻疹、皮膚疾患に伴う痒痒
1歳以上2歳未満	8kg以上12kg未満	0.2g (1.2mg)	0.1g (0.6mg)
2歳以上4歳未満	12kg以上17kg未満	0.3g (1.8mg)	0.15g (0.9mg)
4歳以上7歳未満	17kg以上25kg未満	0.4g (2.4mg)	0.2g (1.2mg)
7歳以上11歳未満	25kg以上40kg未満	0.6g (3.6mg)	0.3g (1.8mg)
11歳以上16歳未満	40kg以上	1g (6.0mg)	0.5g (3.0mg)

【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。〕

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤の投与により眠気を催すことがあるので保護者に対し注意を与えること。
また、高齢の小児に対し本剤投与中には危険を伴う機械操作や遊戯などを行わないよう十分注意を与えること。
- (2) 小児では一般に自覚症状を訴える能力が欠けるので、投与にあたっては保護者に対し患者の状態を十分に観察し、異常が認められた場合には速やかに主治医に連絡する等適切な処置をするよう注意を与えること。
- (3) 本剤は甘みがあるので、誤飲を避けるため、保護者に対し保管及び取扱いについて十分注意を与えること。

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、作用が増強される可能性がある。
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、作用が増強される可能性がある。
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、作用が増強される可能性がある。

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 ^{注1)}	発疹、光線過敏症
肝臓 ^{注2)}	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇、黄疸
血液 ^{注1)}	好中球減少、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	下痢、嘔吐、口渴、食欲不振、胃痛、胃部不快感、便秘、腹痛
循環器	心悸亢進、胸部苦悶感
泌尿器	排尿困難
その他	味覚異常、浮腫、視調節障害、顔面潮紅、咽頭痛、月経異常、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. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

本剤は、小児用製剤である。

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある患者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。]

6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児(使用経験がない)及び乳児(使用経験が少ない)に対する安全性は確立していない。

7. 過量投与

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。

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。

8. 適用上の注意

(1) シロップ調製後は冷暗所に保存し、できるだけ速やかに使用すること。

(2) 他剤との配合についてはできるだけ避けることが望ましいが、やむを得ず配合する場合には、配合変化を起こすことがあるので注意すること。

9. 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】

<生物学的同等性試験>

メキタジン DS0.6%「KN」と標準製剤を、クロスオーバー法により1g及び20mL(メキタジン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90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(図、表)。¹⁾

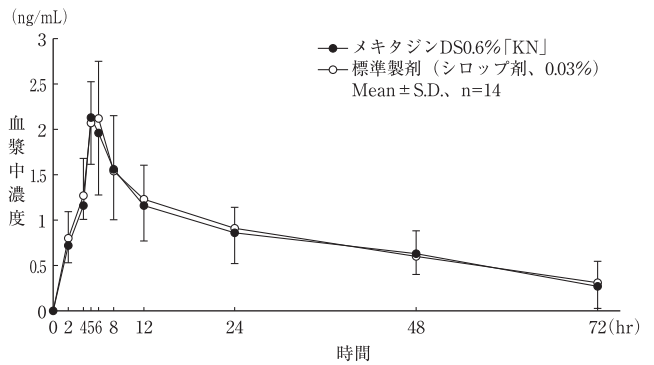


図 メキタジンの血漿中濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→72hr} (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
メキタジン DS 0.6%「KN」	56.09 ± 19.58	2.29 ± 0.39	5.5 ± 0.5	28.4 ± 7.4
標準製剤 (シロップ剤, 0.03%)	57.60 ± 13.92	2.35 ± 0.56	5.7 ± 0.8	29.4 ± 10.2

(Mean ± S.D., n = 14)

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。

*【薬効薬理】

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⁾

【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

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

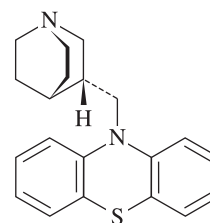
(95)にやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

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℃

構造式：



及び鏡像異性体

【取扱い上の注意】

* (1) 本剤は吸湿しやすく、湿気による固化のおそれがあるため、調剤時にその都度密栓すること。また、分包した場合も、湿気を避けて保存し、なるべく速やかに使用すること。

(2) 本剤は強い光に当たると着色することがあるので、分割して使用する場合には、取扱いに注意すること。

<安定性試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、3年間)の結果、メキタジンDS0.6%「KN」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

【包装】

バラ：100g

【主要文献】

- 1) 小林化工株式会社・社内資料(生物学的同等性試験)
- **2) 第十七改正日本薬局方解説書
- 3) 小林化工株式会社・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。

小林化工株式会社 安全管理部

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15

 0120-37-0690 TEL 0776-73-0911

FAX 0776-73-0821

製造販売元
 **小林化工株式会社**
福井県あわら市矢地5-15

(C.7.0) 001

