2023年3月改訂（第10版）

日本標準商品分類番号：87190
872129

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

劇　　薬
処方箋医薬品(注)

不整脈治療剤・糖尿病性神経障害治療剤

メキシレチン塩酸塩カプセル50mg「JG」
メキシレチン塩酸塩カプセル100mg「JG」

（メキシレチン塩酸塩製剤）

剤形	硬カプセル剤
製剤の規制区分	劇薬 処方箋医薬品　注）注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	カプセル50mg： 　1カプセル中　日局　メキシレチン塩酸塩50mgを含有 カプセル100mg： 　1カプセル中　日局　メキシレチン塩酸塩100mgを含有
一般名	和名：メキシレチン塩酸塩 洋名：Mexiletine Hydrochloride
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：2013年7月16日 （販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2013年12月13日 （販売名変更による） 発売年月日：1994年7月8日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社　お客さま相談室 TEL 0120-893-170　FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html

本IFは2015年1月改訂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，PMDAホームページ「医薬品に関する情報」
https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要　―日本病院薬剤師会―

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, IF と略す)の位置付け並びに IF 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 IF 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 IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では, IF 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-IF)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-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」(http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html)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-IF を掲載する PMDA 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-IF の情報を検討する組織を設置して,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, IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF 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 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,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。

[IF の様式]

①規格は A4 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。

②IF 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「IF 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。

［IF の作成］

①IF 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。

②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。

③添付文書の内容を補完するとの IF 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，「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF 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。

［IF の発行］

①「IF 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，「IF 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 IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 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 IF については，PMDA 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，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薬剤師等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，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，IF の使用にあたっては，最新の添付文書を PMDA 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があり，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

IF 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。IF 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，IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり，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. 開発の経緯……6
2. 製品の治療学的・製剤学的特性……6

Ⅱ. 名称に関する項目
1. 販売名……7
2. 一般名……7
3. 構造式又は示性式……7
4. 分子式及び分子量……7
5. 化学名（命名法）……8
6. 慣用名，別名，略号，記号番号……8
7. CAS 登録番号……8

Ⅲ. 有効成分に関する項目
1. 物理化学的性質……9
2. 有効成分の各種条件下における安定性……9
3. 有効成分の確認試験法……9
4. 有効成分の定量法……10

Ⅳ. 製剤に関する項目
1. 剤形……11
2. 製剤の組成……12
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意……12
4. 製剤の各種条件下における安定性…12
5. 調製法及び溶解後の安定性……14
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）……14
7. 溶出性……15
8. 生物学的試験法……19
9. 製剤中の有効成分の確認試験法……19
10. 製剤中の有効成分の定量法……19
11. 力価……19
12. 混入する可能性のある夾雑物……19
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報……20
14. その他……20

Ⅴ. 治療に関する項目
1. 効能又は効果……21
2. 用法及び用量……21
3. 臨床成績……21

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……23
2. 薬理作用……23

Ⅶ. 薬物動態に関する項目
1. 血中濃度の推移・測定法……24
2. 薬物速度論的パラメータ……25
3. 吸収……26
4. 分布……26
5. 代謝……26
6. 排泄……27
7. トランスポーターに関する情報……27
8. 透析等による除去率……27

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……28
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）……28
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……28
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由……28
5. 慎重投与内容とその理由……28
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法……29
7. 相互作用……30
8. 副作用……31
9. 高齢者への投与……33
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与……34
11. 小児等への投与……34
12. 臨床検査結果に及ぼす影響……34
13. 過量投与……34
14. 適用上の注意……34

15. その他の注意……35
16. その他……35

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目
1. 薬理試験……36
2. 毒性試験……36

Ⅹ. 管理的事項に関する項目
1. 規制区分……37
2. 有効期間又は使用期限……37
3. 貯法・保存条件……37
4. 薬剤取扱い上の注意点……37
5. 承認条件等……37
6. 包装……37
7. 容器の材質……38
8. 同一成分・同効薬……38
9. 国際誕生年月日……38
10. 製造販売承認年月日及び承認番号…38
11. 薬価基準収載年月日……38
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……38
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容……39
14. 再審査期間……39
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報…39
16. 各種コード……39
17. 保険給付上の注意……39

ⅩⅠ. 文献
1. 引用文献……40
2. その他の参考文献……40

ⅩⅡ. 参考資料
1. 主な外国での発売状況……41
2. 海外における臨床支援情報……41

ⅩⅢ. 備考
その他の関連資料……42

Ⅰ. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は, メキシレチン塩酸塩を有効成分とする不整脈治療剤・糖尿病性神経障害治療剤である。

長生堂製薬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, 1994 年 3 月にメトレキシンカプセル 50mg 及びメトレキシンカプセル 100mg として承認を得て, 1994 年 7 月発売に至った。

その後, 2005 年 6 月に一部変更承認され, 糖尿病性神経障害に伴う自覚症状(自発痛, しびれ感)の改善の効能・効果及び用法・用量が追加された。

なお, 2013 年 7 月にメキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」及びメキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」へそれぞれ販売名を変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 本剤は, 不整脈治療剤・糖尿病性神経障害治療剤である。

(2) 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。なお, 重大な副作用として, 中毒性表皮壊死症(Lyell 症候群), 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群), 紅皮症, 過敏症症候群, 心室頻拍, 房室ブロック, 腎不全, 幻覚, 錯乱, 肝機能障害, 黄疸, 間質性肺炎, 好酸球性肺炎があらわれることがある。また, 類薬による重大な副作用として, 心停止, 心室細動, 失神, 洞房ブロック, 徐脈があらわれることがある。(〔Ⅷ.8. (2) 重大な副作用と初期症状〕の項参照)

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名：

メキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」
メキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」

(2) 洋名：

MEXILETINE HYDROCHLORIDE Capsules 50mg “JG”
MEXILETINE HYDROCHLORIDE Capsules 100mg “JG”

(3) 名称の由来：

一般名＋剤形＋含量＋「JG」

2. 一般名

(1) 和名（命名法）：

メキシレチン塩酸塩（JAN）

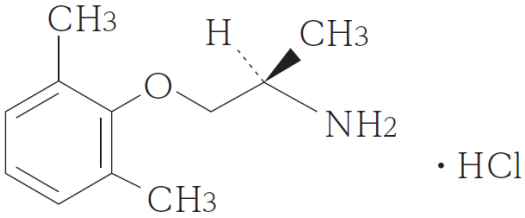
(2) 洋名（命名法）：

Mexiletine Hydrochloride（JAN）
Mexiletine（INN）

(3) ステム：

なし

3. 構造式又は示性式



・HCl　及び鏡像異性体

4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{11}H_{17}NO$・HCl
分子量：215.72

5. 化学名（命名法）

(1*RS*)-2-(2,6-Dimethylphenoxy)-1-methylethylamine monohydrochloride
（IUPAC）

6. 慣用名，別名，略号，記号番号

別名：塩酸メキシレチン

7. CAS 登録番号

5370-01-4（Mexiletine Hydrochloride）
31828-71-4（Mexiletine）

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状：

白色の粉末である。

(2) 溶解性：

水又はエタノール(95)に溶けやすく，アセトニトリルに溶けにくく，ジエチルエーテル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：200 ～ 204℃

(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：

旋光性：水溶液(1→20)は旋光性を示さない。

pH：1.0g を水 10mL に溶かした液の pH は 3.8 ～ 5.8 である。

比吸光度 $E^{1\%}_{1cm}$(262nm)：約 12.0（0.01mol/L 塩酸試液溶液(1→2000)）

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「メキシレチン塩酸塩」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はメキシレチン塩酸塩標準品について同様に操作して得られた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)

本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又は乾燥したメキシレチン塩酸塩標準品の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。

(3) 塩化物の定性反応(2)

4. 有効成分の定量法

日局「メキシレチン塩酸塩」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

Ⅳ. 製剤に関する項目

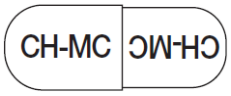
1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状：

カプセル 50mg

剤形・性状：頭部は帯黄赤色不透明, 胴部はわずかに褐色がかった黄色不透明の硬カプセル剤で, 内容物は白色の粒を含む粉末で, わずかに特異なにおいがある。

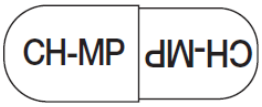
外形：

4 号カプセル 	全　長	14.5 mm
	重　量	120 mg
	頭部径	5.3 mm
	胴部径	5.1 mm

カプセル 100mg

剤形・性状：頭部は帯黄赤色不透明, 胴部は白色不透明の硬カプセル剤で, 内容物は白色の粒を含む粉末で, わずかに特異なにおいがある。

外形：

2 号カプセル 	全　長	17.8 mm
	重　量	225 mg
	頭部径	6.4 mm
	胴部径	6.1 mm

(2) 製剤の物性：

該当資料なし

(3) 識別コード：

カプセル 50mg：　**CH-MC**

カプセル 100mg：　**CH-MP**

(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：

カプセル 50mg：1 カプセル中　日局　メキシレチン塩酸塩 50mg 含有
カプセル 100mg：1 カプセル中　日局　メキシレチン塩酸塩 100mg 含有

(2) 添加物：

カプセル 50mg	カプセル 100mg
トウモロコシデンプン, 結晶セルロース, 軽質無水ケイ酸, ステアリン酸マグネシウム, ゼラチン, 黄色三二酸化鉄, 酸化チタン, ラウリル硫酸ナトリウム, 赤色 3 号	トウモロコシデンプン, 結晶セルロース, 軽質無水ケイ酸, ステアリン酸マグネシウム, ゼラチン, 酸化チタン, ラウリル硫酸ナトリウム, 青色 1 号, 赤色 102 号, 黄色 5 号

(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

(1) 加速試験

カプセル 50mg[1)]

加速試験(40℃, 相対湿度 75%, 6 ヵ月)の結果, 通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヵ月	2 ヵ月	3 ヵ月	4 ヵ月	6 ヵ月
最終包装製品(PTP 包装)	性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
	質量偏差試験	適合	—	—	—	—	適合
	崩壊試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
	定量試験	99.5%	99.9%	99.8%	100.2%	99.1%	100.2%
	純度試験	適合	—	—	—	—	適合

カプセル 100mg[2)]

加速試験（40℃，相対湿度 75%，6 ヵ月）の結果，通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヵ月	2 ヵ月	3 ヵ月	4 ヵ月	6 ヵ月
最終包装製品（PTP 包装）	性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
	質量偏差試験	適合	－	－	－	－	適合
	崩壊試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
	定量試験	101.0%	99.5%	100.1%	100.0%	99.7%	100.2%
	純度試験	適合	－	－	－	－	適合

(2) 長期安定性試験

カプセル 50mg[1)]

長期保存試験（室温保存，3 年）の結果，外観及び含量等は規格の範囲内であり，室温保存における 3 年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3 年
最終包装製品（PTP 包装）	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	質量偏差試験	適合	適合
	溶出試験	97.7%	101.0%
	定量試験	100.0%	98.4%

カプセル 100mg[2)]

長期保存試験（室温保存，3 年）の結果，外観及び含量等は規格の範囲内であり，室温保存における 3 年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3 年
最終包装製品（PTP 包装）	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	質量偏差試験	適合	適合
	純度試験	適合	適合
	溶出試験	92.5%	90.8%
	定量試験	100.4%	101.9%

(3) 無包装状態での安定性試験

カプセル 50mg

保存条件	保存期間	結果
温度(40℃, 遮光・気密容器)	3 ヵ月	変化なし(◎)
湿度(30℃, 75%RH, 遮光・開放)	3 ヵ月	変化なし(◎)
光(120 万 lux・hr, 気密容器)	50 日	変化あり※1 (規格内)(○)

※1 外観

カプセル 100mg

保存条件	保存期間	結果
温度(40℃, 遮光・気密容器)	3 ヵ月	変化なし(◎)
湿度(30℃, 75%RH, 遮光・開放)	3 ヵ月	変化なし(◎)
光(120 万 lux・hr, 気密容器)	50 日	変化なし(◎)

試験項目：外観, 含量, 崩壊性, 溶出性(カプセル 50mg)
外観, 含量, 崩壊性, 溶出性, 純度試験(カプセル 100mg)

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日(社)日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会)の評価分類基準(下記)に準じる(純度試験の項目については, 社内的に判定を追加)。

◎：すべての測定項目において変化を認めなかった。
(外観：変化をほとんど認めない。含量：3%未満の低下。崩壊性・溶出性：規格値内。純度試験：規格値内。)

○：いずれかの測定項目で「規格内」の変化を認めた。
(外観：わずかな色調変化(退色等)等を認めるが, 品質上, 問題とならない程度の変化であり, 規格を満たしている。含量：3%以上の低下で, 規格値内。)

△：いずれかの測定項目で「規格外」の変化を認めた。
(外観：形状変化や著しい色調変化等を認め, 規格を逸脱している。含量：規格値外。崩壊性・溶出性：規格値外。純度試験：規格値外。)

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当資料なし

7. 溶出性

(1) 溶出規格

カプセル 50mg

日本薬局方外医薬品規格第 3 部　メキシレチン塩酸塩カプセル溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法(パドル法)

条　件：回転数　50rpm

試験液　水

結　果：15 分間　80%以上

カプセル 100mg

日本薬局方外医薬品規格第 3 部　メキシレチン塩酸塩カプセル溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法(パドル法)

条　件：回転数　50rpm

試験液　水

結　果：15 分間　80%以上

(2) 品質再評価における溶出試験結果

カプセル 50mg[3)]

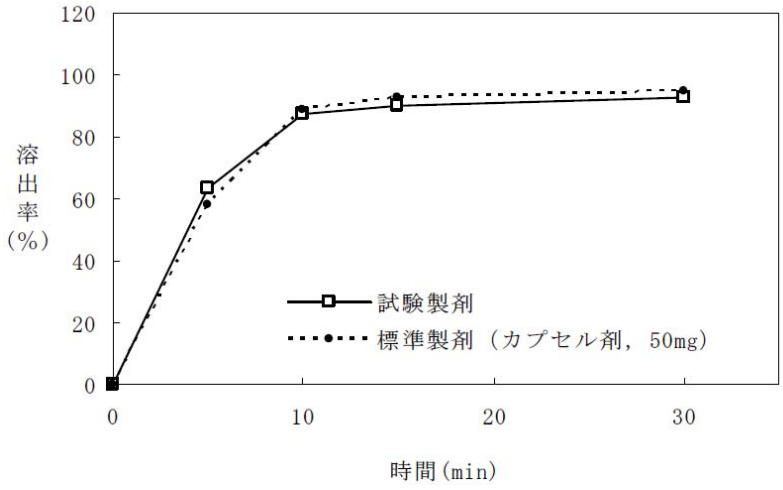
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日医薬審第 487 号)」に従い, 標準製剤との溶出挙動の同等性を判定した結果, 両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH4.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm

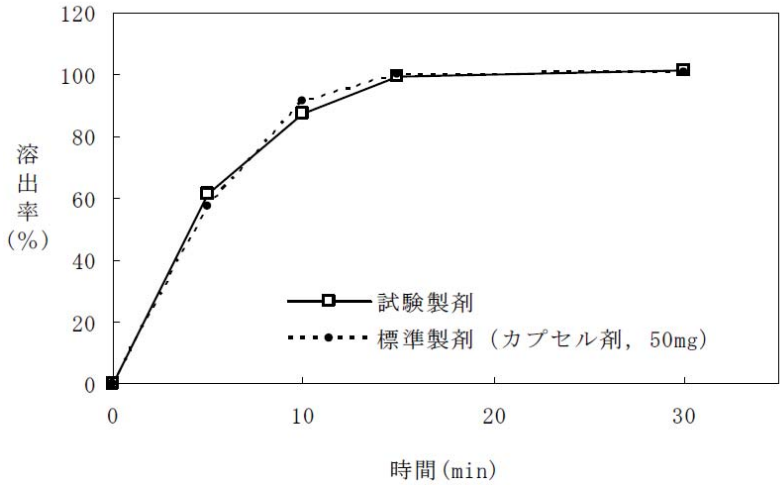
[判定基準]

①～④：試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は, 標準製剤の平均溶出率が 85%付近の適当な時点において, 試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

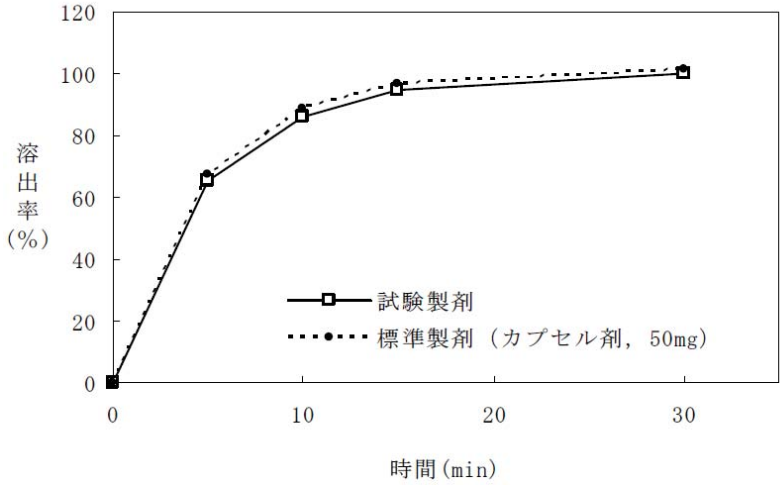
①pH1.2，50rpm



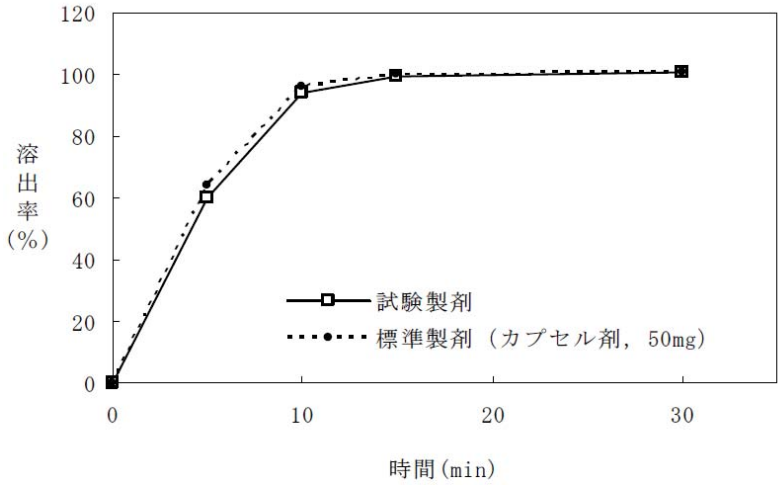
②pH4.0，50rpm



③pH6.8，50rpm



④水，50rpm



カプセル 100mg[4)]

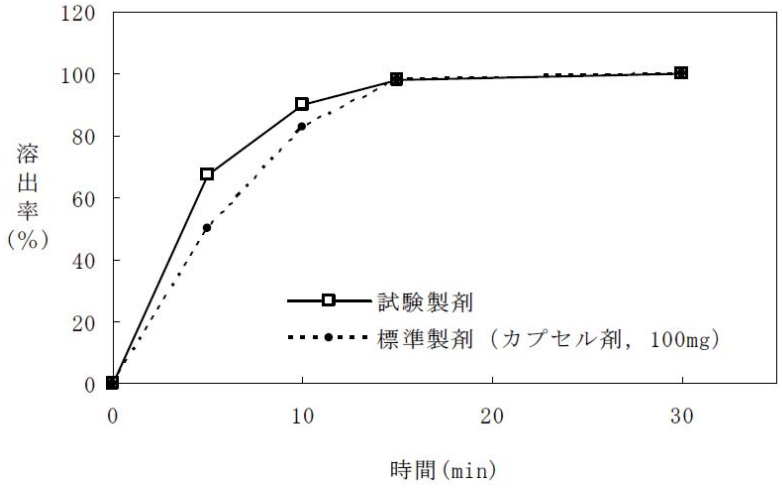
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日医薬審第 487 号）」に従い，標準製剤との溶出挙動の同等性を判定した結果，両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH4.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm

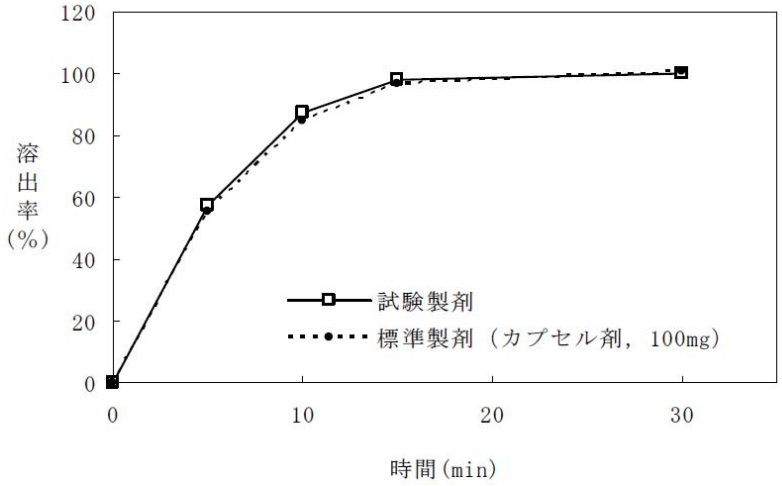
［判定基準］

①～④：試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は，標準製剤の平均溶出率が 85%付近の適当な時点において，試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

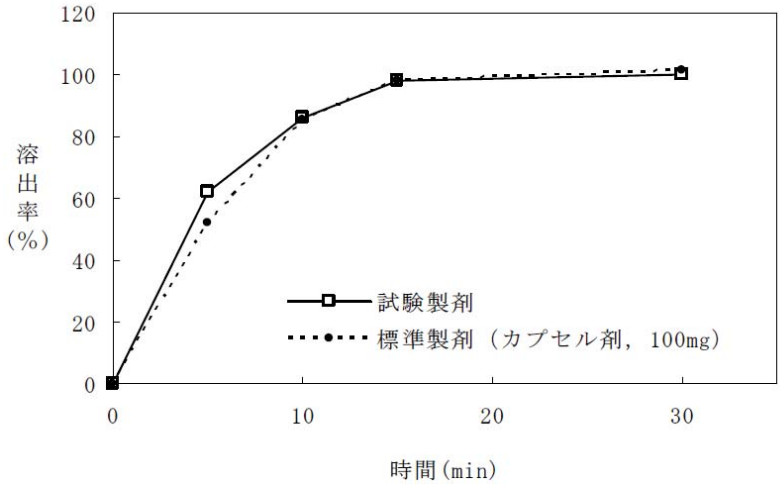
①pH1.2，50rpm



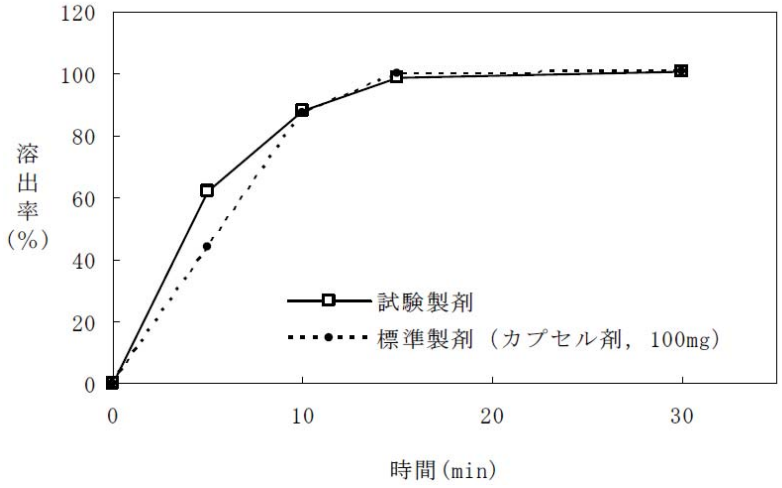
②pH4.0，50rpm



③pH6.8，50rpm



④水，50rpm



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

(1) 紫外線照射による確認

紫外線（主波長 365nm）を照射するとき，液は青緑色の蛍光を発する。

(2) 紫外可視吸光度測定法

極大吸収波長：259 ～ 263nm

(3) 薄層クロマトグラフィー

展開溶媒：クロロホルム／メタノール／アンモニア水混液

薄層板：薄層クロマトグラフィー用シリカゲル

判　定：ヨウ素蒸気中に放置するとき，試料溶液及び標準溶液から得たスポットは褐色を呈し，それらの R_f 値は等しい。

(4) 塩化物の定性反応（2）

10. 製剤中の有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法

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

該当しない

Ⅴ. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

頻脈性不整脈（心室性）
糖尿病性神経障害に伴う自覚症状（自発痛，しびれ感）の改善

2. 用法及び用量

(1) 頻脈性不整脈（心室性）

通常，成人にはメキシレチン塩酸塩として，1日300mgより投与をはじめ，効果が不十分な場合は450mgまで増量し，1日3回に分割し食後に経口投与する。

なお，年齢，症状により適宜増減する。

(2) 糖尿病性神経障害に伴う自覚症状（自発痛，しびれ感）の改善

通常，成人にはメキシレチン塩酸塩として，1日300mgを1日3回に分割し食後に経口投与する。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

(1) 頻脈性不整脈（心室性）に投与する場合：

1日用量450mgを超えて投与する場合，副作用発現の可能性が増大するので注意すること。（**〔Ⅷ.13.過量投与〕**の項参照）

(2) 糖尿病性神経障害に伴う自覚症状（自発痛，しびれ感）の改善を目的として投与する場合：

1) 2週間投与しても効果が認められない場合には，投与を中止すること。（**〔Ⅷ.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕**の項参照）

2) 1日300mgの用量を超えて投与しないこと。（**〔Ⅷ.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕**の項参照）

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ：

該当しない

(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. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

リドカイン塩酸塩, キニジン硫酸塩水和物, ジソピラミド等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序[5]：

Vaughan-Williams の分類による第 I 群の抗不整脈薬。主たる作用は心筋細胞膜 Na^+チャネルの抑制であり, 活動電位の最大脱分極速度を抑制することによって抗不整脈作用を現す。細分類では I b 群に属し, Na^+チャネルとの結合解離速度は速く, 活動電位持続時間は短縮する。

(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

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：

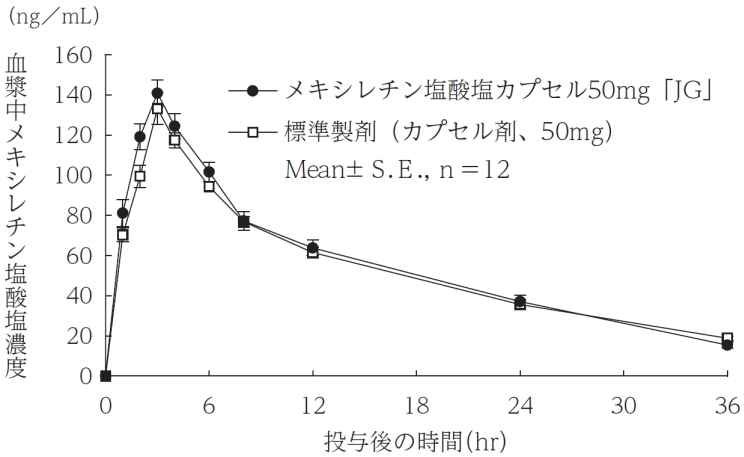
〔(3) 臨床試験で確認された血中濃度〕の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度：

生物学的同等性試験

カプセル 50mg[6)]

メキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」と標準製剤を，クロスオーバー法によりそれぞれ 2 カプセル（メキシレチン塩酸塩として 100mg）を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中メキシレチン塩酸塩濃度を測定し，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。



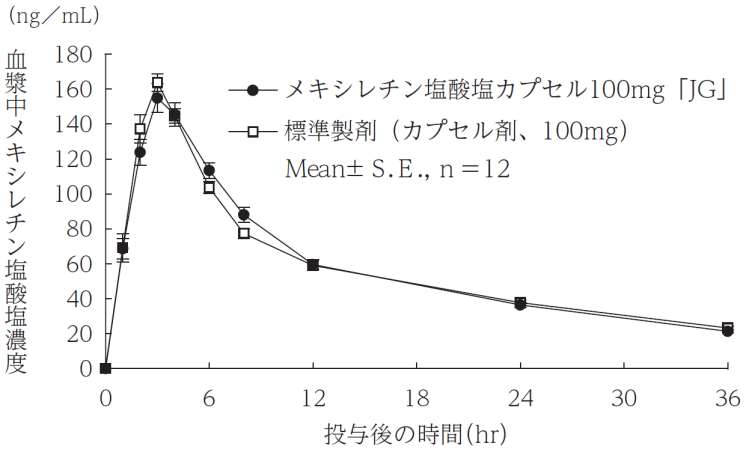
	判定パラメータ		参考パラメータ
	$AUC_{0\text{-}36}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)
メキシレチン塩酸塩カプセル50mg「JG」	2011±74	144.0±6.4	3.1±0.1
標準製剤（カプセル剤、50mg）	1929±54	137.5±6.9	3.2±0.1

(Mean±S.E., n=12)

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。

カプセル 100mg[7)]

メキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」と標準製剤を，クロスオーバー法によりそれぞれ 1 カプセル（メキシレチン塩酸塩として 100mg）を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中メキシレチン塩酸塩濃度を測定し，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。



	判定パラメータ		参考パラメータ
	$AUC_{0\text{-}36}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)
メキシレチン塩酸塩カプセル100mg「JG」	2097±44	160.3±6.2	3.1±0.1
標準製剤（カプセル剤、100mg）	2090±48	165.8±4.3	3.1±0.1

（Mean±S.E., n=12）

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。

(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物体内動態変動要因：

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**：

該当資料なし

(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：

〔Ⅷ.7.相互作用〕の項参照

(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(現段階では定められていない)

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) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

(2) 重篤な刺激伝導障害(ペースメーカー未使用のⅡ～Ⅲ度房室ブロック等)のある患者[刺激伝導障害の悪化,心停止を来すことがある。]

【原則禁忌(次の患者には投与しないことを原則とするが,特に必要とする場合には慎重に投与すること)】

糖尿病性神経障害に伴う自覚症状(自発痛,しびれ感)の改善を目的として投与する場合:

重篤な心不全を合併している患者[心不全を合併している糖尿病性神経障害患者に対する安全性は確立していない(使用経験がない)ので,重篤な心不全を合併している患者には,自覚症状(自発痛,しびれ感)に対する本剤の有益性が危険性(心不全の悪化,不整脈の誘発等)を上回ると判断される場合にのみ投与すること。]

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

〔Ⅴ.治療に関する項目〕を参照

5. 慎重投与内容とその理由

(1) 基礎心疾患(心筋梗塞,弁膜症,心筋症等)のある患者[心機能抑制や催不整脈作用が出現することがある。]

(2) 軽度の刺激伝導障害(不完全房室ブロック,脚ブロック等)のある患者[刺激伝導障害を悪化させることがある。]

(3) 著明な洞性徐脈のある患者[徐脈を悪化させることがある。]

(4) 重篤な肝・腎障害のある患者[本剤の血中濃度が上昇することがある。]

(5) 心不全のある患者[心不全を悪化,不整脈を悪化・誘発させることがあり,また,本剤の血中濃度が上昇することがある。]

(6) 低血圧の患者[循環状態を悪化させることがある。]

(7) パーキンソン症候群の患者[振戦を増強させることがある。]
(8) 高齢者(**〔6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕**及び**〔9.高齢者への投与〕**の項参照)
(9) 血清カリウム低下のある患者[不整脈を誘発させることがある。]
(10) 他の抗不整脈薬による治療を受けている患者[有効性,安全性が確立していない。(**〔6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕**の項及び**〔7.相互作用〕**の項参照)]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

(1) 本剤の投与に際しては,頻回に患者の状態を観察し,心電図,脈拍,血圧,心胸比を定期的に調べること。
PQ の延長, QRS 幅の増大, QT の延長,徐脈,血圧低下等の異常所見が認められた場合には,直ちに減量又は投与を中止すること。
特に,次の患者又は場合には,少量から開始するなど投与量に十分注意するとともに,頻回に心電図検査を実施すること。
1) **心不全のある患者又は基礎心疾患(心筋梗塞,弁膜症,心筋症等)があり,心不全を来すおそれのある患者(心室頻拍,心室細動等が発現するおそれが高いので,開始後 1 ～ 2 週間は入院させること。)**
2) **高齢者(入院させて開始することが望ましい。〔高齢者への投与〕の項参照)**
3) **他の抗不整脈薬との併用(有効性,安全性が確立していない。)**
(2) **紅斑,水疱・びらん,結膜炎,口内炎,発熱等があらわれた場合には中毒性表皮壊死症(Lyell 症候群),皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群),紅皮症の前駆症状である可能性があるため,投与を中止し,直ちに皮膚科専門医を受診させる等適切な処置を行うこと。**
(3) 頭がボーとする,めまい,しびれ等の精神神経系症状が発現し,増悪する傾向がある場合には,直ちに減量又は投与を中止すること。また,本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意すること。
(4) 他の抗不整脈薬(リン酸ジソピラミド)でテルフェナジンとの併用により, QT 延長,心室性不整脈を起こしたとの報告がある。
(5) 本剤は心臓ペーシング閾値を上昇させる場合があるので,恒久的ペースメーカー使用中,あるいは一時的ペーシング中の患者に対しては十分注意して投与すること。また,ペースメーカー使用中の患者に投与する場合は適当な間隔でペーシング閾値を測定すること。異常が認められた場合には直ちに減量又は投与を中止すること。
また,本剤は植え込み型除細動器(ICD)の除細動閾値を上昇させる場合があるので, ICD を使用している患者に本剤を追加投与した場合又は本剤の投与量の変更を行った場合には,十分に注意して経過観察を行うこと。

(6) 糖尿病性神経障害の患者に投与する場合

1) 本剤による治療は原因療法ではなく対症療法であるので, 漫然と投与しないこと。

2) 糖尿病性神経障害の患者に対し 1 日 300mg を超える投与での安全性は確立していない。(使用経験が少ない。)

3) 2 週間投与しても症状の改善が認められない場合は投与を中止し, 血糖コントロールや食事療法等の適切な治療を継続すること。

4) 糖尿病性神経障害の患者では, 下肢の状態を十分に観察すること。(本剤の投与により疼痛が緩解され, 末梢血管障害性の下肢の潰瘍や壊疽の進行を看過するおそれがある。)

7. 相互作用

本剤は, 主として薬物代謝酵素 CYP1A2 及び CYP2D6 で代謝される。

(1) 併用禁忌とその理由：

該当しない(現段階では定められていない)

(2) 併用注意とその理由：

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リドカイン プロカインアミド キニジン アプリンジン カルシウム拮抗剤 β 受容体遮断剤	本剤の作用が増強することがある。	両剤の陰性変力作用と変伝導作用が相加的又は相乗的に増強することがある。
アミオダロン	torsades de pointes を発現したとの報告がある。	機序不明
胃排出能を抑制する薬剤 モルヒネ等	本剤の吸収が遅延することがある。	モルヒネ等により胃の運動が低下し, 胃内容排出時間が延長すると, 本剤の吸収が遅延することがある。
肝薬物代謝酵素機能(特にチトクローム P-450 系の CYP1A2 及び 2D6)に影響を与える薬剤	本剤の血中濃度に影響を与えるおそれがある。	チトクローム P-450 (CYP1A2, 2D6)による本剤の代謝が影響を受けるおそれがある。

シメチジン	本剤の血中濃度が上昇することがある。	シメチジンによりチトクローム P-450 の薬物代謝が阻害され本剤の血中濃度が上昇することがある。
リファンピシン フェニトイン	本剤の血中濃度が低下することがある。	本剤の代謝が促進されることがある。
テオフィリン	テオフィリンの血中濃度が上昇することがある。	本剤はテオフィリンに比べ, チトクローム P-450 への親和性が強く, テオフィリンの代謝が抑制される。
尿の pH をアルカリ化させる薬剤 炭酸水素ナトリウム等	本剤の血中濃度が上昇することがある。	アルカリ性尿は, 本剤の腎排泄を抑制する。
尿の pH を酸性化させる薬剤 塩化アンモニウム等	本剤の血中濃度が低下することがある。	酸性尿は, 本剤の腎排泄を促進する。

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：

1) **重大な副作用**(頻度不明)

① **中毒性表皮壊死症(Lyell 症候群), 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群), 紅皮症**：中毒性表皮壊死症, 皮膚粘膜眼症候群, 紅皮症があらわれることがあるので, 観察を十分に行い, 紅斑, 水疱・びらん, 結膜炎, 口内炎, 発熱等があらわれた場合には, 中毒性表皮壊死症, 皮膚粘膜眼症候群, 紅皮症の前駆症状である可能性があるため, 投与を中止し, 適切な処置を行うこと。

②**過敏症症候群**：初期症状として発疹，発熱がみられ，さらにリンパ節腫脹，肝機能障害，白血球増加，好酸球増多，異型リンパ球出現等を伴う遅発性の重篤な過敏症状があらわれることがあるので，観察を十分に行い，このような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。なお，発疹，発熱，肝機能障害等の症状が再燃あるいは遷延化することがあるので注意すること。また，過敏症症候群に伴い，1型糖尿病を発症しケトアシドーシスに至った例も報告されているので，このような場合には，適切な処置を行うこと。

③**心室頻拍，房室ブロック**：心室頻拍（torsades de pointes を含む），房室ブロック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。

④**腎不全**：腎不全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，投与を中止し，適切な処置を行うこと。

⑤**幻覚，錯乱**：幻覚，錯乱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，投与を中止し，適切な処置を行うこと。

⑥**肝機能障害，黄疸**：AST（GOT），ALT（GPT），γ-GTP の上昇等を伴う肝機能障害，黄疸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，投与を中止し，適切な処置を行うこと。

⑦**間質性肺炎，好酸球性肺炎**：間質性肺炎，好酸球性肺炎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，投与を中止し，副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

2）**重大な副作用（類薬）**

心停止，心室細動，失神，洞房ブロック，徐脈：本剤と類似の Na チャネル阻害作用を有する薬剤でこのような症状があらわれることがあるので，定期的かつ必要に応じて心電図検査を実施し，異常が観察された場合には，投与を中止し，適切な処置を行うこと。

（3）**その他の副作用**：

以下のような副作用があらわれた場合には，症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
循環器	動悸，徐脈，起立時めまい，QRS 延長，血圧上昇，浮腫，胸部圧迫感，心房細動，低血圧

消化器	悪心・嘔吐, 食欲不振, 胸やけ, 胃・腹部不快感, 口渇, 便秘, 下痢, 腹部膨満感, 消化不良, 腹痛, 嚥下障害, 口唇炎, 舌炎, 胃痛, 食道炎, 食道潰瘍
精神神経系	振戦, めまい, しびれ感, 眠気, 頭痛, 不眠, 耳鳴, 眼振, いらいら感, 複視, 発汗, 意識障害, 痙攣, 譫妄, 構音障害
過敏症注1)	瘙痒感, 全身発疹, 発熱, 蕁麻疹, 紅斑, 多形(滲出性)紅斑
肝臓	尿ウロビリノゲンの上昇
腎臓	BUN, クレアチニンの上昇, 腎機能障害
血液注2)	白血球数異常, 赤血球減少, 血色素量減少, ヘマトクリット減少, 血小板数異常, 好酸球増多, リンパ球減少, 好中球増多, 顆粒球減少
泌尿器	排尿困難・尿閉, 尿失禁
その他	咽頭異和感, にがみ, 倦怠感, 咳, 足のこわばり, 血清カリウム, 総コレステロールの上昇, 脱力感, ほてり, 味覚異常

注1) このような症状があらわれた場合には, 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, 投与を中止すること。

(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:

〔2.禁忌内容とその理由〕
〔6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕
〔8.副作用〕
〔15.その他の注意〕の項参照

9. 高齢者への投与

高齢者では, 肝・腎機能が低下していることが多く, また, 体重が少ない傾向があるなど副作用が発現しやすいので, 慎重に投与すること。(**〔6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕**の項参照)

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, 治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
(2) 授乳中の婦人に投与することを避け, やむを得ず投与する場合には, 授乳を中止させること。[母乳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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

(1) **症状**
過量服用の結果, 副作用の項に記載した悪心, 眠気, 徐脈, 低血圧, 痙攣, 錯乱等の症状の他に, 知覚異常及び心停止があらわれたとの報告があるので注意すること。また, 症状に応じて適切な処置を行うこと。
(2) **処置方法**
1) 一般的な対症療法が望ましいが, 過量服用の可能性のある場合は必要に応じて胃洗浄を行うこと。
2) 徐脈, 低血圧が重篤な場合, 必要に応じてアトロピンを使用する等適切な処置を行うこと。
3) 痙攣等があらわれた場合には, 直ちに投与を中止し, ベンゾジアゼピン系薬剤等の投与, 人工呼吸, 酸素吸入等必要に応じて適切な処置を行うこと。

14. 適用上の注意

(1) **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, 更には穿孔をお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。)
(2) **服用時**
食道に停留し, 崩壊すると食道潰瘍を起こすことがあるので, 多めの水で服用させ, 特に就寝直前の服用等には注意すること。

15. その他の注意

本剤とリドカインとの交叉過敏性(交叉アレルギー)についての証明はされていないが,本剤の投与により発現した副作用症状(過敏症状等)が,本剤の投与中止後,リドカイン投与により再発したとの報告がある。

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[8]:

LD_{50} 値 (mg/kg)

動物	性別	経口	皮下注	筋注	静注
マウス	♂	310	235	128	43
ラット	♂	330	540	260	27
ウサギ	♀	160	−	−	−
イヌ	♂	356	−	−	19

(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

(1) 製剤：劇薬, 処方箋医薬品[注)]

注)注意－医師等の処方箋により使用すること

(2) 有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3 年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

遮光保存, 室温保存, 気密容器

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について：

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)：

〔Ⅷ.6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕

〔Ⅷ.14.適用上の注意〕の項参照

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

カプセル 50mg

PTP：100 カプセル(10 カプセル×10)，1000 カプセル(10 カプセル×100)

カプセル 100mg

PTP：100 カプセル(10 カプセル×10)，1000 カプセル(10 カプセル×100)

7. 容器の材質

カプセル 50mg

PTP：PTP（ポリ塩化ビニルフィルム, アルミニウム箔）＋ポリピロー
＋紙箱

カプセル 100mg

PTP：PTP（ポリ塩化ビニルフィルム, アルミニウム箔）＋ポリピロー
＋紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：メキシチール®カプセル 50mg, メキシチール®カプセル 100mg,
メキシチール®点滴静注 125mg

同効薬：リドカイン塩酸塩, キニジン硫酸塩水和物, ジソピラミド等

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
メキシレチン塩酸塩 カプセル 50mg「JG」	2013 年 7 月 16 日 （販売名変更による）	22500AMX01070000
メキシレチン塩酸塩 カプセル 100mg「JG」	2013 年 7 月 16 日 （販売名変更による）	22500AMX01071000

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日	薬価基準経過措置期限
メキシレチン塩酸塩 カプセル 50mg「JG」	2013 年 12 月 13 日 （販売名変更による）	－
メキシレチン塩酸塩 カプセル 100mg「JG」	2013 年 12 月 13 日 （販売名変更による）	－

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

効能・効果及び用法・用量追加承認年月日：2005 年 6 月 2 日

内容：「糖尿病性神経障害に伴う自覚症状（自発痛, しびれ感）の改善」の効能・
効果及び用法・用量の追加

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

販売名	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
メキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」	102581118	2129003M1013	620258118
メキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」	102577419	2129003M2010	620257719

17. 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。

ＸＩ. 文献

1. 引用文献

1) 長生堂製薬株式会社　社内資料（安定性試験に関する資料）
2) 長生堂製薬株式会社　社内資料（安定性試験に関する資料）
3) 長生堂製薬株式会社　社内資料（溶出試験に関する資料）
4) 長生堂製薬株式会社　社内資料（溶出試験に関する資料）
5) 第十六改正日本薬局方解説書
6) 長生堂製薬株式会社　社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
7) 長生堂製薬株式会社　社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
8) 厚生省薬務局推薦：規制医薬品事典（第 5 版），薬業時報社

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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

その他の関連資料

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：

カプセル 50mg

1.試験目的

メキシレチン塩酸塩カプセル50mg「JG」について、脱カプセル後に内容物を粉末とした検体を下記条件にて保存し、安定性を確認した。

2.保存条件

・温度に対する安定性試験 ： 40±2℃/60±5%RH 30日 〔遮光 ・気密容器〕
・湿度に対する安定性試験 ： 25±2℃/75±5%RH 30日 〔遮光 ・開放容器〕
・光に対する安定性試験 ： 120万lux・hr 〔密閉容器(シャーレ+ラップ)〕※
※ 25±2℃/60±5%RH 1000 lux/hr 50日

3.試験項目

性状、定量試験

4.試験結果

<参考>製剤の規格(脱カプセル前の状態)

性状	頭部帯黄赤色不透明，胴部わずかに褐色がかった黄色不透明の硬カプセル剤で，内容物は白色の粒を含む粉末である.
含量	95.0～105.0%

保存条件	試験項目		試験開始時	15日	30日
温度	性状		白色の粉末	変化なし	変化なし
	定量試験	実測値	102.4%	101.4%	100.7%
		残存率	100.0%	99.0%	98.3%
湿度	性状		白色の粉末	変化なし	変化なし
	定量試験	実測値	102.4%	101.7%	101.0%
		残存率	100.0%	99.3%	98.6%

保存条件	試験項目		試験開始時	30万lux・hr (12.5日)	60万lux・hr (25日)	120万lux・hr (50日)
光	性状		白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
	定量試験	実測値	102.4%	101.9%	101.5%	103.0%
		残存率	100.0%	99.5%	99.1%	100.6%

カプセル 100mg

1.試験目的

メキシレチン塩酸塩カプセル100mg「JG」について、脱カプセル後に内容物を粉末とした検体を下記条件にて保存し、安定性を確認した。

2.保存条件

・温度に対する安定性試験 ： 40±2℃/60±5%RH 30日 〔遮光 ・気密容器〕
・湿度に対する安定性試験 ： 25±2℃/75±5%RH 30日 〔遮光 ・開放容器〕
・光に対する安定性試験 ： 120万lux・hr〔密閉容器(シャーレ+ラップ)〕※
※ 25±2℃/60±5%RH 1000 lux/hr 50日

3.試験項目

性状、定量試験

4.試験結果

<参考>製剤の規格(脱カプセル前の状態)

性状	頭部帯黄赤色不透明，胴部白色不透明の硬カプセル剤で，内容物は白色の粒を含む粉末である．
含量	95.0～105.0%

保存条件	試験項目		試験開始時	15日	30日
温度	性状		白色の粉末	変化なし	変化なし
	定量試験	実測値	102.5%	101.6%	101.0%
		残存率	100.0%	99.1%	98.5%
湿度	性状		白色の粉末	変化なし	変化なし
	定量試験	実測値	102.5%	101.3%	101.7%
		残存率	100.0%	98.8%	99.2%

保存条件	試験項目		試験開始時	30万lux・hr (12.5日)	60万lux・hr (25日)	120万lux・hr (50日)
光	性状		白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
	定量試験	実測値	102.5%	101.4%	102.0%	103.2%
		残存率	100.0%	98.9%	99.5%	100.7%

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性：

カプセル 50mg

1.試験目的

メキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」について、崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性を確認するため試験を実施した。

2.試験製剤

メキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」(カプセル剤)

3.試験方法

・崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内にカプセル剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、カプセル剤を開封し充填薬をディスペンサー内に入れてから、上記と同様の操作を行う。

・通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブ(8Fr.)の通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。

4.試験結果

●崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
メキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

●通過性試験結果

品目名	通過性
メキシレチン塩酸塩カプセル 50mg「JG」	8Fr.のチューブを通過した。 (チューブ内にカプセル皮膜の残留が認められた)

カプセル 100mg

1.試験目的

メキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」について、崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性を確認するため試験を実施した。

2.試験製剤

メキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」(カプセル剤)

3.試験方法

・崩壊懸濁試験:

ディスペンサー内にカプセル剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、カプセル剤を開封し充填薬をディスペンサー内に入れてから、上記と同様の操作を行う。

・通過性試験:

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブ(8Fr.)の通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。

4.試験結果

●崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
メキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

●通過性試験結果

品目名	通過性
メキシレチン塩酸塩カプセル 100mg「JG」	8Fr.のチューブを通過した。 (チューブ内にカプセル皮膜の残留が認められた)