

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（1998年9月）に準拠して作成

抗葉酸代謝拮抗剤

処方箋医薬品

ロイコボリン[®] 注3mg

LEUCOVORIN[®] INJECTION 3mg

ホリナートカルシウム注射剤
（別名：ロイコボリンカルシウム注射剤）

剤形	水性注射剤
規格・含量	1アンプル（1mL）中 日局 ホリナートカルシウム3.24mg[ホリナート（ロイコボリン）として3.0mg]含有
一般名	和名：ホリナートカルシウム（JAN） 洋名：Calcium Folate（JAN）
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造・輸入承認年月日：2004年 7月22日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2005年 6月10日 発売年月日：2005年 6月10日
開発・製造・輸入・ 発売・提携・販売会社名	製造販売：ファイザー株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	TEL： FAX：

本IFは2010年10月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

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

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（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）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成 10 年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けと IF 記載要領が策定された。

2. IF とは

IF は「医療用医薬品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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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。しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報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。

3. IF の様式・作成・発行

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で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

4. IF の利用にあたって

IF 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。

MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤の特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全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」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の特徴及び有用性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	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	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 有効成分の規制区分	4
2. 物理化学的性質	4
3. 有効成分の各種条件下における安定性	4
4. 有効成分の確認試験法	5
5. 有効成分の定量法	5
IV. 製剤に関する項目	6
1. 剤形	6
2. 製剤の組成	6
3. 製剤の各種条件下における安定性	6
4. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
5. 製剤中の有効成分の定量法	7
6. 容器の材質	7
7. その他	7
V. 治療に関する項目	8
1. 効能又は効果	8
2. 用法及び用量	8
3. 臨床成績	8
VI. 薬効薬理に関する項目	10
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10
2. 薬理作用	10

VII. 薬物動態に関する項目	11
1. 血中濃度の推移・測定法	11
2. 薬物速度論的パラメータ	12
3. 吸収	12
4. 分布	12
5. 代謝	13
6. 排泄	14
7. 透析等による除去率	14
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	15
1. 警告内容とその理由	15
2. 禁忌内容とその理由	15
3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	15
4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	15
5. 慎重投与内容とその理由	15
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
7. 相互作用	15
8. 副作用	16
9. 高齢者への投与	16
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
11. 小児等への投与	17
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
13. 過量投与	17
14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	17
15. その他の注意	17
16. その他	18
IX. 非臨床試験に関する項目	19
1. 一般薬理	19
2. 毒性	19

X. 取扱い上の注意等に関する項目	20
1. 有効期間又は使用期限	20
2. 貯法・保存条件	20
3. 薬剤取扱い上の注意点	20
4. 承認条件	20
5. 包装	20
6. 同一成分・同効薬	20
7. 国際誕生年月日	20
8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号	20
9. 薬価基準収載年月日	20
10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	21
11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
12. 再審査期間	21
13. 長期投与の可否	21
14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	21
15. 保険給付上の注意	21
XI. 文献	22
1. 引用文献	22
2. その他の参考文献	22
XII. 参考資料	23
主な外国での発売状況	23
XIII. 備考	24
その他の関連資料	24

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロイコボリンは、1949年 *citrovorum factor* といわれる葉酸の誘導体として発見された。

国内においては、葉酸代謝拮抗剤であるメトトレキサートの毒性軽減を目的として、「筋注用ロイコボリン」の販売名称で、1963年に輸入承認を取得した。

その後、毒性量をはるかに上回る量のメトトレキサートを投与し、正常細胞のみを救援する「メトトレキサート・ロイコボリン救援療法」の承認に伴い、解毒剤としての承認を1984年に取得し、さらに Biochemical Modulation の1つである「メトトレキサート・フルオロウラシル交代療法」の承認に伴う解毒剤としての承認も1991年に取得した。

また、「CMF療法」、「関節リウマチ」、「M-VAC療法」におけるメトトレキサートの解毒剤として、それぞれ1996年、1999年、2004年に承認を取得した。

2005年6月に、従来の販売名である「筋注用ロイコボリン」を「ロイコボリン注3mg」と名称変更した。

2. 製品の特徴及び有用性

メトトレキサートの解毒剤として必須である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロイコボリン[®]注 3mg

(2) 洋名

LEUCOVORIN[®] INJECTION 3mg

(3) 名称の由来

一般名の別名であるロイコボリンカルシウムに由来する。

2. 一般名

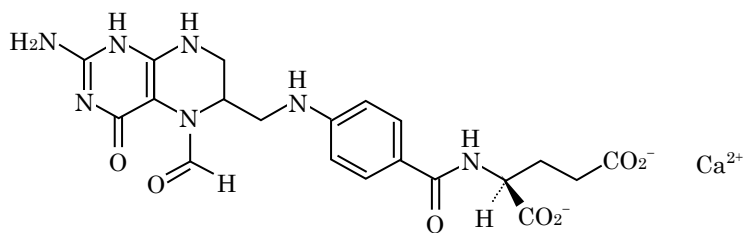
(1) 和名（命名法）

ホリナートカルシウム（JAN）

(2) 洋名（命名法）

Calcium Folate（JAN、INN）

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₀H₂₁CaN₇O₇

分子量：511.50

5. 化学名（命名法）

Monocalcium *N*-(4-[(2-amino-5-formyl-4-oxo-1,4,5,6,7,8-hexahydropteridin-6-yl)methylamino]benzoyl)-L-glutamate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

局方名：ホリナートカルシウム

別 名：ロイコボリンカルシウム、ホリン酸カルシウム

略 号：LV、CF

7. CAS 登録番号

1492-18-8 (Calcium Folate)

III. 有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分

処方箋医薬品

2. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～淡黄色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水にやや溶けにくく、メタノール又はエタノール（99.5）にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

240～250℃（分解）（ロイコボリン） [THE MERCK INDEX]

(5) 酸塩基解離定数

pKa=3.1、4.8、10.4（ロイコボリン） [THE MERCK INDEX]

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値¹⁾

UV : $\lambda_{\max}^{0.1N \text{ NaOH}} = 282\text{nm}$

旋光度 : $[\alpha]_D^{20} = +14.26^\circ$ (C=3.42) [THE MERCK INDEX]

3. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に変化する。 [第十五改正日本薬局方]

4. 有効成分の確認試験法

日局「ホリナートカルシウム」による。

5. 有効成分の定量法

日局「ホリナートカルシウム」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

1 アンプル (1mL) 中、ホリナート (ロイコボリン) 3mg に相当するホリナートカルシウム 3.24mg を含有する淡黄色澄明の水溶性注射液である。

(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 : 6.5~8.5 (3mg/mL 水溶液)

浸透圧比 : 約 0.1 (3mg/mL 水溶液、生理食塩液に対する比)

2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

1 アンプル (1mL) 中ホリナート (ロイコボリン) 3.0mg に相当する日局 ホリナートカルシウム 3.24mg 含有

(2) 添加物

パラオキシ安息香酸プロピル 0.2mg

パラオキシ安息香酸メチル 0.8mg

pH 調節剤

3. 製剤の各種条件下における安定性

保存条件 : 25°C/60%RH、褐色アンプル

試料 No	試験項目	開始時	6ヵ月	12ヵ月	18ヵ月	24ヵ月
1	性状・外観	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液
	pH	7.9	7.6	7.3	7.0	6.8
	含量 (%) *	110	106	103	98	99
2	性状・外観	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液
	pH	7.9	7.5	7.2	6.9	6.7
	含量 (%) *	110	107	100	103	99
3	性状・外観	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液	淡黄色澄明の液
	pH	7.8	7.5	7.2	6.9	6.7
	含量 (%) *	109	105	99	102	98

* : 対表示量

4. 製剤中の有効成分の確認試験法
赤外吸収スペクトル測定法

5. 製剤中の有効成分の定量法
液体クロマトグラフィー

6. 容器の材質
褐色のガラスアンプル

7. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

葉酸代謝拮抗剤の毒性軽減

2. 用法及び用量

◇メトトレキサート通常療法、CMF療法、メトトレキサート関節リウマチ療法又はM-VAC療法：

メトトレキサート通常療法、CMF療法、メトトレキサート関節リウマチ療法又はM-VAC療法でメトトレキサートによると思われる副作用が発現した場合には、通常、ロイコボリンとして成人1回6～12mgを6時間間隔で4回筋肉内注射する。

なお、メトトレキサートを過剰投与した場合には、投与したメトトレキサートと同量を投与する。

◇メトトレキサート・ロイコボリン救援療法：

通常、メトトレキサート投与終了3時間目よりロイコボリンとして1回15mgを3時間間隔で9回静脈内注射、以後6時間間隔で8回静脈内又は筋肉内注射する。

メトトレキサートによると思われる重篤な副作用があらわれた場合には、用量を増加し、投与期間を延長する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

◇メトトレキサート・フルオロウラシル交代療法：

通常、メトトレキサート投与後24時間目よりロイコボリンとして1回15mgを6時間間隔で2～6回（メトトレキサート投与後24、30、36、42、48、54時間目）静脈内又は筋肉内注射する。

メトトレキサートによると思われる重篤な副作用があらわれた場合には、用量を増加し、投与期間を延長する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

3. 臨床成績

(1) 臨床効果

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(3) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

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

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・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

葉酸

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序^{2, 3)}

ロイコボリンは、下記の機序により葉酸代謝拮抗剤であるメトトレキサートの毒性を軽減する。メトトレキサートは、2 水素葉酸を 4 水素葉酸に変換させる酵素である 2 水素葉酸還元酵素 (dihydrofolate reductase : DHFR) の働きを阻止し核酸合成を停止させる。一方、ロイコボリンはメトトレキサートが作用する酵素に関与せず、細胞の葉酸プールに取り込まれ、活性型葉酸 (5,10-methylene tetrahydrofolate 等) となり、細胞の核酸合成を再開させる。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

ビーグル犬に対し、メトトレキサート 100mg/kg (点滴静注) 単独投与及びメトトレキサート 100、300mg/kg (点滴静注) 投与後、3 時間目より一定量のロイコボリン (総量 255mg) (点滴静注) 投与した場合、単独投与群では、著しい嘔吐、下痢便、食思減退、体重減少等があらわれ、5 あるいは 6 日めに全例死亡した。また、ロイコボリン投与群では、単独投与群と同様の症状が認められたが、約 1 週間後より回復した。

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

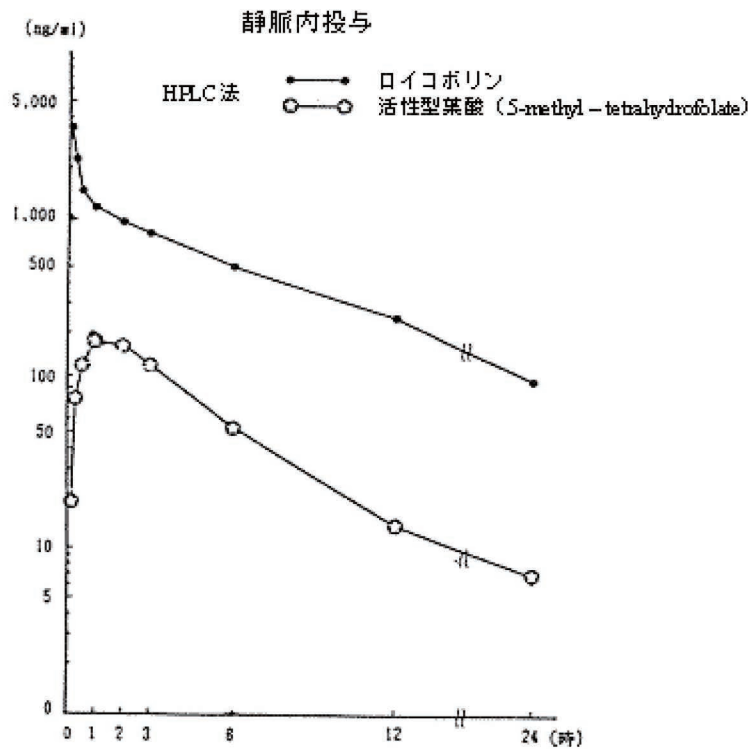
該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間⁴⁾

投与 5 分後 (詳細はVII-1- (3) 参照)

(3) 通常用量での血中濃度⁴⁾

健康成人にロイコボリン注 5 管 (15mg) を静脈内投与した時の血清中ロイコボリン濃度は投与 5 分後に最高値 (3,548ng/mL) に達し、半減期は 5 時間である。また、活性型葉酸 (5-methyl tetrahydrofolate) は、1 時間後に最高値 (177ng/mL) となり、半減期は 2.5 時間である。



ロイコボリンの静脈内投与の未変化体及び代謝物の血清中濃度推移

(4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 吸収速度定数

該当資料なし

(2) バイオアベイラビリティ

AUC

ロイコボリン 10085.6ng・時間/mL

活性型葉酸 1032.4ng・時間/mL

C_{max}

ロイコボリン 3548.0ng/mL

活性型葉酸 177.8ng/mL

(3) 消失速度定数⁵⁾

200mg を静注したとき 0.125hr⁻¹ (外国データ)

(4) クリアランス⁵⁾

200mg を静注したとき 76.14mL/min (外国データ)

(5) 分布容積⁵⁾

200mg を静注したとき 34.8liters (外国データ)

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当しない

4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

メトトレキサート・ロイコボリン救援療法 (MTX : 8g/m²、LV : 24 時間後 10mg 経口投与) を 4 回行った患者で、72 時間後の脳脊髄液中にロイコボリンとしてはほとんど検出されないが、5-methyl tetrahydrofolate としては 25.5ng/mL である。⁶⁾ (外国データ)

(2) 胎児への移行性

該当資料なし

(3) 乳汁中への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

VII-4- (1) 参照

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

<参考ーラット静脈内投与>

ラットに 10mg/kg の ^3H -*I*-LV を単回静脈内投与したとき、投与 5 分後の組織中放射能濃度は腎臓>膀胱>血漿>血液>肺>胃>大腸の順に高い分布を示し、投与 96 時間後では、ほとんどの組織で $1\mu\text{g}$ (*I*-LV 換算) /g 以下であった。

<参考ーウサギ筋肉内投与>

ウサギにロイコボリンを 0.1mg/kg を 4 日間筋肉内投与したとき、48 時間後の各臓器内の 1-5-CHO-FH₄濃度は、下表の通りである。⁷⁾

各臓器	総 1-5-CHO-FH ₄ 含有量 (ng/g)	
	投与群	非投与群
肝臓	8198.8	6035.7
脾臓	335.5	198.5
腎臓	1634.2	1014.0
リンパ腺	830.0	390.0
骨髄	55.3	46.7

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

血清中代謝物質及び尿中代謝物質として以下の物質が確認された。⁸⁾ (外国データ)

- 5-methyl tetrahydrofolate
- 5,10-methylene tetrahydrofolate
- p*-aminobenzoylglutamic acid
- 5,10-methenyl tetrahydrofolate
- 10-formyl tetrahydrofolate

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

該当しない

(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

あり

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

投与後 3 時間以内に投与されたロイコボリンの 2/3 が 5-methyl tetrahydrofolate に代謝され、3 時間を過ぎるとほとんどすべてが代謝物となる。

6. 排泄

(1) 排泄部位

該当資料なし

(2) 排泄率

[³H]-[¹⁴C]-1-CHO-FH₄ を 5 μg/kg をヒトに静脈内投与した時の投与後 24 時間までの累積尿中排泄率は、[³H]放射能で約 8%、[¹⁴C]放射能で約 10%である。⁸⁾ (外国データ)

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

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

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分に対し重篤な過敏症の既往歴のある患者

3. 効能・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・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

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

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
葉酸代謝拮抗剤（スルファメトキサゾール・トリメトプリム等）	これらの薬剤の作用が減弱することがある。	本剤によって葉酸代謝拮抗作用が減弱するためと考えられる。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤のみで副作用発現頻度が明確となる調査は実施していない。

1) 重大な副作用と初期症状

ショック、アナフィラキシー様症状（頻度不明）

ショック、アナフィラキシー様症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発疹、呼吸困難、血圧低下等の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。

2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
過 敏 症 ^{注)}	発疹、発熱、発赤
投 与 部 位	血管痛（静脈内注射時）、一過性の疼痛（筋肉内注射時）

注) 投与を中止すること。

(2) 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

(3) 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

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

9. 高齢者への投与

該当しない

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

該当しない

11. 小児等への投与

[(14. 適用上及び薬剤交付時の注意 (4) 筋肉内注射時) 参照]

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上及び薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)

- (1) 本剤は髄腔内投与しないこと。
- (2) メトトレキサートの過量投与時は、すみやかに本剤を投与すること。メトトレキサートと本剤の投与間隔が長いほど、本剤の効果が低下することがある。
- (3) **メトトレキサート・フルオロウラシル交代療法**
メトトレキサート・フルオロウラシル交代療法における本剤の投与回数は2~6回であるが、投与回数の目安は次のとおりである。
腎機能の低下傾向などによるメトトレキサートの排泄遅延のおそれのある患者、又は一般状態の悪い患者 (特に低栄養状態) では、投与回数を多くすることが望ましい (6回)。一般状態が良好で、かつ腎機能が正常な患者では、投与回数を少なくすることができる。
- (4) **筋肉内注射時**
筋肉内注射にあたっては、組織・神経などへの影響を避けるため下記の点に注意すること。
 - 1) 筋肉内注射はやむを得ない場合にのみ、必要最小限に行うこと。
なお、特に同一部位への反復注射は行わないこと。
また、新生児、低出生体重児、乳児、小児には特に注意すること。
 - 2) 神経走行部位を避けるよう注意すること。
 - 3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。
- (5) **使用時**
本品はワンポイントカットアンプルであるが、アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭し、カットすることが望ましい。

15. その他の注意

葉酸の投与により、ビタミン B₁₂ 欠乏による巨赤芽球性貧血 (悪性貧血等) が隠蔽されるとの報告がある。

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理

該当資料なし

2. 毒性

(1) 単回投与毒性試験

(LD₅₀, mg/kg)

動物 性	マウス	ラット
	♂	♂
投与経路		
経口	>7000	>8000
静脈内	731.7	—
腹腔内	1036	1063

(2) 反復投与毒性試験

亜急性毒性

ホリナートカルシウムの 10、20mg/kg/日をラットに 28 日間腹腔内投与した実験では、本剤によると思われる毒性所見は観察されていない。

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

局所毒性

ホリナートカルシウムの 3、10、50mg/mL を 0.2mL ウサギの背部筋に注射し 40 時間後に注射部位の筋肉を観察した実験では、全群何らかの筋肉の壊死部が認められ、高濃度ほど病変部が大きい。

X. 取扱い上の注意等に関する項目

1. 有効期間又は使用期限

使用期限：2年（最終年月を外箱等に記載）

表示の使用期限内に使用すること。（使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。）

2. 貯法・保存条件

遮光保存、室温保存

3. 薬剤取扱い上の注意点

処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること

4. 承認条件

該当しない

5. 包装

〔アンプル〕（3mg/mL）1mL×10

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ロイコボリン錠 5mg、ロイコボリン錠 25mg

7. 国際誕生年月日

1952年6月

8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号

品名	承認年月日	承認番号
ロイコボリン注3mg （筋注用ロイコボリン： 2006年3月31日 経過措置期間終了）	2004年7月22日 （1963年1月11日）	21600AMY00097 （13800AZY00017）

() 内は旧販売名

9. 薬価基準収載年月日

2005年6月10日（旧販売名：1965年11月1日）

10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

用法・用量追加	1984年2月15日	(メトトレキサート・ロイコボリン救援療法)
	1991年10月4日	(メトトレキサート・フルオロウラシル交代療法)
	1996年8月2日	(CMF療法)
	1999年3月12日	(メトトレキサート慢性関節リウマチ療法)
	2004年1月30日	(M-VAC療法)

11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果	1989年12月20日	(メトトレキサート・ロイコボリン救援療法)
再評価結果	1975年12月26日	

12. 再審査期間

該当しない

13. 長期投与の可否

本剤は、厚生労働省告示第107号(平成18年3月6日付)による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

3929403A1034

15. 保険給付上の注意

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) Temple, C. Jr. et al. : J Med Chem 22 (6) : 731, 1979 [L70010000021]
- 2) Goldman, I. D. : Cancer Treatment Reports 65 (Suppl. 1) : 13, 1981 [L70010000015]
- 3) 田口 博國 : 臨床血液 22 (11) : 1687, 1981 [L70010000130]
- 4) 社内資料 : ロイコボリン注 3mg 血清中濃度 [L70010000053]
- 5) McGuire, B. W. et al. : NCI Monogr 5 : 47, 1987 [L70010000034]
- 6) Allen, J. et al. : J Neurooncol 1 (1) : 39, 1983 [L70010000022]
- 7) 角田 沖介 : 内科宝函 4 (11) : 992, 1957 [L70010000116]
- 8) Nixon, P. F. et al. : N Engl J Med 286 (4) : 175, 1972 [L70010000033]

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

主な外国での発売状況

XIII. 備考

その他の関連資料

なし

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

ファイザー株式会社
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7

