

動物用医薬品 要指示医薬品 抗甲状腺剤

チロブロック錠 1.25/2.5mg
THYLOBLOCK TABLETS 1.25/2.5mg

■成分及び分量

有効成分	チアマゾール
剤形	フィルムコート錠
含量	1.25mg, 2.5mg

■効能又は効果

猫の甲状腺機能亢進症

■用法及び用量

本剤の初期投与量は、チアマゾールとして1.25mg/頭/回～2.5mg/頭/回とし、1日1回又は2回経口投与する。初期投与量は、甲状腺機能亢進症と慢性腎臓病、心筋肥大、高血圧等の併発疾患を考慮して決定する。投与開始前、投与開始から投与開始後3ヵ月までは2～4週毎、投与開始後3ヵ月以降は2～3ヵ月毎にモニタリング*を行う。モニタリングの結果を総合的に判断し、投与量を調節する場合には、1.25mg/頭/回又は2.5mg/頭/回で個体毎に適宜投与量を増減する*。投与量の上限は、チアマゾールとして10mg/頭/回の1日2回とする。

なお、本剤の投与を中止した場合、投与再開時の投与量は、チアマゾールとして1.25mg/頭/回～2.5mg/頭/回とし、1日1回又は1日2回経口投与する。

*モニタリング：臨床症状、副作用の間診、身体検査、血清総T₄の測定、血液学的検査、血液生化学的検査及び血液凝固検査

**投与量の指標：血清総T₄が基準値の範囲(0.5～4.0μg/dL)又は、甲状腺機能亢進症に伴う全身状態・身体検査での改善がみられた投与量

■使用上の注意

(基本的事項)

1. 守らなければならないこと

(一般的注意)

- 本剤は要指示医薬品であるので獣医師等の処方箋・指示により使用すること。
- 本剤は猫以外に使用しないこと。
- 本剤は効能・効果において定められた目的のみに使用すること。
- 本剤は定められた用法・用量を厳守すること。
- 本剤の有効成分であるチアマゾールは、人で催奇形性の報告があるとともに、苦味がある。これらのことから、有効成分の使用量への曝露を防ぎ、猫が苦味を感じないようにするため、本剤をコーティング錠としている。そのため、本剤を投与する際には、錠剤を割錠又は粉砕しないこと。

(使用者に対する注意)

- 人で胎盤移行性、乳汁移行性、催奇形性が認められたとの報告があることから、妊娠している可能性のある女性や妊婦、授乳婦は、可能な限り、本剤、本剤を投与された猫のトイレ砂、糞便、尿、嘔吐物を取扱わないこと。他に投与できる者又は他に処理できる者がいない場合には、素手では触らず、保護手袋を着用する等、取扱い及び処理には十分注意すること。誤って素手で触った場合、手を石鹸と水で洗うこと。

(猫に対する注意)

- 本剤を過剰投与した場合は甲状腺腫、甲状腺機能低下が現れることがあるため、獣医師から指示された量を投与するように注意し、誤って多く投与した場合は獣医師に相談すること。

(取扱い及び廃棄のための注意)

- 本剤の保管は直射日光、高温及び多湿を避け、遮光した気密容器で室温保存すること。
- 本剤は他の医薬品、食品、飼料等と区別し、小児の手の届かないところに保管すること。
- 小児にはこの薬剤を取扱わせないこと。
- 誤用を避け、品質を保持するため、他の容器に入れ替えないこと。
- 使用期限を過ぎたものは使用しないこと。
- 錠剤は使用前までPTP包装シートから出さないこと。
- 本剤を猫に投与する時は、PTP包装シートから取り出して投与すること。また、PTP包装シートの誤飲によって硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、粘膜が破れて炎症を起こす等の重篤な合併症を併発することが報告されているので、PTP包装シートは猫が誤飲しないよう、適切に廃棄すること。
- 本剤のPTP包装シートは、地方公共団体条例等に従って処分すること。

2. 使用に際して気を付けること

(使用者に対する注意)

- 誤って薬剤を飲み込んだ場合は、直ちに医師の診察を受けること。
- 本剤、本剤を投与された猫のトイレ砂、糞便、尿、嘔吐物を取り扱った後、あるいは使用者の皮膚・粘膜に付着したときは、直ちに水洗いすること。

(猫に対する注意)

- 本剤の投与期間中に、下痢、軟便、嘔吐、便秘、皮膚の傷・むくみ、顔・頭面を痒がる、元気消失、異常な鳴き声、痩せる、出血、粘膜が白い等の普段と異なる状態を発生した時には、獣医師に投与の可否について指示を仰ぐこと。

(専門的事項)

1. 禁忌

- チアマゾールに対し過敏症の既往歴を持つ猫への投与は行わないこと。
- 血液疾患(貧血、好中球減少症、リンパ球減少症、血小板減少症等)又は血液凝固障害がある猫には投与しないこと。
- 自己免疫疾患がある猫には投与しないこと。
- 重度の腎機能障害又は重度の肝機能障害がある猫には投与しないこと。
- 妊娠、授乳中及び繁殖を予定している猫への投与を行わないこと。

2. 重要な基本的注意

- 本剤の投与開始前に、モニタリングの必要性及び腎疾患の顕在化の可能性について飼い主に十分説明し同意を得ること。
- モニタリングとして、投与開始前、投与開始から3ヵ月は2～4週毎、投与開始後3ヵ月以降は2～3ヵ月毎に臨床症状、副作用の間診、身体検査、血清総T₄の測定、血液学的検査、血液生化学的検査及び血液凝固検査を行うこと。その際、異常又は副作用が認められた場合には、本剤の継続投与、減量又は投与中止の判断を行うこと。本剤の投与中止の判断を行った場合は、投与中止後、対症療法や支持療法等の適切な処置を行う。本剤の投与中止後、血清総T₄が基準値の上限(>4.0μg/dL)を超えた場合、又は、甲状腺機能亢進症に伴う全身状態・身体検査での悪化がみられた場合、臨床症状と副作用の有無の聴取、身体検査、血清総T₄の測定、血液学的検査、血液生化学的検査及び血液凝固検査を行い、本剤の投与を再開する。
- 本剤の1回来院での処方日数は、投与開始から3ヵ月は2～4週間分、投与開始後3ヵ月以降は2～3ヵ月分を目安とする。
- 本剤投与による血清総T₄の低減や甲状腺機能亢進症に伴う全身状態・身体検査での改善には投与開始から2～4週を要する。また、本剤投与による副作用は投与開始から3ヵ月以内にみられる。
- 本剤を腎機能低下がある猫又は潜在的に腎疾患がある猫に投与する場合、甲状腺機能亢進症の改善により、糸球体過剰の低下、腎機能低下、基礎腎疾患が顕在化することがあるので十分慎重に投与し、腎機能について経時的かつ注意深いモニタリングを行う必要がある。また、腎疾患が顕在化し、重度の腎機能障害がみられた場合は、本剤の投与を中止し、対症療法や支持療法等の適切な処置を行うこと。
- 本剤により、血小板数減少を伴わずに出血性素因を引き起こすおそれがあるので、投与期間十分に観察を行い、この様な場合には必要に応じ投与中止等の適切な処置を行うこと。

3. 相互作用

- 本剤とベンズイミダゾール系駆虫薬(アルベンダゾール、フェンベンダゾール、オクスフェンダゾール)を併用する場合、ベンズイミダゾール系駆虫薬の血中濃度が上昇する可能性がある。
- 本剤と抗凝血剤との併用投与では、本剤のビタミンK依存性の血液凝固因子活性化阻害作用が増強する可能性がある。
- 本剤とクマリン系抗凝血剤(ワルファリンカルウム)との併用投与では、クマリン系抗凝血剤の投与量を増量する必要が生じる場合がある。
- 本剤とジギタリス製剤(ジゴキシン)、アドレナリンβ受容体遮断薬又はキサンチン誘導体(テオフィリン)との併用投与では、ジギタリス製剤、アドレナリンβ受容体遮断薬又はキサンチン誘導体の投与量を減量する必要が生じる場合がある。
- 本剤とフェノバルビタール製剤との併用投与では、本剤の臨床効果が妨げられる可能性がある。
- 本剤は肝薬物代謝酵素Cytochrome P450(CYP)により代謝されることから、本剤とCYPで代謝される薬剤(マクロライド系抗生物質(エリスロマイシン等)、フルオキノロン系合成抗菌剤(エンフロキサシン、オルビフロキサシン等)、シクロスポリン、トリメトプリム、非選択的β遮断薬(カルベジロール)、PDE3阻害薬(ピモベンダン)、カルシウムチャネル拮抗薬(アムロジピン、ジルチアゼム)等)を併用する場合、競合的阻害により本剤又は併用薬のいずれか一方の血中濃度が上昇する可能性がある。
- 本剤の空腹時における経口投与では、血中濃度が上昇する可能性がある。

4. 副作用

- 本剤投与により、消化器障害(下痢又は軟便、嘔吐、便秘)、肝臓障害(γ-GTP、AST及びALTの上昇)がみられ、ときに腎臓障害(無機リン及びナトリウムの減少、尿素素及びクレアチニンの上昇)、皮膚擦過傷/損傷/浮腫(頭部/顔面のそう痒)及び食欲不振、まれに抗甲状腺剤に共通する薬剤誘発性の免疫反応に関連する変化(赤血球数、色素素、ヘマトクリット値、MCHC、顆粒球、白血球数及び血小板数の減少、総蛋白、グロブリン及びMCVの上昇、A/G比の減少)、脱毛・皮膚の糜爛がみられる。その他、頻度不明であるが、抑うつ症状、無気力、異常発声、体重減少、出血性素因、貧血、心臓への影響(LDHの上昇)、骨への影響(ALPの減少)がみられることがある。

5. その他の注意

- チアマゾール投与において、投与期間の延長及び投与量の増加に依存した抗核抗体の上昇がみられたとの報告がある。
- チアマゾール投与において、精巣成熟遅延がみられたとの報告がある。
- ラットを用いた生殖発生毒性試験において、胎子及び出生子において胎子発育及び器官形成に対する影響がみられた。

■包装

チロブロック錠1.25mg 100錠(10錠×10)
チロブロック錠2.5mg 100錠(10錠×10)

■保存方法

室温保存




猫にやさしい・猫のための製剤

動物用医薬品 要指示医薬品 抗甲状腺剤

チロブロック錠 1.25/2.5mg
THYLOBLOCK TABLETS 1.25/2.5mg

猫はじぶん。元気そうでもわかってほしい。甲状腺機能亢進症。

■製造販売元

 あすかアニマルヘルス株式会社
東京都港区芝浦二丁目15番6号

■販売元

DSファーマアニマルヘルス株式会社
大阪市中央区本町2-5-7 <https://animal.ds-pharma.co.jp>

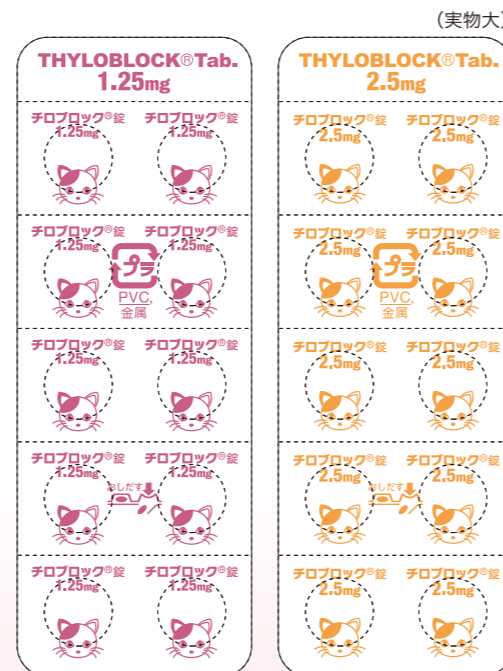
01 製品特長

- 初めて猫用に承認された抗甲状腺剤
- 飲ませやすい小さなフィルムコート錠
- 分割せずに処方できる1.25mg錠・2.5mg錠
- 猫で安全性が確認された製剤

品名	有効成分・含有量	剤形(実物大)
チロブロック®錠 1.25mg	1錠中 日局チアマゾール 1.25mg	 直径5.6mm 厚さ2.6mm 重量63mg
チロブロック®錠 2.5mg	1錠中 日局チアマゾール 2.5mg	 直径5.6mm 厚さ2.6mm 重量63mg



チロブロック®錠なら、猫に投与しやすく、分割の手間が要らないため、猫のご家族の負担を減らせます。



02 使用方法

本剤は、猫1頭に1.25mg錠あるいは2.5mg錠を1日1回または2回投与で開始します。
投与開始後、モニタリング*を行いながら総合的に判断し本剤の投与量を調整**してください。

*: 臨床症状、副作用の問診、身体検査、血清総T4の測定、血液学的検査、血液生化学的検査および血液凝固検査。
**: 血清総T4が基準値の範囲または甲状腺機能亢進症に伴う全身状態・身体検査での改善がみられた投与量を指標に調整。

投与開始後3ヵ月まで
2~4週間毎にモニタリング

投与開始後3ヵ月以降
2~3ヵ月毎にモニタリング



- 投与量の増減は、個体毎に1.25mg/頭/回または2.5mg/頭/回の量で行ってください。
- 投与量の上限は、チアマゾールとして10mg/頭/回の1日2回としてください。

T4の基準値の範囲(チアマゾールの使用実態調査時に用いた基準)

T4(μg/dL)		
低値	基準値	高値
<0.5	0.5~4.0	>4.0

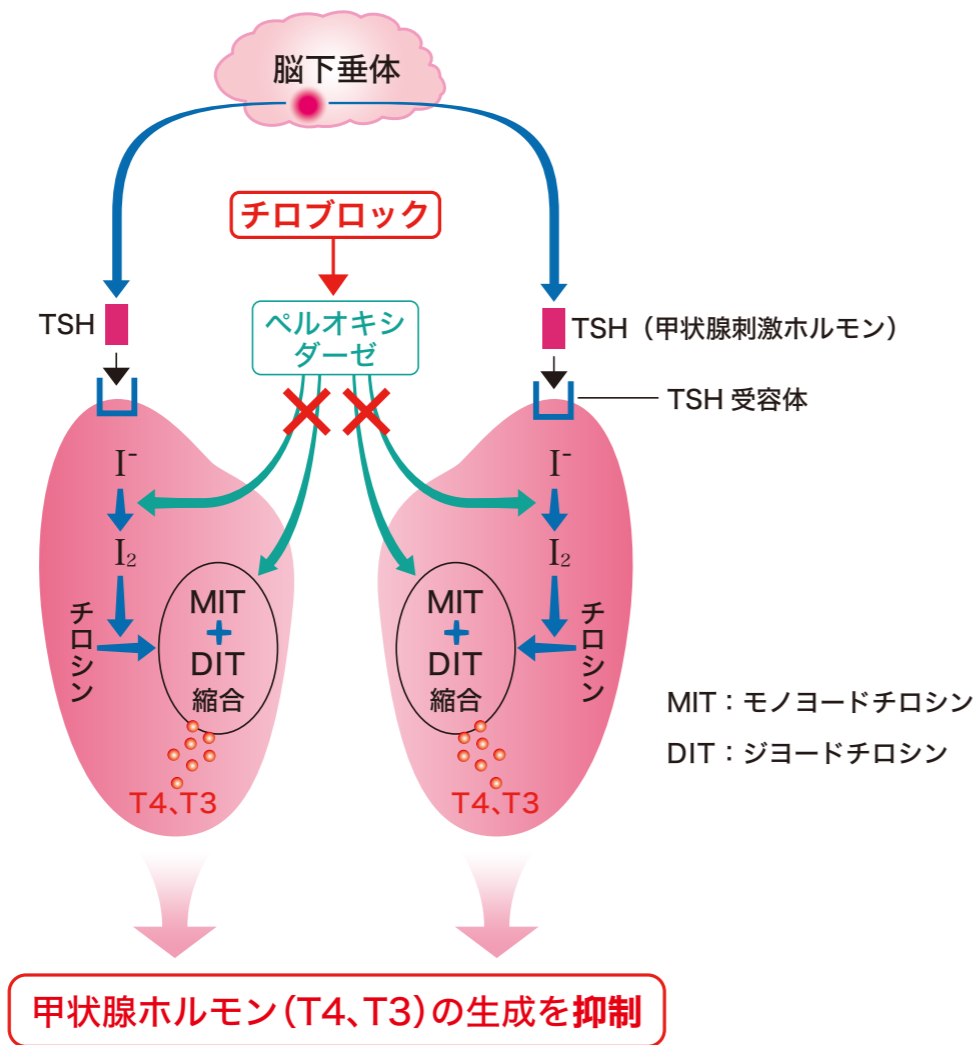
※検査会社によって基準値が異なる場合があります。



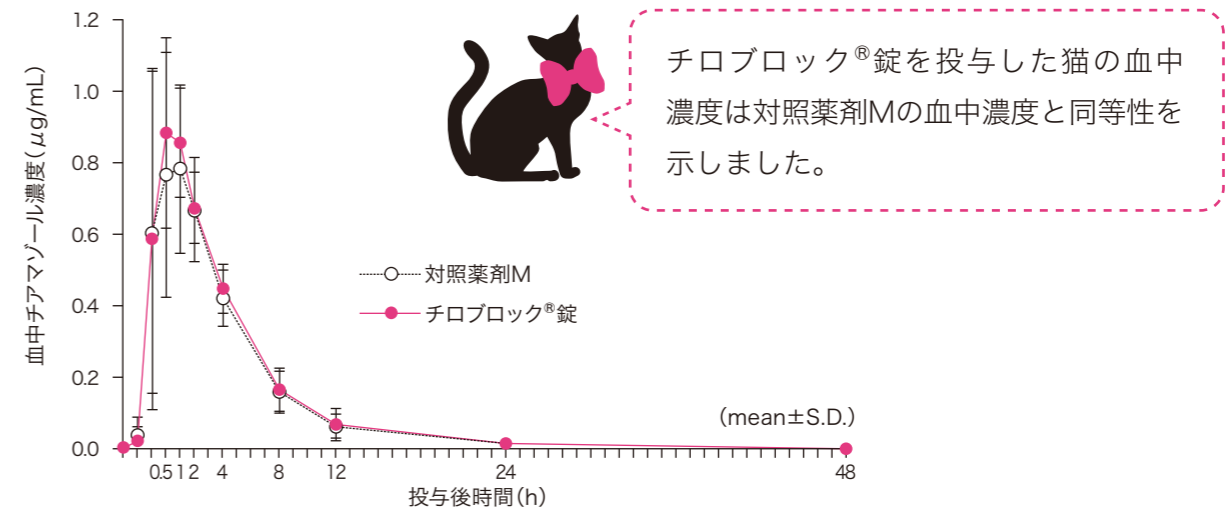
初期投与量は、甲状腺機能亢進症と慢性腎臓病、心筋肥大、高血圧等の併発疾患を考慮してください。

03 作用機序

●チロブロック(チアマゾール)はペルオキシダーゼによるヨウ化物の酸化のみならず、モノヨードチロシン(MIT)およびジヨードチロシン(DIT)からサイロキシン(T4)およびトリヨードサイロニン(T3)に至る縮合反応を阻害します。



04 血中動態



製品名 (投与量)	頭数	Cmax (μg/mL)	Tmax (h)	AUC _{0-48h} (μg·h/mL)	T _{1/2} (h)
チロブロック®錠 (2.5mg)	19 (♂9 ♀10)	0.80~1.1	0.5~0.6	4.5~5.0	2.1~4.1
対照薬剤M (2.5mg)	19 (♂9 ♀10)	0.82~1.0	0.6~0.7	4.2~4.7	2.2~4.1

クロスオーバー試験により絶食下で1回強制経口投与(1日1回×1日)し、血中チアマゾール濃度を測定

出典: あすかアニマルヘルス株式会社社内資料

05 安全性試験

●『チロブロック®錠』を用いて、健常猫(雌雄、3ヵ月齢)に非絶食下で1.25mg/頭/回×1日2回(2.5mg/頭/日)、5mg/頭/回×1日2回(10mg/頭/日)および10mg/頭/回×1日2回(20mg/頭/日)を3ヵ月間反復強制経口投与(各投与群とも4頭)することにより安全性を評価しました。その結果、いずれの投与群においても、投与15日から血清総T4の低値がみられ、血清総T4の低値に起因する甲状腺のコロイド減少、血清総T4の低値に伴う基礎代謝の抑制を示唆する変化*、抗甲状腺剤(チアマゾールも含む)に共通する薬剤誘因性の免疫反応に関連する変化**等が認められました。なお、10mg/頭/回×1日2回(20mg/頭/日)では、投与35日目以降から活力低下を呈し、投与中止と死亡等の重篤な臨床症状の発現もみられたものの、投与中止後35日~41日に回復傾向がみられました。

*: 「基礎代謝の抑制を示唆する変化」
LDHの高値、心臓の心筋細胞萎縮、脾臓のうっ血

** : 「薬剤誘因性の免疫反応に関連する変化」
赤血球数、血色素量、ヘマトクリット値、MCHC、血小板数、好酸球およびリンパ球の低値、胸腺の萎縮、胸腺および大腿骨髄のリンパ濾胞形成、大腿骨髄の造血亢進、総蛋白およびグロブリンの高値、A/G比の低値、赤血球連鎖形成、MCVの高値

出典: あすかアニマルヘルス株式会社社内資料

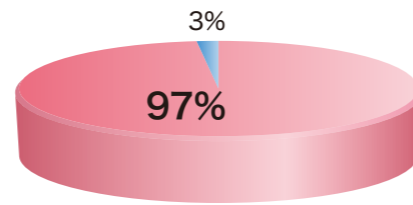
06 | チアマゾールの使用実態調査

●猫甲状腺機能亢進症に対するチアマゾールを有効成分とする人用医薬品の使用実態調査を行い、得られた成績について有効性および安全性を検討したものです。

有効性



有効性評価対象症例399症例において、有効と判定された症例は386症例、有効率は97%を示しました。



安全性

安全性評価対象症例465症例の94症例(20.2%)に副作用が認められました。副作用の種類別の発現率は下表のとおりです。

副作用の種類	発現例数	発現率
下痢・嘔吐	51	11%
肝臓障害 (ASTの上昇、ALTの上昇、ALPの上昇)	32	6.9%
腎臓障害 (尿素窒素の上昇、クレアチニンの上昇)	14	3.0%
顔面そう痒	13	2.8%
食欲不振	7	1.5%
顆粒球減少	4	0.9%
白血球減少	1	0.2%
血小板減少	1	0.2%
脱毛・皮膚の糜爛	1	0.2%
便秘	1	0.2%

出典:あすかアニマルヘルス株式会社社内資料

Q&A

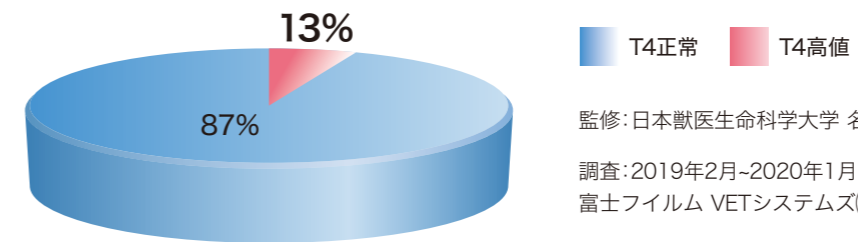
Q T4値が高い値を示す猫はどのくらいの割合でいますか。

A 7歳以上の猫において、8頭に1頭の割合でT4高値を示す猫がいるようです。



甲状腺機能亢進症の場合は見た目が元気なことも多くご家族の方が気づきにくいことがあります。このためT4高値の猫はこの疾患を疑い身体検査等を行うことが肝要です。

■健康診断による7歳以上のT4高値割合 (>4.0μg/dL)



監修:日本獣医生命科学大学 名誉教授 獣医学博士 左向敏紀先生
 調査:2019年2月~2020年1月 n=47,932頭
 富士フイルム VETシステムズ(株)技術資料より抜粋

Q チロブロック®錠の投与は食事と一緒にしていいですか。

A 食事と一緒に投与して構いません。本剤による治療は食事と一緒にあるいは空腹時でも同様です。

Q 猫の主な排泄経路はどこですか。

A 尿中排泄です。

Q チロブロック®錠を継続投与後にT4値を検査するための採血時間を教えてください。

A 採血する時間は任意の時間で問題ありません。