

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

抗甲状腺剤

日本薬局方 チアマゾール錠

メルカゾール[®]錠2.5mg
メルカゾール[®]錠5mg
MERCAZOLE[®] TABLETS

剤形	錠 2.5mg : 淡赤色のフィルムコーティング錠 錠 5mg : 淡黄色のフィルムコーティング錠			
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）			
規格・含量	錠 2.5mg : 1錠中 日局チアマゾール 2.5mg 錠 5mg : 1錠中 日局チアマゾール 5mg			
一般名	和名：チアマゾール（JAN） 洋名：Thiamazole（JAN、INN）			
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日		製造販売承認年月日	薬価基準収載年月日	発売年月日
	錠 2.5mg	2020年8月17日	2020年12月11日	2021年2月18日
	錠 5mg	2006年8月24日	1957年12月1日	1956年7月5日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：あすか製薬株式会社 販売元：武田薬品工業株式会社			
医薬情報担当者の連絡先				
問い合わせ窓口	あすか製薬株式会社 くすり相談室 TEL 0120-848-339 FAX 03-5484-8358 医療関係者向けホームページ https://www.aska-pharma.co.jp/medical/index.html			

本 IF は 2025 年 6 月改訂の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。

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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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I F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I Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切に審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI F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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I F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

I F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。I F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・表現には薬機法の広告規則や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、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I F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、I Fを活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	VI. 薬効薬理に関する項目	9
1. 開発の経緯	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9
2. 製品の治療学的特性	1	2. 薬理作用	9
3. 製品の製剤学的特性	1	VII. 薬物動態に関する項目	10
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	1. 血中濃度の推移	10
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	2. 薬物速度論的パラメータ	11
6. RMPの概要	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析	11
II. 名称に関する項目	2	4. 吸収	12
1. 販売名	2	5. 分布	12
2. 一般名	2	6. 代謝	13
3. 構造式又は示性式	2	7. 排泄	14
4. 分子式及び分子量	2	8. トランスポーターに関する情報	14
5. 化学名（命名法）又は本質	2	9. 透析等による除去率	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 特定の背景を有する患者	14
III. 有効成分に関する項目	3	11. その他	14
1. 物理化学的性質	3	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	1. 警告内容とその理由	15
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	2. 禁忌内容とその理由	15
IV. 製剤に関する項目	4	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	15
1. 剤形	4	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	15
2. 製剤の組成	4	5. 重要な基本的注意とその理由	15
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	16
4. 力価	5	7. 相互作用	17
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	8. 副作用	18
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	10. 過量投与	20
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	11. 適用上の注意	20
9. 溶出性	5	12. その他の注意	20
10. 容器・包装	6	IX. 非臨床試験に関する項目	21
11. 別途提供される資材類	6	1. 薬理試験	21
12. その他	6	2. 毒性試験	21
V. 治療に関する項目	7	X. 管理的事項に関する項目	24
1. 効能又は効果	7		
2. 効能又は効果に関連する注意	7		
3. 用法及び用量	7		
4. 用法及び用量に関連する注意	7		
5. 臨床成績	7		

1. 規制区分	24
2. 有効期間	24
3. 包装状態での貯法	24
4. 取扱い上の注意	24
5. 患者向け資材	24
6. 同一成分・同効薬	24
7. 国際誕生年月日	24
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 記載年月日、販売開始年月日	24
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	24
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ の内容	25
11. 再審査期間	25
12. 投薬期間制限に関する情報	25
13. 各種コード	25
14. 保険給付上の注意	25
X I. 文献	26
1. 引用文献	26
2. その他の参考文献	26
X II. 参考資料	27
1. 主な外国での発売状況	27
2. 海外における臨床支援情報	27
X III. 備考	28
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	28
2. その他の関連資料	30

略語表

略語	Spelling	略語の内容
ALT (GPT)	Alanine transaminase (Glutamine-pyruvate transaminase)	アラニンアミノトランスフェラーゼ (グルタミン酸ピルビン酸転移酵素)
ANCA	Anti-neutrophil cytoplasmic antibody	抗好中球細胞質抗体
AST (GOT)	Aspartate aminotransferase (Glutamate-oxaloacetate transaminase)	アスパラギン酸アミノトランスフェ ラーゼ (グルタミン酸オキサロ酢酸転 移酵素)
AUC	Area Under the Curve	薬物血清中濃度-時間曲線下面積
CK	Creatine kinase	クレアチンキナーゼ
C _{max}	Maximum concentration	最高血清中濃度
CYP	Cytochrome P450	チトクローム 450
PTU	Propylthiouracil	プロピルチオウラシル
T _{1/2} / t _{1/2}	Biological half-life	消失半減期
T ₃	Triiodothyronine	トリヨードチロニン
T ₄	Thyroxine	サイロキシン
T _{max}	Time-to-maximum plasma concentration	最高血清中濃度到達時間

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1940年代、Astwoodらが、thiouracilに甲状腺ホルモン生成を阻害することにより、強い甲状腺機能抑制作用があることを発見して以来、次々と抗甲状腺剤が開発され、チアマゾールは甲状腺機能亢進症の治療に用いられるようになった¹⁾⁴⁾。

メルカゾール錠 5mg は 2015 年 10 月に中外製薬からあすか製薬に製造販売承認が承継された。従来より小用量剤の要望が多かったことから、あすか製薬はメルカゾール錠 5mg を糖衣錠からフィルムコーティング錠に変更した上でメルカゾール錠 2.5mg を開発し、2020 年 8 月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) メルカゾールの成分チアマゾールは、甲状腺機能亢進症に対し、プロピルチオウラシル (propylthiouracil, PTU) とともに広く用いられている。「Ⅵ.2.(1)作用部位・作用機序」の項参照)
- (2) 重大な副作用として、汎血球減少、再生不良性貧血、無顆粒球症、白血球減少、低プロトロンビン血症、第Ⅶ因子欠乏症、血小板減少、血小板減少性紫斑病、肝機能障害、黄疸、多発性関節炎、SLE 様症状、インスリン自己免疫症候群、間質性肺炎、抗好中球細胞質抗体 (ANCA) 関連血管炎症候群、横紋筋融解症、急性膵炎が報告されている。「Ⅷ. 8. 副作用」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

特になし

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料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	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

設定されていない

(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

メルカゾール® 錠 2.5mg

メルカゾール® 錠 5mg

(2) 洋名

MERCAZOLE® TABLETS

(3) 名称の由来

1-methyl-2-mercaptoimidazole (化学名) に由来

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

チアマゾール (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

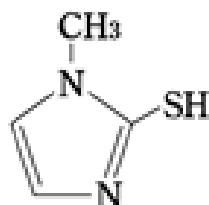
Thiamazole (JAN, INN)

Methimazole (USAN)

(3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₄H₆N₂S

分子量 : 114.17

5. 化学名 (命名法) 又は本質

1-Methyl-1*H*-imidazole-2-thiol (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号 : MMI

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～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末で、僅かに特異なおいがあり、味は苦い。

(2) 溶解性

水又はエタノール（95）に溶けやすく、ジエチルエーテルに溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：144～147℃

沸点：280℃（Merck Index 12th ed.）

(5) 酸塩基解離定数

pK_a = 約 11.7

(6) 分配係数⁵⁾

3～4（pH 1.8～8.0）

(7) その他の主な示性値

pH：本品 1.0g を水 50mL に溶かした液の pH は 5.0～7.0 である。

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、定量法

確認試験法

日本薬局方「チアマゾール」の確認試験による。

①ペンタシアノニトロシル鉄（Ⅲ）酸ナトリウム試液による呈色

②炭酸ナトリウム試液による呈色

定量法

日本薬局方「チアマゾール」の定量法による。

滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	メルカゾール錠 2.5mg			メルカゾール錠 5mg		
剤形	淡赤色のフィルムコーティング錠			淡黄色のフィルムコーティング錠		
外形	表	側面	裏	表	側面	裏
	直径約 7.2mm 厚さ約 3.2mm 質量約 132mg					
製剤表示	メルカゾール 2.5			メルカゾール 5		

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当しない

(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

1) 有効成分（活性成分）の含量

販売名	メルカゾール錠 2.5mg	メルカゾール錠 5mg
有効成分	1錠中 日局チアマゾール 2.5 mg	1錠中 日局チアマゾール 5 mg

2) 添加剤

販売名	メルカゾール錠 2.5mg	メルカゾール錠 5mg
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、部分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、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 6000、カルナウバロウ	
	三二酸化鉄	黄色三二酸化鉄

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当しない

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

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

〈メルカゾール錠 2.5mg〉

加速試験

保存条件	保存期間	保存形態	結果
40°C、75%RH	6 カ月	PTP／ピロー包装	規格内

測定項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、定量

長期保存試験

保存条件	保存期間	保存形態	結果
25°C、60%RH	36 カ月	PTP／ピロー包装	規格内

測定項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、定量

〈メルカゾール錠 5mg〉

加速試験

保存条件	保存期間	保存形態	結果
40°C、75%RH	6 カ月	PTP／ピロー包装	規格内

測定項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、定量

長期保存試験

保存条件	保存期間	保存形態	結果
25°C、60%RH	36 カ月	PTP／ピロー包装	規格内

測定項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、定量

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（物理化学的变化）

該当しない

9. 溶出性

(1) 溶出規格への適合性

本剤につき日本薬局方製剤総則錠剤の項に定める崩壊試験法により試験を行うとき、これに適合する。

(2) 溶出挙動の類似性

〈メルカゾール錠 2.5mg〉

「Ⅶ. 1. (2). 3) 生物学的同等性試験」の項参照

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

メルカゾール錠 2.5mg : 100錠 [10錠(PTP)×10]

: 500錠 [10錠(PTP)×50]

メルカゾール錠 5mg : 100錠 [10錠(PTP)×10]

: 500錠 [10錠(PTP)×50]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP包装	PTPシート	遮光ポリプロピレン、アルミニウム
	ピロー	アルミニウム・ポリプロピレン

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

甲状腺機能亢進症

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

チアマゾールとして、通常成人に対しては初期量 1 日 30mg を 3～4 回に分割経口投与する。症状が重症のときは、1 日 40～60mg を使用する。機能亢進症状がほぼ消失したなら、1～4 週間毎に漸減し、維持量 1 日 5～10mg を 1～2 回に分割経口投与する。

通常小児に対しては初期量 5 歳以上～10 歳未満では 1 日 10～20mg、10 歳以上～15 歳未満では 1 日 20～30mg を 2～4 回に分割経口投与する。機能亢進症状がほぼ消失したなら、1～4 週間毎に漸減し、維持量 1 日 5～10mg を 1～2 回に分割経口投与する。

通常妊婦に対しては初期量 1 日 15～30mg を 3～4 回に分割経口投与する。機能亢進症状がほぼ消失したなら、1～4 週間毎に漸減し、維持量 1 日 5～10mg を 1～2 回に分割経口投与する。正常妊娠時の甲状腺機能検査値を低下しないよう、2 週間毎に検査し、必要最低限量を投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

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

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

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

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

チオウレイン系薬物 一般名：プロピルチオウラシル

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

甲状腺のペルオキシダーゼを阻害することにより、ヨウ素のサイログロブリンへの結合を阻止し、さらにヨードサイロシンのトリヨードサイロニン (T₃)、サイロキシシン (T₄) への縮合を阻害することによって甲状腺ホルモンの生成を阻害する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

①ヨウ素化阻害作用

羊の甲状腺を用いた実験で、チアマゾールはヨウ素に対し強い競合阻害を示した⁷⁾。

②基礎代謝抑制作用

乾燥甲状腺末投与による甲状腺機能亢進症ラットにチアマゾールを投与すると、基礎代謝亢進が著しく抑制される⁸⁾。

③末梢組織酸化抑制作用

乾燥甲状腺末投与及び正常ラットの心臓 homogenate の cytochrome 酸化酵素、コハク酸脱水素酵素の活性は、チアマゾール投与により抑制されることから末梢組織の酸化機能も抑制する⁸⁾。

(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

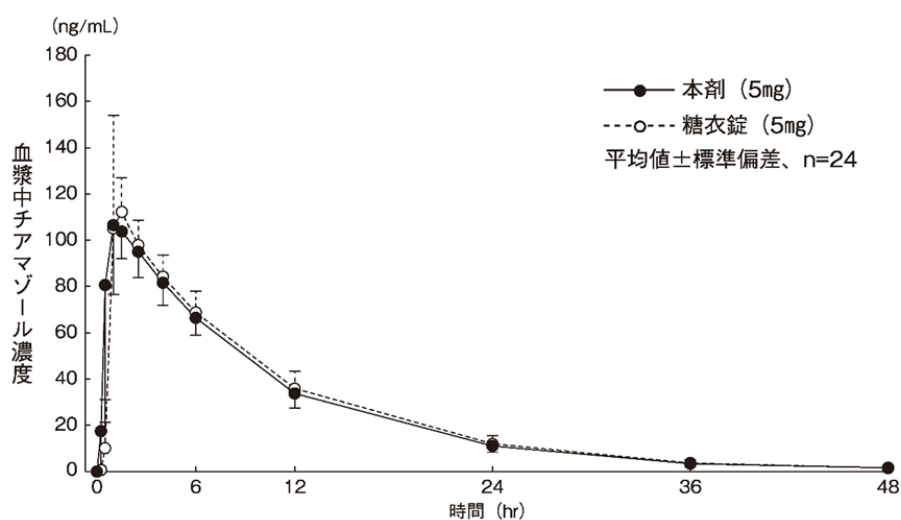
1) 単回投与

〈メルカゾール錠 5mg〉

健康成人男性に本剤（フィルムコーティング錠 5mg）1錠又は糖衣錠（5mg）1錠を絶食時単回経口投与した結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。薬物動態パラメータ及び血漿中濃度は以下のとおりであった⁹⁾。

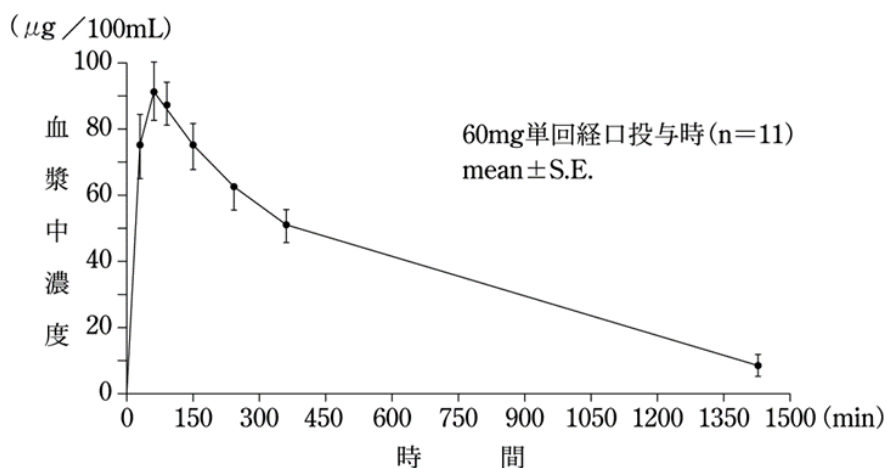
投与量	例数	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
本剤（5mg）	24	1179±146	128.5±25.6	1.0±0.6	7.5±0.9
糖衣錠（5mg）	24	1204±186	129.8±23.6	1.3±0.4	7.4±0.7

(平均値±標準偏差)



〈参考〉外国人データ

甲状腺機能正常者 11 例に 60mg を単回経口投与したところ、平均血漿中濃度は投与 1 時間後に 920ng/mL と最高になり、24 時間後にほぼ消失した。T_{1/2} (150~360min) は 6.4 時間であった¹⁰⁾。



〈メルカゾール錠 2.5mg〉

該当資料なし

2) 反復投与

該当資料なし

3) 生物学的同等性試験

〈メルカゾール錠 2.5mg〉

メルカゾール錠 2.5mg は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、メルカゾール錠 5mg を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた⁶⁾。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

該当資料なし

2) 薬物間相互作用

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

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) 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¹¹⁾

630±110mL/kg

(6) その他

該当資料なし

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

(1) バイオアベイラビリティ¹¹⁾

AUC $7.05 \pm 0.95 \mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$

<参考>動物での体内動態

ラットに ^{14}C -チアマゾール 20mg/kg を経口、腹腔内、静脈内投与した結果、経口、腹腔内投与における吸収は同傾向を示した⁵⁾。

(2) 吸収部位

該当資料なし

<参考>外国人データ

腸管より速やかに吸収される¹⁰⁾。

5. 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

<参考>外国人データ

妊娠 14 週及び 16 週の妊婦に ^{35}S -チアマゾールを経口投与した場合、約 2 時間後の胎児血清中濃度/母体血清中濃度比は各々、0.72、0.81 であった¹²⁾。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>外国人データ

母乳/血清比が、1.16¹³⁾、0.98¹⁴⁾、1.03¹⁵⁾という値が報告されている。

(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

ラットに ^{14}C -チアマゾール 20mg/kg を経口、腹腔内、静脈内投与した結果、特定組織への親和性は認められず、血漿蛋白結合率は 5%であった⁵⁾。

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

<参考>外国人データ

ほとんど結合しないとの報告がある¹⁴⁾。

<参考>動物での体内動態

ラットに ^{14}C -チアマゾール 20mg/kg を経口、腹腔内、静脈内投与した結果、特定組織への親和性は認められず、血漿蛋白結合率は 5%であった⁵⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

1) 代謝部位

該当資料なし

2) 代謝経路

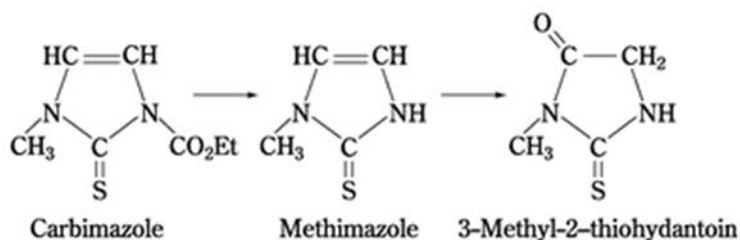
該当資料なし

<参考>動物での体内動態

ラットに ^{14}C -チアマゾール 20mg/kg を経口、腹腔内、静脈内投与した結果、主要代謝産物はグルクロナイド抱合体で、その量は投与量に対し尿中で 36~48%、胆汁中で 4% であった⁵⁾。

<参考>カルビマゾールの代謝

3-Methyl-2-thiohydantoin は Carbimazole 投与の 3%に認められた¹⁶⁾。



(2) 代謝に関与する酵素 (CYP等) の分子種、寄与率

該当資料なし

(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

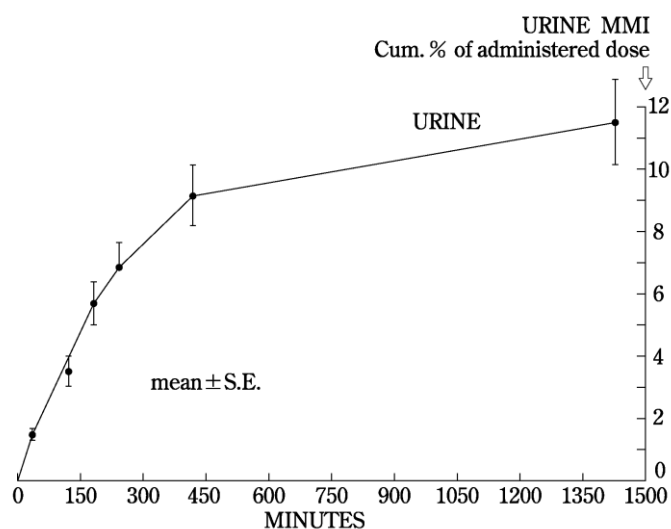
該当資料なし

<参考>外国人データ

甲状腺機能正常者 11 例に 60mg を単回経口投与したところ、24 時間までに投与量の 11.6% が尿中に排泄された¹⁰⁾。

<参考>動物での体内動態

ラットに ¹⁴C-チアマゾール 20mg/kg を経口、腹腔内、静脈内投与した結果、尿中排泄率は各投与経路で同傾向を示し、投与 24 時間後では radioactivity の 80% が排泄され、うち 14~21% が未変化で排泄された⁵⁾。



甲状腺機能正常者 11 例における尿中排泄（投与量に対する割合）

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

「Ⅷ. 6. (8) 高齢者」の項参照

11. その他

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

1. 警告

1.1 重篤な無顆粒球症が主に投与開始後 2 ヶ月以内に発現し、死亡に至った症例も報告されている。少なくとも投与開始後 2 ヶ月間は、原則として 2 週に 1 回、それ以降も定期的に白血球分画を含めた血液検査を実施し、顆粒球の減少傾向等の異常が認められた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、一度投与を中止して投与を再開する場合にも同様に注意すること。[8.1、8.2、11.1.1 参照]

1.2 本剤投与に先立ち、無顆粒球症等の副作用が発現する可能性があること及びこの検査が必要であることを患者に説明するとともに、下記について患者を指導すること。

- ・ 無顆粒球症の症状（咽頭痛、発熱等）があらわれた場合には速やかに主治医に連絡すること。
- ・ 少なくとも投与開始後 2 ヶ月間は原則として 2 週に 1 回、定期的な血液検査を行う必要があるため、通院すること。

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

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

8. 重要な基本的注意

8.1 本剤を新たに投与開始する場合には、無顆粒球症等の重大な副作用が主に投与開始後 2 ヶ月以内にあらわれることがあるので、本剤の有効性と安全性を十分に考慮し、本剤の投与が適切と判断される患者に投与すること。[1.1、11.1.1 参照]

8.2 定期的な血液検査において、白血球数が正常域であったとしても、減少傾向にある場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。[1.1、11.1.1 参照]

8.3 肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、肝機能検査値に注意するなど観察を十分に行うこと。[11.1.3 参照]

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. 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 中等度以上の白血球減少又は他の血液障害のある患者

白血球減少あるいは血液障害を悪化させるおそれがある。[11.1.1、11.1.2 参照]

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

肝障害を悪化させるおそれがある。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

9.5.1 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。妊娠中の投与により、新生児に頭皮欠損症・頭蓋骨欠損症、さい帯ヘルニア、さい腸管の完全または部分的な遺残（さい腸管ろう、メッケル憩室等）、気管食道ろうを伴う食道閉鎖症、後鼻孔閉鎖症等があらわれたとの報告がある。また、妊娠中の投与により、胎児に甲状腺機能抑制、甲状腺腫を起こすことがある。本剤はヒト胎盤を通過することが報告されている。

9.5.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性に投与する場合には、定期的に甲状腺機能検査を実施し、甲状腺機能を適切に維持するよう投与量を調節すること。

9.5.3 新生児に出生後しばらくは、甲状腺機能抑制、甲状腺機能亢進があらわれることがある。

(解説)

9.5 「IX.2. (5) 生殖発生毒性試験」の項参照

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

授乳を避けさせること。ヒト母乳中へ移行（血清とほぼ同等レベル）し、乳児の甲状腺機能に影響を与えることがある。

(解説)

9.6「VII.5.(3) 乳汁への移行性」の項参照

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

用量に注意すること。一般に生理機能が低下していることが多い。

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. 相互作用

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
クマリン系抗凝血剤 ワルファリンカリウム	併用開始時、中止時及び病態の変化に応じて血液凝固能が変化するので、血液凝固能検査値の変動に十分注意し、必要があれば抗凝血剤の用量調節を行う。	甲状腺機能が亢進すると凝固因子の合成・代謝亢進により、相対的にクマリン系抗凝血剤の効果は増強する。本剤投与により甲状腺機能が正常化すると、増強されていたクマリン系抗凝血剤の効果が減弱するとの報告がある。
ジギタリス製剤 ジゴキシン等	併用開始時、中止時及び病態の変化に応じてジギタリス製剤の血中濃度が変動するので、血中濃度の変動に十分注意し、必要があればジギタリス製剤の用量調節を行う。	甲状腺機能亢進時には、代謝・排泄が促進されているため、ジギタリス製剤の血中濃度が正常時に比較して低下する。本剤投与により甲状腺機能が正常化すると、ジギタリス製剤の血中濃度が上昇するとの報告がある。

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 汎血球減少、再生不良性貧血、無顆粒球症、白血球減少（いずれも頻度不明）

初期症状として発熱、全身倦怠、咽頭痛等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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。[1.1、8.1、8.2、9.1.1 参照]

11.1.2 低プロトロンビン血症、第Ⅶ因子欠乏症、血小板減少、血小板減少性紫斑病（いずれも頻度不明）

[9.1.1 参照]

11.1.3 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

[8.3 参照]

11.1.4 多発性関節炎（頻度不明）

多発性や移動性の関節炎があらわれることがある。

11.1.5 SLE 様症状（頻度不明）

発熱、紅斑、筋肉痛、関節痛、リンパ節腫脹、脾腫等があらわれることがある。

11.1.6 インスリン自己免疫症候群（頻度不明）

低血糖等があらわれることがある。

11.1.7 間質性肺炎（頻度不明）

発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、このような症状があらわ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。

11.1.8 抗好中球細胞質抗体（ANCA）関連血管炎症候群（頻度不明）

本剤投与中に急速進行性腎炎症候群（初発症状：血尿、蛋白尿等）や肺出血（初発症状：咳嗽、喀血、呼吸困難等）、発熱、関節痛、関節腫脹、皮膚潰瘍、紫斑等の ANCA 関連血管炎症候群による障害があらわれることがある。このような症状があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

11.1.9 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

11.1.10 急性膵炎（頻度不明）

上腹部痛、背部痛、発熱、嘔吐等の症状、膵酵素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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用	
	頻度不明
肝臓	AST 上昇、ALT 上昇等
皮膚	脱毛、色素沈着、掻痒感、紅斑、多形紅斑等
消化器	悪心・嘔吐、下痢、食欲不振等
精神神経系	頭痛、めまい、末梢神経異常等
過敏症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、発熱等
筋・骨格	こむらがえり、筋肉痛、関節痛
血液	好酸球増多
その他	CK 上昇、倦怠感、リンパ節腫脹、唾液腺肥大、浮腫、味覚異常 (味覚減退を含む)

注) このような場合には他の薬剤に切り換えること。症状が軽い場合は、抗ヒスタミン剤を併用し、経過を観察しながら慎重に投与すること。

(解説)

ときに発疹、蕁麻疹、発熱等の過敏症状があらわれることがあるので、このような場合には他の薬剤に切り換えること。症状が軽い場合は、抗ヒスタミン剤を併用し、経過を観察しながら慎重に投与すること。

<参考>

日本で見られていない外国での副作用報告¹⁷⁾

nephritis (腎炎)、renalvasculitis (腎尿細管炎)、coldness (寒冷)、constipation (便秘)、dryskin (乾燥肌)、sleepiness (眠気)、weightgain (体重増加)

◆項目別副作用発現頻度

<参考>

国内文献 (再評価申請時の文献調査) 35 報によれば 732 症例中 83 例 (11.3%) に副作用が認められ、その内容は過敏症 41 件 (5.60%)、消化器症状 14 件 (1.91%)、白血球減少症 23 件 (3.14%)、無顆粒球症 5 件 (0.68%)、肝障害 2 件 (0.27%) 等であった。

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

甲状腺腫、甲状腺機能低下があらわれることがある。

(解説)

<参考>

過量投与時の処置¹⁸⁾

- ①気道確保、呼吸・循環の管理、バイタルサイン、血液ガス、血清電解質、骨髄機能の監視
- ②活性炭投与の反復（強制利尿、腹膜透析、血液透析、血液灌流の有効性は確立されていない）

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

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 シートの誤飲防止のため、PTP 製剤に共通の注意事項（平成 22 年 9 月 15 日付 医政総発 0915 第 2 号、薬食総発 0915 第 5 号、薬食安発 0915 第 1 号）として記載した。

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

設定されていない

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

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

<参考>

①小腸に対する作用

モルモットの小腸を用い、Magnas 法で実験した結果では、何らの固有作用も示さなかった。また、塩化バリウムによるけいれん状態に対する緩解作用もみられなかった¹⁹⁾。

②血圧への影響

チアマゾール 100mg をネコ (Numalnakose の状態) の静脈に注射したが、何ら影響を示さなかった¹⁹⁾。

③放射線障害防御作用

チアマゾールは分子内に SH 基を有し、システイン同様、放射線障害の防御作用を有すると言われている。dd 系の雄雌マウスにチアマゾール 5mg、25mg/kg を腹部皮下に投与した後、700 γ 全身照射し、生存率、体重の推移を調べたところ、コントロールは 14 日までに全例死亡したが、チアマゾール 25mg 投与群 30 日目において、雄は全例生存、雌は 70% が生存であった。照射により減少した体重は 5mg、25mg 投与群とも 30 日目に照射前の値に回復した¹⁷⁾。また、Wistar 系ラットにチアマゾール 5mg/kg を腹部皮下に投与後、300 γ 全身照射した場合の赤血球数、血色素数、白血球数の 30 日目回復率はコントロール群の 89~93%、90~95%、92~99% に対し、投与群は 102~105%、104~105%、117~125% であった²⁰⁾。

RF 系及び C57BL/6 系のマウスを用い、照射 1 週間前よりチアマゾール 0.5% 量を飲料水にとかして自然給水し、RF 系には 600 γ 、C57BL/6 系には 650 γ の X 線を全身照射したとき、両系統の死亡率は 62.3%、79.7% でコントロールの 84.9%、90.9% より低下した。この効果は系統間で差があり、X 線感受性の強い RF 系でより高い効果を示した²¹⁾。

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

チアマゾールの LD₅₀ 値 (mg/kg)¹⁹⁾

動物	経口	皮下
マウス	860	345
ラット	2,250	—

(2) 反復投与毒性試験

- 1) ラットに 100~200mg/kg を 5 週間経口投与し、血液所見を観察したところ、200mg/kg 投与群で赤血球、白血球、リンパ球、顆粒球の減少がみられた¹⁹⁾。
- 2) ウサギに 25mg/kg を 8 週間経口投与したが、体重減少、血液像等の変化はみられなかった¹⁹⁾。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

生後 2 ヶ月の C3H 系マウスにチアマゾール含有の飲料水を 26 ヶ月供与した。チアマゾール濃度は 35mg/L より徐々に増量させ、最終的に 500mg/L とした。チアマゾール投与群の甲状腺重量は有意に増加し、19~20 ヶ月目に最高に達したが甲状腺癌は投与群、control 群に各 1 例見出されたのみであった。組織学的には、甲状腺短立方上皮細胞から過形成円柱上皮細胞への発達、腺房内のコロイドの染色性低下、量の減少、空胞化が認められた。また、甲状腺組織の乳酸生成量は両群間に差がみられなかった²²⁾。

(5) 生殖発生毒性試験

チアマゾールの 0 (蒸留水)、25、50、100、及び 200mg/kg/day を SD 系ラットの胎児器官形成期に経口投与し、母動物、胎児の発生ならびに出生児(F1)に及ぼす影響を検討した。母動物所見としては、200mg/kg 群で 20 例中 3 例が死亡、その他の個体にも消瘦、流涎、立毛、脱毛などの一般状態の悪化が認められた。また、100mg/kg 群でも消瘦、流涎が認められた。体重及び摂餌量は、投与翌日よりすべての投薬群において減少が認められた。また、妊娠期間の延長が 200mg/kg 群で認められた。胎児所見として、すべての投薬群で体重の低下が認められた。一方、黄体数、着床数、胎児死亡率及び性比については投薬の影響はなかった。胎児骨格検査において、200mg/kg 群で骨格異常の発生率が 6.8%、骨格変異の発生率は 95.8%と、それぞれ有意に増加した。胎児外形及び内臓への影響は認められなかった。出生児(F1)では、離乳後に全ての投薬群で体重増加抑制がみられた。一方、諸機能、行動、性周期、妊娠維持、帝王切開所見には投薬の影響はなかった。また、生殖機能検査に用いた 200mg/kg 群の雄 3 例中 2 例に精巣萎縮及び精巣上体形成不全が認められた。以上の結果より、胚致死作用は認められなかったものの、胎児発育及び形態形成への影響が示唆された。母動物における一般毒性的な無影響量は 25mg/kg 以下、生殖機能に対する無影響量は 100mg/kg、胎児及び出生児の発達に対する無影響量は 25mg/kg 以下と結論した²³⁾。

(6) 局所刺激性試験

2%溶液を用い、ウサギに静脈注射、ラットに皮下注射を行ったが、局所刺激現象はみられなかった¹⁹⁾。

(7) その他の特殊毒性

血液像、造血器官に及ぼす影響

①ラット

チアマゾール 100, 200mg/kg を 5 週間経口投与した。実験期間中、死亡例は 100mg/kg 投与の場合は認められず、200mg/kg 投与では 5 匹中 3 匹が死亡した¹⁹⁾。

投与量	所見
100mg/kg	赤血球、白血球は 5 週間以内で変化なし。 胸骨髄もほとんど正常。
200mg/kg	投与後、2 週間目より白血球数 50%減少、リンパ球、顆粒球も同一比率で減少。骨髄芽細胞の左方推移は認められない。赤血球数は 30%低下。

②ウサギ

チアマゾール 25mg/kg を 8 週間経口投与した。この期間中、体重の減少、その他の目立った症状は認められず、血液像の変動もみられなかった¹⁹⁾。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：メルカゾール錠 2.5mg・5mg

処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：チアマゾール

該当しない

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取り扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は遮光して保存すること。

5. 患者向け資材

(1) 患者向医薬品ガイド：あり

(2) くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分：メルカゾール注 10mg

同効薬：プロピルチオウラシル

7. 国際誕生年月日

不明

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

販売名	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
メルカゾール錠 2.5mg	2020年8月17日	30200AMX00765	2020年12月11日	2021年2月18日
メルカゾール錠 5mg	2006年8月24日 2015年10月1日 (製造販売承認を承継)	21800AMX10800	1957年12月1日	1956年7月5日
メルカゾール錠 (旧販売名)	1985年5月15日	16000AMZ00647		

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

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

〈メルカゾール錠 5mg〉

再評価結果公表年月日：1978年3月24日（第一次再評価結果その14）

内容：「有用性が認められるもの」と判定された。

11. 再審査期間

該当しない

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
メルカゾール錠 2.5mg	2432001F2021	2432001F2021	128424901	622842401
メルカゾール錠 5mg	2432001F1017	2432001F1033	105161202	620004391

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 熊原雄一他:治療.1964;46(3):595-602
- 2) 大塚舜一他:日本内分泌学会雑誌.1970;46(9):1048
- 3) 上野高次他:診療と新薬.1965;2(6):647-651
- 4) 藤原元始他 (監訳) :グットマン・ギルマン薬理書, 廣川書店.1992:1688-1692
- 5) Sitar, DS., et al.:J Pharm Exp Ther.1973;184(2):432-439 (PMID:4688180)
- 6) 社内資料 : 溶出試験
- 7) De Groot, LJ. et al.:Endocrinology.1962;70:492-504 (PMID:13884895)
- 8) 坪井 実他 : 総合医学.1957;14(12):1048-1051
- 9) 社内資料:薬物動態比較試験, 健康成人男性
- 10) Pittman, J.A.et al.:J Clin Endocrinol Metab.1971;33(2):182-185 (PMID:4105238)
- 11) 奥野晃正他 : 日本内分泌学会雑誌.1984;60(8):985-994
- 12) Marchant, B.et al.:J Clin Endocrinol Metab.1977;45(6):1187-1193 (PMID:591614)
- 13) Tegler, L.et al.:Lancet.1980;2(8194):591 (PMID:6158636)
- 14) Johansen, K.et al.:Eur J Clin Pharmacol.1982;23(4):339-341 (PMID:6897386)
- 15) Cooper, DS.et al.:J Clin Endocrinol Metab.1984;58(3):473-479 (PMID:6546390)
- 16) Skellern, GG.et al.:Xenobiotica.1977;7(4):247-253 (PMID:868080)
- 17) United States Pharmacopeial Convention. USP—DI20th ed.: Englewood CO: MicromedixInc.2000;1:461
- 18) Montvale, NJ.:Physicians' Desk Reference 53rd ed.: Medicaeconomics Data.1999: 1447-1448
- 19) Brock, N.et al.:Arzneim Forsch.1954;4(1):20-26 (PMID:13140049)
- 20) 田崎 力:久留米医学会雑誌.1960;23(10):4752-4792
- 21) Hayakawa, J.et al.:Strahlentherapie.1961;116:415-419 (PMID:13905556)
- 22) Jemec, B.:Acta Pathol Microbiol Scand A.1970;78(2):151-160 (PMID:4193619)
- 23) 社内資料:ラットにおける器官形成期経口投与試験.1992

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

メルカゾール錠は、外国で発売されていない。

チアマゾール製剤として、Tapazole (Eli Lilly Co. Ltd.), Favistan (Asta Co. Ltd.) 等がある。

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

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。

(掲載根拠：「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する Q&A について (その3)」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課事務連絡)

(1) 粉砕

<メルカゾール錠 2.5mg・5mg>

貯法：室温保存

取扱い上の注意：アルミピロー包装開封後は遮光して保存すること。

粉砕後の安定性

メルカゾール錠 2.5mg 及び錠 5mg の粉砕後の安定性は、それぞれ以下のとおりであった。

試験薬剤

メルカゾール錠 2.5mg (Lot No. P123A)

メルカゾール錠 5mg (Lot No. THZ01C)

<メルカゾール錠 2.5mg (Lot No. P123A) >

測定項目	錠剤としての規格
性状	淡赤色のフィルムコーティング錠
含量	94.0~106.0%

◆保存条件：40±2℃（遮光・気密容器）

測定項目		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	フィルム片	淡赤色	淡赤色	淡赤色	淡赤色
	粉末	白色	白色	白色	白色
含量		100.0%	98.7%	99.4%	99.8%

◆保存条件：25±2℃、75±5%RH（遮光・開放）

測定項目		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	フィルム片	淡赤色	淡赤色	淡赤色	淡赤色
	粉末	白色	白色	白色	白色
含量		100.0%	98.3%	97.5%	98.1%

◆保存条件：光：120 万 Lux・hr (25℃・開放)

測定項目		開始時	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
性状	フィルム片	淡赤色	淡赤色	淡赤色
	粉末	表面：白色 内部：白色	表面：白色 内部：白色	表面：白色 内部：白色
含量		100.0%	94.9%	95.8%

<メルカゾール錠 5mg (Lot No. THZ01C) >

測定項目	錠剤としての規格
性状	淡黄色のフィルムコーティング錠
含量	94.0~106.0%

◆保存条件：40±2℃ (遮光・気密容器)

測定項目		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	フィルム片	淡黄色	淡黄色	淡黄色	淡黄色
	粉末	白色	白色	白色	白色
含量		99.5%	98.7%	99.1%	99.6%

◆保存条件：25±2℃、75±5%RH (遮光・開放)

測定項目		開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	フィルム片	淡黄色	淡黄色	淡黄色	淡黄色
	粉末	白色	白色	白色	白色 (一部凝集 ^{注)})
含量		99.5%	99.4%	97.9%	98.9%

注)：保存した粉末の一部が凝集し、ガラス容器に付着する現象が確認された。ガラス容器を傾けることにより取り出せた塊は薬さじで触れると容易に崩れた。

◆保存条件：光：120 万 Lux・hr (25℃・開放)

測定項目		開始時	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
性状	フィルム片	淡黄色	淡黄色	淡黄色
	粉末	表面：白色 内部：白色	表面：淡黄色 内部：白色	表面淡黄色 内部：白色
含量		99.5%	96.4%	94.0%

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

試験製剤

メルカゾール錠 2.5mg (Lot No. P123A)

メルカゾール錠 5mg (Lot No. THZ01C)

1) 崩壊・懸濁性

懸濁条件：製剤 1 錠分のコーティング粉砕品をディスペンサーに入れた後、55°Cの温湯 20mL を吸い取り、5 分自然放置し、ディスペンサーを手で 90°、15 往復横転し、試験した。さらに時間を追加し観察する場合は、5 分放置するごとに、同様の操作を行った。

破壊操作：コーティング破壊操作あり（錠剤を薬包紙で包み、乳棒で 15 回叩いてコーティングを破壊）。

測定項目	測定条件	結果	
		メルカゾール錠 2.5mg	メルカゾール錠 5mg
崩壊懸濁性	10 分 (55°Cの温湯 20mL)	錠剤のコーティング破壊後、完全に崩壊・懸濁した。	

2) 経管投与チューブの通過性

測定項目	測定条件	結果	
		メルカゾール錠 2.5mg	メルカゾール錠 5mg
チューブ通過性	8 Fr.チューブ	通過性は良好であった。	

3) 懸濁後の含量

測定項目	測定条件	結果	
		メルカゾール錠 2.5mg	メルカゾール錠 5mg
懸濁後の含量	55°C の温湯 20mL	101.2% (100.7~101.8%)	99.5% (99.2~99.7%)
	室温水 20mL	100.6% (100.1~100.9%)	99.6% (99.2~100.3%)

2. その他の関連資料

承認申請に際し、準拠又は参考とした通知名

- ・後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発第 0229 号第 10 号）