

貯法: 室温保存
使用期限: 外箱等に表示(使用期間5年)

片頭痛・緊張性頭痛治療剤

ミグリステン錠20

ジメトチアジンメシル酸塩錠
Migristene®

承認番号	14700AMZ01054
薬価収載	1972年11月
販売開始	1972年11月
再評価結果	1989年9月

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- 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
- 昏睡状態にある患者〔昏睡状態が悪化するおそれがある。〕
- バルビツール酸誘導体・麻酔剤等の中枢神経抑制剤の強い影響下にある患者〔中枢神経抑制剤の作用を延長し増強させる。〕

【組成・性状】

1. 組成

販売名	ミグリステン錠20
有効成分 (1錠中)	ジメトチアジンメシル酸塩 24.9mg (ジメトチアジンとして20mgに相当)
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、タルク、白糖、ゼラチン、アラビアゴム末、安息香酸ナトリウム、沈降炭酸カルシウム、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルナウバロウ

2. 性状

販売名	ミグリステン錠20
性状・剤形	白色円形の糖衣錠である。
外形	 表面 裏面 側面
大きさ	直径 約6.1mm 厚さ 約3.7mm
重量	約0.12g
識別コード	Ⓢ 072 20

【効能・効果】

片頭痛、緊張性頭痛

【用法・用量】

通常、成人にはジメトチアジンとして1日60mgを3回に分けて経口投与する。

重症には必要に応じジメトチアジンとして1日120mgまで増量することができる。

年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 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の操作に従事させないように十分注意すること。**
- 制吐作用を有するため、他の薬剤に基づく中毒、腸閉塞、脳腫瘍等による嘔吐症状を不顕性化することがあるので注意すること。

2. 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 アルコール	相互に中枢神経抑制作用を増強することがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	共に中枢神経抑制作用を有する。
降圧剤	相互に降圧作用を増強することがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	共に降圧作用を有する。
アトロピン様作用を有する薬剤	相互に抗コリン作用を増強することがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	共に抗コリン作用を有する。

3. 副作用

再評価結果における安全性評価対象例1325例中、副作用は441例(33.28%)に認められた。主なものは、眠気175例(13.21%)等であった¹⁾。

また、6ヵ月以上の長期投与の16例について、臨床検査値の異常変動が検討され、末梢血、肝・腎機能のいずれも問題となる検査所見は認められなかった²⁾。

種類\頻度	5%以上又は頻度不明	0.1~5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注1}	発疹等		
皮膚	光線過敏症		色素沈着
精神神経系	眠気	ふらつき、めまい、倦怠感、不眠	振戦、神経過敏等
消化器	口渇	胃不快感、悪心、胃痛、便秘、下痢	食欲不振、腹痛、軟便等
内分泌系			乳房痛、月経異常等
その他			熱感

注1: 症状があらわれた場合には投与を中止すること。

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳中の婦人には、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。〔妊娠中及び授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

6. 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。)

【薬物動態】

1. 吸収

(参考)

ラットにジメトチアジン100mg/kg単回経口投与後の血漿中ジメトチアジン濃度は、投与2時間後に最高値0.4μg/mLとなり、24時間後には消失した³⁾。

2. 分布

(参考)

ラットにジメトチアジン単回経口投与2時間後の体内分布は、

ミグリステン錠 (2)

肝臓、肺に血漿の約80~100倍分布し、次いで腎臓、脾臓、脂肪組織、心臓、脳、腓腸筋の順であった。脳内濃度は血漿中濃度の約5倍であった。24時間後の各組織内濃度は、いずれもゼロに近かった³⁾。

3. 代謝

健康成人4例にジメトチアジンカプセル1mg/kgを単回経口投与したとき、ジメトチアジンは肝臓で代謝され、側鎖の脱メチル化、フェノチアジン核のSの酸化及び水酸化を受けた⁴⁾。(外国人によるデータ)

(承認用量：通常、1日60mgを3回に分けて経口投与する。)

4. 排泄

(参考)

ラットにジメトチアジン100mg/kgを単回経口投与したとき、24時間の未変化体の尿中排泄量は投与量の0.03%、また胆汁中排泄量は0.04%であった³⁾。

【臨床成績】

再評価結果における疾患別有効率は以下のとおりであった¹⁾。

表1 臨床成績

疾患名	有効例数/有効性評価対象例数	有効率 (%)
片頭痛	153/250	61.2
緊張性頭痛	26/68	38.2

【薬効薬理】

薬理作用

1. 抗セロトニン作用

セロトニンによるモルモット気管支痙攣、ラット後肢足底部浮腫及びラット毛細血管透過性増大に対し、プロメタジンと同等ないしは3倍の拮抗作用を示した^{5), 6)}。

2. 抗ヒスタミン作用

ヒスタミンによるモルモット気管支痙攣に対し、プロメタジンよりやや強い抗ヒスタミン作用を示した^{5), 6)}。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般的名称：ジメトチアジンメシル酸塩 (JAN) [局外規]

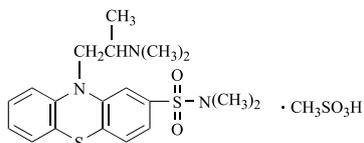
Dimetotiazine Mesilate

化学名：10-[2-(Dimethylamino)propyl]-N,N-dimethylphenothiazine-2-sulfonamide monomethanesulfonate

分子式：C₁₉H₂₅N₃O₂S₂ · CH₄O₃S

分子量：487.66

化学構造式：



性状：淡黄色の粉末で、においはなく、味は極めて苦い。

水に極めて溶けやすく、メタノール、エタノール (95)、アセトン又はクロロホルムに溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

融点：約170℃ (分解)

分配係数：3.09 [pH4.3, 1-オクタノール/緩衝液]

【包装】

ミグリステン錠20：PTP100錠 (10錠×10)

【主要文献】

- 1) 塩野義製薬集計；岩根弘明ほか：最新医学, 1968, 23(6), 1238ほか
- 2) 筒井末春ほか：最新医学, 1977, 32(6), 1182
- 3) 峰下鍊雄ほか：社内資料 (吸収, 分布, 排泄について, 1970)
- 4) Jolles, G. et al. : Arch. int. Pharmacodyn., 1968, 171(2), 449

5) Julou, L. et al. : Arch. int. Pharmacodyn., 1966, 159(1), 70

6) 城戸良之助ほか：応用薬理, 1968, 2(2), 173

【文献請求先】**,*

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

共和薬品工業株式会社 学術情報課

〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

発売元**,*

 共和薬品工業株式会社
大阪市北区中之島3-2-4

製造販売元

塩野義製薬株式会社

〒541-0045 大阪市中央区道修町3丁目1番8号