

## 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  
 日本薬局方 メピバカイン塩酸塩注射液  
**0.5% 塩酸 メピバカイン 注「NM」**  
**1% 塩酸 メピバカイン 注「NM」**  
**2% 塩酸 メピバカイン 注「NM」**  
 0.5%・1%・2% MEPIVACAINE HCl Inj. 「NM」

剤形	注射液
製剤の規制区分	劇薬、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)
規格・含量	0.5%塩酸メピバカイン注「NM」： 1mL中 メピバカイン塩酸塩 5mg 含有 1% 塩酸メピバカイン注「NM」： 1mL中 メピバカイン塩酸塩 10mg 含有 2% 塩酸メピバカイン注「NM」： 1mL中 メピバカイン塩酸塩 20mg 含有
一般名	和名：メピバカイン塩酸塩 (JAN) 洋名：Mepivacaine Hydrochloride (JAN)、Mepivacain (INN)
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：1998年2月25日 薬価基準収載年月日：1998年6月8日 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 <a href="http://pfizerpro.jp/cs/sv/pfizerpro/di/Page/1259675500452">http://pfizerpro.jp/cs/sv/pfizerpro/di/Page/1259675500452</a>

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、添付文書で赤字・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

<b>I. 概要に関する項目</b>		7. 他剤との配合変化（物理化学的变化） ...	5
1. 開発の経緯 .....	1	8. 生物学的試験法 .....	6
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	6
		10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	6
<b>II. 名称に関する項目</b>		11. 力価 .....	6
1. 販売名 .....	2	12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	6
(1) 和 名 .....	2	13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 ...	6
(2) 洋 名 .....	2	14. その他 .....	6
(3) 名称の由来 .....	2		
2. 一般名 .....	2	<b>V. 治療に関する項目</b>	
(1) 和 名（命名法） .....	2	1. 効能又は効果 .....	7
(2) 洋 名（命名法） .....	2	2. 用法及び用量 .....	7
(3) ステム .....	2	3. 臨床成績 .....	7
3. 構造式又は示性式 .....	2	(1) 臨床データパッケージ .....	7
4. 分子式及び分子量 .....	2	(2) 臨床効果 .....	7
5. 化学名（命名法） .....	2	(3) 臨床薬理試験：忍容性試験 .....	7
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	2	(4) 探索的試験：用量反応探索試験 .....	7
7. CAS登録番号 .....	2	(5) 検証的試験 .....	8
		(6) 治療的使用 .....	8
<b>III. 有効成分に関する項目</b>		<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	
1. 物理化学的性質 .....	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は	
(1) 外観・性状 .....	3	化合物群 .....	9
(2) 溶解性 .....	3	2. 薬理作用 .....	9
(3) 吸湿性 .....	3	(1) 作用部位・作用機序 .....	9
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点 .....	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績 .....	9
(5) 酸塩基解離定数 .....	3	(3) 作用発現時間・持続時間 .....	10
(6) 分配係数 .....	3		
(7) その他の主な示性値 .....	3	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	
2. 有効成分の各種条件下における安定性 ...	3	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	11
3. 有効成分の確認試験法 .....	3	(1) 治療上有効な血中濃度 .....	11
4. 有効成分の定量法 .....	3	(2) 最高血中濃度到達時間 .....	11
		(3) 臨床試験で確認された血中濃度 .....	11
<b>IV. 製剤に関する項目</b>		(4) 中毒域 .....	11
1. 剤 形 .....	4	(5) 食事・併用薬の影響 .....	11
(1) 剤形の区別、規格及び性状 .....	4	(6) 母集団（ポピュレーション）解析により	
(2) 溶液及び溶解時のpH、浸透圧比、粘度、		判明した薬物体内動態変動要因 .....	11
比重、安定なpH域等 .....	4	2. 薬物速度論的パラメータ .....	11
(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無		(1) コンパートメントモデル .....	11
及び種類 .....	4	(2) 吸収速度定数 .....	11
2. 製剤の組成 .....	4	(3) バイオアベイラビリティ .....	11
(1) 有効成分（活性成分）の含量 .....	4	(4) 消失速度定数 .....	11
(2) 添加物 .....	4	(5) クリアランス .....	11
(3) 電解質の濃度 .....	5	(6) 分布容積 .....	12
(4) 添付溶解液の組成及び容量 .....	5	(7) 血漿蛋白結合率 .....	12
(5) その他 .....	5	3. 吸 収 .....	12
3. 注射剤の調整法 .....	5	4. 分 布 .....	12
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	5	(1) 血液－脳関門通過性 .....	12
5. 製剤の各種条件下における安定性 .....	5	(2) 血液－胎盤関門通過性 .....	12
6. 溶解後の安定性 .....	5		

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

# 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<sup>1)</sup>。  
0.5%・1%・2%塩酸メピバカイン注「NM」は、日本薬局方メピバカイン塩酸塩注射液として帝国化学産業株式会社（現ナガセ医薬品株式会社）が1998年2月に製造承認を取得した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、アミド型の局所麻酔剤である。
- (2) 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が、メピバカイン塩酸塩の重大な副作用として、ショック、意識障害、振戦、痙攣、異常感覚、知覚・運動障害が報告されている。

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

(1) 和 名 :

0.5%塩酸メピバカイン注「NM」、1%塩酸メピバカイン注「NM」  
2%塩酸メピバカイン注「NM」

(2) 洋 名 :

0.5%MEPIVACAINE HCl Inj. 「NM」、1%MEPIVACAINE HCl Inj. 「NM」  
2%MEPIVACAINE HCl Inj. 「NM」

(3) 名称の由来：日本薬局方の別名「塩酸メピバカイン」に由来する

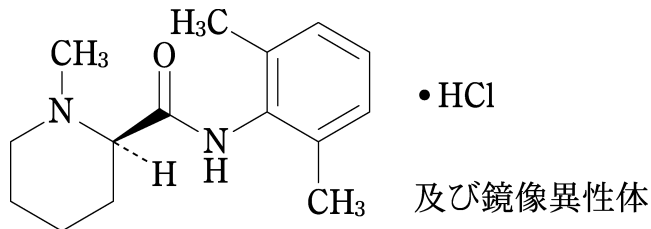
### 2. 一般名

(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)、Mepivacaine (INN)

(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：C<sub>15</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O・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 (日局)：塩酸メピバカイン

### 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

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	1mL以上	10mL未満	溶けやすい
酢酸 (100)	10mL以上	30mL未満	やや溶けやすい
エタノール (99.5)	30mL以上	100mL未満	やや溶けにくい

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点：約256°C (分解)

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa<sup>2)</sup>：7.86

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

旋光度：本品の水溶液 (1→10) は旋光性を示さない。

pH：4.0～5.0 (0.2→10)

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「メピバカイン塩酸塩」の確認試験法による。

#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方「メピバカイン塩酸塩」の定量法による。



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、規格及び性状

剤形：注射液  
規格：

販売名	規格
0.5%塩酸メピバカイン注「NM」	1mL 中 メピバカイン塩酸塩 5mg 含有
1% 塩酸メピバカイン注「NM」	1mL 中 メピバカイン塩酸塩 10mg 含有
2% 塩酸メピバカイン注「NM」	1mL 中 メピバカイン塩酸塩 20mg 含有

性状：無色澄明の注射液

#### (2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH：4.5～6.8

浸透圧比：

0.5%塩酸メピバカイン注「NM」；0.9～1.1（生理食塩液に対する比）

1% 塩酸メピバカイン注「NM」；1.0～1.2（生理食塩液に対する比）

2% 塩酸メピバカイン注「NM」；1.3～1.5（生理食塩液に対する比）

安定な pH 域<sup>3)</sup>：塩基性薬剤との配合は、メピバカインが析出することがあるので、注意を要する。

#### (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

販売名	1mL 中 メピバカイン塩酸塩含量
0.5%塩酸メピバカイン注「NM」	5mg
1% 塩酸メピバカイン注「NM」	10mg
2% 塩酸メピバカイン注「NM」	20mg

#### (2) 添加物

1mL 中   パラオキシ安息香酸メチル       : 1mg  
          塩化ナトリウム                 : 7.5mg  
          リン酸水素ナトリウム水和物   : 1mg  
          pH 調節剤                     : 適量

(3) 電解質の濃度

該当しない

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

特になし

3. 注射剤の調整法

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<sup>4)~9)</sup>

保存条件	包装形態	保存期間	結果
40℃ 75%RH	密封容器	6 ヶ月	いずれの試験項目も変化を認めなかった <sup>注1)</sup> 。
室温 40~80%RH	密封容器 箱入り	3 年	いずれの試験項目も規格に適合した <sup>注2)</sup> 。

注 1) 試験項目：性状、pH、浸透圧比、含量、保存剤含量

注 2) 試験項目：性状、pH、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）

pH 変動試験

各濃度の塩酸メピバカイン注「NM」を20mLとり、0.1N HClあるいは0.1N NaOHを0.1mLずつ加えて混合し、外観変化を観察した<sup>3)</sup>。試液の混合量は外観変化がない場合は等容量（20mL）まで、外観変化が生じた場合は変化点までとした。

濃度	試料 pH	0.1N HCl	最終 pH 又は 変化点 pH	移動 指数	変化 所見
		0.1N NaOH			
0.5%	6.23	20.0mL	1.39	4.84	—
	6.23	20.0mL	12.75	6.52	—
1%	6.09	20.0mL	1.38	4.71	—
	6.05	5.1mL	8.18	2.13	白濁
2%	6.36	20.0mL	1.39	4.97	—
	6.39	2.9mL	7.39	1.00	白濁

**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**

日本薬局方「メピバカイン塩酸塩注射液」の確認試験法に準ずる。

**10. 製剤中の有効成分の定量法**

日本薬局方「メピバカイン塩酸塩注射液」の定量法に準ずる。

**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. 治療上注意が必要な容器に関する情報**

該当資料なし

**14. その他**

該当しない

## 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、1回 500mg（0.5%の場合 100mL、1%の場合 50mL、2%の場合 25mL）である（mg 数はメピバカイン塩酸塩としての投与量、括弧内 mL 数は各濃度における注射液の投与量を示す）。

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。

種類 麻酔方法	0.5%注射液	1%注射液	2%注射液
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)
指趾神経遮断	20～40mg (4～8mL)	40～80mg (4～8mL)	80～160mg (4～8mL)
肋間神経遮断	25mg (5mL)	—	—
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

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (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

アミド型局所麻酔剤（ブピバカイン、プロピトカイン、リドカイン、ロピバカイン）

### 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：神経細胞膜のNa<sup>+</sup>チャネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制するという局所麻酔薬共通の作用により、知覚神経の求心性伝導を抑制する<sup>1)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

薬力学的同等性試験<sup>10)</sup>

##### 1) 浸潤麻酔作用

モルモット背部に0.5%・1.0%・2.0%メピバカイン塩酸塩注射液あるいは標準製剤を皮内投与し、麻酔作用持続時間を比較した。両剤の麻酔作用持続時間はほぼ同値を示し、有意な差は認められず、両製剤は生物学的に同等であると判断した。

浸潤麻酔作用持続時間（min、平均±標準誤差、n=9）

	メピバカイン塩酸塩濃度		
	0.5%	1.0%	2.0%
被験製剤	21.6±1.2	33.6±1.4	46.4±2.7
標準製剤	21.1±1.0	34.0±1.8	46.7±2.0

##### 2) 伝達麻酔作用

0.5%・1.0%・2.0%メピバカイン塩酸塩注射液あるいは標準製剤をラット坐骨神経に投与し、坐骨神経遮断作用の持続時間を比較した。両剤の麻酔作用持続時間はほぼ同値を示し、有意な差は認められず、両製剤は生物学的に同等であると判断した。

伝達麻酔作用持続時間（min、平均±標準誤差、n=10）

	メピバカイン塩酸塩濃度		
	0.5%	1.0%	2.0%
被験製剤	46.0±4.3	77.5±4.8	154.5±9.2
標準製剤	46.5±2.1	85.5±3.8	144.0±8.5

### 3) 脊椎麻酔作用

硬膜外麻酔作用を裏付ける薬理試験は動物実験では困難なため、脊椎麻酔で評価した。0.5%・1.0%・2.0%メピバカイン塩酸塩注射液あるいは標準製剤をラット脊椎内に投与し、麻酔作用持続時間を比較した。両剤の麻酔作用持続時間はほぼ同値を示し、有意な差は認められず、両製剤は生物学的に同等であると判断した。

脊椎麻酔作用持続時間 (min、平均±標準誤差、n=9)

	メピバカイン塩酸塩濃度		
	0.5%	1.0%	2.0%
被験製剤	10.1±0.8	19.9±1.1	28.7±2.0
標準製剤	10.3±0.7	20.3±1.5	29.8±1.0

### (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) 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

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

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（次の患者には投与しないこと）】			
項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
(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。]			
(4) 本剤の成分又はアミド型局所麻酔薬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）			
項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
(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（「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。麻酔中はさら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			

項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
<p>察を十分に行うこと。]</p> <p>(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りやすいので、患者の全身状態の観察を十分に行うこと。]</p>			
<p>(7) 高齢者（「高齢者への投与」及び「重要な基本的注意」の項参照）</p> <p>(8) 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。]（「重要な基本的注意」の項参照）</p> <p>(9) 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。]</p> <p>(10) 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。]</p>		○	○

## 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			
項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
<p>(1) まれに<b>ショック</b>あるいは<b>中毒症状</b>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<b>救急処置</b>のとれるよう、常時準備をしておくこと。なお、事前の<b>静脈路確保</b>が望ましい。</p> <p>(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、<b>ショック</b>あるいは<b>中毒症状</b>をできるだけ避けるために、次の諸点に留意すること。</p> <p>1) 患者の<b>全身状態の観察</b>を十分に行うこと。</p> <p>2) できるだけ<b>薄い濃度</b>のものを用いること。</p> <p>3) できるだけ<b>必要最小量</b>にとどめること。</p> <p>4) 必要に応じて<b>血管収縮剤</b>の併用を考慮すること。</p> <p>5) 注射の速度はできるだけ<b>遅く</b>すること。</p> <p>6) 注射針が、<b>血管</b>又は<b>くも膜下腔</b>に入っていないことを確かめること。</p>		○	○
<p>7) <b>試験的に注入</b>（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。</p> <p>8) 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、<b>麻酔範囲</b>に注意すること。</p>		○	—
<p>9) 血管の多い部位（頭部、顔面、扁桃等）に注射する場合には、<b>吸収が速い</b>ので、できるだけ少量を投与すること。</p>		—	○
<p>10) 前投薬や術中に投与した<b>鎮静薬</b>、<b>鎮痛薬</b>等による<b>呼吸抑制</b>が発現することがあるので、これらの薬剤を使用する</p>		○	○

項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
<p>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。</p> <p>(3) 注射針又はカテーテルが適切に位置していないなどにより、<b>神経障害</b>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。</p>			
<p>(4) 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。</p> <p>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。</p> <p>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。</p>		—	○
<p>(5) 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。</p>		○	○

## 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。

## (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。(「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

	頻度不明
1) <b>中枢神経</b> <sup>注)</sup>	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等
2) <b>消化器</b> <sup>注)</sup>	悪心・嘔吐等
3) <b>過敏症</b>	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

- 1) 本剤の成分又はアミド型局所麻酔薬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) 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。
- 3) 蕁麻疹等の皮膚症状、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

#### [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。

## 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

項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
(1) 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。]		○	○
(2) 妊産婦 1) 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など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。麻酔中はさらに増悪することがある。]（「慎重投与」の項参照）		○	—
2) 頸動脈ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。		—	○*

\*：伝達麻酔

## 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

#### 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。

#### 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。

#### 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

該当しない

### 15. その他の注意

#### その他の注意

- (1) ポルフィリン症の患者に投与した場合、急性腹症、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

#### 【取扱い上の注意】

1. 本剤は使用前にゴム栓をアルコール綿等で清拭すること。
2. 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には、使用後十分に水洗すること。



## 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

製 剤：0.5%・1%・2%塩酸メピバカイン注「NM」；劇薬、処方せん医薬品<sup>注)</sup>

有効成分：メピバカイン塩酸塩；劇薬

注) 医師等の処方せん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（安定性試験結果に基づく）

### 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

20mL×5バイアル、100mL×1バイアル

### 7. 容器の材質

無色透明のガラス瓶

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：カルボカイン注射液 0.5%・1%・2%

同 効 薬：塩酸リドカイン、ブピバカイン塩酸水和物、ロピバカイン塩酸塩水和物、  
レボブピバカイン塩酸塩

### 9. 国際誕生年月日

該当しない

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
0.5%塩酸メピバカイン注「NM」	1998年2月25日	21000AMZ00299000
1%塩酸メピバカイン注「NM」	1998年2月25日	21000AMZ00300000
2%塩酸メピバカイン注「NM」	1998年2月25日	21000AMZ00301000

11. 薬価基準収載年月日

1998年6月8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

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

製品名	HOT(9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
0.5%塩酸メピバカイン注「NM」	101667307	1214402A1013	640431026
1%塩酸メピバカイン注「NM」	101668007	1214402A2010	640431027
2%塩酸メピバカイン注「NM」	101669707	1214402A3016	640431028

17. 保険給付上の注意

該当しない

# XI. 文 献

---

## 1. 引用文献

- 1) 第十六改正日本薬局方解説書、廣川書店、C-4926
- 2) JPDI、日本薬局方 医薬品情報、日本薬剤師研修センター編、じほう、2006、p1899
- 3) ナガセ医薬品(株)：塩酸メピバカイン注「テイサン」の pH 変動試験結果 (NM0170)
- 4) ナガセ医薬品(株)：0.5%塩酸メピバカイン注「NM」の安定性試験 (NM0048)
- 5) ナガセ医薬品(株)：1%塩酸メピバカイン注「NM」の安定性試験 (NM0049)
- 6) ナガセ医薬品(株)：2%塩酸メピバカイン注「NM」の安定性試験 (NM0050)
- 7) ナガセ医薬品(株)：0.5%塩酸メピバカイン注「NM」の長期保存試験 (NM0261)
- 8) ナガセ医薬品(株)：1%塩酸メピバカイン注「NM」の長期保存試験 (NM0262)
- 9) ナガセ医薬品(株)：2%塩酸メピバカイン注「NM」の長期保存試験 (NM0263)
- 10) ナガセ医薬品(株)：塩酸メピバカイン注「テイサン」に関する薬効薬理試験 (NM0174)

## 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

妊婦に関する海外情報

メピバカイン塩酸塩製剤の妊婦への投与に関するFDAのカテゴリー分類は以下のとおりである。

FDA: Pregnancy Category C

<参考>分類の概要

FDA: Pregnancy Category

C: RISK CANNOT BE RULED OUT

Adequate, well-controlled human studies are lacking, and animal studies have shown a risk to the fetus or are lacking as well. There is a chance of fetal harm if the drug is administered during pregnancy, but the potential benefits may outweigh the potential risk.

なお、本剤の本邦における「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりである。

#### 【使用上の注意】「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」

項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
(1) 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。]		○	○
(2) 妊産婦 1) 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など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。麻酔中はさらに増悪することがある。]（「慎重投与」の項参照）		○	—
2) 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。		—	○*

\*:伝達麻酔

## XIII. 備 考

---

### 1. その他の関連資料

#### (1) JAN コード

製品名	JAN コード	
	20mL×5 バイアル	100mL×1 バイアル
0.5%塩酸メピバカイン注「NM」	4987114098108	4987114098009
1% 塩酸メピバカイン注「NM」	4987114098306	4987114098207
2% 塩酸メピバカイン注「NM」	4987114098504	4987114098405



---

**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