

## 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 2013 に準拠して作成

骨格筋痙攣弛緩剤

**ロバキシン<sup>®</sup> 顆粒90%****ROBAXIN<sup>®</sup> GRANULES 90%**

メトカルバモール顆粒

剤 形	顆粒剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1g 中 メトカルバモール 900mg
一般名	和名：メトカルバモール (JAN) 洋名：Methocarbamol (JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2008年8月11日 薬価基準収載年月日：2008年12月19日 発売年月日：1962年2月16日
開発・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：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 <a href="http://www.aska-pharma.co.jp/medical/index.html">http://www.aska-pharma.co.jp/medical/index.html</a>

本 IF は 2011 年 11 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ

<http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

## IF 利用の手引きの概要 — 日本病院薬剤師会 —

### 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品医療機器総合機構ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF 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 IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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。

#### 【IF の様式】

- ①規格は A 4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

## [ I F の作成 ]

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

## [ I F の発行 ]

- ① 「I F 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「I F 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

### 3. I F の利用にあたって

「I F 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

## 目 次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目	11
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	11
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	.....	11
II. 名称に関する項目	2	2. 薬理作用	11
1. 販売名	2	VII. 薬物動態に関する項目	12
2. 一般名	2	1. 血中濃度の推移・測定法	12
3. 構造式又は示性式	2	2. 薬物速度論的パラメータ	12
4. 分子式及び分子量	2	3. 吸収	13
5. 化学名（命名法）	2	4. 分布	13
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3	5. 代謝	13
7. CAS登録番号	3	6. 排泄	14
III. 有効成分に関する項目	4	7. トランスポーターに関する情報	14
1. 物理化学的性質	4	8. 透析等による除去率	14
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	15
3. 有効成分の確認試験法	4	1. 警告内容とその理由	15
4. 有効成分の定量法	5	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15
IV. 製剤に関する項目	6	.....	15
1. 剤形	6	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	15
2. 製剤の組成	6	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	15
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	6	5. 慎重投与内容とその理由	15
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	.....	15
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7	7. 相互作用	15
7. 溶出性	7	8. 副作用	16
8. 生物学的試験法	7	9. 高齢者への投与	17
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	17
10. 製剤中の有効成分の定量法	8	11. 小児等への投与	17
11. 力価	8	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
12. 混入する可能性のある夾雑物	8	13. 過量投与	18
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8	14. 適用上の注意	18
14. その他	8	15. その他の注意	18
V. 治療に関する項目	9	16. その他	18
1. 効能又は効果	9	IX. 非臨床試験に関する項目	19
2. 用法及び用量	9	1. 薬理試験	19
3. 臨床成績	9	2. 毒性試験	19

X. 管理的事項に関する項目 .....	21
1. 規制区分 .....	21
2. 有効期間又は使用期限 .....	21
3. 貯法・保存条件 .....	21
4. 薬剤取扱い上の注意点 .....	21
5. 承認条件等.....	21
6. 包装.....	21
7. 容器の材質.....	21
8. 同一成分・同効薬.....	22
9. 国際誕生年月日 .....	22
10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	22
11. 薬価基準収載年月日 .....	22
12. 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 .....	22
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びそ の内容 .....	22
14. 再審査期間 .....	23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	23
16. 各種コード .....	23
17. 保険給付上の注意 .....	23
X I. 文献.....	24
1. 引用文献 .....	24
2. その他の参考文献.....	24
X II. 参考資料 .....	25
1. 主な外国での発売状況 .....	25
2. 海外における臨床支援情報 .....	25
X III. 備考.....	26



## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

メトカルバモールは、米国 A.H.ロビンス社で開発・製品化された中枢性筋弛緩剤であるが、既に使用されていた同薬効を有するメフェネシンは、作用持続が短く、静脈内注射で溶血作用を呈するなどの問題があった。メトカルバモールはこれらの問題を解消し、中枢性筋弛緩作用の強化と持続性をはかった製剤である。

ロバキシンはグレラン製薬（現あすか製薬）が開発し、1961年に承認を取得、2008年8月に医療過誤防止のため「ロバキシン顆粒 90%」に販売名を変更した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 主に脊髄の介在ニューロンを遮断して、異常に興奮・緊張している骨格筋のみを弛緩・鎮静し、正常な筋肉および筋運動には全く影響を与えない。
- (2) 副作用として、眠気、めまい、発疹、瘙痒感、悪心・嘔吐、胃部不快感等が認められている。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ロバキシン® 顆粒 90%

#### (2) 洋名

ROBAXIN® GRANULES 90%

#### (3) 名称の由来

特になし（米国 A.H.ロビンス社との提携品であるため、その名称を継承した。）

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

メトカルバモール（JAN）

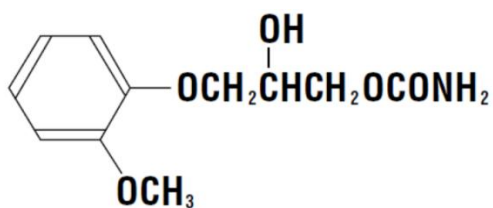
#### (2) 洋名（命名法）

Methocarbamol（JAN）

#### (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：C<sub>11</sub>H<sub>15</sub>NO<sub>5</sub>

分子量：241.24

### 5. 化学名（命名法）

3-(*o*-Methoxyphenoxy)-2-hydroxypropyl-1-carbamate



6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

なし

7. CAS登録番号

532-03-6

### 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り、味は苦い。

##### (2) 溶解性

メタノールに溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすく、水又はジエチルエーテルにやや溶けにくい。

##### (3) 吸湿性

吸湿性はない。

##### (4) 融点（分解点），沸点，凝固点

融点：93.5 ～ 97.5℃

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

本品 1.0g を水 50mL に加温して溶かし、冷却した液の pH は 4.5～8.0 である。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

保存方法			結果
粉末状			安定
マクロゴール 300 水溶液中	pH7	18 カ月 室温	安定
	pH8	6hr 室温	分解*
	pH3	750hr 室温	分解*

\* 分解生成物はグアヤコールグリセリンエーテル

### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方外医薬品規格「メトカルバモール」の確認試験による。

- (1) リトマス紙の変色
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方外医薬品規格「メトカルバモール」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

剤形・性状	白色顆粒剤
におい	—
味	苦い

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

該当なし

#### (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

1g 中 メトカルバモールを 900mg 含有

#### (2) 添加物

乳糖水和物、メチルセルロース

#### (3) その他

該当しない

### 3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

### 4. 製剤の各種条件下における安定性

#### 長期安定性試験

保存条件	保存期間	保存形態	結果
室温	48 カ月	バラ包装 (アルミ袋)	変化なし

試験項目：性状、確認試験、粒度試験、崩壊試験、定量

## 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

メトカルバモール 1.0g に下記の薬品のほぼ 1 日常用量を配合し、30°C、R.H.92%の条件下で 14 日間の変化を確認した。なるべく実際の調剤投与に近い条件で実験を行うため、上質模造紙の薬包紙に包み又はその薬包紙の上に載せて、薬品の変化とともに薬包紙のしめり具合等も併せて観察した。<sup>2)</sup>

結果: (-)変化は全くみられない、(±)変化の有無が疑わしい、(+)明らかに変化は認めるが実際の調剤授与には支障なし、(++)調剤授与に支障あり

No.	薬品名	経過 直後	日						適要
			1	2	4	7	10	14	
—	ロバキシム(1.0g)	—	—	—	—	—	—	—	
1	アスピリン (1.5g)	—	—	—	—	—	—	—	
2	スルピリン (1.0g)	—	±	±	++				紙ぬれ黄色
3	サリチル酸ナトリウム (3.0g)	—	++						紙ぬれピンク
4	10倍クロルプロマジン散 (0.25g)	—	—	—	—	—	—	—	
5	100倍ビタミン B <sub>1</sub> 散 (1.0g)	—	—	—	±	±	±	±	微黄色
6	100倍ビオタミン散 (1.0g)	—	—	—	—	—	—	—	
7	100倍ビタミン B <sub>2</sub> 散 (1.0g)	—	—	—	—	—	—	—	
8	10倍ビタミン B <sub>6</sub> 散 (0.3g)	—	—	—	—	±	±	±	小塊
9	10倍ビタミン C 散 (1.0g)	—	—	—	±	±	+	+	一部淡茶色
10	炭酸水素ナトリウム (2.0g)	—	—	±	±	±	±	±	固塊
11	アミノフィリン (0.3g)	—	±	±	±	+	+	+	大塊・紙黄色
12	10倍タンニン酸ジフェンヒドラミン散 (1.0g)	—	—	—	±	±	+	+	塊

## 7. 溶出性

日本薬局方外医薬品規格第三部に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

試験条件	試験液	溶出規格		
		表示量	規定時間	溶出率
パドル法、50rpm	水、900mL	900mg/g	15分	85%以上

## 8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 融点確認
- (2) 吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

吸光度測定法

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. 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

運動器疾患に伴う有痛性痙縮（腰背痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、変形性脊椎症など）

### 2. 用法及び用量

メトカルバモールとして、通常成人 1 日 1.5～2.25g を 3 回に分割経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

ただし、小児は 1 日体重 1kg 当たり 60mg をこえてはならない。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験<sup>3)</sup>

肩関節周囲炎患者、頸肩腕症候群患者及び変形性脊椎症患者を対象として、偽薬との二重盲検比較試験を行った。

本剤または偽薬を 1 回 1 包、1 日 3 回毎食後に服用させ、2 週間後に各群間で薬剤の効果を比較した。なお、ロバキシンの 1 包は 0.85g（メトカルバモールとして 765mg）とした。

その結果、総合判定は、本剤投与群で肩関節周囲炎 54.5% (30 例/55 例)、頸肩腕症候群 67.2% (39 例/58 例)、変形性脊椎症 60.9% (39 例/64 例)、偽薬投与群で肩関節周囲炎 37.1% (23 例/62 例)、頸肩腕症候群 52.4% (33 例/63 例)、変形性脊椎症 70.3% (45 例/64 例) の有効率が認められた（やや有効以上）。

変形性脊椎症に関しては、有意差はないが本剤の効果が偽薬に優らないという成績であった。

この主な理由としては、腰痛症の病態が極めて複雑であり、変形性脊椎症を基盤とする腰痛症としても種々の因子が関与し、精神・心理的に、生活環境により、あるいは安静保持の程度や適度な運動、血行などにより症状が変動しやすく、いわゆる偽薬効果も発現しやすいことが考えられた。

また、副作用発現率は両群に大差なく、本剤投与群 6.9%、偽薬投与群 10.9%であり、大部分が軽度の胃腸障害であった。

本試験の結果から、本剤は運動器疾患に伴う疼痛性（反射性）筋痙縮に対して有用であると考えられた。

### 3) 安全性試験

該当資料なし

### 4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない



## 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

クロルフェネシンカルバミン酸エステル、フェンプロバメート等の中枢性筋弛緩薬

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### <作用部位>

脊髄骨格筋痙攣に関与する多相シナプス及び、骨格筋紡錘の $\alpha$ 、 $\beta$ 運動ニューロンと推定される。

##### <作用機序>

- 1) 骨格筋痙攣に関与する多相シナプス反射を抑制して、神経伝導を持続的に遮断し筋肉の異常緊張を緩解する。
- 2) 骨格筋紡錘の $\alpha$ 、 $\beta$ 運動ニューロンの活動を抑制する。
- 3) 筋弛緩作用は 1)、2) の協力作用であり、この作用の発現用量では上位の脳機能に対する作用は示さない。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 抗痙攣作用<sup>4)</sup>

ストリキニーネによる痙攣（ラット）に対しては、持続的な予防効果を示し、ペンテトラゾールあるいは電気刺激による痙攣（マウス）に対してはメフェネシンカルバメートより強い抑制作用を示した。

##### 2) 筋弛緩作用<sup>5)、6)</sup>

中枢神経系に作用を有し、とくに脊髄の介在ニューロンに作用を有することが認められている。すなわち、骨格筋痙攣に関与する多相シナプス反射を抑制して、神経伝導を持続的に遮断し筋肉の異常緊張を緩解する。

#### (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・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

健康成人男子における血中濃度推移（外国データ）<sup>7)</sup>

投与量（メトカルバモールとして）	例数	Tmax	T <sub>1/2</sub>
200mg	1	0.5hr	1.6hr
1,000mg	1	0.5hr	2.15hr

注) 本剤の承認された用量は「メトカルバモールとして、通常成人1日1.5～2.25gを3回に分割経口投与する。」である。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

#### (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

<参考. 動物データ><sup>8)</sup>

イヌ経口投与では24時間以内に尿から投与量の50~90%、糞中から10~12%が排泄された。

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)

**【禁忌】** (次の患者には投与しないこと)

本剤及び類似化合物 (クロルフェネシンカルバミン酸エステル等) 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使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

**慎重投与** (次の患者には慎重に投与すること)

(1) 肝障害のある患者

[肝障害を悪化させるおそれがある。]

(2) 腎障害のある患者

[腎障害を悪化させるおそれがある。]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、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注意すること。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

[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 フェノチアジン系薬剤 バルビツール酸誘導体	相互に作用を増強することがあるので、やむを得ず併用する場合には、減量するなど注意すること。	相互に作用を増強することがある。
アルコール		
モノアミン酸化酵素阻害剤		
トルペリゾン塩酸塩	眼の調節障害があらわれたとの報告がある。	機序不明

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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、自発報告等を参考に集計した（再審査対象外）。  
次のような副作用が認められた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満
<b>過 敏 症</b> <sup>注)</sup>	発疹、痒感	
<b>精神神経系</b>	頭痛・頭重感、めまい、ふらつき、眠気、運動失調	霧視
<b>消 化 器</b>	悪心・嘔吐、便秘、下痢、食欲不振、胸やけ・胃のもたれ・胃部不快感	

注) 発現した場合には投与を中止すること。

(2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

(3) その他の副作用

該当しない

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

国内社内集計 全症例 1,415 例中 73 件 (5.16%)

副作用の種類		発現数(発生率%)	副作用の種類		発現数(発生率%)
消化器系	嘔気	10 (0.71)	精神神経系	めまい	8 (0.56)
	悪心	7 (0.49)		フラフラ感	3 (0.21)
	食欲不振	6 (0.42)		眠気	8 (0.56)
	胃障害	4 (0.28)		頭痛	5 (0.35)
	胃症状	3 (0.21)	発疹		3 (0.21)
	下痢	2 (0.14)	心悸亢進		1 (0.07)
	胃部膨満感	2 (0.14)	口渇		1 (0.07)
	胃不快	2 (0.14)	排尿困難		1 (0.07)
	胃痛	1 (0.07)	手のふるえ		1 (0.07)
	胃腸障害	1 (0.07)	痔の悪化		1 (0.07)
	心窩部痛	1 (0.07)	嗝声		1 (0.07)
	便秘	1 (0.07)			

(5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

本剤及び類似化合物（クロルフェネシンカルバミン酸エステル等）に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。

発疹、痒痒感の過敏症が発現した場合には投与を中止すること。

9. 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。

10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

(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。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳中の女性には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせる。

[授乳中の投与に関する安全性は確立していない。]

#### 11. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

#### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

尿中 5-ヒドロキシインドール酢酸値及び尿中バニルマンデル酸値を増大させる。

#### 13. 過量投与

症状・処置法は確立されていない。

第V腰椎分離症及び坐骨神経痛を合併した患者（1例、力士）にメトカルバモールとして1日4500mgを10日間経口投与した結果、副作用と思われる症状の発現は認めなかった<sup>9)</sup>。

#### 14. 適用上の注意

該当しない

#### 15. その他の注意

該当しない

#### 16. その他

該当しない



## 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」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

1) LD<sub>50</sub>

動物	投与経路	LD <sub>50</sub> (mg/kg)	信頼限界 (mg/kg)
マウス	経口	1900 (96 時間値)	1328 - 2717
	静注	805 (48 時間値)	749 - 865
ラット	経口	2830 (168 時間値)	2021 - 3962
	静注	> 500 (168 時間値)	—
イヌ	経口	>2000 (168 時間値)	—
	静注	> 440 (168 時間値)	—

2) 中毒症状 (マウス) <sup>5)</sup>

腹腔内投与では、200mg/kg 以下ではやや鎮静的に運動を制したのみであり、300mg/kg 以上で可逆性の麻痺が発現し、死亡するものは 600mg/kg 以上でみられ、1000mg/kg ではすべて死亡した。いずれの場合でも痙攣、興奮の発現はなく、死亡する動物はまず呼吸緩徐となり停止し、続いて心拍の停止が起こった。

経口投与では、300mg/kg ではすべてに可逆性の歩行失調を認めるが麻痺発現はなかった。500mg/kg 以上では投与後 5~10 分に麻痺発現するものをみた。死亡するものは 1000mg/kg 以上でみられ、1500mg/kg ではすべて死亡した。

(2) 反復投与毒性試験

1) ラットに 400、300、200mg/kg を 30 日間経口投与し、対照群と比較検討した結果、体重、食欲、運動状態、血液所見、臓器所見に異常は認められなかった<sup>4)</sup>。

- 2) ラットに 200、800、1600mg/kg を 1 週間に 5 日、13 週間又は 26 週間経口投与し、成長・外観・行動の観察結果と、血液学的・生化学的・組織学的な評価を行った。  
投与開始後 6～8 週間に 1600mg/kg/日投与群で歩行不良と抑うつ症状を認めたが、その後軽快した。死亡例は 200mg/kg/日投与群と 1600mg/kg/日投与群に認められた。  
また、26 週投与後、200mg/kg/日投与群に間質性腎炎、800mg/kg/日投与群に腎炎、1600mg/kg/日投与群に肝線維膜と食道外側組織の壊死が認められた。
- 3) イヌに 1 週間に 5 日、14 週間又は 27 週間経口投与し、成長・外観・行動の観察結果と、血液学的・生化学的・組織学的な評価を行った。75mg/kg/日投与群及び 400mg/kg/日投与群で嘔吐が見られ、1000mg/kg/日投与群で鎮静状態と運動失調を示し、時に嘔吐と軽度の痙攣が見られたが、他に異常はなく、対照群との差は認められなかった。

### (3) 生殖発生毒性試験

- 1) 雌雄ラットに 0.74%のメトカルバモールを食餌に混ぜ与え続け、2 度交配させたところ、無投与群に比較して以下のような結果となった。
- ①親の雌性ラットで平均体重増加がわずかに劣っていた。
  - ②1 度目及び 2 度目の交配ともに、妊娠の比率はわずかに低かった。
  - ③産まれた児の授乳中の生存がわずかに少なかった。
  - ④産まれた児のいずれにも催奇形性は認められなかった。
- 2) 胎児発育の後の段階から離乳までの授乳期間中、雌性イヌにメトカルバモール 200mg/kg を投与した。母児ともに有害な影響は認められなかった。

### (4) その他の特殊毒性<sup>10)</sup>

ヒト血液を *in vitro* で 50%溶血する薬物濃度を求めた。メフェネシンは 0.88%の濃度で 50%溶血が起こるが、メトカルバモールは 2.26%であった。メフェネシンはメトカルバモールの 2.57 倍の溶血性を示した。

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：4年（外箱等に表示）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

500g

### 7. 容器の材質

袋：アルミニウムポリエチレンラミネート

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分：該当なし

同効薬：クロルフェネシンカルバミン酸エステル、フェンプロバメートの中枢性筋弛緩薬

## 9. 国際誕生年月日

不明

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
ロバキシン顆粒 90%	2008年 8月 11日	22000AMX01830000
ロバキシン (旧製品名)	1961年 7月 18日	13600A Z Z02052000

## 11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
ロバキシン顆粒 90%	2008年 12月 19日
ロバキシン (旧製品名)	1963年 1月 1日

## 12. 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

## 13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

### (1) 再評価

通知年月日：1976年 7月 23日

再評価結果：

[承認時]

#### 効能又は効果

##### 1) 筋肉の異常緊張、痙攣、強直をともなう次の諸症

腰痛、胸背痛、肩こり、関節痛、筋肉痛、四十腰、五十肩、変形性脊椎症、椎間板ヘルニア、顔面筋痙攣、四肢痛、神経痛、リウマチ、挫傷、捻挫、打撲、斜頸、スポーツ後のこり、脳性麻痺、頸腕症候群、骨折にともなう筋緊張、更年期障害の随伴症状（腰痛、肩こり、関節痛等）、肺外科手術後の筋緊張

##### 2) 仮性近視

#### 用法及び用量

1日 1.7～2.5g を3回に分服する。年齢症状により適宜増減することができる。ただし、小児に用いる場合は1日総量が体重 kg 当たりメトカルバモールとして 66mg を超えて投与してはならない。

[評価結果]

効能又は効果

運動器疾患に伴う有痛性痙縮（腰背痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、変形性脊椎症など）

用法及び用量

メトカルバモールとして、通常成人1日1.5～2.25gを3回に分割経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

ただし、小児は1日体重1kg当たり60mgをこえてはならない。

(2) 品質再評価

通知年月日：2004年2月23日

再評価結果：薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

薬価基準収載医薬品コード	HOT (9桁) コード	レセプト電算コード
1225003D1031	101715101	620008779

17. 保険給付上の注意

該当しない

## X I . 文献

### 1. 引用文献

- 1) Linoli,G.,et.al. : Boll.Chim.Farm., 98 : 582、1959
- 2) 社内資料 (配合変化)
- 3) 山本 真 他 : 診療と新薬、13(2) : 323、1976
- 4) Truitt,E.B.,et al. : J.Pharmacol.Exp.Ther., 122(2) : 239、1958
- 5) 猪木 令三 他 : 奈良医学雑誌、12(5) : 1048、1961
- 6) 村山 智 他 : 千葉医学、50 : 315、1974
- 7) Bruce,R.B.,et al. : J.Pharm.Sci., 60(1) : 104、1971
- 8) Campbell,A.D.,et al. : J.Pharmacol.Exp.Ther., 131(1) : 18、1961
- 9) 岩崎 一平 : 新薬と臨床、11(5) : 517、1962
- 10) Truitt,E.B.,et al. : Proc.Soc.Exp.Biol.Med., 95 : 422、1957

### 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

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

### X Ⅲ . 備考

その他の関連資料

該当資料なし