

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2013に準拠して作成

局所麻酔剤

塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5% 「NP」

塩酸メピバカイン注シリンジ 1% 「NP」

塩酸メピバカイン注シリンジ 2% 「NP」

MEPIVACAINE HYDROCHLORIDE INJECTION SYRLINGE

日本薬局方
メピバカイン塩酸塩注射液

剤形	注射剤（シリンジ）
製剤の規制区分	劇薬、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	0.5%：1mL中 メピバカイン塩酸塩 5mg （1シリンジ10mL中 メピバカイン塩酸塩 50mg） 1%：1mL中 メピバカイン塩酸塩 10mg （1シリンジ10mL中 メピバカイン塩酸塩 100mg） 2%：1mL中 メピバカイン塩酸塩 20mg （1シリンジ10mL中 メピバカイン塩酸塩 200mg）
一般名	和名：メピバカイン塩酸塩 洋名：Mepivacaine Hydrochloride
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：2005年 3月 3日 薬価基準収載年月日：2005年12月16日 発売年月日：2006年 7月10日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	発売 丸石製薬株式会社 製造販売 ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	丸石製薬株式会社 学術情報部 TEL 0120-014-561 FAX 06-6965-0900 医薬関係者向けホームページ http://www.maruishi-pharm.co.jp/med2/

本IFは2019年4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.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>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の医薬品情報提供ホームページ (<http://www.info.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 を掲載する医薬品情報提供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 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。
- ②IF 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】

- ①IF 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。
- ②IF 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 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」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 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、「IF 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 IF が改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF 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 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、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
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
1. 販売名	1
2. 一般名	1
3. 構造式又は示性式	1
4. 分子式及び分子量	1
5. 化学名（命名法）	1
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	2
1. 物理化学的性質	2
2. 有効成分の各種条件下における安定性	2
3. 有効成分の確認試験法	2
4. 有効成分の定量法	2
IV. 製剤に関する項目	2
1. 剤形	2
2. 製剤の組成	3
3. 注射剤の調製法	3
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	3
5. 製剤の各種条件下における安定性	3
6. 溶解後の安定性	3
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	4
8. 生物学的試験法	4
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	4
10. 製剤中の有効成分の定量法	4
11. 力価	4
12. 混入する可能性のある夾雑物	4
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	4
14. その他	5
V. 治療に関する項目	5
1. 効能又は効果	5
2. 用法及び用量	5
3. 臨床成績	6
VI. 薬効薬理に関する項目	6
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	6
2. 薬理作用	6
VII. 薬物動態に関する項目	7
1. 血中濃度の推移・測定法	7
2. 薬物速度論的パラメータ	7
3. 吸収	7
4. 分布	7
5. 代謝	7
6. 排泄	8
7. トランスポーターに関する情報	8
8. 透析等による除去率	8
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	8
1. 警告内容とその理由	8
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	8
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	8
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	8
5. 慎重投与内容とその理由	8
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	9

7. 相互作用	9
8. 副作用	10
9. 高齢者への投与	10
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	10
11. 小児等への投与	11
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	11
13. 過量投与	11
14. 適用上の注意	11
15. その他の注意	11
16. その他	11
IX. 非臨床試験に関する項目	11
1. 薬理試験	11
2. 毒性試験	12
X. 管理的事項に関する項目	12
1. 規制区分	12
2. 有効期間又は使用期限	12
3. 貯法・保存条件	12
4. 薬剤取扱い上の注意点	12
5. 承認条件等	13
6. 包装	13
7. 容器の材質	13
8. 同一成分・同効薬	13
9. 国際誕生年月日	13
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	13
11. 薬価基準収載年月日	13
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	13
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	13
14. 再審査期間	13
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	13
16. 各種コード	14
17. 保険給付上の注意	14
XI. 文献	14
1. 引用文献	14
2. その他の参考文献	14
XII. 参考資料	14
1. 主な外国での発売状況	14
2. 海外における臨床支援情報	14
XIII. 備考	14
その他の関連資料	14

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

メピバカイン塩酸塩は、アメリカ Winthrop 社により開発された局所麻酔薬である。
塩酸メピバカイン注シリンジ「NP」は、メピバカイン塩酸塩をシリンジ充填したプレフィルドシリンジ製剤としてニプロファーマ(株)が開発したキット製品である。
2005年3月にニプロファーマ(株)が承認を取得し、2006年7月より丸石製薬(株)で販売を開始した。
なお、2014年2月に製造販売承認をニプロファーマ(株)からニプロ(株)が承継した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

メピバカイン塩酸塩は、アミド型の局所麻酔薬で作用発現が速く、作用持続時間は長い。また毒性は弱く、組織障害もなく耐薬性が大きい特徴を有する薬剤である。
塩酸メピバカイン注シリンジ「NP」は、単回使用のプレフィルドシリンジ製剤で、下記に示すような特徴があり、緊急性、利便性及び作業効率の向上等が期待される。

プレフィルドシリンジ製剤としての特徴・有用性

- (1) 清潔・携帯性
高圧蒸気滅菌済みのプリスター包装のため、清潔な取扱いが可能。
- (2) 誤投薬防止
 - 1) カラーラベルによる識別性の向上。
 - 2) 薬剤名、内容量が直接製品上に明記されているため、薬剤の取り違いや調製過誤の防止に役立つ。
- (3) 薬剤汚染防止
アンプルカット・薬剤吸引が不要なため、微生物汚染、異物混入の可能性が低減。
- (4) 調製作業の簡略化
緊急時等の迅速な対応が可能。

II. 名称に関する項目

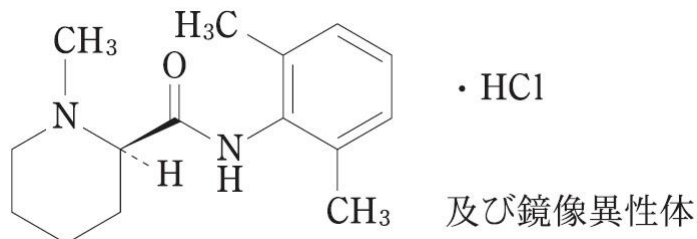
1. 販売名

- (1) 和名 塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5%「NP」
塩酸メピバカイン注シリンジ 1%「NP」
塩酸メピバカイン注シリンジ 2%「NP」
- (2) 洋名 MEPIVACAINE HYDROCHLORIDE INJECTION SYRINGE
- (3) 名称の由来 有効成分であるメピバカイン塩酸塩のシリンジ製剤による。

2. 一般名

- (1) 和名 (命名法) メピバカイン塩酸塩 (JAN)
- (2) 洋名 (命名法) Mepivacaine Hydrochloride (JAN)
- (3) ステム -caine 局所麻酔薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₅H₂₂N₂O・HCl
分子量：282.81

5. 化学名 (命名法)

(2*RS*)-*N*-(2,6-Dimethylphenyl)-1-methylpiperidine-2-carboxamide monohydrochloride(IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：塩酸メピバカイン注射液

7. CAS 登録番号

1722-62-9

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ある。

(2) 溶解性

水又はメタノールに溶けやすく、酢酸（100）にやや溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けにくい。

(3) 吸湿性

やや吸湿性である。相対湿度 75%、25℃で 6 時間後 2～2.5%吸湿し、その後平衡になる¹⁾。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 256℃（分解）

(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

水溶液（1→10）は旋光性を示さない。

pH：本品 0.2g を水 10mL に溶かした液の pH は 4.0～5.0 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

<参考>

光による変化は少ない¹⁾。

3. 有効成分の確認試験法

(1) 吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法

(3) 定性反応

4. 有効成分の定量法

電位差滴定法により滴定する。

Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	塩酸メピバカイン注 シリンジ 0.5% 「NP」	塩酸メピバカイン注 シリンジ 1% 「NP」	塩酸メピバカイン注 シリンジ 2% 「NP」
性状	無色澄明の水溶性注射液		
容器	プラスチックシリンジ		
pH	4.5～6.8		
浸透圧比 (生理食塩液に対する比)	約 1		

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

「Ⅳ. 1. (1) 剤形の区別、外観及び性状」の項参照

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1mLあたりの成分・含量

販売名	塩酸メピバカイン注射液 0.5%「NP」	塩酸メピバカイン注射液 1%「NP」	塩酸メピバカイン注射液 2%「NP」
成分・含量 (1mL中)	メピバカイン塩酸塩 5mg	メピバカイン塩酸塩 10mg	メピバカイン塩酸塩 20mg
添加物 (1mL中)	塩化Na 8.4mg pH調整剤 適量	塩化Na 7.9mg pH調整剤 適量	塩化Na 6.9mg pH調整剤 適量

1 シリンジあたりの有効成分・含量

販売名	塩酸メピバカイン注射液 0.5%「NP」	塩酸メピバカイン注射液 1%「NP」	塩酸メピバカイン注射液 2%「NP」
1 シリンジ 10mL中	メピバカイン塩酸塩 50mg	メピバカイン塩酸塩 100mg	メピバカイン塩酸塩 200mg

(2) 添加物

「IV. 2. (1) 有効成分（活性成分）の含量」の項参照

(3) 電解質の濃度

塩化ナトリウム含量：0.5% 8.4mg/mL
1% 7.9mg/mL
2% 6.9mg/mL

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

3. 注射剤の調製法

該当しない

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

最終包装製品を用いた長期保存試験〔室温（1～30℃）、3年間〕の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、塩酸メピバカイン注射液 0.5%「NP」、塩酸メピバカイン注射液 1%「NP」及び塩酸メピバカイン注射液 2%「NP」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された²⁾。

加速試験及び長期保存試験²⁾

塩酸メピバカイン注射液 0.5%「NP」

塩酸メピバカイン注射液 1%「NP」

塩酸メピバカイン注射液 2%「NP」

保存条件	包装状態	保存期間	試験結果
40℃、75%RH	内包装：プラスチック製シリンジ (材質：ポリプロピレン) 外包装：ブリスター包装	6ヵ月	変化なし
室温（1～30℃）		36ヵ月	変化なし

試験項目：性状（色調・pH）、確認試験、エンドトキシン試験、無菌試験、不溶性異物検査、不溶性微粒子試験、実用量試験、含量

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

1%及び2%注射剤にアルカリ溶液を加えると、塩基が析出して白濁する。ただし溶解度の関係で0.5%注射剤はほとんど変化しないといわれる。リン酸デキサメタゾン二ナトリウム注射剤と混合すると、濃度により直後又は7時間以内に白濁する例も見られるが、これは塩の交換反応に基づくものと考えられるため、同様の反応を生じる可能性がある注射剤との配合は注意を要する。なお、セファロチンナトリウム注射剤との混合では、白濁を生じないが、約3時間で色調の変化を認めたといわれる¹⁾。

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

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

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

容器の材質

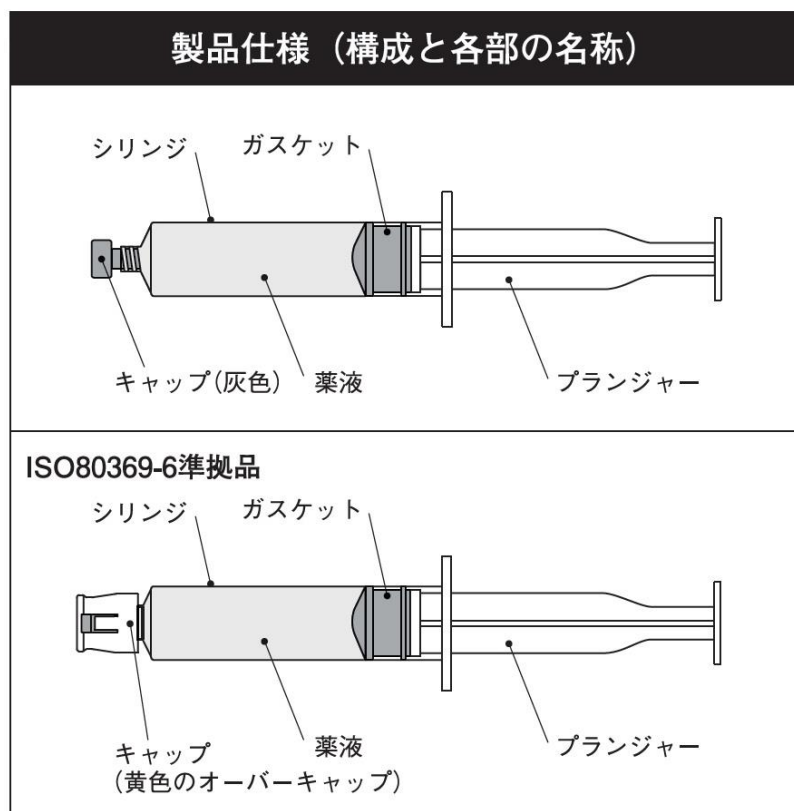
シリンジ : ポリプロピレン

プランジャー : ポリプロピレン

ガスケット : ブチルゴム

キャップ : ブチルゴム

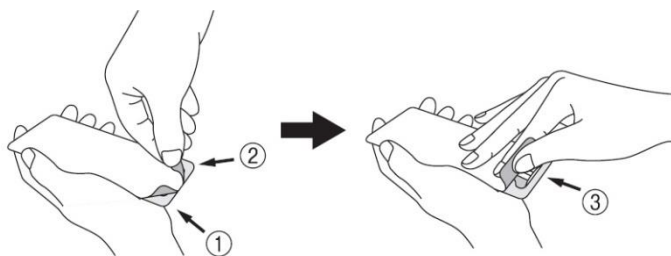
オーバーキャップ (ISO80369-6 準拠品) : ポリプロピレン



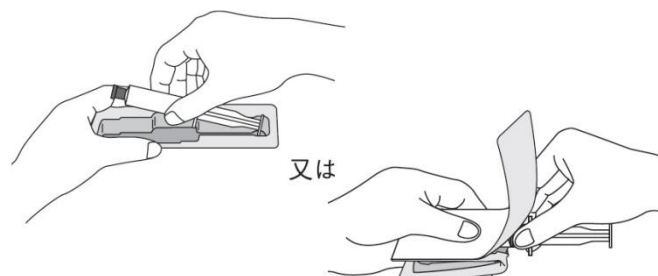
ISO80369-6準拠品はキャップの形状及び色が異なります。

操作方法

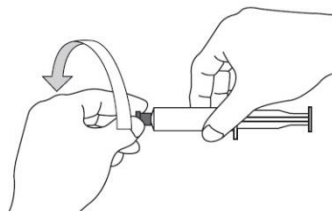
1. ブリスター包装を開封する。
2つの“開封口”（下図①、②）から側面全体（下図③）を開封し、シールをゆっくり剥がしながら開封する。
注意：ブリスター包装は使用直前まで開封しないこと。
[ブリスター内は高圧蒸気滅菌されています。]



2. シリンジを取り出す。
注意：プランジャーを持って引き出さないこと。[ガスケットが変形し、プランジャーが外れたり、薬液が漏出するおそれがある。]



3. シリンジ先端のゴムキャップをゆっくり回転させながら外す。
[薬液が飛び散る等のおそれがある。]
注意：キャップを外した後、シリンジ先端部に触れないこと。



4. 注射針に接続し、シリンジ内の空気を除去後、薬液を注入する。
カテーテルに接続する場合は、シリンジ内の空気を除去後、カテーテルに接続し、薬液を注入する。
注意：プランジャーは回さないこと。[外れるおそれがある。]

14. その他 該当なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔

2. 用法及び用量

メピバカイン塩酸塩として、通常成人には次の用量を投与する。

なお、メピバカイン塩酸塩の基準最高用量は、それぞれ1回 500mg（0.5%注：100mL、1%注：50mL、2%注：25mL）である。

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。

麻酔方法別の用量：メピバカイン塩酸塩として、通常成人には次記量を使用する。（ ）内は注射液としての用量である。

麻酔方法	0.5%注	1%注	2%注
硬膜外麻酔	50～150mg (10～30mL)	100～300mg (10～30mL)	200～400mg (10～20mL)
伝達麻酔	—	50～200mg (5～20mL)	40～400mg (2～20mL)
伝達麻酔 [指趾神経遮断]	20～40mg (4～8mL)	40～80mg (4～8mL)	80～160mg (4～8mL)
伝達麻酔 [肋間神経遮断]	25mg (5mL)	—	—
伝達麻酔 [交感神経遮断]	25mg (5mL)	—	—
浸潤麻酔	10～200mg (2～40mL)	20～400mg (2～40mL)	40～400mg (2～20mL)

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

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

アミド型局所麻酔薬

(リドカイン、プロピトカイン、ブピバカイン、レボブピバカイン、ロピバカイン)

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

1. 局所麻酔作用

メピバカイン塩酸塩は、感覚・求心神経線維のナトリウムチャンネルを遮断し、活動電位の伝導を抑制することにより局所麻酔作用を示すといわれる。

その作用の強さはリドカイン塩酸塩と同等か、やや強く、持続は同じか、やや長い。

2. 血管収縮作用

メピバカイン塩酸塩自身が弱い血管収縮作用を持っているといわれる。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

- 該当資料なし
(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
- (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
該当しない
- (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
消失半減期：成人で2～3時間、新生児で9時間¹⁾
- (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
78%¹⁾

3. 吸収

該当しない

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

肝で速やかに代謝され、投与量の10%未満が未変化体として尿中に排泄される。代謝物としては、グルクロンサン抱合体、N-脱メチル化体、2,6-pipecoloxylidideがあり、これらも尿中に排泄される。投与量の約50%が代謝物として胆汁中に排泄されるが、腸肝循環のため、ふ

ん便中排泄量は少ない¹⁾。

- (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
該当しない
- (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
「VII. 5. 代謝 (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照
- (2) 排泄率
「VII. 5. 代謝 (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照
- (3) 排泄速度
該当資料なし

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）】

【共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔）】

本剤の成分又はアミド型局所麻酔剤に対し過敏症の既往歴のある患者

【硬膜外麻酔】

1. 大量出血やショック状態の患者 [過度の血圧低下が起こることがある。]
2. 注射部位又はその周辺に炎症のある患者 [化膿性髄膜炎症状を起こすことがある。]
3. 敗血症の患者 [敗血症性の髄膜炎を生じるおそれがある。]

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）

【共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔）】

- (1) 高齢者（「VIII. 9. 高齢者への投与」及び「VIII. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照）
- (2) 全身状態が不良な患者 [生理機能の低下により麻酔に対する忍容性が低下していることがある。]（「VIII. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照）
- (3) 心刺激伝導障害のある患者 [症状を悪化させることがある。]
- (4) 重篤な肝機能障害又は腎機能障害のある患者 [中毒症状が発現しやすくなる。]

【硬膜外麻酔】

- (1) **中枢神経系疾患**：髄膜炎、灰白脊髄炎、脊髄ろう等の患者及び脊髄・脊椎に腫瘍又は結核

- 等のある患者〔硬膜外麻酔により症状が悪化するおそれがある。〕
- (2) 血液凝固障害や抗凝血薬投与中の患者〔出血しやすく、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがあるので、やむを得ず投与する場合は観察を十分に行うこと。〕
 - (3) 脊柱に著明な変形のある患者〔脊髄や神経根の損傷のおそれがあり、また麻酔範囲の予測も困難であるので、やむを得ず投与する場合は患者の全身状態の観察を十分に行うこと。〕
 - (4) 妊産婦（「Ⅷ. 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
 - (5) 腹部腫瘍のある患者〔仰臥位性低血圧を起こしやすく、麻酔範囲が広がりやすい。麻酔中は更に増悪することがあるので、投与量の減量を考慮するとともに、患者の全身状態の観察を十分に行うこと。〕
 - (6) 重篤な高血圧症、心弁膜症等の心血管系に著しい障害のある患者〔血圧低下や病状の悪化が起こりやすいので、患者の全身状態の観察を十分に行うこと。〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

〔共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔）〕

- (1) まれに**ショックあるいは中毒症状**を起こすことがあるので、本剤の投与に際しては、十分な問診により患者の全身状態を把握するとともに、異常が認められた場合に直ちに**救急処置**のとれるよう、常時準備をしておくこと。なお、事前の**静脈路確保**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、ショックあるいは中毒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。
 - 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。
 - 4) 必要に応じて**血管収縮剤**の併用を考慮すること。
 - 5) 注射の速度はできるだけ**遅くする**こと。
 - 6) 注射針が、**血管又はくも膜下腔**に入っていないことを確かめること。
 - 7) 前投薬や術中に投与した**鎮静剤、鎮痛剤**等による**呼吸抑制**が発現することがあるので、これらの薬剤を使用する際は**少量**より投与し、必要に応じて追加投与することが望ましい。なお、高齢者、小児、全身状態が不良な患者、肥満者、呼吸器疾患を有する患者では特に注意し、異常が認められた際には、適切な処置を行うこと。
- (3) 注射針又はカテーテルが適切に位置していない等により、**神経障害**が生じることがあるので、穿刺に際し異常を認めた場合には本剤の注入を行わないこと。
- (4) 本剤に血管収縮剤（アドレナリン等）を添加して投与する場合には、血管収縮剤の添付文書に記載されている禁忌、慎重投与、重大な副作用等の使用上の注意を必ず確認すること。

〔硬膜外麻酔〕

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、ショックあるいは中毒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。

- 1) **試験的に注入**（test dose）し、注射針又はカテーテルが適切に留置されていることを確認すること。
- 2) **麻酔範囲**が予期した以上に広がることにより、過度の血圧低下、徐脈、呼吸抑制を来すことがあるので、麻酔範囲に注意すること。

〔伝達麻酔・浸潤麻酔〕

- (1) 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、ショックあるいは中毒症状をできるだけ避けるために、次の点に留意すること。

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、できるだけ少量を投与すること。
- (2) 球後麻酔、眼球周囲麻酔施行時は次の諸点に留意すること。
 - 1) 持続性の眼筋運動障害が発現するおそれがあるので、できるだけ薄い濃度で、必要最小量を用いることとし、外眼筋内への注入は避けること。また、血管収縮剤は障害を悪化させることがあるので、必要な場合にのみ使用すること。
 - 2) 視神経鞘内への誤注入により、一過性の失明、心肺停止を起こすことがあるので、注射針はできるだけ短く、先の鈍いものを使用することが望ましい。

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
クラスⅢ抗不整脈剤 ・アミオダロン等	心機能抑制作用が増強するおそれがあるので、心電図検査等によるモニタリングを行うこと。	作用が増強することが考えられる。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は、副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）

1) ショック

徐脈、不整脈、血圧低下、呼吸抑制、チアノーゼ、意識障害等を生じ、まれに心停止を来すことがある。

また、まれにアナフィラキシーショックを起こしたとの報告があるので、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、適切な処置を行うこと。

2) 意識障害、振戦、痙攣

意識障害、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、適切な処置を行うこと。（「Ⅷ. 13. 過量投与」の項参照）

3) 異常感覚、知覚・運動障害

注射針又はカテーテルの留置時に神経（神経幹、神経根）に触れることにより一過性の異常感覚が発現することがある。また、神経が注射針や薬剤あるいは虚血によって障害を受けると、まれに持続的な異常感覚、疼痛、知覚障害、運動障害、硬膜外麻酔では膀胱直腸障害等の神経学的疾患があらわれることがある。

(3) その他の副作用

その他の副作用

種類\頻度	頻度不明
中枢神経 ^{注)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等
消化器 ^{注)}	悪心、嘔吐等
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等

注) このような症状があらわれた場合は、ショックあるいは中毒へ移行することがあるので、患者の全身状態の観察を十分に行い、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

「Ⅷ. 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」の項、
「Ⅷ. 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項、
「Ⅷ. 8. 副作用」の項 参照

9. 高齢者への投与

【硬膜外麻酔】

一般に高齢者では、麻酔範囲が広がりやすく、生理機能の低下により麻酔に対する忍容性が低下しているため、投与量の減量を考慮するとともに、患者の全身状態の観察を十分に行うなど慎重に投与すること起こすことがあるので、注射針はできるだけ短く、先の鈍いものを使用することが望ましい。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

【共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔）】

妊婦等

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。]

【硬膜外麻酔】

妊産婦

妊娠後期の患者には、投与量の減量を考慮するとともに、患者の全身状態の観察を十分に行う等慎重に投与すること。[妊娠末期は、仰臥位性低血圧を起こしやすく、麻酔範囲が広がりやすい。麻酔中は更に増悪することがある。]（「Ⅷ. 5. 慎重投与内容とその理由」の項参照）

【伝達麻酔】

妊産婦

旁頸管ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。

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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

局所麻酔剤の血中濃度の上昇に伴い、中毒が発現する。特に誤って血管内に投与した場合には、数分以内に発現することがある。その症状は、主に中枢神経系及び心血管系の症状としてあらわれる。

(1) 徴候、症状

○**中枢神経系の症状**

初期症状として不安、興奮、多弁、口周囲の知覚麻痺、舌のしびれ、ふらつき、聴覚過敏、耳鳴、視覚障害、振戦等があらわれる。症状が進行すると意識消失、全身痙攣があらわれ、これらの症状に伴い低酸素血症、高炭酸ガス血症が生じるおそれがある。より重篤な場合には呼吸停止を来すこともある。

○**心血管系の症状**

血圧低下、徐脈、心筋収縮力低下、心拍出量低下、刺激伝導系の抑制、心室性頻脈及び心室細動等の心室性不整脈、循環虚脱、心停止等があらわれる。

(2) 処置

呼吸を維持し、酸素を十分投与することが重要である。必要に応じて人工呼吸を行う。振戦や痙攣が著明であれば、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）を投与する。心機能抑制に対しては、カテコールアミン等の昇圧剤を投与する。心停止を来した場合には直ちに心マッサージを開始する。

14. 適用上の注意

プリスター包装開封後直ちに使用し、使用後の残液は決して使用しないこと。

15. その他の注意

(1) ポルフィリン症の患者に投与した場合、急性腹痛、四肢麻痺、意識障害等の急性症状を誘発するおそれがある。

(2) 因果関係は明らかでないが、外国において術後に本剤を**関節内**（特に肩関節）に**持続**投与された患者で軟骨融解を発現したとの報告がある。

16. その他

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
該当資料なし
 - (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

劇薬

処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（ラベル等に表示の使用期限を参照すること。）

3. 貯法・保存条件

貯法：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

シリンジ製品に関する注意

- (1) ブリスター包装は高圧蒸気滅菌済みであるため、使用直前まで開封しないこと。使用に際しては、開封口からゆっくり開けること。
- (2) シリンジが破損するおそれがあるため、強い衝撃を避けること。
- (3) ブリスター包装から取り出す際、プランジャーを持って引き出さないこと。[ガasketが変形し、プランジャーが外れたり、薬液が漏出するおそれがある。]
- (4) 薬液が漏れている場合や、薬液に混濁や浮遊物等の異常が認められるときは使用しないこと。
- (5) シリンジに破損等の異常が認められるときは使用しないこと。
- (6) シリンジ先端のキャップを外した後、シリンジ先端部に触れないこと。
- (7) 開封後の使用は一回限りとし、使用後の残液は容器とともに速やかに廃棄すること。
- (8) シリンジの再滅菌・再使用はしないこと。
- (9) 注射針等を接続する場合は誤刺に注意し、しっかりと固定すること。
- (10) 本剤は金属を侵す性質があるので、長時間金属器具（カニューレ、注射針等）に接触させないことが望ましい。
なお、金属器具を使用した場合は、使用后十分に水洗すること。
- (11) 本シリンジを高圧自動注入装置及び極端な陰圧が発生する回路には使用しないこと。
[破損等のおそれがある。]
- (12) ISO80369-6 準拠品は、シリンジに貼付したラベル、ブリスター包装蓋部、個装箱に、ISO80369-6 準拠品の表示がある。
- (13) 本剤の使用にあたっては、接続する医療機器のコネクタ形状を確認すること。本剤のISO規格と医療機器のISO規格が一致した場合にのみ接続可能である。

操作方法は、「IV. 製剤に関する項目 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報」の項参照

(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）

該当資料なし

(3) 調剤時の留意点について

ラベルの色調

- 塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5% 「NP」：緑色
 塩酸メピバカイン注シリンジ 1% 「NP」：青色
 塩酸メピバカイン注シリンジ 2% 「NP」：赤色

5. 承認条件等
該当資料なし

6. 包装

塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5% 「NP」 :
10mL×10 シリンジ
10mL×10 シリンジ [ISO80369-6 準拠品]
塩酸メピバカイン注シリンジ 1 % 「NP」 :
10mL×10 シリンジ
10mL×10 シリンジ [ISO80369-6 準拠品]
塩酸メピバカイン注シリンジ 2 % 「NP」 :
10mL×10 シリンジ
10mL×10 シリンジ [ISO80369-6 準拠品]

7. 容器の材質

「IV. 製剤に関する項目 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報」の項参照

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：カルボカイン注、カルボカインアンプル注、日本薬局方メピバカイン塩酸塩注射液
同効薬：リドカイン塩酸塩、プピバカイン塩酸塩、レボプピバカイン塩酸塩、ロピバカイン塩酸塩、塩酸プロピトカイン

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

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5% 「NP」	2005年3月3日	21700AMZ00279
塩酸メピバカイン注シリンジ 1 % 「NP」	2005年3月3日	21700AMZ00280
塩酸メピバカイン注シリンジ 2 % 「NP」	2005年3月3日	21700AMZ00281

11. 薬価基準収載年月日

塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5% 「NP」 : 2005年12月16日
塩酸メピバカイン注シリンジ 1 % 「NP」 : 2005年12月16日
塩酸メピバカイン注シリンジ 2 % 「NP」 : 2005年12月16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

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

該当しない

16. 各種コード

販売名	HOT (13桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5% 「NP」	1171006020101	1214406G1022	620003201
塩酸メピバカイン注シリンジ 0.5% 「NP」 [ISO80369-6 準拠品]	1171006020201		
塩酸メピバカイン注シリンジ 1% 「NP」	1171013020101	1214406G2029	620003202
塩酸メピバカイン注シリンジ 1% 「NP」 [ISO80369-6 準拠品]	1171013020201		
塩酸メピバカイン注シリンジ 2% 「NP」	1171020020101	1214406G3025	620003203
塩酸メピバカイン注シリンジ 2% 「NP」 [ISO80369-6 準拠品]	1171020020201		

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016, C5506-9.
- 2) ニプロ株式会社: 社内資料 (安定性試験)

2. その他の参考文献

第十七改正 日本薬局方

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

C-1