2026年4月改訂（第18版）　　日本標準商品分類番号：874413

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

ゼスラン®錠3mg

Zesulan®Tablets

アレルギー性疾患治療剤

ゼスラン®小児用シロップ0.03%
ゼスラン®小児用細粒0.6%

Zesulan®Syrup for Pediatric

Zesulan®Fine Granules for Pediatric

剤形	ゼスラン錠3mg：白色素錠（片面割線入り） ゼスラン小児用シロップ0.03%：液剤（シロップ剤） ゼスラン小児用細粒0.6%：散剤（細粒）
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	ゼスラン錠3mg：1錠中　日局メキタジン3mg ゼスラン小児用シロップ0.03%：1mL中　日局メキタジン0.3mg ゼスラン小児用細粒0.6%：1g中　日局メキタジン6mg
一般名	和名：メキタジン（JAN） 洋名：Mequitazine（r-INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	ゼスラン錠3mg：製造販売承認年月日：2009年3月26日 薬価基準収載年月日：2009年9月25日 販売開始年月日：1983年2月3日 ゼスラン小児用シロップ0.03%：製造販売承認年月日：2008年3月7日 薬価基準収載年月日：2008年6月20日 販売開始年月日：1997年8月1日 ゼスラン小児用細粒0.6%：製造販売承認年月日：2001年3月14日 薬価基準収載年月日：2001年7月6日 販売開始年月日：2001年7月13日
製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：旭化成セラピューティクス株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	旭化成セラピューティクス株式会社　くすり相談窓口 TEL:0120-114-936　FAX:03-6699-3697 受付時間：9:00～17:45　（土日祝、休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://akp-pharma-digital.com

本IFは2026年4月（ゼスラン錠）、2026年4月（ゼスラン小児用シロップ）、2026年4月（ゼスラン小児用細粒）改訂の電子化された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，「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・表現には医薬品，医療機器等の品質，有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン，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を利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
1．開発の経緯…… 1
2．製品の治療学的特性…… 1
3．製品の製剤学的特性…… 1
4．適正使用に関して周知すべき特性…… 2
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項…… 2
6．ＲＭＰの概要…… 2

Ⅱ．名称に関する項目…… 3
1．販売名…… 3
2．一般名…… 3
3．構造式又は示性式…… 3
4．分子式及び分子量…… 3
5．化学名（命名法）又は本質…… 4
6．慣用名、別名、略号、記号番号…… 4

Ⅲ．有効成分に関する項目…… 5
1．物理化学的性質…… 5
2．有効成分の各種条件下における安定性…… 6
3．有効成分の確認試験法、定量法…… 7

Ⅳ．製剤に関する項目…… 8
1．剤形…… 8
2．製剤の組成…… 9
3．添付溶解液の組成及び容量…… 9
4．力価…… 9
5．混入する可能性のある夾雑物…… 10
6．製剤の各種条件下における安定性…… 10
7．調製法及び溶解後の安定性…… 11
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）…… 11
9．溶出性…… 11
10．容器・包装…… 12
11．別途提供される資材類…… 12
12．その他…… 12

Ⅴ．治療に関する項目…… 13
1．効能又は効果…… 13
2．効能又は効果に関連する注意…… 13
3．用法及び用量…… 13
4．用法及び用量に関連する注意…… 14
5．臨床成績…… 14

Ⅵ．薬効薬理に関する項目…… 20
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群… 20
2．薬理作用…… 20

Ⅶ．薬物動態に関する項目…… 22
1．血中濃度の推移…… 22
2．薬物速度論的パラメータ…… 24
3．母集団（ポピュレーション）解析…… 24
4．吸収…… 24
5．分布…… 25
6．代謝…… 26
7．排泄…… 27
8．トランスポーターに関する情報…… 27
9．透析等による除去率…… 28
10．特定の背景を有する患者…… 28
11．その他…… 28

Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目… 29
1．警告内容とその理由…… 29
2．禁忌内容とその理由…… 29
3．効能又は効果に関連する注意とその理由… 30
4．用法及び用量に関連する注意とその理由… 30
5．重要な基本的注意とその理由…… 30
6．特定の背景を有する患者に関する注意…… 31
7．相互作用…… 33
8．副作用…… 34
9．臨床検査結果に及ぼす影響…… 39
10．過量投与…… 39
11．適用上の注意…… 40
12．その他の注意…… 40

Ⅸ．非臨床試験に関する項目…… 41
1．薬理試験…… 41
2．毒性試験…… 42

Ⅹ．管理的事項に関する項目…… 44
1. 規制区分…… 44
2. 有効期間…… 44
3. 包装状態での貯法…… 44
4. 取扱い上の注意…… 44
5. 患者向け資材…… 44
6. 同一成分・同効薬…… 45
7. 国際誕生年月日…… 45
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…… 45
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…… 45
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容…… 45
11. 再審査期間…… 45
12. 投薬期間制限に関する情報…… 46
13. 各種コード…… 46
14. 保険給付上の注意…… 46

ⅩⅠ．文献…… 47
1. 引用文献…… 47
2. その他の参考文献…… 48

ⅩⅡ．参考資料…… 50
1. 主な外国での発売状況…… 50
2. 海外における臨床支援情報…… 51

ⅩⅢ．備考…… 52
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…… 52
2. その他の関連資料…… 52

Ⅰ．概要に関する項目

1. 開発の経緯

ゼスランは、1969 年フランス・ファルムカ社研究所の Mr.Gueremy により発見された化合物で、キヌクリジン環を有するフェノチアジン系の持続性抗ヒスタミン剤である。

ゼスランは薬理学的検討により持続的な抗アレルギー作用、ケミカルメディエーター遊離抑制作用及び拮抗作用を有することが認められている。

本邦では、アレルギー性鼻炎、じん麻疹などの皮膚そう痒性疾患に対する有用性が認められ、1982 年に「ゼスラン錠」として承認され、1983 年より販売している。また、1990 年に気管支喘息に対する効能が追加され、各種アレルギー性疾患に用いられている。

さらに、小児用製剤として液状シロップ剤「ゼスラン小児用シロップ」を開発、「ゼスラン錠」同様気管支喘息、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）に対して優れた臨床効果を示すことが認められ、1997 年承認を得て発売に至った。

また、小児用としてのコンプライアンスと製剤の安定性の向上を目的として、「ゼスラン小児用細粒」を開発、「ゼスラン錠」「ゼスラン小児用シロップ」同様の効能・効果で 2001 年承認・発売に至った。

2. 製品の治療学的特性

(1) ケミカルメディエーター拮抗作用・遊離抑制作用を示す（*in vitro*）。[「Ⅵ.2.（2）薬効を裏付ける試験成績」の項参照]

(2) 抗アレルギー作用を有し、その作用は持続的である（ラット、モルモット）。[「Ⅵ.2.（2）薬効を裏付ける試験成績」の項参照]

(3) 気管支喘息、アレルギー性鼻炎、じん麻疹、湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症に対し、有用性が認められている。[「Ⅴ.5.（4）検証的試験」の項参照]

(4) 1 日 2 回の投与で症状のコントロールが可能である。[「Ⅴ.3.用法及び用量」の項参照]

(5) 小児用シロップ：小児に服用しやすいミックスフルーツの香りの液状シロップ剤である。
小児用細粒：小児に服用しやすいイチゴの香りの細粒である。

(6) ゼスラン錠及びニポラジン錠（共同開発品目）、ゼスランシロップ及びニポラジンシロップ（共同開発品目）、ゼスラン細粒及びニポラジン細粒（共同開発品目）：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、肝機能障害、黄疸、血小板減少があらわれることがある。[「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

該当しない。

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材、最適使用推進ガイドライン等	有無
ＲＭＰ	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	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

ゼスラン錠　　：ゼスラン®錠 3mg
ゼスラン小児用シロップ：ゼスラン®小児用シロップ 0.03%
ゼスラン小児用細粒　：ゼスラン®小児用細粒 0.6%

(2) 洋名

ゼスラン錠　　：Zesulan® Tablets
ゼスラン小児用シロップ：Zesulan® Syrup for Pediatric
ゼスラン小児用細粒　：Zesulan® Fine Granules for Pediatric

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

メキタジン（JAN）

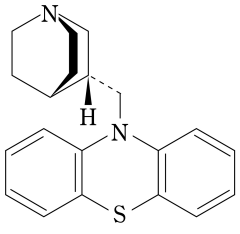
(2) 洋名（命名法）

Mequitazine（r-INN）

(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：$C_{20}H_{22}N_2S$
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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

記号番号：LM209（治験番号）

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。
本品は光によって徐々に着色する。

(2) 溶解性

各種溶媒に対する溶解性

溶　媒	溶媒量（mL）注)	日局表現
クロロホルム	0.97	極めて溶けやすい
メタノール	6.66	溶けやすい
n-ブタノール	2.82	溶けやすい
ベンゼン	5.14	溶けやすい
氷酢酸	3.60	溶けやすい
エタノール	16.72	やや溶けやすい
アセトン	20.80	やや溶けやすい
酢酸エチル	22.12	やや溶けやすい
エーテル	57.66	やや溶けにくい
石油エーテル	408.56	溶けにくい
水	10,000 以上	ほとんど溶けない

注) 1 g を溶かすのに要する溶媒量　　（測定温度：20±5℃）

各種 pH 溶液に対する溶解性

溶　媒	溶媒量（mL）注)	日局表現
日局第 1 液	69.94	やや溶けにくい
日局第 2 液	10,000 以上	ほとんど溶けない
pH2.0	60.16	やや溶けにくい
pH3.0	2118.16	極めて溶けにくい
pH5.0	4159.72	極めて溶けにくい
pH7.0	10,000 以上	ほとんど溶けない
pH8.0	10,000 以上	ほとんど溶けない
pH10.0	10,000 以上	ほとんど溶けない

注) 1 g を溶かすのに要する溶媒量　　（測定温度：20±5℃）

(3) 吸湿性

相対湿度 40～92%の条件下気密容器（デシケーター）、遮光下で 30 日間保存した結果、吸湿性を示さなかった。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：146～150℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa：10～12

(6) 分配係数

水層（pH）	クロロホルム層/水層
2.00 注 1)	0.36
3.03 注 2)	0.31
4.00 注 1)	4.55
5.00 注 2)	6.34
6.00 注 1)	319.00
6.99 注 2)	71.7
8.90 注 2)	183.00

（測定温度：25℃）

注 1) メキタジン 0.015 mM、22℃、5 分間

注 2) メキタジン 0.025 mg/mL、23～24℃、20 分間

分配率は酸性側で小さく、アルカリ性側で極めて大きかった。

(7) その他の主な示性値

吸収極大及び分子吸光係数：$E^{1\%}_{1cm}$（256 nm）：992.7±13.2

（乾燥後、0.01 g、エタノール、100 mL）

〔日局一般試験法吸光度測定法〕

旋光度：旋光性は示さなかった。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験の種類		保存条件	保存形態	保存期間	結　果
長期保存試験		室温	遮光下、開放、気密（褐色規格びん）	36 ヵ月	規格内
苛酷試験	温度	45℃	遮光下、開放、気密（褐色規格びん）	6 ヵ月	
		65℃	遮光下、開放、気密（褐色規格びん）	6 ヵ月	
	湿度	30℃ 80%RH	遮光下、開放、気密（褐色規格びん）	6 ヵ月	規格内
		30℃ 90%RH	遮光下、開放、気密（褐色規格びん）	6 ヵ月	
	光	太陽光下	遮光下、密閉（無色透明シャーレ）	積算照度 400 ラングリー	規格内
			非遮光下、密閉（無色透明シャーレ）		経時的に着色し、積算照度 80 ラングリーで規格外となった

試験の種類		保存条件	保存形態	保存期間	結　　果
苛酷試験	光	人工光線下	遮光下、密閉（無色透明シャーレ）	300 時間	規格内
			非遮光下、密閉（無色透明シャーレ）		経時的に着色し、100 時間後に規格外となった
		室内散光下	遮光下、密閉（無色透明シャーレ）	24 ヵ月	規格内
			非遮光下、密閉（無色透明シャーレ）	12 ヵ月	
	溶液（0.1 w/v%）	室温	遮光下、密封	15 日間	pH2.0 以下で経時的に着色
		65℃	遮光下、密封	15 日間	pH6.0 以下で経時的に着色
					pH2.0 以下で分解物の生成

測定項目：性状、紫外吸収スペクトル、定量、類縁物質他

反応生成物

(1) 溶液中の分解物（pH：1.2、2.0、65℃15 日間）

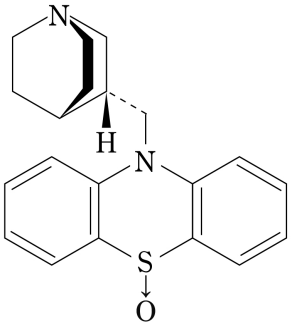
メキタジン-S-オキサイド（a）

(2) 光分解物（太陽光下、400 ラングリー注)）

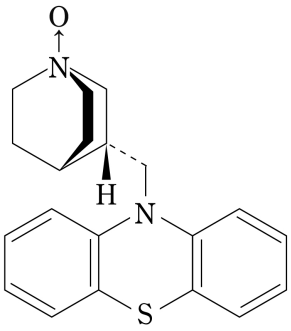
メキタジン-N-オキサイド（b）

注) 1 ラングリー＝ 1〔cal/cm²〕＝ 69.77 mW･min/cm²

(a)



(b)



3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：日局「メキタジン」の確認試験法による。

定量法：日局「メキタジン」の定量法による。

Ⅳ. 製剤に関する項目

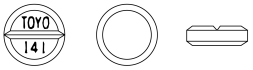
1. 剤形

(1) 剤形の区別

ゼスラン錠　　：白色・片面割線入りの素錠
ゼスラン小児用シロップ：液剤（シロップ剤）
ゼスラン小児用細粒　　：散剤（細粒）

(2) 製剤の外観及び性状

ゼスラン錠：

外形	色調	直径	厚さ	質量
表面　裏面　側面 	白　色	8.0 mm	2.6 mm	170 mg

ゼスラン小児用シロップ：

性　状	味	におい
無色～微黄色の澄明な濃稠の液	甘い	芳香がある

ゼスラン小児用細粒：

性　状	味	におい
白色～微黄白色の散剤（細粒）	甘い	芳香がある

(3) 識別コード

ゼスラン錠：TOYO 141（錠剤に刻印表示及び PTP シートの裏面に表示）

(4) 製剤の物性

ゼスラン錠：硬度：3.5 kgf 以上

ゼスラン小児用シロップ：比重：d_{20}^{20} ：約 1.23
pH ：5.6～6.1
粘度：12.5～14.5 mm^2/s（第 1 法、20℃）

ゼスラン小児用細粒：粒度：18 号ふるい通過量 100%
30 号ふるい残留量 5%以下
200 号ふるい通過量 10%以下

(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

ゼスラン錠

販売名	ゼスラン錠 3mg
有効成分	1 錠中 日局　メキタジン　3 mg
添加剤	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、カルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム

ゼスラン小児用シロップ

販売名	ゼスラン小児用シロップ 0.03%
有効成分	1 mL 中 日局　メキタジン　0.3 mg
添加剤	D-ソルビトール、無水クエン酸、無水リン酸一水素ナトリウム、β-シクロデキストリン、無水エタノール、香料

ゼスラン小児用細粒

販売名	ゼスラン小児用細粒 0.6%
有効成分	1 g 中 日局　メキタジン　6 mg
添加剤	D-マンニトール、タルク、ヒプロメロース、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、香料、バニリン、エチルバニリン、アラビアゴム末、デキストリン

(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

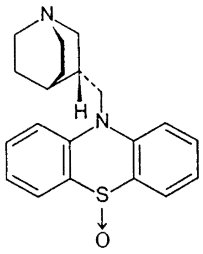
該当しない。

4. 力価

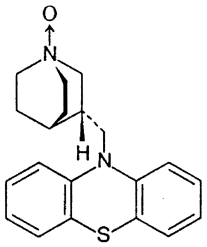
該当しない。

5. 混入する可能性のある夾雑物

Ⅲ.2.「有効成分の各種条件下における安定性」の項参照。



メキタジン-S-オキサイド



メキタジン-N-オキサイド

6. 製剤の各種条件下における安定性

ゼスラン錠：

試験の種類		保存条件	保存形態	保存期間	結果[注2)]
長期保存試験		室温	商品包装[注1)]	60 ヵ月	規格内
苛酷試験	温度	45℃	着色 PTP	6 ヵ月	規格内
		65℃	着色 PTP	6 ヵ月	規格内
	湿　度	30℃ 80%RH	着色 PTP	6 ヵ月	規格内
			開放		表面の光沢がなくなり膨張したが、全ての項目で規格内。また、参考測定項目である硬度の低下が認められた。
		30℃ 90%RH	着色 PTP	5 週間	規格内。参考測定項目である硬度の低下及び摩損度の増加が認められた。
			開放		表面の光沢がなくなり膨張したが、全ての項目で規格内。また、参考測定項目である硬度の低下及び摩損度の増加が認められた。
	光	太陽光下	着色 PTP	150 ラングリー	積算照度 90 ラングリーで着色し規格外。
			密閉		積算照度 30 ラングリーで着色し規格外。また、参考試験項目である TLC で分解物のスポットが認められた。
		人工 光線下	着色 PTP	300 時間	規格内
			密閉		50 時間より着色し規格外。
		室内 散光下	着色 PTP	24 ヵ月	規格内
			密閉	12 ヵ月	3 ヵ月目より着色し規格外。

注 1) 着色 PTP、防湿袋に封入後、紙ケースに納入

注 2) 測定項目：性状、色差、吸湿度、硬度、摩損度、崩壊性、溶出性、TLC、定量法（左記のほか、光は HPLC による分解物の検索、定量法）

ゼスラン小児用シロップ：

試験の種類		保存条件	容　量	保存形態	保存期間	結果[注1)]
長期保存試験		室温	500 mL	遮光ガラスびん／紙箱[注2)]	39 ヵ月	類縁物質の増加が認められたが、全ての項目で規格内。
苛酷試験	温度	40℃ 75%RH	500 mL	遮光ガラスびん／紙箱[注2)]	6 ヵ月	類縁物質の増加が認められたが、全ての項目で規格内。
			100 mL			
		65℃	500 mL	遮光ガラスびん／紙箱[注2)]	3 ヵ月	着色により規格外。また、類縁物質の増加が認められたが、外観以外の項目は規格内。
	光	室温散光下 (500 lx)	500 mL	遮光ガラスびん	3 ヵ月	類縁物質の増加が認められたが、全ての項目で規格内。
				非遮光ガラスびん		類縁物質の増加が認められたが、全ての項目で規格内。

注 1) 測定項目：性状、におい、味、pH、粘度、定量法、純度試験（類縁物質）
注 2) 商品包装形態

ゼスラン小児用細粒：

試験の種類		保存条件	保存形態	保存期間	結果[注1)]
苛酷試験	温度	60℃	ポリエチレンボトル包装品(気密)	1 ヵ月	類縁物質の増加が認められたが、全ての項目で規格内。
	湿度	30℃、75%RH	ポリエチレンボトル包装品(開放)	1 ヵ月	規格内
	光	D-65 蛍光ランプ (3000 Lx)	プラスチック製シャーレ(開放)	120 万 Lx･hr	類縁物質の増加が認められたが、全ての項目で規格内。
加速試験		40℃、75%RH	ポリエチレンボトル包装品(気密)	6 ヵ月	類縁物質の増加が認められたが、全ての項目で規格内。

注 1) 測定項目：性状、におい、味、pH、粘度、定量法、純度試験（類縁物質）

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）

ゼスラン錠　　：該当しない。
ゼスラン小児用シロップ：https://akp-pharma-digital.com/products/compound
「ゼスランシロップ配合変化一覧表」を参照。
ゼスラン小児用細粒　：https://akp-pharma-digital.com/products/compound
「ゼスラン小児用細粒 0.6%配合変化一覧表」を参照。

9. 溶出性

ゼスラン錠　　：日局「メキタジン錠」の溶出性による。
ゼスラン小児用細粒：日本薬局方外医薬品規格メキタジン細粒溶出性(a)により試験を行うとき、適合する。

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

ゼスラン錠：
100 錠［10 錠（PTP）×10］
500 錠［10 錠（PTP）×50］
1,000 錠［10 錠（PTP）×100］
1,400 錠［14 錠（PTP）×100］
3,000 錠［10 錠（PTP）×300］
500 錠［瓶、バラ］
ゼスラン小児用シロップ：
100mL［瓶、液ダレ防止キャップ 1 個添付］
500mL［瓶、液ダレ防止キャップ 1 個添付］
ゼスラン小児用細粒：
100g［瓶、乾燥剤入り］

(3) 予備容量

該当しない。

(4) 容器の材質

ゼスラン錠　：・PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔
　　・バラ：褐色ガラス瓶
ゼスラン小児用シロップ：遮光ガラス瓶
ゼスラン小児用細粒　：乳白色ポリエチレン瓶

11. 別途提供される資材類

該当しない。

12. 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

ゼスラン錠：

〈気管支喘息〉

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。

ゼスラン小児用シロップ：

〈気管支喘息〉

通常小児1回メキタジンとして0.12 mg/kg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）〉

通常小児1回メキタジンとして0.06 mg/kg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。

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	シロップ1回投与量 mL （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、皮膚疾患に伴うそう痒
1歳以上　2歳未満	8 kg以上12 kg未満	4 mL（1.2 mg）	2 mL（0.6 mg）
2歳以上　4歳未満	12 kg以上17 kg未満	6 mL（1.8 mg）	3 mL（0.9 mg）
4歳以上　7歳未満	17 kg以上25 kg未満	8 mL（2.4 mg）	4 mL（1.2 mg）
7歳以上 11歳未満	25 kg以上40 kg未満	12 mL（3.6 mg）	6 mL（1.8 mg）
11歳以上 16歳未満	40 kg以上	20 mL（6.0 mg）	10 mL（3.0 mg）

ゼスラン小児用細粒：

〈気管支喘息〉

通常小児 1 回メキタジンとして 0.12 mg/kg 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）〉

通常小児 1 回メキタジンとして 0.06 mg/kg 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。

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	細粒 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、皮膚疾患に伴うそう痒
1 歳以上　2 歳未満	8 kg 以上 12 kg 未満	0.2 g（1.2 mg）	0.1　g（0.6 mg）
2 歳以上　4 歳未満	12 kg 以上 17 kg 未満	0.3 g（1.8 mg）	0.15 g（0.9 mg）
4 歳以上　7 歳未満	17 kg 以上 25 kg 未満	0.4 g（2.4 mg）	0.2　g（1.2 mg）
7 歳以上 11 歳未満	25 kg 以上 40 kg 未満	0.6 g（3.6 mg）	0.3　g（1.8 mg）
11 歳以上 16 歳未満	40 kg 以上	1　g（6.0 mg）	0.5　g（3.0 mg）

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

「V.5.(3)用量反応探索試験」の項参照。

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

ゼスラン錠：一般臨床試験及び二重盲検比較試験を含む臨床試験成績の概要は以下のとおりである[1, 2, 4〜14]。

疾患名	有効率（有効以上）
気管支喘息[注)]	39.9%（81/203）
アレルギー性鼻炎	54.8%（244/445）
じん麻疹	69.5%（228/328）
湿疹・皮膚炎群	62.6%（122/195）
皮膚そう痒症	71.1%（59/83）

注）改善率（中等度改善以上）

ゼスラン小児用シロップ：メキタジンシロップによる一般臨床試験及び二重盲検比較試験を含む臨床試験成績の概要は以下のとおりである[15~20]。

疾患名	改善率（中等度改善以上）
気管支喘息	75.4%（92/122）
アレルギー性鼻炎	59.1%（81/137）
じん麻疹	100%（13/13）
湿疹・皮膚炎群	80.7%（88/109）

ゼスラン小児用細粒：該当資料なし。

(1) 臨床データパッケージ

該当しない。

(2) 臨床薬理試験

ゼスラン錠：健常成人男性9名に対して本剤を6、12、24 mg[注)]を各3例ずつ単回 投与した結果、6、12 mg 投与群の各1例に眠気の訴えを認めたが、ともに症状は軽度であった。各群で脈拍数の減少を認めたが、血圧、心電図測定には異常を認めなかった[21]。

注) ゼスラン錠の用法・用量は（〔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、年令、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）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、年令、症状に応じて適宜増減する。）である。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：該当資料なし。

(3) 用量反応探索試験

ゼスラン錠：

1) 気管支喘息[2)]

気管支喘息219例を対象とし封筒法により1日6 mg[注)]及び12 mg の2用量で比較試験を行った。全般改善度は“中等度改善以上”で12 mg/日投与群33.7%、6 mg/日投与群28.4%（$p < 0.05$）、全般的有用度は“かなり有用以上”で12 mg/日投与群32.6%、6 mg/日投与群27.1%（$p < 0.05$）と、12 mg/日投与群の方が6 mg/日投与群よりも優れ、有意差が認められた。よって気管支喘息の至適投与量は1日12 mg と判断された。

注) ゼスラン錠の用法・用量は（〔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、年令、症状に応じて適宜増減する。）である。

2) アレルギー性鼻炎

該当資料なし。

3) じん麻疹など

該当資料なし。

ゼスラン小児用シロップ：

1) 気管支喘息[15)]

小児気管支喘息 109 例に対するオープン臨床試験による体重 1 kg 当たりメキタジンシロップ 0.06 mg、0.12 mg、0.24 mg 及び 0.48 mg の 4 用量[注)]での検討により、小児気管支喘息に対する至適投与量は、成人気管支喘息に対する成人用量（1 日 12 mg、体重 50 kg 換算で 0.24 mg/kg）と同量の 0.24 mg/kg と判断された。

2) アレルギー性鼻炎[17)]

小児通年性アレルギー性鼻炎 175 例に対する封筒法による体重 1 kg 当たりメキタジンシロップ 0.06 mg、0.12 mg 及び 0.24 mg の 3 用量[注)]での検討により、小児アレルギー性鼻炎に対する至適投与量は、成人アレルギー性鼻炎に対する成人用量（1 日 6 mg、体重 50 kg 換算で 0.12 mg/kg）と同量の 0.12 mg/kg と判断された。

3) じん麻疹など

該当資料なし。

注) ゼスラン小児用シロップの用法・用量は（〔気管支喘息の場合〕通常小児 1 回メキタジンとして 0.12 mg/kg 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）の場合〕通常小児 1 回メキタジンとして 0.06 mg/kg 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。）である。

ゼスラン小児用細粒：該当資料なし。

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

無作為化並行用量反応試験

ゼスラン錠：

①気管支喘息

該当資料なし。

②アレルギー性鼻炎

該当資料なし。

③じん麻疹など[11)]

慢性じん麻疹計 133 例に対し 1 日用量 2、6、10 mg（1 回用量 1、3、5 mg）[注)]投与群に分けて二重盲検試験を行った結果、有効率は“有効以上”で 2 mg 投与群 46.6%、6 mg 投与群 67.4%、10 mg 投与群 71.4%であり、2、6 mg 投与群間並びに 2、10 mg 投与群間に有意差が認められた（$p < 0.05$）。

注) ゼスラン錠の用法・用量は（〔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）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、年令、症状に応じて適宜増減する。）である。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：該当資料なし。

比較試験

ゼスラン錠：

①〈気管支喘息〉

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）[22)]

気管支喘息患者 211 例を対象にメキタジン 6 mg 又はケトチフェン 1 mg 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。

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）

②〈アレルギー性鼻炎〉

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）[12)]

通年性鼻アレルギー患者 185 例を対象にメキタジン 3 mg 又はクレマスチン 1 mg 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。

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）

③〈蕁麻疹、皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）〉

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）[13)]

慢性蕁麻疹の患者 297 例を対象にメキタジン 3 mg 又はクレマスチン 1 mg 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。

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）

ゼスラン小児用シロップ：

①〈気管支喘息〉

国内臨床試験（オキサトミドを対照とした比較試験）[16]

15歳以下の小児気管支喘息患者201例を対象に、メキタジンシロップ（0.20～0.31 mg/kg/日[注)]）又はオキサトミドドライシロップ（0.83～1.30 mg/kg/日）を1日2回6週間経口投与した結果、改善例数（中等度改善以上）は下表の通りであった。副作用は、メキタジンシロップ群では認められなかった。

投与群	有効性		安全性	
	解析対象例数（187例）	改善例数（%）（中等度改善以上）	解析対象例数（192例）	副作用発現例数（%）
メキタジン	88	67（76.1）	91	0（0）
オキサトミド	99	55（55.6）	101	2（2.0）

②〈アレルギー性鼻炎〉

国内臨床試験（フマル酸クレマスチンシロップとの比較試験）[18]

15歳以下の通年性アレルギー性鼻炎患者203例を対象に、メキタジンシロップ[注)]又はクレマスチンシロップを1日2回1週間経口投与した結果、改善例数（中等度改善以上）は下表の通りであった。副作用は、メキタジンシロップ群では認められなかった。

投与群	有効性		安全性	
	解析対象例数（181例）	改善例数（%）（中等度改善以上）	解析対象例数（199例）	副作用発現例数（%）
メキタジン	94	52（55.3）	101	0（0）
クレマスチン	87	39（44.8）	98	1（1.0）

③じん麻疹など

該当資料なし。

注) ゼスラン小児用シロップの用法・用量は（〔気管支喘息の場合〕通常小児1回メキタジンとして0.12 mg/kg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）の場合〕通常小児1回メキタジンとして0.06 mg/kg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。）である。

ゼスラン小児用細粒：該当資料なし。

2）安全性試験

ゼスラン錠：

①気管支喘息[4, 5]

気管支喘息に対する長期投与試験の結果、安全性については追加調査症例を加えた63例中1例（1.6%）に軽度の副作用が認められたのみであったことから、長期投与が可能な薬剤であると推察された。

②アレルギー性鼻炎
該当資料なし。

③じん麻疹など[8)]
慢性じん麻疹3例、湿疹・皮膚炎群7例にメキタジン6 mg/日が28～41日間投与され、「有効」以上の有効率は慢性じん麻疹100%、湿疹・皮膚炎群57.1%であった。
安全性については、2例に副作用が認められたが、投与中止に至る程度のものではなく、減量又は継続投与により症状は消失した。また、10例について投与前後に臨床検査が実施されたが全例に異常は認められなかった。

ゼスラン小児用シロップ：
小児気管支喘息患児40例についてメキタジン0.12 mg/kg・分1を24～48週間の継続投与が実施された。最終全般改善度の改善率は67.5%、副作用、臨床検査値の異常変動例は全く認められなかった[23)]。

ゼスラン小児用細粒：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
ゼスラン錠：該当資料なし。
ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：再審査期間中に実施。

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. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

(1) 抗ヒスタミン剤：プロメタジン塩酸塩、アリメマジン酒石酸塩、クロルフェニラミンマレイン酸塩、クレマスチンフマル酸塩など。

(2) 抗アレルギー剤：アゼラスチン塩酸塩、オキサトミド、フェキソフェナジン塩酸塩、エバスチン、オロパタジン塩酸塩、セチリジン塩酸塩、ロラタジンなど。

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

作用部位：特定できない。

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

1) ケミカルメディエーター拮抗作用[24~27]

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、ブラディキニン、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 $F_{2\alpha}$ によるモルモット摘出肺実質収縮を抑制する（*in vitro*）。

②抗ヒスタミン作用：ヒスタミン及びメタコリンによる致死を用量依存的に防禦し、ヒスタミン致死を長時間防禦する（マウス）。

2) ケミカルメディエーター遊離抑制作用[26, 27]

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*）、Ca^{2+}流入阻害（*in vitro*）等の関与が考えられている。

3) 抗アレルギー作用[25, 28]

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（*in vitro*）。

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（ラット）。

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（モルモット）。

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（モルモット）。

(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

ゼスラン錠：

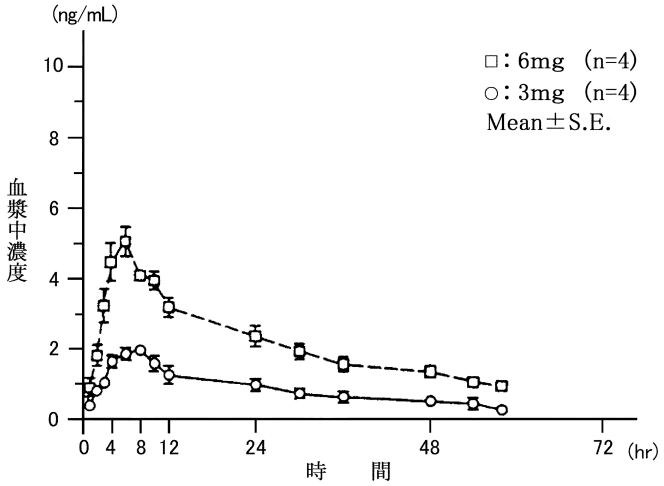
1) 単回投与（健康成人）[29)]

健康成人に 3 mg（n=4）又は 6 mg（n=4）を食後 2 時間単回経口投与した場合の薬物動態学的パラメータは以下の通りであった。

投与量 (mg)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$AUC_{0-\infty}$ (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（n=4、Mean±S.E.）

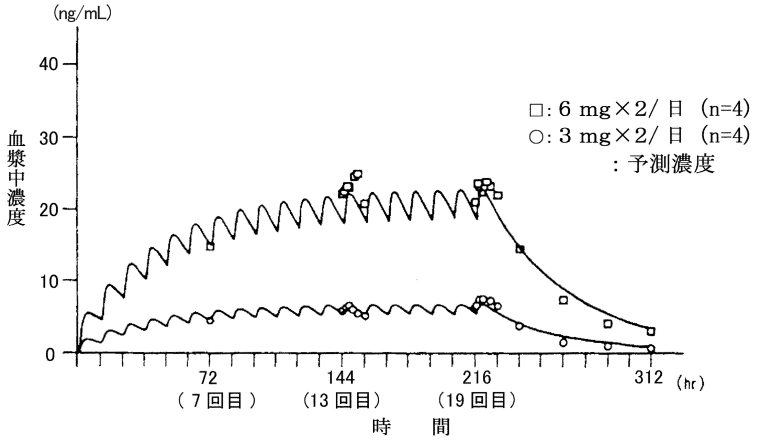
単回投与時（食後）の血漿中濃度



2) 反復投与（健康成人）[29)]

健康成人に 3 mg（n=4）又は 6 mg（n=4）を食後連続経口投与した場合、血漿中メキタジン濃度は投与 7 日目までに定常状態に達し、その血漿中濃度は単回投与時の最高血漿中濃度の 3～4 倍であった。また、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。

反復投与時の血漿中未変化体濃度の推移



ゼスラン小児用シロップ：

1) 単回投与(小児患者)

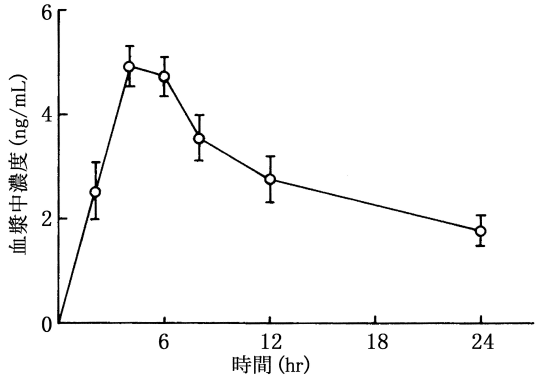
8～14 歳（体重 25～49 kg）の気管支喘息患児 7 例にゼスランシロップ 0.12 mg/kg を朝食後経口投与した時、血漿中濃度は投与後平均 4.86 時間で 5.1 ng/mL の最高濃度に達し、以後徐々に減少した。生物学的半減期は平均 23.3 時間であった[23]。

C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$AUC_{0\sim24}$ (ng·hr/mL)	$T_{1/2}$ (α) (hr)	$T_{1/2}$ (β) (hr)
5.10±0.41	4.86±0.40	67.04±8.56	5.81±1.19	23.3±3.59

Cmax、Tmax、$AUC_{0\sim24}$ は実測値、$T_{1/2}$ (α)、$T_{1/2}$ (β) は 2-コンパートメントモデルより算出

(n=7、Mean±S.E.)

単回投与時の血漿中濃度の推移（n=7）



(3) 中毒域

該当資料なし。

(4) 食事・併用薬の影響 [29]

体内動態に及ぼす食事の影響は少ないものと考えられる。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法 [29)]

4 例の健康成人男子に対し、メキタジン 3 mg 及び 6 mg を食後経口投与した後の血漿中メキタジン濃度測定データ 15 点を収集し、2-コンパートメントモデルに従い、薬動力学的パラメータを算出した。

(2) 吸収速度定数

ゼスラン錠 [29)] : Ka : 0.332 hr^{-1}〔健康成人（n=4）に食後 3 mg 経口投与〕
0.445 hr^{-1}〔健康成人（n=4）に食後 6 mg 経口投与〕
ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：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

該当しない。

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

吸収部位：小腸と考えられる。
幼若ラット（3 週齢）に ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与した場合、血液中放射能は約 4 時間後に最高濃度に達し（0.2 μg/mL）、その後α 相 4.2 時間、β 相 27 時間の半減期で消失した [30)]。

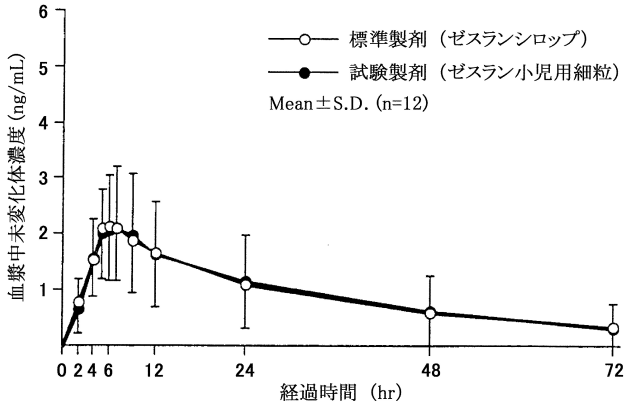
バイオアベイラビリティ
ゼスラン錠：該当資料なし。
ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：
健康成人（n=12）にいずれもメキタジンとして 6 mg を空腹時単回経口投与した場合、ゼスランシロップとゼスラン小児用細粒の血漿中未変化体濃度はほぼ

同様の推移を示し、薬物動態パラメータについても同様の値を示した両製剤は生物学的に同等であると判断された[31]。

製　剤	C_{max} (ng/mL)	AUC_{72} (ng·hr/mL)	T_{max} (hr)	K_{el} (hr^{-1})	$T_{1/2}$ (hr)	AUC_{∞} (ng·hr/mL)	MRT (hr)
ゼスラン小児用細粒	2.232 ±1.085	67.518 ±48.956	6.25 ±1.22	0.03470 ±0.01332	24.11 ±12.19	86.477 ±73.826	35.79 ±17.89
ゼスラン小児用シロップ	2.256 ±0.877	66.425 ±45.880	5.92 ±0.90	0.03596 ±0.01579	23.60 ±11.30	84.397 ±68.456	35.91 ±17.04

（n=12、Mean±S.D.）

投与薬剤別血漿中未変化体濃度の推移



5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

ラットに ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口及び静脈内投与したときの脳内濃度は測定臓器中最も低い値を示し、血液-脳関門はほとんど通過しない[32]。

(2) 血液－胎盤関門通過性

妊娠ラットに ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与したとき、胎仔 1 匹への移行率は最大取り込み時において 0.02%で、血液-胎盤関門はほとんど通過しない[33]。

(3) 乳汁への移行性

ラットにおける乳汁を介しての乳仔（12 匹）への移行は ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与 24 時間後で乳仔 1 匹当たり 0.039%であったとの報告がある[33]。

(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

1) ラットに ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与したときの組織内濃度は、ほとんどの組織で投与後 1～4 時間で最高に達し、その順位は 1 時間値で小腸＞胃＞肺・肝＞腎・副腎・膵・脾＞大腸・下垂体・心・子宮の順で、中枢神経系への分布は低い[33, 34]。

2) 幼若ラット（3 週齢）に ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与した場合、放射能の分布は肺、肝、副腎に高く、肺中の未変化体濃度は血漿中の約 50 倍（4 時間後）であった [30]。

(6) 血漿蛋白結合率

1) ラットに ^{14}C-メキタジンを経口投与したときの血漿蛋白結合率は約 60%、静脈内投与したときの血漿蛋白結合率は約 80%であった [33]。

2) 幼若ラット（3 週齢）に ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与したときの 4 時間後の血漿蛋白結合率は 31.5%であった（*in vivo*）。^{14}C-メキタジンを 0.05～1 μg/mL になるよう添加した際のメキタジンの幼若ラット（3 週齢）に対する血漿蛋白結合率は 71～75%であった（*in vivo*）[30]。

6. 代謝

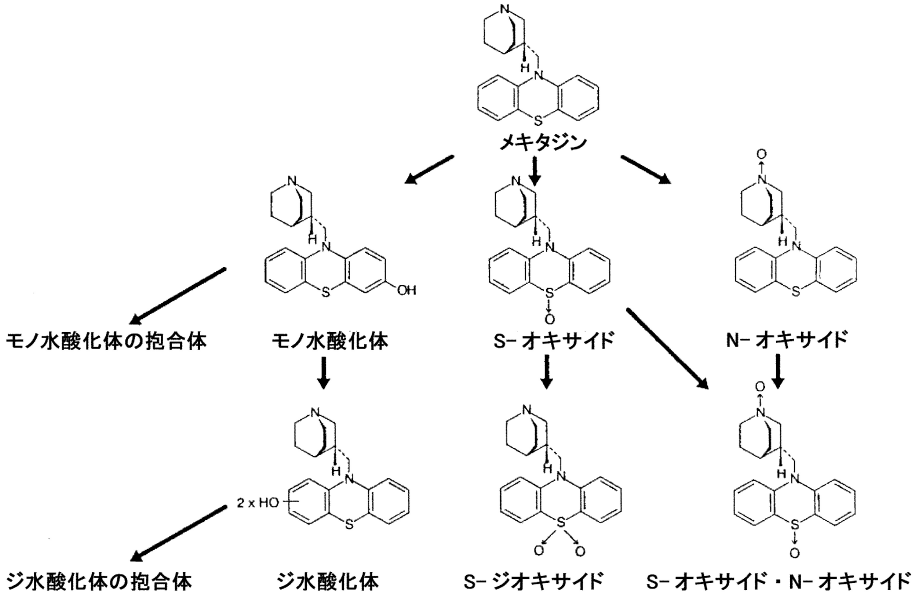
(1) 代謝部位及び代謝経路

ゼスラン錠：健康成人（n=6）にゼスラン錠を 15 mg 経口投与したときの尿中排泄量は、投与量の約 20%であった。尿、血漿から未変化体のほか代謝物としてモノ水酸化体、S-オキサイド、N-オキサイド及び抱合体が確認されている [35]。

ゼスラン小児用シロップ：

小児気管支喘息患児（n=7）にゼスランシロップ 0.12 mg/kg を経口投与したときの尿中排泄量は、投与量の約 20%であった。尿、血漿から未変化体のほか代謝物としてモノ水酸化体、S-オキサイド、N-オキサイド及び抱合体が確認されている [23]。

メキタジンの推定代謝経路



ラットに ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与したとき、尿、血漿などからモノ水酸化体、ジ水酸化体、スルフォン、N-オキサイド、S-オキサイド及び抱合体が確認されている。その主な割合は、糞中では未変化体が 36～42%、モノ水酸化体の抱合体が 30～34%、尿中では抱合体が 36～73%、胆汁中では抱合体が 77～81%、血漿中では抱合体 40～58%であった[36]。

(2) 代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率[37]

メキタジンは主に CYP2D6 により代謝される。

(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

該当資料なし。

7. 排泄

1) 排泄部位及び経路

尿中及び糞中（推定）

ラットに ^{14}C-メキタジン 5 mg/kg を経口投与したとき、48 時間までに投与量の約 24%が尿中へ、約 67%が糞中に排泄され、また 21 日間の連続投与でも生体内蓄積性はみられない[33, 32, 34]。

2) 排泄率

ゼスラン錠：健康成人（n=6）にゼスラン錠 15 mg を経口投与したとき 48 時間までに投与量の約 20%が尿中に排泄される[35]。

ゼスラン小児用シロップ：

小児気管支喘息患児（n=7）にゼスランシロップ 0.12 mg/kg を経口投与したとき投与後 24 時間までに尿中に排泄された未変化体は 0.46%であり、代謝物を含めた総排泄率は 12.6%であった[23]。

メキタジンの尿中未変化体及び代謝物の尿中排泄率（%）

メキタジン	メキタジン N-オキサイド	メキタジン モノ水酸化体	メキタジン S-オキサイド	抱合体	合計
0.46±0.11	0.11±0.02	2.11±0.92	1.07±0.36	8.86±1.86	12.62±3.14

（n=7、Mean±S.E.）

3) 排泄速度

「Ⅶ.6.(2)排泄率」参照。

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

該当しない。

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

ゼスラン錠：

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。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：

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 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

ゼスラン錠：

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。

ゼスラン小児用シロップ：

8. 重要な基本的注意

8.1 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、高年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。

8.2 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。

＜解説＞

8.1 本剤には中枢神経抑制作用があり、眠気を催すことがあるため、小児用製剤であることから危険を伴う機械操作・遊戯等が想定されるため、日常生活態度について注意を喚起している。

8.2 本剤は小児用製剤であり、一般に自覚症状を訴える能力に欠ける年少児が対象であることを考慮して、処方に際しては、保護者に対し患児の日常生活態度を十分観察するよう注意を促している。

ゼスラン小児用細粒：

8. 重要な基本的注意

8.1 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、高年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。

8.2 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。

＜解説＞

8.1 本剤には中枢神経抑制作用があり、眠気を催すことがあるため、小児用製剤であることから危険を伴う機械操作・遊戯等が想定されるため、日常生活態度について注意を喚起している。

8.2 本剤は小児用製剤であり、一般に自覚症状を訴える能力に欠ける年少児が対象であることを考慮して、処方に際しては、保護者に対し患児の日常生活態度を十分観察するよう注意を促している。

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**
> 9.2.1 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。

＜解説＞

ゼスラン錠：ゼスラン錠の気管支喘息の承認時迄の調査において、18 週以上長期投与された 63 例において、BUN が検査された 53 例のうち臨床検査値異常として BUN 上昇が 2 例に認められた（19.4→22.2 mg/dL、15.8→21.9 mg/dL）。いずれの症例も担当医より本剤との因果関係は否定されたが慎重を期して記載した。なお、本剤の使用成績調査において、腎疾患合併患者 143 例（18,552 例中）に使用されたが、腎障害あるいは腎機能異常の副作用が発現したとの指摘はない。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：ゼスランシロップ承認時迄の調査で長期投与された 51 例（そう痒性皮膚疾患：8～14 週、11 例、気管支喘息：6～12 ヵ月、40 例）において副作用の発現あるいは臨床検査値の異常変動は認められていない[19, 23]。なお、ゼスランシロップの使用成績調査において、腎障害合併患者 11 例（5,164 例中）に使用されたが、腎障害あるいは腎機能異常の副作用が発現したとの指摘はない。

(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。

＜解説＞
妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。なお、ゼスラン錠の使用成績調査において 13 例の妊婦に投与されたが、その妊婦及び新生児には特に異常が発現したとの指摘はない。また、動物実験にて特記すべき異常所見は認められていない。[「Ⅸ.2.(5)生殖発生毒性試験」の項参照]

(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 [33]、ヒトの乳汁移行に関する報告はない。なお、ゼスラン錠の使用成績調査において 24 例の授乳婦に投与されたが、その授乳婦及び乳児に副作用が発現したとの指摘はない。[「Ⅶ.5.(3)乳汁への移行性」の項参照]

(7) 小児等

ゼスラン錠：

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。

＜解説＞
ゼスラン錠の使用成績調査において 15 才未満の小児 2,110 例（18,552 例中）に投与され、そのうち 17 例（0.81%）に眠気、倦怠感等の副作用が発現した。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：

9.7 小児等
低出生体重児及び新生児を対象とした臨床試験は実施していない。

＜解説＞
ゼスランシロップの使用成績調査において 1 歳未満の乳児 643 例（5,390 例中）に投与され、そのうち 6 例（0.93%）に眠気等の副作用が発現した。

(8) 高齢者

ゼスラン錠：

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。

＜解説＞
使用成績調査において 65 歳以上の高齢者 2,166 例（15,256 例中）に投与され、そのうち 71 例（3.28%）に眠気、口渇、胃不快感等の副作用が発現した。また、口渇等の胃腸系障害の発現頻度が高齢者では高かった。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：設定されていない。

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

ゼスラン錠：

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。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：

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		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、口渇、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）発現頻度は使用成績調査を含む。

＜解説＞

光毒性及び光感作性については、健常成人 20 例においてメキタジン 6 mg/日の連続 2 週間内服投与による紫外線等に対する影響を検討した結果、内服量が少ないので何らの光毒性反応は認められなかった[38]。

項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

ゼスラン錠[注]副作用発現頻度一覧表

	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）		気管支喘息		計
	承認時迄の調査	承認時以降の調査（昭和63年10月6日迄）	承認時迄の調査	承認時以降の調査（平成6年3月29日迄）	
調査症例数(1)	1,124	23,203	484	5,357	30,168
副作用発現症例数(2)	200	601	45	159	1,005
副作用発現件数(3)	276	716	57	208	1,257
副作用発現症例率((2)／(1)×100)	17.79%	2.59%	9.30%	2.97%	3.33%
副作用の種類	副作用発現件数（%）				
皮膚・皮膚付属器障害	**3 (0.27)**	**9 (0.04)**	**3 (0.62)**	**6 (0.11)**	**21 (0.07)**
発疹	2 (0.18)	8 (0.03)	1 (0.21)	4 (0.07)	15 (0.05)
じん麻疹	－	－	1 (0.21)	－	1 (0.003)
かゆみ	－	－	1 (0.21)	1 (0.02)	2 (0.01)
皮疹	－	－	1 (0.21)	－	1 (0.003)
皮膚炎	1 (0.09)	－	－	1 (0.02)	2 (0.01)
日光過敏症	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
中枢・末梢神経系障害	**4 (0.36)**	**42 (0.18)**	**1 (0.21)**	**12 (0.22)**	**59 (0.20)**
ろれつがまわらない	－	－	－	1 (0.02)	1 (0.003)
頭痛	1 (0.09)	8 (0.03)	－	1 (0.02)	10 (0.03)
頭重（感）	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
しびれ（感）	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
めまい	－	4 (0.02)	－	－	4 (0.01)
舌しびれ	－	1 (0.004)	－	1 (0.02)	2 (0.01)
口唇しびれ（感）	－	－	－	2 (0.04)	2 (0.01)
手指しびれ（感）	－	－	－	1 (0.02)	1 (0.003)
ふらふら（感）	3 (0.27)	29 (0.12)	1 (0.21)	7 (0.13)	40 (0.13)
視覚障害	－	－	**2 (0.41)**	**1 (0.02)**	**3 (0.01)**
調節障害	－	－	2 (0.41)	1 (0.02)	3 (0.01)
その他の特殊感覚障害	－	**3 (0.01)**	－	**1 (0.02)**	**4 (0.01)**
苦味	－	1 (0.004)	－	1 (0.02)	2 (0.01)
味覚異常	－	2 (0.01)	－	－	2 (0.01)
精神障害	**160 (14.23)**	**401 (1.73)**	**20 (4.13)**	**73 (1.36)**	**654 (2.17)**
眠気	160 (14.23)	401 (1.73)	20 (4.13)	73 (1.36)	654 (2.17)
消化管障害	**28 (2.49)**	**154 (0.66)**	**19 (3.93)**	**51 (0.95)**	**252 (0.84)**
嘔気	4 (0.36)	9 (0.04)	1 (0.21)	2 (0.04)	16 (0.05)
嘔吐	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
下痢	5 (0.44)	8 (0.03)	1 (0.21)	3 (0.06)	17 (0.06)
口内炎	－	1 (0.004)	－	1 (0.02)	2 (0.01)
口渇	9 (0.80)	74 (0.32)	16 (3.31)	35 (0.65)	134 (0.44)
胸やけ	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
食欲不振	3 (0.27)	8 (0.03)	－	2 (0.04)	13 (0.04)
舌炎	－	－	－	1 (0.02)	1 (0.003)
腹痛	1 (0.09)	4 (0.02)	－	－	5 (0.02)
胃不快感	5 (0.44)	38 (0.16)	－	6 (0.11)	49 (0.16)
胃痛	2 (0.18)	13 (0.06)	－	1 (0.02)	16 (0.05)
心窩部不快感	－	－	1 (0.21)	－	1 (0.003)
便秘	1 (0.09)	15 (0.06)	－	3 (0.06)	19 (0.06)

注）共同開発品目「ニポラジン錠」（アルフレッサファーマ株式会社）との合算である。

	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）		気管支喘息		計
	承認時迄の調査	承認時以降の調査（昭和63年10月6日迄）	承認時迄の調査	承認時以降の調査（平成6年3月29日迄）	
副作用の種類	副作用発現件数（%）				
肝臓・胆管系障害	－	**13 (0.06)**	－	**10 (0.19)**	**23 (0.08)**
AST上昇	－	9 (0.04)	－	9 (0.17)	18 (0.06)
ALT上昇	－	11 (0.05)	－	8 (0.15)	19 (0.06)
代謝・栄養障害	－	－	－	**2 (0.04)**	**2 (0.01)**
ALP上昇	－	－	－	2 (0.04)	2 (0.01)
心拍数・心リズム障害	**1 (0.09)**	**3 (0.01)**	－	**2 (0.04)**	**6 (0.02)**
心悸亢進	1 (0.09)	3 (0.01)	－	2 (0.04)	6 (0.02)
呼吸器系障害	**3 (0.27)**	**1 (0.004)**	**5 (1.03)**	**13 (0.24)**	**22 (0.07)**
去痰困難	－	1 (0.004)	5 (1.03)	13 (0.24)	19 (0.06)
咽頭痛	3 (0.27)	－	－	－	3 (0.01)
白血球・網内系障害	－	－	－	**3 (0.06)**	**3 (0.01)**
好酸球増多（症）	－	－	－	1 (0.02)	1 (0.003)
白血球増多（症）	－	－	－	2 (0.04)	2 (0.01)
血小板・出血凝血障害	－	**1 (0.004)**	－	－	**1 (0.003)**
血小板減少（症）	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
泌尿器系障害	－	**3 (0.01)**	**2 (0.41)**	**4 (0.07)**	**9 (0.03)**
排尿困難	－	3 (0.01)	2 (0.41)	4 (0.07)	9 (0.03)
女性生殖（器）障害	－	**1 (0.004)**	－	－	**1 (0.003)**
月経異常	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
一般的全身障害	**73 (6.49)**	**54 (0.23)**	**4 (0.83)**	**19 (0.35)**	**150 (0.50)**
顔面浮腫	2 (0.18)	2 (0.01)	－	－	4 (0.01)
下肢浮腫	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
胸内苦悶症	1 (0.09)	1 (0.004)	－	1 (0.02)	3 (0.01)
ピリピリ感	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
倦怠（感）	71 (6.32)	48 (0.21)	2 (0.41)	18 (0.34)	139 (0.46)
浮腫	－	－	2 (0.41)	－	2 (0.01)
ほてり	－	1 (0.004)	－	－	1 (0.003)
顔面潮紅	1 (0.09)	4 (0.02)	－	－	5 (0.02)

注）共同開発品目「ニポラジン錠」（アルフレッサファーマ株式会社）との合算である。

器官別（過敏症、肝臓等）の小計は、副作用発現件数の合計ではなく、器官別副作用発現症例数（%）とした。

ゼスランシロップ[注]副作用発現頻度一覧表

	承認時迄の調査	使用成績調査 (平成13年4月21日迄)	合　計
調査施設数	67	905	972
調査症例数 (1)	588	8,829	9,417
副作用発現症例数 (2)	6	46	52
副作用発現件数 (3)	6	53	59
副作用発現症例率 ((2)／(1)×100)	1.02%	0.52%	0.55%
副作用の種類	副作用発現件数（%）		
皮膚・皮膚付属器障害	**2 (0.34)**	**7 (0.08)**	**9 (0.10)**
じん麻疹	1 (0.17)	3 (0.03)	4 (0.04)
皮膚そう痒症	－	1 (0.01)	1 (0.01)
発疹	1 (0.17)	3 (0.03)	4 (0.04)
その他の特殊感覚障害	－	**1 (0.01)**	**1 (0.01)**
苦味	－	1 (0.01)	1 (0.01)
精神障害	**4 (0.68)**	**11 (0.12)**	**15 (0.16)**
眠気	4 (0.68)	11 (0.12)	15 (0.16)
消化器障害	－	**17 (0.19)**	**17 (0.18)**
嘔吐	－	5 (0.06)	5 (0.05)
下痢	－	10 (0.11)	10 (0.11)
口渇	－	2 (0.02)	2 (0.02)
食欲不振	－	1 (0.01)	1 (0.01)
胃痛	－	1 (0.01)	1 (0.01)
腸炎	－	1 (0.01)	1 (0.01)
肝臓・胆管系障害	－	**2 (0.02)**	**2 (0.02)**
AST 上昇	－	2 (0.02)	2 (0.02)
ALT 上昇	－	1 (0.01)	1 (0.01)
代謝・栄養障害	－	**1 (0.01)**	**1 (0.01)**
ALP 上昇	－	1 (0.01)	1 (0.01)
心拍数・心リズム障害	－	**1 (0.01)**	**1 (0.01)**
動悸	－	1 (0.01)	1 (0.01)
呼吸器障害	－	**3 (0.03)**	**3 (0.03)**
息苦しい	－	1 (0.01)	1 (0.01)
アトピー性アレルギー性鼻炎	－	1 (0.01)	1 (0.01)
鼻閉	－	1 (0.01)	1 (0.01)
白血球・網内系障害	－	**3 (0.03)**	**3 (0.03)**
好中球減少	－	1 (0.01)	1 (0.01)
白血球増多（症）	－	1 (0.01)	1 (0.01)
好酸球増多（症）	－	1 (0.01)	1 (0.01)
血小板・出血凝固障害	－	**1 (0.01)**	**1 (0.01)**
血小板増多（症）	－	1 (0.01)	1 (0.01)
泌尿器系障害	－	**1 (0.01)**	**1 (0.01)**
血尿	－	1 (0.01)	1 (0.01)
一般的全身障害	－	**1 (0.01)**	**1 (0.01)**
倦怠（感）	－	1 (0.01)	1 (0.01)

注) 共同開発品目「ニポラジンシロップ」（アルフレッサファーマ株式会社）との合算である。

器官別（過敏症、肝臓等）の小計は、副作用発現件数の合計ではなく、器官別副作用発現症例数（%）とした。

ゼスランシロップ臨床検査値異常一覧表

ゼスランシロップ承認時迄の調査

臨床検査項目			発現症例数／検査症例数（%）
一般血液検査	赤血球数		1/300 (0.30)
	白血球数		0/330
	ヘモグロビン		1/330 (0.30)
	ヘマトクリット		1/330 (0.30)
	血小板		1/329 (0.30)
	白血球分画	好塩基球	0/300
		好酸球	3/304 (0.99)
		好中球	1/304 (0.33)
		リンパ球	1/315 (0.32)
		単球	0/315
肝機能	AST（GOT）		1/328 (0.30)
	ALT（GPT）		0/328
	ALP		3/317 (0.95)
	総ビリルビン		1/296 (0.34)
腎機能	BUN		0/317
	クレアチニン		0/218
尿生化学	蛋白		1/313 (0.32)
	糖		0/313
	ウロビリノーゲン		0/312
	潜血		1/158 (0.63)

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＞

本剤の開発国である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（マレイン酸クロルフェニラミン）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

ゼスラン錠：

> **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。

＜解説＞

PTP 包装の誤飲事故防止のため、「PTP 誤飲対策について」（平成 8 年 3 月 27 日日薬連発第 240 号）に則り、設定した。

ゼスラン小児用シロップ：

> **14. 適用上の注意**
>
> **14.1 薬剤交付時の注意**
>
> 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。

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＞

本剤 5 mg/kg を有色ラット（Long-Evans 系）に、経口投与した実験[32]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、レボメプロマジン、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、本剤 5 mg/kg/日を白色ラット（Wistar 系）に経口投与した実験[33]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

1. 中枢神経系に対する作用

(1) 0.3～5 mg/kg を静脈内投与した場合、自発脳波を徐波化し、また脳波覚醒反応及び脳波漸増反応を抑制する（ウサギ）。5～10 mg/kg の経口投与では、オキソトレモリン振戦を抑制し、また 5～100 mg/kg の経口投与では、自発運動、協調運動及び薬物誘発痙攣に明らかな作用をおよぼさない（マウス）[39]。

(2) 5 mg/kg の腹腔内投与にて H_1 レセプターに特異的親和性を示す ^{3}H−メピラミンの結合に対し、回腸（末梢組織）では有意な結合阻害を示すが、脳では有意な結合阻害は認められず、脳内 H_1 レセプターに対する親和性は低いと考えられる（モルモット）[40]。

2. 自律神経系に対する作用 [41]

(1) 0.1 mg/kg の静脈内投与でノルエピネフリンによる昇圧反応を増強し、チラミン昇圧反応を抑制する（イヌ）。

(2) 25 mg/kg 経口投与で持続性の散瞳を発現する（マウス）。

3. 循環器系に対する作用 [41]

静脈内投与において 1～5 mg/kg で心拍数の増加及び脈圧増大、5 mg/kg 以上で血圧下降などを発現し、20 mg/kg で心電図変化をきたす（麻酔イヌ）。

(3) その他の薬理試験

局所麻酔作用 [41]（参考情報）

0.01～0.30%の点眼投与にてリドカインと同等（浸潤麻酔）及び 3.5 倍（表面麻酔）の局所麻酔作用を有する（モルモット）。

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験 [42, 43]

LD_{50} 値（mg/kg）

動物＼投与経路			経口	皮下	腹腔
JCL-Wistar ラット	1 日齢[注 1)]	幼若雄	86	−	−
		幼若雌	81	−	−
	1 週齢[注 1)]	幼若雄	119	−	−
		幼若雌	122	−	−
	2 週齢[注 1)]	幼若雄	202	−	−
		幼若雌	229	−	−
	3 週齢[注 1)]	幼若雄	298	−	−
		幼若雌	296	−	−
	6 週齢[注 2)]	成熟雄	245	1,050	58
		成熟雌	400	690	54
JCL-ICR 系マウス	7 週齢[注 2)]	成熟雄	210	278	71
		成熟雌	273	350	54

注 1)Probit 法　注 2)Litchfield-Wilcoxon 法

(2) 反復投与毒性試験

1. Wistar 系雌雄ラットに 1 日 4、12、36、108 mg/kg を 30 日間連続経口投与した試験において、12 mg/kg 以上で散瞳、体重増加の抑制が認められている。36 mg/kg 群で自発運動の抑制が認められ、108 mg/kg では全例が死亡している [43]。
2. Wistar 系雌雄幼若ラット（3 週齢）に 1 日 1.33、4、12、36 mg/kg を 28 日間連続投与した試験において、12 mg/kg 以上で散瞳、36 mg/kg 以上で有意な体重増加の抑制が認められている。この変化は休薬により回復した。無影響量は 4 mg/kg と考えられる [44]。
3. ビーグル犬（雌雄）に 1 日 1、5、25 mg/kg を 13 週間連続経口投与した試験において、5 及び 25 mg/kg で散瞳が認められている。25 mg/kg で、投与初期に摂餌、摂水量の減少に伴う体重増加抑制、自発運動の抑制、嗜眠が認められた以外、特記すべき異常所見は認められていない [45]。
4. Wistar 系雌雄ラットに 1 日 2、6、18、54 mg/kg を 180 日間連続経口投与した試験において、6 mg/kg 以上で散瞳、18 mg/kg 以上で軽度の鎮静症状、衰弱、体重増加の抑制などが、また、54 mg/kg 群で死亡が発現し、その剖検で、肺及び肝のうっ血性変化が認められた以外、特記すべき異常は認められていない [46]。
   最大無作用量：2 mg/kg/日（ラット）

(3) 遺伝毒性試験 [47]

マウス微小核法による染色体異常誘発性試験及び微生物による変異原性試験で変異原性は認められていない。

(4) がん原性試験 [48)]

雌雄ラットに 1 日 3、9、27（11 週以降 18）mg/kg、雌雄マウスに 1 日 36 mg/kg をそれぞれ 24 ヵ月間反復経口投与した試験において、本剤の発がん性は示唆されなかった。

(5) 生殖発生毒性試験 [49～52)]

JCL-Wistar 系ラットの妊娠前・妊娠初期（S_1）に 1.25、5、20 mg/kg/日、器官形成期（S_2）に 1.25、5、10、20 mg/kg/日、周産期・授乳期（S_3）に 1.25、5、10 mg/kg/日を各々経口投与した試験では、親動物（妊娠あるいは哺育中）で S_1、S_3 においては 1.25 mg/kg 以上、S_2 においては 5 mg/kg 以上、また新生仔で 5 mg/kg 以上の用量で体重増加の抑制が認められた以外、本剤投与によると思われる特記すべき異常所見は認められていない。

また、日本白色ウサギの器官形成期に 5、25、125 mg/kg/日を経口投与した試験では、125 mg/kg 群の親動物に軽度の体重増加抑制がみられた以外、特記すべき異常所見は認められていない。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし。

(7) その他の特殊毒性

1. 依存性 [53)]（マウス、ラット）
   バルビタール型依存マウス及びラット長期投与による身体的依存性形成能試験で依存性は認められていない。
2. 抗原性 [54)]（モルモット、マウス）
   モルモットによる全身アナフィラキシー試験及びマウスによる IgE 抗体産生能試験で抗原性は認められていない。
3. 光感作用 [55)]（モルモット）
   モルモットによる光アレルギー試験、光毒性試験、光化学反応試験において軽度の光感反応が認められている。
   ［「Ⅷ.12.(2)非臨床試験に基づく情報」の＜解説＞を参照］

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製　　剤：ゼスラン錠　　：該当しない。
　　ゼスラン小児用シロップ：該当しない。
　　ゼスラン小児用細粒　　：該当しない。
有効成分：メキタジン　劇薬

2. 有効期間

ゼスラン錠　　：60ヵ月
ゼスラン小児用シロップ：36ヵ月
ゼスラン小児用細粒　　：36ヵ月

3. 包装状態での貯法

ゼスラン錠　　：室温保存
ゼスラン小児用シロップ：室温保存
ゼスラン小児用細粒　　：室温保存

4. 取扱い上の注意

ゼスラン錠：

20. 取扱い上の注意
　外箱開封後は遮光して保存すること。

ゼスラン小児用シロップ：

20. 取扱い上の注意
20.1 本剤は防腐剤を添加していないので、他の容器に分割して使用する場合には、微生物汚染等を考慮して取扱いに注意すること。
20.2 本剤は強い光にあたると着色することがあるので、他の容器に分割して使用する場合には、取扱いに注意すること。
20.3 使用期限内であっても、開栓後はなるべく速やかに使用すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

一物二名称：ニポラジン錠・小児用シロップ 0.03%・小児用細粒 0.6%

同　効　薬：アゼプチン錠 0.5mg,1mg、アレグラ錠 30mg、エバステル錠/OD 錠 1mg、アレロック錠/OD 錠 2.5、ザイザル錠 5mg、タベジール錠 1mg など。

7. 国際誕生年月日

1970 年 1 月 31 日

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

製造販売承認年月日及び承認番号

	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
ゼスラン錠 3mg[注 1)]	2009 年 3 月 26 日	22100AMX00514000	2009 年 9 月 25 日	2009 年 10 月 26 日
ゼスラン小児用シロップ 0.03%[注 2)]	2008 年 3 月　7 日	22000AMX00469000	2008 年 6 月 20 日	2008 年　8 月　1 日
ゼスラン小児用細粒 0.6%	2001 年 3 月 14 日	21300AMZ00194000	2001 年 7 月　6 日	2001 年　7 月 13 日

注 1) 販売名変更前の「ゼスラン錠」は承認番号 15700AMZ01116000 で 1982 年 10 月 7 日に製造承認され、1983 年 2 月 3 日に薬価基準収載、1983 年 2 月 3 日に販売開始された。

注 2) 販売名変更前の「ゼスランシロップ」は承認番号 20900AMZ00332000 で 1997 年 4 月 22 日に製造承認され、1997 年 6 月 20 日に薬価基準収載、1997 年 8 月 1 日に販売開始された。

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

ゼスラン錠：1990 年 3 月 30 日 気管支喘息効能追加

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：該当しない。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

ゼスラン錠：・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）：1990 年 9 月 5 日 承認内容に同じ。
・気管支喘息：1996 年 3 月 7 日 承認内容に同じ。

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：2005 年 1 月 13 日 承認内容に同じ。

11. 再審査期間

ゼスラン錠　：・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）
：1982 年 10 月 7 日～1988 年 10 月 6 日（6 年）
・気管支喘息：1990 年 3 月 30 日～1994 年 3 月 29 日（4 年）

ゼスラン小児用シロップ：1997 年 4 月 22 日～2001 年 4 月 21 日（4 年）

ゼスラン小児用細粒　：2001 年 3 月 14 日～2001 年 4 月 21 日（終了）

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
ゼスラン錠 3mg[注 1)]	4413004F1251	4413004F1251	109327801	620932701
ゼスラン小児用シロップ 0.03%[注 2)]	4413004Q1058	4413004Q1058	109339101	620006955
ゼスラン小児用細粒 0.6%	4413004C2022	4413004C2022	114379901	610453057

注 1）販売名変更前の「ゼスラン錠」の薬価基準収載医薬品コードは 4413004F1030 であった。
注 2）販売名変更前の「ゼスランシロップ」の薬価基準収載医薬品コードは 4413004Q1023 であった。

14. 保険給付上の注意

該当しない。

ＸⅠ．文献

1. 引用文献

1) 信太 隆夫 他：臨床医薬、4(4),611(1988)
2) 長野 準 他：臨床医薬、4(6),991(1988)
3) 前田 広由 他：応用薬理、21(6),893(1981)
4) 佐野 靖之 他：Prog.Med.、8(9),2159(1988)
5) 三井 健司：臨床医薬、4(5),745(1988)
6) 須貝 哲郎：基礎と臨床、15(5),2897(1981)
7) 久木田 淳 他：皮膚、23(3),332(1981)
8) 須貝 哲郎：基礎と臨床、15(9),4466(1981)
9) 雲井 健雄 他：耳鼻臨床、74(2),171(1981)
10) 古内 一郎 他：耳鼻咽喉科展望、24(補 1),74(1981)
11) 外松 茂太郎 他：皮膚、23(2),260(1981)
12) 武田 一雄 他：耳鼻臨床、74(3),381(1981)
13) 久木田 淳 他：西日本皮膚科、43(6),1346(1981)
14) 斎藤 英雄 他：耳鼻咽喉科展望、27(補 4),531(1984)
15) 三河 春樹 他：小児科臨床、46(4),983(1993)
16) 三河 春樹 他：小児科臨床、46(4),967(1993)
17) 奥田 稔 他：耳鼻咽喉科展望、33(補 5),637(1990)
18) 奥田 稔 他：耳鼻咽喉科展望、36(4),515(1993)
19) 木村 俊次 他：西日本皮膚科、55(3),507(1993)
20) 須貝 哲郎 他：基礎と臨床、27(3),1081(1993)
21) 石岡 忠夫：医学と薬学、5(5),807(1981)
22) 長野 準 他：臨床医薬、4(6), 1013(1988)
23) 佐々木 聖 他：基礎と臨床、27(3),1003(1993)
24) 藤村 一 他：日薬理誌、78,279(1981)A
25) 藤村 一 他：日薬理誌、78,291(1981)
26) 河野 茂勝 他：日薬理誌、92,145(1988)
27) K. Tasaka et al.：Arzneim.-Forsch./Drug Res.、40(II)10,1092(1990)
28) 河野 茂勝 他：日薬理誌、92,159(1988)
29) 社内資料：メキタジンの健常人における体内動態に関する研究
30) 横山 信治 他：基礎と臨床、26(14),67(1992)
31) 社内資料：ゼスラン小児用細粒 0.6%生物学的同等性に関する試験成績
32) 横山 信治 他：医薬品研究、12(2),506(1981)
33) 宗田 靖二 他：医薬品研究、12(2),462(1981)
34) 横山 信治 他：医薬品研究、12(2),481(1981)
35) 社内資料：新抗ヒスタミン剤 Mequitazine の健康人における薬物動態と作業能率におよぼす影響
36) 宗田 靖二 他：医薬品研究、12(2),489(1981)
37) K.Nakamura et al.：J.Pharmacol.Exp.Ther.、284(2),437 (1998) (PMID: 9454781)

38)須貝 哲郎：皮膚、25(3),344(1983)
39)藤村 一 他：日薬理誌、78,249(1981)
40)A.Uzan. et al.：Allergie et Immunologie、11,27(1979)
41)北条 雅一 他：日薬理誌、78,403(1981)
42)社内資料：Mequitazine の幼若ラットにおける経口投与による急性毒性試験
43)藤村 一 他：応用薬理、22(4),491(1981)
44)高橋 みち子 他：薬理と治療、20(11),4281(1992)
45)矢野 譲次 他：J.Toxicol.Sci.、6,129(1981) (PMID: 6115947)
46)藤村 一 他：応用薬理、22(4),507(1981)
47)園 明 他：J.Toxicol.Sci.、6,123(1981) (PMID: 7024562)
48)社内資料：メキタジンのがん原性試験
49)前田 広由 他：応用薬理、21(6),855(1981)
50)前田 広由 他：応用薬理、21(6),867(1981)
51)前田 広由 他：応用薬理、21(6),881(1981)
52)前田 広由 他：応用薬理、21(6),893(1981)
53)金戸 洋：J.Toxicol.Sci.、6,61(1981)
54)社内資料：Mequitazine の抗原性に関する研究
55)社内資料：抗ヒスタミン剤 Mequitazine (LM−209) の光毒性および光アレルギー試験

2. その他の参考文献

ゼスラン錠：＜気管支喘息、その他に関する臨床文献＞
1）長野 準 他：臨床医薬、4(5),735(1988)
2）長岡 滋 他：Therapeutic Research,、4(3),589(1986)

＜アレルギー性鼻炎等に関する臨床文献＞
1）黒坂 文武 他：基礎と臨床、18(7),3143(1984)
2）小林 一女 他：医学と薬学、12(1),263(1984)
3）山岸 益夫 他：耳鼻咽喉科展望、27(5),579(1984)
4）増山 敬祐 他：耳鼻と臨床,、31(2),270(1985)
5）朝倉 光司 他：Prog.Med.、5(4),1237(1985)
6）古内 一郎 他：Prog.Med.、6(1),235(1986)
7）石崎 道治 他：Prog.Med.、7(1),161(1987)

＜じん麻疹に関する臨床文献＞
1）鬼頭 芳子 他：Prog.Med、4(7),1456(1984)
2）手嶋 秀毅 他：診療と新薬、21(8),1659(1984)

＜そう痒性皮膚疾患に関する臨床文献＞
1）花咲 宏一 他：新薬と臨床、32(11),1868(1983)
2）山田 健一 他：西日本皮膚科、46(増),287(1984)
3）手塚 正 他：薬理と治療、12(4),1829(1984)

4）菊池 一郎 他：Prog.Med、5(8),2408(1985)

ゼスラン小児用シロップ・ゼスラン小児用細粒：なし

ⅩⅡ. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

メキタジン製剤は 1974 年 11 月に錠剤が、1983 年 2 月にシロップ剤がフランス政府に承認されており、1976 年にプリマラン錠、1984 年にプリマランシロップの商品名で発売された。

国　　名	フランス
販売名（会社名）	PRIMALAN（Pierre Fabre Medicament）
発　売　年	1976 年
剤　　形	10 mg 錠
効能・効果	種々のアレルギー症状（アレルギー性鼻炎、じん麻疹、結膜炎）
用法・用量	10 mg/日（1～2 回）
国　　名	フランス
販売名（会社名）	PRIMALAN　Sirup（Pierre Fabre Medicament）
発　売　年	1984 年
剤　　形	0.5 mg/L（60 mL ボトル）
効能・効果	種々のアレルギー症状（痙攣性鼻炎、アレルギー性鼻炎、結膜炎、クインケ病の浮腫、じん麻疹）、湿疹そう痒疹に伴う皮膚そう痒症の緩和治療
用法・用量	1.25 mg/5 kg/日（1～2 回）

メキタジン錠剤のフランス以外の主な承認国及び商品名は次の通りである。

国　　名	販　売　名	承認年
ドイツ	METAPLEXAN　メタプレキセン	1976
イギリス	PRIMALAN　プリマラン	1976

メキタジンシロップのフランス以外の主な承認国及び商品名は次の通りであり、小児用細粒の開発は本邦のみである。

国　　名	販　売　名	承認年
ドイツ	METAPLEXAN　メタプレキセン	1985
オランダ	MIRCOL　ミルコール	1985
ベルギー	MIRCOL　ミルコール	1984
韓国	PRIMALAN　プリマラン	1985
スペイン	MIRCOL　ミルコール	1985
モロッコ	PRIMALAN　プリマラン	1986
ポルトガル	PRIMALAN　プリマラン	1984
スイス	VIGIGAN　ビジガン	1987
ジャマイカ	PRIMALAN　プリマラン	1988

本邦における効能効果は以下の通りであり、外国での承認状況とは異なる。
＜効能・効果＞
気管支喘息 アレルギー性鼻炎 じん麻疹
皮膚疾患に伴うそう痒（湿疹・皮膚炎、皮膚そう痒症）

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし。

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

(1) 粉砕

個別に照会すること。
照会先：表紙の「問い合わせ窓口」の項参照。

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること。
照会先：表紙の「問い合わせ窓口」の項参照。

2. その他の関連資料

該当資料なし。

旭化成セラピューティクス株式会社
IFZET200100001012