

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2008に準拠して作成

局所麻酔剤

テーカイン[®] 原末

T·CAIN

剤形	原末
製剤の規制区分	劇薬
規格・含量	1g中 パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩 1g含有
一般名	和名：パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩 (JAN) 洋名：Diethylaminoethyl <i>p</i> -Butylaminobenzoate Hydrochloride (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：2007年8月31日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2007年12月21日（販売名変更による） 発売年月日：2001年10月1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売：ファイザー株式会社 提携：マイラン製薬株式会社 製造販売元：ナガセ医薬品株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ファイザー株式会社 製品情報センター 学術情報ダイヤル 0120-664-467 Fax 03-3379-3053 医療用製品情報 http://pfizerpro.jp/cs/sv/pfizerpro/di/Page/1259675500452

本IFは2013年1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、医薬品医療機器情報提供ホームページ
<http://www.info.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小委員会によってIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、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新たなIF記載要領が策定された。

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A4判、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。

[IFの作成]

- ① IF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 IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとのIF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2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）により作成されたIF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。

[IFの発行]

- ① 「IF記載要領2008」は、平成21年4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「IF記載要領2008」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異なる場合にはIFが改訂・発行される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、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、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供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、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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、IF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、IF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、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供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

IF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。IF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、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後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。

目 次

I. 概要に関する項目

- 1. 開発の経緯 1
- 2. 製品の治療学的・製剤学的特性 1

II. 名称に関する項目

- 1. 販売名 2
 - (1) 和 名 2
 - (2) 洋 名 2
 - (3) 名称の由来 2
- 2. 一般名 2
 - (1) 和 名 (命名法) 2
 - (2) 洋 名 (命名法) 2
 - (3) ステム 2
- 3. 構造式又は示性式 2
- 4. 分子式及び分子量 2
- 5. 化学名 (命名法) 2
- 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 2
- 7. CAS登録番号 2

III. 有効成分に関する項目

- 1. 物理化学的性質 3
 - (1) 外観・性状 3
 - (2) 溶解性 3
 - (3) 吸湿性 3
 - (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点 3
 - (5) 酸塩基解離定数 3
 - (6) 分配係数 3
 - (7) その他の主な示性値 3
- 2. 有効成分の各種条件下における安定性 ... 3
- 3. 有効成分の確認試験法 4
- 4. 有効成分の定量法 4

IV. 製剤に関する項目

- 1. 剤 形 5
 - (1) 投与経路 5
 - (2) 剤形の区別、規格及び性状 5
 - (3) 製剤の物性 5
 - (4) 識別コード 5
 - (5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH域等 5
 - (6) 無菌の有無 5
- 2. 製剤の組成 5
 - (1) 有効成分 (活性成分) の含量 5
 - (2) 添加物 5
 - (3) 添付溶解液の組成及び容量 5
- 3. 用時溶解して使用する製剤の調製法 5
- 4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 6
- 5. 製剤の各種条件下における安定性 6
- 6. 溶解後の安定性 6

- 7. 他剤との配合変化 (物理化学的变化) ... 6
- 8. 溶出性 6
- 9. 生物学的試験法 6
- 10. 製剤中の有効成分の確認試験法 6
- 11. 製剤中の有効成分の定量法 6
- 12. 力価 6
- 13. 混入する可能性のある夾雑物 6
- 14. 治療上注意が必要な容器に関する情報 ... 7
- 15. 刺激性 7
- 16. その他 7

V. 治療に関する項目

- 1. 効能又は効果 8
- 2. 用法及び用量 8
- 3. 臨床成績 8
 - (1) 臨床データパッケージ 8
 - (2) 臨床効果 9
 - (3) 臨床薬理試験：忍容性試験 10
 - (4) 探索的試験：用量反応探索試験 10
 - (5) 検証的試験 10
 - (6) 治療的使用 11

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 12
- 2. 薬理作用 12
 - (1) 作用部位・作用機序 12
 - (2) 薬効を裏付ける試験成績 12
 - (3) 作用発現時間・持続時間 12

VII. 薬物動態に関する項目

- 1. 血中濃度の推移・測定法 13
 - (1) 治療上有効な血中濃度 13
 - (2) 最高血中濃度到達時間 13
 - (3) 臨床試験で確認された血中濃度 13
 - (4) 中毒域 13
 - (5) 食事・併用薬の影響 13
 - (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 13
- 2. 薬物速度論的パラメータ 13
 - (1) コンパートメントモデル 13
 - (2) 吸収速度定数 13
 - (3) バイオアベイラビリティ 13
 - (4) 消失速度定数 13
 - (5) クリアランス 14
 - (6) 分布容積 14
 - (7) 血漿蛋白結合率 14
- 3. 吸 収 14

4. 分 布	14	IX. 非臨床試験に関する項目	
(1) 血液－脳関門通過性	14	1. 薬理試験	20
(2) 血液－胎盤関門通過性	14	(1) 薬効薬理試験	20
(3) 乳汁への移行性	14	(2) 副次的薬理試験	20
(4) 髄液への移行性	14	(3) 安全性薬理試験	20
(5) その他の組織への移行性	14	(4) その他の薬理試験	20
5. 代 謝	14	2. 毒性試験	20
(1) 代謝部位及び代謝経路	14	(1) 単回投与毒性試験	20
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450等) の分子種	14	(2) 反復投与毒性試験	21
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	14	(3) 生殖発生毒性試験	21
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	15	(4) その他の特殊毒性	21
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	15	X. 管理的事項に関する項目	
6. 排 泄	15	1. 規制区分	22
(1) 排泄部位及び経路	15	2. 有効期間又は使用期限	22
(2) 排泄率	15	3. 貯法・保存条件	22
(3) 排泄速度	15	4. 薬剤取扱い上の注意点	22
7. 透析等による除去率	15	(1) 薬局での取り扱いについて	22
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目		(2) 薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)	22
1. 警告内容とその理由	16	5. 承認条件等	22
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	16	6. 包 装	22
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由	16	7. 容器の材質	22
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由	16	8. 同一成分・同効薬	22
5. 慎重投与内容とその理由	16	9. 国際誕生年月日	22
6. 重要な基本的注意とその理由及び 処置方法	17	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
7. 相互作用	17	11. 薬価基準収載年月日	23
(1) 併用禁忌とその理由	17	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	23
(2) 併用注意とその理由	17	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	23
8. 副作用	17	14. 再審査期間	23
(1) 副作用の概要	17	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
(2) 重大な副作用と初期症状	17	16. 各種コード	23
(3) その他の副作用	18	17. 保険給付上の注意	23
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	18	XI. 文 献	
(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	18	1. 引用文献	24
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び 試験法	18	2. その他の参考文献	24
9. 高齢者への投与	18	XII. 参考資料	
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18	1. 主な外国での発売状況	25
11. 小児等への投与	19	2. 海外における臨床支援情報	25
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19	XIII. 備 考	
13. 過量投与	19	1. その他の関連資料	26
14. 適用上の注意	19	(1) JANコード	26
15. その他の注意	19		
16. その他	19		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

テーカインは、帝国化学産業株式会社（現ナガセ医薬品株式会社）が開発したエステル型局所麻酔剤である。本剤は、テトラカインのジメチルアミノ基をジエチルアミノ基に置換した化合物で、1949年1月に承認を取得した。

本剤は第一次再評価により、薬事法（1960年法律第145号）第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの結果を得た（1974年11月20日付薬発第1046号）。

なお、医療事故防止対策のため、2007年8月に販売名を「テーカイン」から「テーカイン原末」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) テーカインは日本薬局方テトラカイン塩酸塩と同一系に属するエステル型局所麻酔剤である。
- (2) テトラカインと同等の知覚麻痺作用を示し、麻酔持続時間はテトラカインより長い。
- (3) ジブカインとほぼ同一の作用強度を有し、麻酔作用の発現はジブカインに比し速やかで、麻酔持続時間はジブカインより短い傾向がみられた。
- (4) 本剤の重大な副作用として、ショック、振戦・痙攣等の中毒症状等があらわれることがある。

II. 名称に関する項目

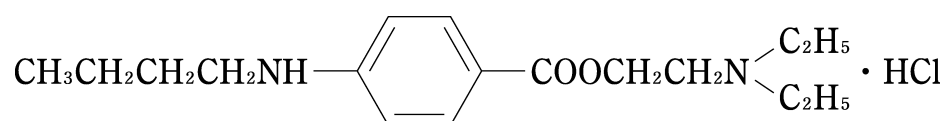
1. 販売名

- (1) 和 名 : テーカイン原末
- (2) 洋 名 : T - CAIN
- (3) 名称の由来 : 不明

2. 一般名

- (1) 和 名 (命名法) : パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩 (JAN)
- (2) 洋 名 (命名法) :
Diethylaminoethyl *p*-Butylaminobenzoate Hydrochloride (JAN)
- (3) ス テ ム : caine (局所麻酔剤)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $\text{C}_{17}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_2 \cdot \text{HCl}$
分子量 : 328.88

5. 化学名 (命名法)

2-(Diethylamino) ethyl 4-(butylamino)benzoate hydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名 (JAN) : 塩酸パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル

7. CAS 登録番号

16488-48-5

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

(2) 溶解性

溶 媒	1gを溶かすのに要する溶媒量	日本薬局方の 溶解性表記
水、メタノール、酢酸 (100)、 クロロホルム	1mL以上 10mL未満	溶けやすい
エタノール (99.5)	10mL以上 30mL未満	やや溶けやすい
ジエチルエーテル	10000mL以上	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点：101～106℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa¹⁾：8.96

(6) 分配係数

234.32 (オレイルアルコール/リン酸緩衝液 pH7.4) ¹⁾

(7) その他の主な示性値

pH：4.3～5.3 (1→10)

吸光度：本品のエタノール溶液 (1→200,000) につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長223～227nm及び308～312nmに吸収の極大を示す。

2. 有効成分の各種条件下における安定性 ²⁾³⁾

保存条件	包装形態	保存期間	結果
40℃、75%RH	褐色ガラス瓶、密栓	6 ヶ月	いずれの試験項目も規格に適合した ^{注1)} 。
室温	褐色ガラス瓶 密栓、紙箱	3 年	いずれの試験項目も規格に適合した ^{注2)} 。

注 1) 試験項目：性状、確認試験、pH、純度試験、乾燥減量、強熱残分、含量

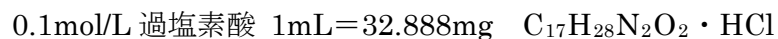
注 2) 試験項目：性状、pH、類縁物質、乾燥減量、含量

3. 有効成分の確認試験法

- (1)本品 0.5g に水 10mL を加えて溶かし、水酸化ナトリウム試液 2mL を加えて振り混ぜた後、エーテル 40mL で抽出する。エーテル抽出液は、水 10mL ずつで 3 回洗い、無水硫酸ナトリウム 1g を加えて振り混ぜた後、ろ過する。ろ液を水浴上で蒸発乾固し、残留物を冷所に放置し、結晶を析出させるとき、その融点は、30～36℃である（第 2 法）。
- (2)本品のエタノール溶液（1→200,000）につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 223～227nm 及び 308～312nm に吸収の極大を示す。
- (3)本品の水溶液（1→50）は塩化物の定性反応を呈する。

4. 有効成分の定量法

本品を乾燥し、その約 0.4g を精密に量り、酢酸 (100) 50mL を加えて溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する（電位差滴定法）。同様の方法で空試験を行い、補正する。



IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

筋注、経皮、点眼

(2) 剤形の区別、規格及び性状

剤形：原末

規格：1g

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。

(3) 製剤の物性

該当資料なし

(4) 識別コード

該当しない

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

該当しない

(6) 無菌の有無

なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1g中 パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩1g含有

(2) 添加物

なし

(3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

3. 用時溶解して使用する製剤の調整法

パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩を各目的濃度（0.05～0.5%）の水性注射液に調製し、アドレナリンを添加する。

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性²⁾³⁾

保存条件	包装形態	保存期間	結果
40℃ 75%RH	褐色ガラス瓶 密栓	6 ヶ月	いずれの試験項目も規格に適合した ^{注1)} 。
室温	褐色ガラス瓶 密栓、紙箱	3 年	いずれの試験項目も規格に適合した ^{注2)} 。

注1) 試験項目：性状、確認試験、pH、純度試験、乾燥減量、強熱残分、含量

注2) 試験項目：性状、pH、類縁物質、乾燥減量、含量

6. 溶解後の安定性

溶解後の pH 安定域

テーカイン水溶液（0.48g を 200mL に溶解）を各 pH に調製し 37℃における経時的な含量を調査した結果、pH 2～5 では 0～168 時間で含量変化が認められなかったが、pH 5 以上になると不安定となり pH 7 では 168 時間後に約 20% の分解が認められた。

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

8. 溶出性

該当資料なし

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

「Ⅲ—3. 有効成分の確認試験法」に準ずる。

11. 製剤中の有効成分の定量法

「Ⅲ—4. 有効成分の定量法」に準ずる。

12. 力価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

14. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

15. 刺激性

10例10眼のヒト健常眼にパラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩（ターカイン）を0.5%含有する製剤を1滴点眼し、点眼直後の自覚的刺激感を調査した結果は、以下のとおりであった⁴⁾。

自覚的刺激感	眼数
「シミナイ」	6眼
わずかに「シ米尔」	3眼
軽いがかなり「シ米尔」	1眼
ひどく「シ米尔」	0眼

16. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

伝達麻酔、浸潤麻酔、表面麻酔、歯科領域における伝達麻酔・浸潤麻酔

2. 用法及び用量

使用に際し、目的濃度の水性注射液または水性液として使用する。

ただし、年齢、麻酔領域、部位、組織、症状、体質により適宜増減する。

伝達麻酔	(基準最高用量：1回 30mg) 0.1%注射液にアドレナリンを添加したものを、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩として、通常成人 2～20mg を使用する。
浸潤麻酔	(基準最高用量：1回 50mg) 0.05～0.25%注射液にアドレナリンを添加したものを、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩として、通常成人 5～50mg を使用する。
表面麻酔	0.3～0.5%液にアドレナリンを添加したものを、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩として、通常成人 30mg の範囲内で使用する。眼科領域の麻酔には 0.3～0.5%液とし、1～3 滴を点眼する。
歯科領域麻酔	0.25%注射液にアドレナリンを添加したものを、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩として、通常成人伝達麻酔には 2.5～6.25mg、浸潤麻酔には 1.25～5mg を使用する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

1) 表面麻酔

① 眼科領域⁵⁾

パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチルを0.5%含む水溶液を眼科処置に際し点眼し、その表面麻酔効果を検討した結果は下記のとおりである。副作用は、201例中48例にわずかなあるいは軽度の結膜充血を認めたが、いずれも一過性であった。

適用処置	点眼量	効果		
		効果良好または疼痛なし	わずかな疼痛あり	計
異物除去	2	30		30
	3	25		25
眼圧測定	1	38		38
	2	30		30
結膜下注射	2	10	3	13
	3	30	1	31
コンタクトレンズ試用	1	34		34
計		197	4	201

② 耳鼻科領域⁵⁾

慢性副鼻腔炎、慢性扁桃炎等の耳鼻科領域各種手術例24例にパラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル0.5%液を0.5~10mL使用し、その表面麻酔を検討した結果、麻酔持続時間は15~55分であった。

2) 浸潤麻酔・伝達麻酔⁵⁾

パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル（テーカイン）単独で手術を実施した症例108例、および脊椎麻酔不良のためテーカインの局所麻酔を施行した症例7例の計115例について、臨床効果を検討した。テーカイン濃度は0.05%、0.1%、0.2%の3種類を使用し、アドレナリン添加の有無により6種類とした。使用量は最大290mLで100mL以上使用した症例は10例であった。麻酔発現時間、術中麻酔程度は下記のとおりである。副作用は115例中1例にみられた。

① 麻酔発現時間、術中麻酔程度

ほとんどの症例で注射直後に作用が発現し、浸潤麻酔では2分を超えた例はなかった。

麻酔発現時間

	直後	1分	2分	3分	4分	5分	7分	不明
浸潤麻酔	88	9	1					10
伝達麻酔				2	1	2	2	

(例数)

投与方法別の術中麻酔程度は以下のとおりであり、麻酔不十分で手術に支障をきたした症例はなかった。

術中麻痺程度

	優	良	可	不良	不明
0.2%	10	3	0	0	1
0.2%+A	15	2	0	0	1
0.1%	4	0	1	0	0
0.1%+A	23	3	0	0	3
0.05%	3	2	1	0	0
0.05%+A	24	15	3	0	1
計	79	25	5	0	6

(例数)

優：術中全く疼痛を訴えず、良：術中ごく軽微な疼痛あり、

可：術中に疼痛あるが手術に支障なし

A：アドレナリン

② 副作用

テーカイン 0.2%液にアドレナリンを併用して 290mL 投与した症例で、投与 40 分後に興奮状態を呈し、胸部苦悶、浅い呼吸 (34/分)、脈拍 120/分、顔面軽度蒼白が認められた。コルニジン、カンフル皮下注にて 10 分後に症状は消失し、手術は続行。術後、異常は認めなかった。

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

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

該当資料なし

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

安息香酸エステル系局所麻酔剤

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：神経線維

作用機序：一次感覚神経の無髄（C）神経線維、細い有髄（A δ ）神経線維のNa⁺チャネル内の特異的結合部位に結合してイオンの細胞内への流入を阻止し、活動電位の発生を抑制（神経伝導を遮断）することにより局所麻酔作用を発現する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

- 1) ヒトの前腕内側皮内に0.01～0.1%パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩（テーカイン）生理食塩液溶液 0.1mLを注射し、痛覚麻痺作用をジブカイン塩酸塩と比較したところ、ジブカイン塩酸塩とほぼ同一の作用強度を有し、作用発現はパラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩の方が速やかで、持続は短い傾向がみられた⁶⁾。
- 2) 健康人の一眼に0.4%パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩（テーカイン）あるいは4%リドカイン、他眼に2%コカインを一滴点眼し麻酔発現時間を比較したところ、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩 38.0秒（コカイン 41.4秒）、リドカイン 33.0秒（コカイン 41.0秒）といずれもコカインより短かった。また麻酔持続時間は、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩 13.6分（コカイン 12.6分）、リドカイン 12.4分（コカイン 13.0分）とパラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩はコカインより長かった⁷⁾。
- 3) パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩（テーカイン）およびテトラカイン塩酸塩を各種濃度の溶液（0.025%、0.05%、0.1%、0.2%、0.5%、1.0%）に調整し、同一濃度の溶液を家兔に点眼して角膜反射の消失を観察した結果、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩の知覚麻痺強度はテトラカイン塩酸塩と同等で、作用持続時間はパラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩の方が長かった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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当しない

(2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

<参考>⁹⁾

ウサギにパラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩（テーカイン）
1mg/kg (0.2%液) 静脈内投与後の血漿中濃度推移を検討した結果、投与後5分で0.38
 $\mu\text{g/mL}$ と検出感度（0.5 $\mu\text{g/mL}$ ）以下になり、15分後にはほとんど消失した。

(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) コンパートメントモデル

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

吸収部位：投与部位の血管

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

ウサギ血漿中でエステル部分が速やかに加水分解され、主にパラブチルアミノ安息香酸とジエチルアミノエタノールになる⁹⁾。

(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

7. 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（次の患者又は部位には投与しないこと）】

1. 次の患者には投与しないこと

本剤又は安息香酸エステル（コカインを除く）系局所麻酔剤に対し過敏症の既往歴のある患者

2. 次の患者に投与する場合には、血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと

(1) 血管収縮剤に対し過敏症の既往歴のある患者

(2) 高血圧、動脈硬化、心不全、甲状腺機能亢進、糖尿病、血管痙攣等のある患者 [これらの症状が悪化するおそれがある。]

(3) 耳、指趾又は陰茎の麻酔 [浸潤、伝達麻酔用のみ] [壊死状態になるおそれがある。]

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) 次の患者には慎重に投与すること

1) 高齢者（「高齢者への投与」の項(1)参照）

(2) 次の患者に血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加して投与する場合には、慎重に投与すること

1) ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤使用中の患者 [心筋の被刺激性が高まって不整脈が発現しやすい。]

2) 三環系抗うつ剤服用中の患者 [心血管作用の増強がみられることがある。]

3) 高齢者（「高齢者への投与」の項(2)参照）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (1) まれに**ショック様症状**を起こすことがあるので、本剤の投与に際しては、常時、直ちに**救急処置**のとれる準備が望ましい。
- (2) 本剤の投与に際し、その副作用を完全に防止する方法はないが、ショック様症状をできるだけ避けるために、次の諸点に留意すること。

伝達麻酔 浸潤麻酔 表面麻酔 歯科領域麻酔	1) 患者の 全身状態の観察 を十分に行うこと。 2) できるだけ 薄い濃度 のものを用いること。 3) できるだけ 必要最小量 にとどめること。
伝達麻酔 浸潤麻酔	1) 必要に応じて、 血管収縮剤 の併用を考えること。 2) 血管の多い部位（頭部、顔面、扁桃等）に注射する場合には、 吸収が速い ので、できるだけ少ない量で使用する こと。 3) 注射針が 血管 に入っていないことを確かめること。 4) 注射の速度はできるだけ 遅く すること。
表面麻酔	1) 気道内表面麻酔の場合には、 吸収が速い ので、できるだけ少ない量で使用する 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

該当しない

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、副作用発現頻度については不明である。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用

- 1) **ショック** ショックがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、**血圧降下**、**顔面蒼白**、**脈拍の異常**、**呼吸抑制等**があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) **中枢神経** 振戦、痙攣等の中毒症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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、**ジアゼパム**又は

超短時間作用型バルビツール酸製剤（チオペンタールナトリウム等）の投与等の適切な処置を行うこと。

（3）その他の副作用

その他の副作用

	頻度不明
1) 精神神経系 ^{注)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心・嘔吐等
2) 過 敏 症	蕁麻疹、浮腫等

注) 観察を十分に行い、ショックあるいは中毒への移行に注意し、必要に応じて適切な処置を行うこと。

（4）項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

（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

- 1) 本剤又は安息香酸エステル（コカインを除く）系局所麻酔剤に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 血管収縮剤に対し過敏症の既往歴のある患者に投与する場合には、血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと。
- 3) 蕁麻疹、浮腫等の過敏症があらわれることがある。

9. 高齢者への投与

高齢者への投与

- (1) 一般に高齢者では生理機能が低下しているので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。
- (2) 高齢者では血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）の作用に対する感受性が高いことがあるので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。]

11. 小児等への投与

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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

該当しない

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

1. 循環器系に対する作用⁸⁾

ウレタン麻酔家兔にパラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩 (テーカイン) 0.1、0.25、0.5、1、1.5、2.0mg/kg を静脈内注射し、心臓、血圧に対する作用を検討した結果は以下のとおりである。

(1) 心臓に対しては少量 (0.25-0.5mg/kg の静脈内注射) で興奮、1.5-2.0mg/kg の大量で抑制 (不整脈、収縮力減弱) がみられた。

(2) 血圧は 0.25mg/kg では上昇のみであったが、0.5mg/kg 以上では初期に下降後上昇がみられた。

2. 腸管に対する作用⁸⁾

家兔摘出腸管の振子運動をマグヌス法により描記し、パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩 (テーカイン) を栄養液 (タイロード液) に添加 (1 億倍、1000 万倍、100 万倍、10 万倍、1 万倍) して、その摘出腸管に対する作用を検討した。その結果、本剤は腸管に対して常に抑制で興奮はなく、100 万倍で抑制があらわれた。

(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⁹⁾

LD₅₀ (mg/kg)

動物種 投与経路	マウス(ddY系)		ラット(Wistar系)		ウサギ
	♂	♀	♂	♀	♂
静脈内	4.9 (4.5-5.4)	5.6 (5.1-6.2)	2.6 (2.4-3.0)	2.5 (2.2-2.8)	2.4
腹腔内	31.5 (29.0-34.2)	32.0 (29.6-34.6)	20.5 (18.8-22.4)	26.5 (23.3-30.2)	—
皮下	19.1 (18.2-20.1)	25.4 (23.4-27.5)	22.8 (20.2-25.8)	22.5 (18.0-28.1)	—
経口	182 (165.5-200.2)	156 (141.2-172.4)	—	—	—

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：テーカイン原末；劇薬

有効成分：パラブチルアミノ安息香酸ジエチルアミノエチル塩酸塩；劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

遮光、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱いについて

該当しない

（2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

5g

7. 容器の材質

容 器：褐色のガラス瓶

中 栓：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同 効 薬：テトラカイン、プロカイン

9. 国際誕生年月日

該当資料なし

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日：2007年8月31日（販売名変更による）
旧販売名：テーカイン 承認年月日：1949年1月20日
承認番号：21900AMX01211000

11. 薬価基準収載年月日

2007年12月21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

再評価結果公表年月日：1974年11月20日（薬発第1046号）
薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）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、投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

H O T （ 9 桁 ） 番 号 : 101651203
厚生労働省薬価基準収載医薬品コード：1211700X1036
レセプト電算コード：620006455

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) Büchi, J. et al. : *Arzneim.-Forsch.* 17 (12) 1491, 1967 (NM10298)
- 2) ナガセ医薬品 (株) : テーカイン原末の安定性試験 (NM0237)
- 3) ナガセ医薬品 (株) : テーカイン原末の長期保存試験 (NM0271)
- 4) 西岡啓介 : *眼科臨床医報* 67 (3) 249, 1973 (NM10299)
- 5) ナガセ医薬品 (株) : テーカインの臨床効果 (NM0238)
- 6) 湯浅義雄 : *米子医学雑誌* 6 (2) 135, 1955 (NM10084)
- 7) 金子良正 : *眼科臨床医報* 51 (8) 743, 1957 (NM10077)
- 8) 貫 文三郎 他 : *実地医家と臨床* 21 (2) 115, 1944 (NM10076)
- 9) 大塚正道 他 : *応用薬理* 9 (3) 413, 1975 (NM10107)

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 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

該当しない

XIII. 備 考

1. その他の関連資料

(1) JANコード

4987114059901

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

製造販売元

ナガセ医薬品株式会社
〒664-0898 兵庫県伊丹市千僧 4-323

販売

ファイザー株式会社
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7

提携

マイラン製薬株式会社
〒541-0053 大阪市中央区本町 2 丁目 6 番 8 号