



** 2010年12月改訂
(第11版, 包装変更による改訂)

網膜・硝子体・小児喘息・甲状腺疾患治療剤

日本標準商品分類番号 873221

* 2009年11月改訂

処方せん医薬品：注意－医師等の
処方せんにより
使用すること
貯 法：室温保存
使用期間：5年
使用期限：外箱に表示

ヨウレチン®錠「50」^①
ヨウレチン®錠「100」^②
***ヨウレチン®散0.02%^③**
Jolethin®
 (ヨウ素レシチン製剤)

	①	②	**③
承認番号	13512KUZ08503004	13512KUZ08503005	22100AMX01680000
薬価収載	1958年3月10日	1970年8月1日	2009年11月13日 (販売名変更)
販売開始	1958年4月1日	1970年9月1日	1969年3月1日
再評価結果	1984年6月	1984年6月	1984年6月

*** 禁忌 (次の患者には投与しないこと)**

ヨード過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

販売名	ヨウレチン錠「50」	ヨウレチン錠「100」	ヨウレチン散0.02% ¹⁾
成分・含量	1錠中 ヨウ素レシチン0.75mg (ヨウ素量50 μ g)	1錠中 ヨウ素レシチン1.5mg (ヨウ素量100 μ g)	1g中 ヨウ素レシチン3.0mg (ヨウ素量200 μ g)
添加物	カンゾウ末、 乳糖、黄色5号	カンゾウ末、 乳糖	カンゾウエキス、 乳糖
性状・剤形	橙色の糖衣錠	白色の糖衣錠	淡黄白色 ^{注)} 細粒状の散剤
外形	表面 側面 	表面 側面 	
大きさ	直径 8.1mm 厚さ 4.4mm 重量 0.23g	直径 8.1mm 厚さ 4.4mm 重量 0.23g	
識別コード	なし	なし	

注) 原料であるカンゾウエキスは天然物のため、色の濃い粒子が混じることがありますが、効能・効果に問題はありません。

【効能・効果】

- ヨード不足による甲状腺腫、ヨード不足による甲状腺機能低下症
- 中心性網膜炎、網膜出血、硝子体出血・混濁、網膜中心静脈閉塞症
- 小児気管支喘息、喘息様気管支炎

【用法・用量】

* 通常ヨウ素として10 μ g/Kgを1日2～3回に分割経口投与する。成人は1日ヨウ素量300～600 μ g (ヨウレチン錠「50」で6～12錠、ヨウレチン錠「100」で3～6錠、ヨウレチン散0.02%で1.5～3g)を1日2～3回に分割投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

- 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)
 - 慢性甲状腺炎のある患者
 - 治療後のバセドウ病のある患者
 - 先天性の甲状腺ホルモン生成障害のある患者
- 副作用

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ため、発現頻度については文献等を参考に集計した。

副作用集計の対象となった2015例中15例 (0.74%) の副作用が認められた。胃腸障害は9例 (0.44%)、薬疹は3例 (0.15%)、食欲不振は3例 (0.15%) である。

3. 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。

4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、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まわると判断される場合のみ投与すること。

5. 小児等への投与

- 小児気管支喘息及び小児における喘息様気管支炎の場合
未熟児又は新生児に対する安全性は確立していない。
(使用経験がない)
- その他の疾患の場合
未熟児、新生児、乳児、幼児または小児に対する安全性は確立していない。(使用経験がない)

**** 6. 適用上の注意**

薬剤交付時

〔ヨウレチン錠〕

(1) 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)。

(2) 本剤をPTPシートから取り出して保存する場合は、湿気、光を避けて保存するよう指導すること。

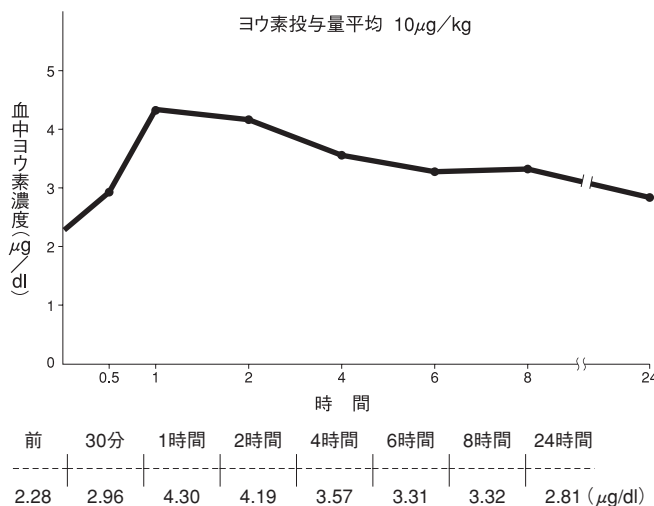
〔ヨウレチン散0.02%〕

無包装状態または分包の場合には、湿気を避けて保存するよう指導すること。

【薬物動態】

1. 血中濃度推移

ヨウ素量 600 μ g相当を服用した成人男子9名の平均血中濃度の推移は、以下の通りである。(ヨウ素量で表示)



ヨウレチンのヨウ素は非常に吸収がよく、血中ヨウ素濃度は1時間で最高値に達し、しかも高い血中濃度が持続する。²⁾

2. 代謝

ヨウレチンのヨウ素は消化管より血中にヨウ素イオンの形で取り込まれる。血中のヨウ素イオンは、甲状腺に取り込まれ甲状腺ホルモンとなり、血中にPBI(蛋白結合ヨウ素)として放出され全身をまわる。

過剰のヨウ素はヨウ化物として尿中に排泄される。

3. 排泄

ヨウ素としての尿中排泄率は、ヨウ素量 3 mg 投与群では、48時間後89.85%、9mg 投与群では、80.84%であった。³⁾

4. 分布 (参考)

¹²⁵I を用いた標識ヨウ素レシチンを注射用蒸留水に懸濁し、ラット胃内に強制経口投与した後の、各組織内放射能濃度の測定によると、投与 4 時間後にはすでに特異的に血液から甲状腺への移行が確認され、336時間後でも高く分布することが示されている。その他の組織では、血液中の濃度推移と同様に時間とともに減少が見られている。⁴⁾⁵⁾

【臨床成績】

国内における疾患別臨床成績では以下に示すと通りの有効率が得られている。

疾患別臨床効果 (社内集計)

甲状腺腫	84.7%	(177/209)
甲状腺機能低下症	80.0%	(4/5)
中心性網膜炎	58.9%	(43/73)
網膜出血	62.2%	(23/37)
硝子体混濁・出血	80.4%	(37/46)
小児気管支喘息	69.4%	(186/268)

【薬効薬理】

1. 甲状腺に対する作用

ヨウ素レシチンはラットおよび健康成人男子において血液中に吸収され、無機ヨードとして作用する。⁶⁾そして甲状腺にとりこまれて、ヨード不足による甲状腺腫⁷⁾、患児の甲状腺機能低下症⁸⁾⁹⁾に奏効する。

2. 眼科における作用

(1)ヨウ素レシチンは家兎網膜の組織呼吸を促進し、網膜の新陳代謝を亢進する。¹⁰⁾¹¹⁾

(2)ヨウ素レシチンは成熟白色家兎の ERG 律動様小波に対し促進的に働き、その効果はヨウ素 18 μ g/Kg/day の投与群で最も著明であり、3ヶ月の長期連用で増強される。¹²⁾

(3)家兎に於ける実験的アレルギー性ブドウ膜炎、実験的電撃性ブドウ膜炎の両者共消炎効果、ERG 所見の改善が著明であった。¹³⁾

3. 喘息に対する作用

(1)モルモット、ラット、マウスに於いて摘出気管に於けるアドレナリン弛緩反応増強、摘出回腸でのアセチルコリン反応抑制、能動型、受動型アナフィラキシーの抑制、血清 cAMP、cGMP の上昇、カラゲニン炎症の抑制がみられた。¹⁴⁾

又小児気管支喘息患児の臨床試験に於いて治療効果が認められた。血清 IgE 値の低下、血清 cAMP、cGMP、cAMP/cGMP の上昇、トリメトキノール反応性上昇による交感神経 β 受容体感受性の上昇が認められた。¹⁴⁾¹⁵⁾

(2)ダニ抗原で感作された気管支喘息患児および卵白アルブミンで感作されたアトピー性皮膚炎児に於いて抗原特異的な IL-2 反応性誘導を抑制する作用がみられた。¹⁵⁾

(3)リンパ球に於けるダニ抗原誘導 IL-4 の分泌、PHA または PMA+CaI 誘導の IL-4 生成を用量依存的に抑制し、ダニ抗原刺激によって引き起こされる IFN- γ の生成量低下を用量依存的に反転させ、Th1 / Th2 バランスを Th1 側に偏らせた。^{16) 17) 18)}

(4)気管支喘息の炎症の指標となる血清 ECP 値の検討で症状改善グループに有意な低下が認められた。¹⁹⁾

(5)ヨウレチン内服 8 週間後の患児リンパ球の IFN- γ 産生能は治療前よりも亢進しており、重症度の軽快化が認められた。²⁰⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ヨウ素レシチン

**化学名：ヨウ素レシチン

*分子式：C₈₈H₁₆₈O₁₆N₂P₂I₂

*分子量：1826.06

融 点：160~167℃

性 状：黄褐色の粉末または粒状で特異なおいがある。クロロホルム、ジクロロメタンに溶けやすくエーテル、エタノール、熱エタノールには殆ど溶けない。水にはコロイド溶液となる。

構造式：
$$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{O}-\text{COR} \\ | \\ \text{CHO}-\text{COR}' \\ | \\ \text{CH}_2\text{O}-\text{P} \begin{array}{l} \nearrow \text{O}^- \\ \searrow \text{O} \end{array} \text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}^+(\text{CH}_3)_3 \end{array} \right]_2 \cdot \text{I}_2$$

COR:リノール酸残基 COR':ステアリン酸残基

【包装】

50 μ g錠(PTP) : 100錠, 1000錠, 3000錠

100 μ g錠(PTP) : 100錠, 1000錠, 3000錠

*散0.02% : 100g, 250g

【主要文献】

- 1) 柳金太郎 : 診断と治療 43巻690-695, 1955
- 2) 長滝重信, 他: ホルモンと臨床 35巻1号, 1987
- 3) 池田 斉, 他: 薬理と治療 Vol.19, No.12
- 4) 内山利満, 他: 薬理と治療 22巻, 1994
- 5) 内山利満, 他: 薬物動態 11巻, 1996
- 6) 池田 斉, 他: ホルモンと臨床 25巻293-296, 1977
- 7) 上田 寛, 他: お茶の水医学雑誌 7巻2032-2049, 1959
- 8) 下田新一 : 日本内分泌学会雑誌 45巻1016-1032, 1970
- 9) 堀田正之, 他: 小児科臨床 17巻1223-1227, 1964
- 10) 村田秀秋, 他: 日本眼科学会雑誌 67巻326-333, 1963
- 11) 鈴木俊之, 他: 日本眼科紀要 44巻547-550, 1993
- 12) 山名忠己, 他: 日本眼科学会雑誌 86巻978-987, 1982
- 13) 大岡良子, 他: 臨床眼科 25巻1142-1150, 1971
- 14) 関 賀江, 他: 東邦医学会誌 26巻304-326, 1979
- 15) 川野 豊, 他: アレルギー 42巻1707-1714, 1993
- 16) 野間 剛 : アレルギーの臨床 16巻 1058, 1996
- 17) 川野 豊, 他: Brit.J.Pharmacol 115巻1141-1148, 1995
- 18) 川野 豊, 他: Int.J.Immunopharmac 18巻241-249, 1996
- 19) 鈴木五男, 他: 東邦大小児科(社内資料) 1998
- 20) 川野 豊, 他: 日本小児アレルギー学会誌 18巻560-565, 2004

【文献請求先】

第一薬品産業株式会社

*〒103-0025 東京都中央区日本橋茅場町 1 丁目 6 番 16 号

*電話 03(3666)6773 FAX03(3666)0598

製造販売元

① 第一薬品産業株式会社

* 東京都中央区日本橋茅場町 1 丁目 6 番 16 号