

貯 法：室温保存
有効期間：
SP包装：3年
*PTP包装：1年

重症筋無力症治療剤

ピリドスチグミン臭化物製剤

メスチノン[®]錠60mg

Mestinon Tablets

劇薬

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋により使用すること

承認番号	22000AMX02170
販売開始	1970年8月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

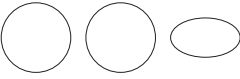
- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 消化管又は尿路の器質的閉塞のある患者〔蠕動運動を亢進させ、また排尿筋を収縮させるおそれがある。〕
- 2.3 迷走神経緊張症の患者〔迷走神経を興奮させるおそれがある。〕
- 2.4 脱分極性筋弛緩剤（スキサメトニウム塩化物水和物）を投与中の患者〔10.1 参照〕

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	メスチノン錠 60mg
有効成分	1錠中、日局ピリドスチグミン臭化物 60.0mg を含有する。
添加剤	軽質無水ケイ酸、トウモロコシデンプン、ポビドン、アルファー化デンプン、タルク、ステアリン酸マグネシウム、白糖、コメデンプン、アラビアゴム末、パラフィン、流動パラフィン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄

3.2 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
メスチノン錠 60mg	糖衣錠		KW600
	だいたい色	直径：約 9.2mm 厚さ：約 5.2mm 質量：約 350mg	

4. 効能又は効果

重症筋無力症

6. 用法及び用量

通常成人1日3錠を1日3回に分けて経口投与する。
ただし、医師の監督下に症状に応じて、適宜、用量および服用回数を増減することができる。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 重症筋無力症患者では、症状の重篤かつ急速な悪化をみる場合がある（クリーゼ）。
クリーゼには抗コリンエステラーゼ剤不足による筋無力性のクリーゼ（症状：呼吸困難、唾液排出困難、チアノーゼ、全身の脱力等）と同剤過剰によるコリン作動性クリーゼ（症状：腹痛、下痢、発汗、流涎、縮瞳、線維性攣縮、徐脈等）とがある。
この2種類のクリーゼの鑑別は、次のとおりである。

- 8.1.1 筋無力性クリーゼ：エドロホニウム塩化物 10mg を小注射器にとり、まず 2mg を静注し、約 1 分前後で過敏反応がみられない場合に、残りの 8mg を投与する。これにより筋力の改善が認められれば、筋無力性クリーゼであるので、メスチノンを増量すべきである。
- 8.1.2 コリン作動性クリーゼ：エドロホニウム塩化物投与後に症状悪化がみられればコリン作動性クリーゼであるので、直ちに投与を中止し、アトロピン硫酸塩水和物 1～2mg を静注

する。必要に応じて陽圧人工呼吸、気管切開等により気道を確保する。〔11.1.1、13.1 参照〕

- 8.2 ムスカリン様作用軽減のために、アトロピン硫酸塩水和物を投与することは、コリン作動性作用を過小評価し、メスチノンの過剰投与を招くおそれがあるので、常用すべきではない。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 気管支喘息の患者

気管支平滑筋を収縮させ、気管支喘息の症状を悪化させるおそれがある。

9.1.2 冠動脈閉塞のある患者

冠血流を著しく低下させるおそれがある。

9.1.3 徐脈のある患者

心拍数低下を起こすおそれがある。

9.1.4 消化性潰瘍のある患者

胃液分泌を亢進させ、症状を悪化させるおそれがある。

9.1.5 てんかんの患者

てんかんの症状を悪化させるおそれがある。

9.1.6 パーキンソン症候群の患者

パーキンソン症候群の症状を悪化させるおそれがある。

9.2 腎機能障害患者

高い血中濃度が持続するおそれがある。〔16.1 参照〕

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。

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。

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。

9.8 高齢者

少量から投与を開始するなど投与量に留意し、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。本剤は主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがある。

10. 相互作用

10.1 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
脱分極性筋弛緩剤 スキサメトニウム塩化物水和物（レラキシン） 〔2.4 参照〕	脱分極性筋弛緩剤の作用が増強するおそれがある。	本剤が脱分極性筋弛緩剤の代謝を阻害するためと考えられている。

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
副交感神経抑制剤 アトロピン硫酸塩水和物等	副交感神経抑制剤は、ムスカリン様作用を隠蔽し、本剤の過剰投与を招くおそれがある。	本剤と拮抗する。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
コリン作動薬 アセチルコリン 塩化物 ベタネコール塩 化物等 コリンエステラー ゼ阻害薬 ドネペジル塩酸 塩等	コリン作用が増強 するおそれがある。	本剤はコリンエス テラーゼを阻害す るため、相互に作用 が増強する。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 コリン作動性クリーゼ（頻度不明）

本剤の過剰投与によりニコチン様作用として呼吸筋麻痺、線維性攣縮が、ムスカリン様作用として腹痛、下痢、発汗、流涎、縮瞳、徐脈等があらわれることがある。[8.1.2、13.1 参照]

11.2 その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	1%未満	頻度不明
骨格筋	骨格筋の線 維性攣縮			
消化器	下痢 (14.8%)、 腹痛 (14.1%)、 流涎	悪心	腹鳴	嘔吐
循環器		動悸		
その他	発汗	頭痛	流涙、気管 支分泌の亢 進、耳鳴、 発疹	縮瞳

13. 過量投与

13.1 症状

コリン作動性クリーゼ（腹痛、下痢、発汗、流涎、縮瞳、線維性攣縮、徐脈等）が起こるおそれがある。[8.1.2、11.1.1 参照]

* 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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人 11 例にピリドスチグミン臭化物として、60mg を単回経口投与したときの血中半減期は約 200 分であった¹⁾。また、腎機能障害を有する患者 4 例に静脈注射したとき、腎機能障害のない患者 5 例と比べ半減期は約 3.4 倍に延長し、クリアランス値は約 1/4 に減少した²⁾。重症筋無力症患者 5 例に経口投与したとき、投与後 24 時間の尿中未変化体総排泄率は 2～16%であった³⁾(外国人における成績)。[9.2 参照]

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内一般臨床試験

66 例（小児 14 例、成人 52 例）の一般臨床試験における有効率は 87.9%（58/66 例）で、症状別臨床効果は以下のとおりであった⁴⁾。

表 17-1 症状別臨床効果

症状	有効率(%) (有効以上)
眼瞼下垂	92.6 (50/54)
複視	81.3 (26/32)
構音障害	84.6 (33/39)
嚥下障害	82.1 (32/39)
咀嚼障害	80.0 (4/5)
呼吸障害	61.3 (19/31)
四肢脱力	93.3 (42/45)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

本薬は、主に神経筋接合部のコリンエステラーゼ活性を可逆的に阻害してアセチルコリンの分解を抑制する結果、間接的にアセチルコリンの作用を増強するとともに、自らもアセチルコリン様作用を呈する。本薬のコリンエステラーゼ阻害作用、アセチルコリン作用増強作用、抗クラレ作用等はいずれもネオスチグミンより弱く、作用発現は緩徐でより持続的であった^{5),6)}。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名

ピリドスチグミン臭化物（Pyridostigmine Bromide）

化学名

3-Dimethylcarbamoyloxy-1-methyl pyridinium bromide

分子式

C₉H₁₃BrN₂O₂

分子量

261.12

性状

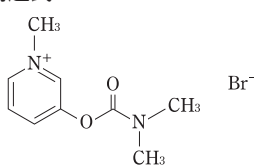
白色の結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。

水に極めて溶けやすく、エタノール（95）又は酢酸（100）に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品 1.0g を水 10mL に溶かした液の pH は 4.0～6.0 である。

潮解性である。

構造式



融点

153～157℃

* 20. 取扱い上の注意

SP 包装及び PTP 包装開封後は、湿気を避けて遮光して保存すること。

* 22. 包装

100 錠 [10 錠 (SP) × 10]
100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

23. 主要文献

- 1) Breyer-Pfaff, U., et al. : Clin. Pharmacol. Ther. 1985 ; 37 : 495-501
- 2) Cronnelly, R., et al. : Clin. Pharmacol. Ther. 1980 ; 28 : 78-81
- 3) Nowell, P. T., et al. : Br. J. Pharmacol. 1962 ; 18 : 617-624
- 4) 社内資料：臨床試験
- 5) 梶本礼義, 他：現代の臨床. 1969 ; 3 : 645-658
- 6) 梶本礼義：現代の臨床. 1968 ; 2 (6) : 395-405

24. 文献請求先及び問い合わせ先

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口
〒530-0005 大阪市北区中之島 3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

共和薬品工業株式会社

大 阪 市 北 区 中 之 島 3 - 2 - 4