

## 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

消化器機能調整剤

**塩酸メトクロプラミド注射液10mg「タカタ」**

メトクロプラミド注射液

METOCLOPRAMIDE HYDROCHLORIDE

剤形	水性注射剤
製剤の規制区分	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	1管(2mL)中塩酸メトクロプラミド 10mg を含有
一般名	和名：塩酸メトクロプラミド(JAN) 洋名：Metoclopramide Hydrochloride (JAN)
製造販売承認年月日	2018年1月25日(販売名変更による)
薬価基準収載	2018年6月15日(販売名変更による)
発売年月日	1971年4月1日(旧販売名)
開発・製造販売(輸入)・提携販売会社名	製造販売元:高田製薬株式会社
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社 学術部TEL:0120-989-813 FAX:048-816-4183 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.takata-seiyaku.co.jp">https://www.takata-seiyaku.co.jp</a>

本IFは2018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、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://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 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。
- 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 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 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 の利用にあたっては、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。（2008 年 9 月）

## 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>16</b>
1. 開発の経緯 .....	1	1. 警告内容とその理由 .....	16
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	16
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
1. 販売名 .....	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
2. 一般名 .....	2	5. 慎重投与内容とその理由 .....	16
3. 構造式又は示性式.....	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	16
4. 分子式及び分子量.....	2	7. 相互作用 .....	17
5. 化学名（命名法） .....	2	8. 副作用.....	18
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	2	9. 高齢者への投与 .....	19
7. CAS 登録番号 .....	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 .....	19
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	11. 小児等への投与 .....	19
1. 物理化学的性質 .....	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4	13. 過量投与.....	19
3. 有効成分の確認試験法 .....	4	14. 適用上の注意.....	20
4. 有効成分の定量法.....	4	15. その他の注意.....	20
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>	16. その他.....	20
1. 剤形 .....	5	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>21</b>
2. 製剤の組成 .....	5	1. 薬理試験 .....	21
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	5	2. 毒性試験 .....	21
4. 製剤の各種条件下における安定性.....	6	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>22</b>
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	6	1. 規制区分 .....	22
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化） .....	7	2. 有効期間又は使用期限.....	22
7. 溶出性 .....	7	3. 貯法・保存条件 .....	22
8. 生物学的試験法 .....	7	4. 薬剤取扱い上の注意点.....	22
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	7	5. 承認条件.....	22
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	7	6. 包装 .....	22
11. 力価 .....	8	7. 容器の材質 .....	22
12. 混入する可能性のある夾雑物.....	8	8. 同一成分・同効薬.....	22
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 .....	8	9. 国際誕生年月日 .....	22
14. その他 .....	8	10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	23
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>9</b>	11. 薬価基準収載年月日 .....	23
1. 効能又は効果.....	9	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. 用法及び用量.....	9	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	24
3. 臨床成績 .....	9	14. 再審査期間 .....	24
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>11</b>	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	24
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群.....	11	16. 各種コード .....	24
2. 薬理作用 .....	11	17. 保険給付上の注意 .....	24
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>13</b>	<b>XI. 文献</b> .....	<b>25</b>
1. 血中濃度の推移・測定法.....	13	1. 引用文献.....	25
2. 薬物速度論的パラメータ .....	13	2. その他の参考文献.....	25
3. 吸収 .....	14	<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>26</b>
4. 分布 .....	14	1. 主な外国での発売状況.....	26
5. 代謝 .....	14	2. 海外における臨床支援情報 .....	26
6. 排泄 .....	14	<b>XIII 備考</b> .....	<b>27</b>
7. 透析等による除去率.....	15	1. その他の関連資料.....	27

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

メクロプラミドは、フランスにおいて開発された制吐作用を有する薬剤である。本邦では 1965 年に発売されている。

エリーテン注 10mg/2mL は、このメクロプラミドの二塩酸塩一水和物を原薬とする消化器機能調整剤で、日本化薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、1971 年 1 月に承認を得て、同年 4 月に発売に至った。

1984 年 6 月 1 日に再評価結果が公表され、その結果効能・効果並びに用法・用量が変更となった。

その後、2000 年 9 月 19 日付医薬発第 935 号厚生省医薬安全局長(当時)通知「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」に基づき販売名に含量の表示を含めることとし、2008 年 3 月 14 日にエリーテン注 10mg/2mL として承認された。

2011 年 7 月に製造販売承認が日本化薬株式会社から高田製薬株式会社に承継された。

なお、医療事故防止対策に基づき、販売名をエリーテン注 10mg/2mL から塩酸メクロプラミド注射液 10mg「タカタ」に変更し、2018 年 1 月 25 日に承認を得た。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 脳幹の消化機能を調整する部位に選択的に作用して胃の運動を亢進し、中枢性嘔吐、末梢性嘔吐の両者を抑制する<sup>1)</sup>。
- (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。  
メクロプラミドとしての重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー様症状、悪性症候群 (Syndrome malin)、意識障害、痙攣、遅発性ジスキネジアが報告されている。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

(1) 和名

塩酸メクロプラミド注射液10mg「タカタ」

(2) 洋名

METOCLOPRAMIDE HYDROCHLORIDE Injection 10mg “TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

### 2. 一般名

(1) 和名（命名法）

塩酸メクロプラミド(JAN)

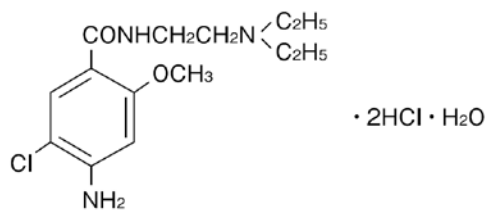
(2) 洋名（命名法）

Metoclopramide Hydrochloride (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>14</sub>H<sub>22</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub> · 2HCl · H<sub>2</sub>O

分子量: 390.73

### 5. 化学名（命名法）

4-Amino-5-chloro-N-(2-diethylaminoethyl)-2-methoxybenzamide  
dihydrochloride monohydrate (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

## 7. CAS 登録番号

5581-45-3

(メトクロプラミド : 364-62-5)

### 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～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかにアミン臭があり、味は極めて苦い。

##### (2) 溶解性

水、メタノール又はエタノール(95)に溶けやすく、アセトンに溶けにくく、クロロホルムに極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

水溶液(1→10)のpHは約1である。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

##### (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

pH：約1(1→10の水溶液)

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

熱または光に不安定であり、水溶液は酸性では安定であるが、アルカリ性では不安定である。

#### 3. 有効成分の確認試験法

(1)  $\beta$ -ナフトールをカップリング試薬とするジアゾ反応

(2) 紫外外部吸収スペクトル(0.1N塩酸溶液、1→100,000)

極大吸収波長：272～277nm、307～312nm

極小吸収波長：249～254nm、289～294nm

(3) 水溶液をアルカリ性とし、クロロホルム抽出して得た遊離塩基の融点測定

(4) 日局一般試験法、塩化物の定性反応

#### 4. 有効成分の定量法

定量法：過塩素酸による電位差滴定法



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、規格及び性状

表IV-1 組成・性状

品名	塩酸メクロプラミド注射液 10mg「タカタ」
成分・分量	1 管(2mL)中 塩酸メクロプラミド 10mg
添加物	塩化ナトリウム、クエン酸ナトリウム水和物
性状	無色澄明の水性注射液
pH	4.5～5.5
浸透圧比 (生理食塩水に対する比)	約 1
注射剤の容器中の特殊な気体の 有無及び種類	窒素

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

上記「表IV-1 組成・性状」参照

#### (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

上記「表IV-1 組成・性状」参照

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

上記「表IV-1 組成・性状」参照

#### (2) 添加物

上記「表IV-1 組成・性状」参照

#### (3) その他

該当資料なし

### 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

##### (1) 長期保存試験 (25°C、60%RH、48 ヶ月)<sup>2)</sup>

本剤は最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、通常の市場流通下において 4 年間安定であることが確認された。

性状、pH、含量の測定結果

(3 ロットの平均値)

	開始時	48 箇月
性状	無色澄明な液で、にがい味がある	変化なし
pH	4.8	4.8
含量(%)	100.9	100.6

##### (2) アンプルでの光安定性試験

3 箇月後まで大きな変化は認められなかった。

光(1000 lx)、室温(15~30°C)

測定項目	開始時	1箇月後	2箇月後	3箇月後
外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	4.9	4.9	4.9	4.9
含量 (%)	99.9	100.2	100.4	100.3

##### (3) 生理食塩水またはブドウ糖液に配合後の光安定性試験

生理食塩水との配合は 48 時間後まで大きな変化は認められなかった。一方、ブドウ糖液との配合は、外観と pH は変化がなかったが、含量(残存率)は低下した。

光(1000 lx)、室温(15~30°C)

配合薬剤	測定項目	配合直後	8時間後	24時間後	48時間後
生理食塩液 (大塚生食注)	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
	pH	4.9	4.9	4.9	4.9
	含量(残存率) (%)	100.0	101.0	101.0	100.7
ブドウ糖液 (大塚糖液 5%)	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
	pH	5.2	5.3	5.2	5.1
	含量(残存率) (%)	100.0	97.6	96.1	91.8

※配合直後の定量値を 100.0%とし、残存率を算出した。

#### 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）

塩酸メクロプラミド注射液 10mg「タカタ」 pH5.6

分類	配合剤	容量	配合前 pH	配合後 pH	備考
中枢神経系用剤	ノバミン筋注 5 mg		5.86	5.70	
	ピーゼットシー筋注 2 mg		5.2	5.5	
	フェノバル注射液 100 mg			—	白沈
糖類及び輸液	20% フルクトン注	20mL	3.90	5.21	
	ブドウ糖注 20%	20mL	3.90	5.32	
	マンニトール注射液	20mL	6.72	6.09	
	キシリトール注射液	20mL	5.3	5.5	
	強力ネオミノファーゲンシー静注		5.8	5.3	
血液代用剤	リンゲル液		4.9	5.4	
抗生物質	エリスロシン点滴静注用 500mg		9.56		白沈
その他	アドナ注（静脈用） 25 mg		4.8	5.3	
	ブスコパン注 20 mg		4.5	5.3	
	ネオラミン・スリービー液（静注用）		4.00	4.70	
	タチオン注射用		5.70	5.58	
	ソル・コーテフ注射用 100 mg		6.8	5.6	

注) 容量の記載のないものは常用量

配合 24 時間後の pH はいずれも配合後の pH と同じ

## 7. 溶出性

該当しない

## 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<sup>3)</sup>

本品の表示量に従い「塩酸メクロプラミド」0.025g に対応する容量をとり、4-ジメチルアミノベンズアルデヒド試液1mL を加えるとき、液は黄色を呈する。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法<sup>3)</sup>

本品の表示量に従い塩酸メクロプラミド ( $C_{14}H_{22}ClN_3O_2 \cdot 2HCl \cdot H_2O$ ) 約 0.025g に対応する容量を正確に量り、内標準溶液 20mL を正確に加えた後、メタノールを加えて 100mL とし、試料溶液とする。別にメクロプラミド標準品を 105°C で 3 時間乾燥し、その約 0.1g を精密に量り、1mol/L 塩酸試液 5mL 及び水を加えて溶かし、正確に 25mL とする。この液 5mL を正確に量り、内標準溶液 20mL を正確に加えた後、メタノールを加えて 100mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 5  $\mu$ L につき、次の条件で液体クロマトグラフ法により試験を行い、内標準物質のピーク面積に対するメクロプラミドのピーク面積の比  $Q_1$  及び  $Q_2$  を求める。

塩酸メクロプラミド ( $C_{14}H_{22}ClN_3O_2 \cdot 2HCl \cdot H_2O$ ) の量 (mg)

$$= \text{メクロプラミドの標準品の量 (mg)} \times \frac{Q_T}{Q_S} \times 0.2 \times 1.3033$$

1.3033 : メクロプラミドを塩酸メクロプラミドに換算する係数

内標準溶液  $\beta$ -ナフチルメチルエーテルのメタノール溶液 (3→1000)

操作条件

検出器 : 紫外吸光光度計 (測定波長: 280nm)

カラム : 内径約 4mm、長さ約 15cm のステンレス管に 10  $\mu$ m の液体クロマトグラフ用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度 : 25°C 付近の一定温度

移動相 : ラウリル硫酸ナトリウム 0.79g を水 550mL 及びアセトニトリル 450mL に溶かし、氷酢酸 0.3mL を加える。

流量 : メクロプラミドの保持時間が約 5 分になるように調整する。

カラムの選定 : 標準溶液 5  $\mu$ L につき、上記の条件で操作するとき、メクロプラミド、内標準物質の順に溶出し、その分離度が 5 以上のものを用いる。

## 11. 力価

本剤は力価表示に該当しない。

## 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

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

次の場合における消化器機能異常(悪心・嘔吐・食欲不振・腹部膨満感)

胃炎、胃・十二指腸潰瘍、胆嚢・胆道疾患、腎炎、尿毒症、乳幼児嘔吐、薬剤(制癌剤・抗生物質・抗結核剤・麻酔剤)投与時、胃内・気管内挿管時、放射線照射時、開腹術後  
X線検査時のバリウムの通過促進

### 2. 用法及び用量

メクロプラミドとして、通常成人 1 回 7.67mg(塩酸メクロプラミドとして 10mg、本剤 1 管)を 1 日 1~2 回筋肉内又は静脈内に注射する。

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

ベンズアミド系

### 2. 薬理作用

消化管の運動調節作用と制吐作用を有している。胃腸管においては、上部消化管の平滑筋の運動を増強し、胃の幽門部の異常な緊張を緩解することによって、胃内容物の排出及び十二指腸内容物の移送を促進する。また、延髄最後野にある化学受容体引き金帯(CTZ)のドパミン D<sub>2</sub>受容体を遮断してドパミン作用を抑制することにより制吐作用を示す。本剤は中枢性嘔吐、末梢性嘔吐のいずれに対しても抑制作用を示す。

#### (1) 作用部位・作用機序

作用機序:ドパミン受容体拮抗作用、5-HT<sub>4</sub>受容体作動性、迷走神経および中枢 5-HT<sub>3</sub>受容体拮抗作用を有する。下部食道括約筋緊張度および幽門部や小腸の収縮促進作用を示す。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績<sup>4)</sup>

##### 1) 消化管運動亢進作用 (ビーグル犬)

メクロプラミド 5mg/kg 静注により、胃運動の著明な亢進と、十二指腸の間歇的収縮が認められた。しかしイヌによっては、胃運動は亢進するが、十二指腸内圧が低下するものがあった。胃運動の亢進と十二指腸の間歇的収縮あるいは内圧低下は、ともに胃内容物の排出を容易にするものと推察される。作用時間は比較的長く、1回の静脈注射で数十分持続する。

##### 2) 呼吸・血圧に対する作用 (ビーグル犬)

胃運動を著明に亢進させる用量(5mg/kg)を静脈内に急速に注入した場合は、頻脈を伴った軽度の一過性の血圧低下がみられる。しかしゆっくり注入した場合は、ほとんど血圧は変動を示さない。その際心拍数の軽度の増加がみられるが、心電図上には変化が認められない。

##### 3) 胃液分泌に対する作用

###### ① 胃内灌流法(ラット)

合成ヒトガストリン I (Synthetic Human Gastrin I, SHG-I) 1 μg/kg 静注で著明な分泌促進(灌流 pH の低下)が起こるが、メクロプラミドでは 10mg/kg を投与してもそれ自身ではほとんど作用を示さず、また SHG-I の作用にも影響を与えない。

###### ② Shay rat 法(ラット)

メクロプラミド 15mg/kg 筋肉内注射で胃液分泌量、酸排出量はわずかに増大するが、有意差は認められない。メクロプラミドは消化管運動を亢進させる用量では胃液分泌に影響を与えない。

##### 4) 胃内容物排出促進作用 (ラット)

メクロプラミド 20mg/kg 筋肉内注射で吸着樹脂の胃内残存率は極めて著明に低下する。これによりメクロプラミドは消化管運動を亢進させ、胃内容物排出を促進することが明らかである。

#### 5) 摘出消化管に対する作用（ラット及びモルモット）

摘出胃及び腸管のアセチルコリン  $10^{-7}$ ～ $10^{-5}$ g/mL による収縮は、メクロプラミド  $10^{-5}$ g/mL により、胃では増強され、腸では抑制される。メクロプラミドの摘出腸管弛緩作用は、ヒスタミン、セロトニンに対してもみられ非特異的作用と考えられるが、胃の収縮増強作用はヒスタミン、セロトニンの場合は認められなかった。

#### (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

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度(生物学的同等性試験)

承認申請時において生物学的同等性資料を必要とせず実施していない。

(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**

(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（原則禁忌を含む）

#### 【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 褐色細胞腫の疑いのある患者[急激な昇圧発作を起こすおそれがある。]
- (3) 消化管に出血、穿孔又は器質的閉塞のある患者  
[本剤には消化管運動の亢進作用があるため、症状を悪化させるおそれがある。]

### 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) 小児 [「11. 小児等への投与」の項参照]
- (2) 高齢者 [「9. 高齢者への投与」の項参照]
- (3) 腎障害のある患者 [高い血中濃度が持続するおそれがある。]
- (4) 脱水・栄養不良状態等を伴う身体的疲弊のある患者  
[悪性症候群(Syndrome malin)が起りやすい。]

### 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) 本剤の投与により、内分泌機能異常(プロラクチン値上昇)、錐体外路症状等の副作用があらわれることがあるので、本剤の投与に際しては、有効性と安全性を十分考慮のうえ投与すること。
- (2) 眠気、めまいがあらわれることがあるので、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に注意すること。

(3) 制吐作用を有するため、他の薬剤に基づく中毒、腸閉塞、脳腫瘍等による嘔吐症状を不顕性化することがあるので注意すること。

## 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
フェノチアジン系薬剤 プロクロルペラジン、 クロルプロマジン、 チエチルペラジン等 ブチロフェノン系薬剤 ハロペリドール等 ラウオルフィアルカロイド薬剤 レセルピン等 ベンザミド系薬剤 スルピリド、 チアプリド等	内分泌機能異常、錐体外 路症状が発現しやすくな る。	本剤及びこれらの薬剤は 抗ドパミン作用を有する ため、併用により抗ドパ ミン作用が強くあらわれ る。
ジギタリス剤 ジゴキシン、 ジギトキシン等	ジギタリス剤飽和時の指 標となる悪心・嘔吐、食 欲不振症状を不顕性化す るおそれがある。	本剤の制吐作用による。
カルバマゼピン	カルバマゼピンの中毒症 状（眠気、悪心・嘔吐、 眩暈等）があらわれるこ とがある。	機序不明
抗コリン剤 アトロピン硫酸塩水和物、 ブチルスコパラミン臭化物等	相互に消化管における作 用を減弱するおそれがあ る。	本剤は消化管運動を亢進 するため、抗コリン剤の 消化管運動抑制作用と拮 抗する。

## 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(頻度不明)と初期症状

- 1) **ショック、アナフィラキシー様症状** ショック、アナフィラキシー様症状(呼吸困難、喉頭浮腫、蕁麻疹等)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) **悪性症候群(Syndrome malin)** 悪性症候群があらわれることがあるので、無動緘黙、強度の筋強剛、嚥下困難、頻脈、血圧の変動、発汗等が発現し、それに引き続き発熱がみられる場合は、投与を中止し、体冷却、水分補給等の全身管理とともに適切な処置を行うこと。本症発症時には、白血球の増加や血清CK(CPK)の上昇がみられることが多く、また、ミオグロビン尿を伴う腎機能の低下がみられることがある。なお、高熱が持続し、意識障害、呼吸困難、循環虚脱、脱水症状、急性腎不全へと移行し、死亡した例が報告されている。
- 3) **意識障害** 意識障害があらわれることがある。このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) **痙攣** 痙攣があらわれることがある。このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 5) **遅発性ジスキネジア** 長期投与により、口周部等の不随意運動があらわれ、投与中止後も持続することがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。

### (3) その他の副作用

	頻度不明
錐体外路症状 <sup>注1)</sup>	手指振戦、筋硬直、頸・顔部の攣縮、眼球回転発作、焦躁感
内分泌 <sup>注2)</sup>	無月経、乳汁分泌、女性型乳房
消化器	胃の緊張増加、腹痛、下痢、便秘
循環器	血圧降下、頻脈、不整脈
精神神経系	眠気、頭痛、頭重、興奮、不安
過敏症 <sup>注3)</sup>	発疹、浮腫
その他	めまい、けん怠感

注1) 症状があらわれた場合には、投与を中止すること。なお、これらの症状が強い場合には、抗パーキンソン剤の投与等適切な処置を行うこと。(太字)

注2) 観察を十分に行い、異常が認められた場合には直ちに投与を中止すること。(太字)

注3) 症状があらわれた場合には投与を中止すること。(太字)

### (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」に以下の記載あり。

**【禁忌】(次の患者には投与しないこと)**

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

「VIII. 8. (3)その他の副作用」に以下の記載あり。

発疹、浮腫 : 症状があらわれた場合には投与を中止すること。

## 9. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、副作用(錐体外路症状等)の発現に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。

## 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (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) 授乳婦 : 授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。[母乳中に移行することが報告されている。]

## 11. 小児等への投与

錐体外路症状が発現しやすいため、過量投与にならないよう注意すること。特に脱水状態、発熱時等には注意すること。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 13. 過量投与

**症状** : 錐体外路症状、意識障害(昏睡)等があらわれることがある。また外国において、本剤の大量投与によりメヘモグロビン血症があらわれたとの報告がある。

**処置** : 対症療法及び維持療法を行う。錐体外路症状に対しては、抗パーキンソン剤等を投与する。

## 14. 適用上の注意

- (1) **筋肉内注射時**：筋肉内注射にあたっては、下記の点に注意すること。
  - 1) 筋肉内投与はやむを得ない場合にのみ、必要最小限に行うこと。同一部位への反復注射は行わないこと。特に、新生児、未熟児、乳児、小児には注意すること。
  - 2) 神経走行部位を避けること。
  - 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には、直ちに針を抜き部位をかえて注射すること。
  - 4) 注射部位に疼痛、硬結をみることがある。
- (2) **アンプルカット時**：ワンポイントアンプルなのでマークを上にして下方へ折ること。なお、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。
- (3) **他剤との配合**：本剤はアルカリ性注射液と混合すると混濁を生じることがあるので配合しないこと。

## 15. その他の注意

該当しない

## 16. その他

特になし



## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

該当資料なし

(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：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：塩酸メクロプラミド 劇薬

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：4年

（「IV. 製剤に関する項目 3.製剤の各種条件下における安定性」参照）

### 3. 貯法・保存条件

遮光し、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

(2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)

（「VIII. 安全性(使用上の注意等)」に関する項目 14. 適用上の注意」参照）

### 5. 承認条件

該当しない

### 6. 包装

2mL×10管（ガラスアンプル）

2mL×50管（ガラスアンプル）

### 7. 容器の材質

褐色ガラス

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：プリンペラン注射液 10mg、テルペラン注射液 10mg ほか

同 効 薬：ドンペリドン

### 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

販売名	塩酸メトロプロラミド注射液 10mg「タカタ」
製造販売承認年月日	2018年1月25日
承認番号	23000AMX00126

(参考) エリーテン注として1971年1月14日承認、承認番号(46AM)第166号

旧販売名:エリーテン注 10mg/2mL 製造販売承認年月日:2008年3月14日

## 11. 薬価基準収載年月日

[注]旧販売名エリーテン注 10mg/2mL:2008年6月20日

塩酸メトロプロラミド注射液 10mg「タカタ」:2018年6月15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

効能・効果、用法・用量変更年月日:1984年6月1日

	変更前	変更後
効能・効果	<p>下記疾患時の消化器機能異常(食欲不振、悪心、嘔吐、腹部膨満感、上腹部痛、呑酸、嘔噎、噯気、しゃっくり)。</p> <p>○内科及び一般領域： 胃炎、胃下垂症、胃腸神経症、非急性期の胃・十二指腸潰瘍、胆のう炎、胆石症、胆道ディスキネジー、腎炎、尿毒症、慢性膵炎、薬剤(制癌剤、抗生物質、抗結核剤)投与時、胃内・気管内挿管時、幽門狭窄。</p> <p>○小児科領域： 習慣性嘔吐、神経性嘔吐、自家中毒症、胃腸炎、神経性食欲不振。</p> <p>○外科・麻酔科領域： 麻酔及び手術時、麻酔及び手術後。</p> <p>○放射線科領域： 放射線照射時、X線検査時バリウム停滞。</p>	<p>次の場合における消化器機能異常(悪心・嘔吐・食欲不振・腹部膨満感)</p> <p>胃炎、胃・十二指腸潰瘍、胆嚢・胆道疾患、腎炎、尿毒症、乳幼児嘔吐、薬剤(制癌剤・抗生物質・抗結核剤・麻酔剤)投与時、胃内・気管内挿管時、放射線照射時、開腹術後</p> <p>X線検査時のバリウムの通過促進</p>
用法・用量	<p>通常成人には、1回1管(2ml、塩酸メトロプロラミドとして10mg)を1日1~2回筋注又は静注します。尚年令、症状により適宜増減します。</p>	<p>メトロプロラミドとして、通常成人1回7.67mg(塩酸メトロプロラミドとして10mg、本剤1アンプル)を1日1~2回筋肉内又は静脈内に注射する。</p> <p>なお、年齢、症状により適宜増減する。</p>

### 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価公表年月日:1984年6月1日

「X. 12 効能・効果追加、用法・用量変更追加の年月日及びその内容」を参照。

### 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

厚生労働省告示第97号(平成20年3月19日付)で定められた「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。

### 16. 各種コード

HOTコード(9桁)	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
105073802	2399401A1148	620507302

### 17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## **XI. 文献**

### **1. 引用文献**

- 1) 薬科学大辞典 第3版 2001,1570,廣川書店
- 2) 高田製薬株式会社 社内資料:安定性試験
- 3) 日本薬局方外医薬品規格 2002,691,じほう
- 4) 高田製薬株式会社 社内資料:エリーテン文献集 I.

### **2. その他の参考文献**

特になし

## **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**

#### **1. その他の関連資**

特になし

MEMO



MEMO

MEMO

MEMO

製造販売

**高田製薬株式会社**

さいたま市西区宮前町203番地1