

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

疼痛治療剤（局所注射用）

タイオゼット[®]注2mL

タイオゼット[®]注5mL

TAIOZET

剤形	注射液
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	○タイオゼット注2mL 1管中：ジブカイン塩酸塩……………2mg サリチル酸ナトリウム……………6mg 臭化カルシウム……………4mg ○タイオゼット注5mL 1管中：ジブカイン塩酸塩……………5mg サリチル酸ナトリウム……………15mg 臭化カルシウム……………10mg
一般名	和名：ジブカイン塩酸塩（JAN） サリチル酸ナトリウム（JAN） 臭化カルシウム（JAN） 洋名：Dibucaine Hydrochloride（JAN） Sodium Salicylate（JAN） Calcium Bromide（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：2006年8月4日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2006年12月8日（販売名変更による） 発売年月日：1997年7月11日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売：武田薬品工業株式会社 発売元：日医工株式会社 製造販売元：日医工岐阜工場株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ https://www.nichiiko.co.jp/

本IFは2022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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://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、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 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。
- 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	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	14
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）	14
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
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	14
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	14
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	14
4. 分子式及び分子量	3	7. 相互作用	15
5. 化学名（命名法）	3	8. 副作用	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	16
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	16
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	17
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	17
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	17
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	17
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	18
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	18
3. 注射剤の調製法	6	2. 毒性試験	18
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	X. 管理的事項に関する項目	19
5. 製剤の各種条件下における安定性	7	1. 規制区分	19
6. 溶解後の安定性	8	2. 有効期間又は使用期限	19
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	8	3. 貯法・保存条件	19
8. 生物学的試験法	8	4. 薬剤取扱い上の注意点	19
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	8	5. 承認条件等	19
10. 製剤中の有効成分の定量法	9	6. 包装	19
11. 力価	9	7. 容器の材質	19
12. 混入する可能性のある夾雑物	9	8. 同一成分・同効薬	19
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	9	9. 国際誕生年月日	19
14. その他	9	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
V. 治療に関する項目	10	11. 薬価基準収載年月日	20
1. 効能又は効果	10	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	20
2. 用法及び用量	10	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
3. 臨床成績	10	14. 再審査期間	20
VI. 薬効薬理に関する項目	11	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	20
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	20
2. 薬理作用	11	17. 保険給付上の注意	20
VII. 薬物動態に関する項目	12	XI. 文献	21
1. 血中濃度の推移・測定法	12	1. 引用文献	21
2. 薬物速度論的パラメータ	12	2. その他の参考文献	21
3. 吸収	12	XII. 参考資料	22
4. 分布	12	1. 主な外国での発売状況	22
5. 代謝	13	2. 海外における臨床支援情報	22
6. 排泄	13	XIII. 備考	23
7. トランスポーターに関する情報	13	その他の関連資料	23
8. 透析等による除去率	13		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、局所麻酔作用、消炎鎮痛作用、中枢興奮作用を持つ薬剤を配合した、局所注射用疼痛治療剤である。

武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）は、後発医薬品としてタイオゼット注の開発を企画し、薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、1996 年 11 月に承認を取得、1997 年 7 月 11 日に販売を開始した。

その後、「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」（平成 12 年 9 月 19 日医薬発第 935 号）に基づき、容量を表示したタイオゼット注 2mL・5mL へと販売名を変更し、2006 年 8 月 4 日に承認を取得し、2006 年 12 月 8 日に薬価基準収載された。

2022 年 4 月 1 日、武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、日医工株式会社が販売を開始した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 症候性神経痛、筋肉痛、腰痛症、肩関節周囲炎に適応を有している。

（「V-1. 効能又は効果」の項参照）

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のでいずれも頻度は不明であるが、重大な副作用として、ショック、アナフィラキシーがあらわれることがある。また、類薬で悪性高熱が報告されている。

（「VIII-8. 副作用」の項参照）

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

タイオゼット注 2mL

タイオゼット注 5mL

(2) 洋名

TAIOZET

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

ジブカイン塩酸塩 (JAN)

サリチル酸ナトリウム (JAN)

臭化カルシウム (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

Dibucaine Hydrochloride (JAN)

Sodium Salicylate (JAN)

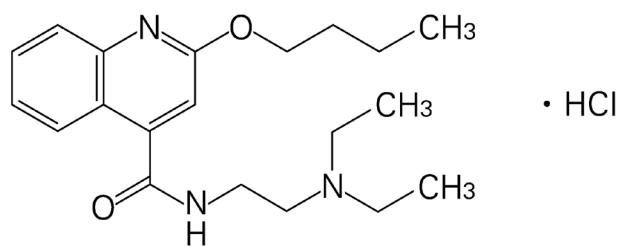
Calcium Bromide (JAN)

(3) ステム

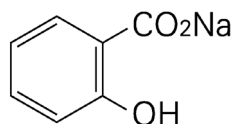
不明

3. 構造式又は示性式

○ジブカイン塩酸塩



○サリチル酸ナトリウム



○臭化カルシウム

$\text{CaBr}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$

4. 分子式及び分子量

- ジブカイン塩酸塩
分子式： $C_{20}H_{29}N_3O_2 \cdot HCl$
分子量：379.92
- サリチル酸ナトリウム
分子式： $C_7H_5NaO_3$
分子量：160.10
- 臭化カルシウム
分子式： $CaBr_2 \cdot 2H_2O$
分子量：235.92

5. 化学名（命名法）

- ジブカイン塩酸塩
2-Butyloxy-*N*-(2-diethylaminoethyl)-4-quinolinecarboxamide monohydrochloride
- サリチル酸ナトリウム
Monosodium 2-hydroxybenzoate
- 臭化カルシウム
Calcium Bromide

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

- ジブカイン塩酸塩
別名：塩酸ジブカイン、塩酸シンコカイン

7. CAS 登録番号

- ジブカイン塩酸塩
61-12-1
- サリチル酸ナトリウム
54-21-7
- 臭化カルシウム
7789-41-5

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

- ジブカイン塩酸塩
白色の結晶又は結晶性の粉末である。
- サリチル酸ナトリウム
白色の結晶又は結晶性の粉末である。
- 臭化カルシウム
白色の塊又は粒状の結晶で、においはなく、味はわずかに苦い。

(2) 溶解性

- ジブカイン塩酸塩
水、エタノール（95）又は酢酸（100）に極めて溶けやすく、無水酢酸に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
- サリチル酸ナトリウム
水に極めて溶けやすく、酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすい。
- 臭化カルシウム
水又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール（95）に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

- ジブカイン塩酸塩
吸湿性である。
- 臭化カルシウム
極めて吸湿性である。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

- ジブカイン塩酸塩
融点：95～100℃

(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¹⁾

- ジブカイン塩酸塩
本品 1.0 g を水 50mL に溶かした液の pH は 5.0～6.0 である。
- サリチル酸ナトリウム
本品 2.0 g を水 20mL に溶かした液の pH は 6.0～8.0 である。
- 臭化カルシウム
本品 1.0 g を水 10mL に溶かした液の pH は 7.0～9.0 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

- サリチル酸ナトリウム
光によって徐々に着色する。

3. 有効成分の確認試験法

○ジブカイン塩酸塩

日局「ジブカイン塩酸塩」の確認試験法による

- 1) 紫外可視吸光度測定法（吸収スペクトル）
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
- 3) 塩化物の定性反応

○サリチル酸ナトリウム

日局「サリチル酸ナトリウム」の確認試験法による

- 1) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
- 2) ナトリウム塩の定性反応

○臭化カルシウム

カルシウム塩及び臭化物の定性反応

4. 有効成分の定量法

○ジブカイン塩酸塩

日局「ジブカイン塩酸塩」の定量法による

電位差滴定法

○サリチル酸ナトリウム

日局「サリチル酸ナトリウム」の定量法による

電位差滴定法

○臭化カルシウム

キレート滴定法

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	剤形の区別	性状
タイオゼット注 2mL	水性注射剤	無色澄明の注射液
タイオゼット注 5mL		

(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	浸透圧比
4.0～6.0	0.9～1.1（日局生理食塩液に対する比）

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

○タイオゼット注 2mL

- 1 管中：ジブカイン塩酸塩を 2mg 含有
- サリチル酸ナトリウムを 6mg 含有
- 臭化カルシウムを 4mg 含有

○タイオゼット注 5mL

- 1 管中：ジブカイン塩酸塩を 5mg 含有
- サリチル酸ナトリウムを 15mg 含有
- 臭化カルシウムを 10mg 含有

(2) 添加物

等張化剤、pH 調節剤

(3) 電解質の濃度

該当資料なし

(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

<加速試験> ²⁾

◇タイオゼット注 2mL 加速 40℃・75%RH, 遮光 [最終包装形態：無色ガラスアンプル]

試験項目 <規格>	保存期間		
	開始時	6 ヶ月	
性状 <無色澄明の液>	適合	適合	
確認試験 (紫外可視吸光度測定法, 定性反応)	適合	適合	
浸透圧比 (生理食塩液に対する比) <0.9~1.1>	1.0±0.0 ^{※2}	1.0±0.0 ^{※2}	
pH <4.0~6.0>	4.9±0.0 ^{※2}	5.2±0.1 ^{※2}	
採取容量 <表示量以上>	適合	適合	
不溶性異物 <日本薬局方判定>	適合	適合	
無菌 <日本薬局方判定>	適合	適合	
含量 <93.0~107.0%>	ジブカイン塩酸塩 (%) ^{※1}	97.8±0.3 ^{※2}	95.6±0.9 ^{※2}
	サリチル酸ナトリウム (%) ^{※1}	98.0±0.2 ^{※2}	99.3±1.0 ^{※2}
	臭化カルシウム (%) ^{※1}	98.6±0.4 ^{※2}	97.7±0.2 ^{※2}

※1：表示量に対する含有率 (%) ※2：平均値±標準偏差 (SD)

◇タイオゼット注 5mL 加速 40℃・75%RH, 遮光 [最終包装形態：無色ガラスアンプル]

試験項目 <規格>	保存期間		
	開始時	6 ヶ月	
性状 <無色澄明の液>	適合	適合	
確認試験 (紫外可視吸光度測定法, 定性反応)	適合	適合	
浸透圧比 (生理食塩液に対する比) <0.9~1.1>	1.1±0.0 ^{※2}	1.1±0.0 ^{※2}	
pH <4.0~6.0>	4.8±0.0 ^{※2}	5.0±0.0 ^{※2}	
採取容量 <表示量以上>	適合	適合	
不溶性異物 <日本薬局方判定>	適合	適合	
無菌 <日本薬局方判定>	適合	適合	
含量 <93.0~107.0%>	ジブカイン塩酸塩 (%) ^{※1}	99.8±0.3 ^{※2}	97.4±0.5 ^{※2}
	サリチル酸ナトリウム (%) ^{※1}	98.5±0.1 ^{※2}	100.5±0.5 ^{※2}
	臭化カルシウム (%) ^{※1}	99.4±0.1 ^{※2}	99.8±0.1 ^{※2}

※1：表示量に対する含有率 (%) ※2：平均値±標準偏差 (SD)

<光安定性試験> ³⁾

◇タイオゼット注 2mL・5mL 光安定性 曝光 [850Lx, アンプル容器]

試験項目 <規格>	総曝光量		
	開始時	2 万 Lx・hr	60 万 Lx・hr
性状 <無色澄明の液>	無色澄明の液	微黄色澄明の液 (10 本中 3 本に異物が認められた)	微黄褐色澄明の液 (10 本中 10 本に異物が認められた)
pH <4.0~6.0>	4.73	4.72	4.77

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) ⁴⁾

<pH 変動試験>

試験製剤	規格 pH	試料 pH	0.1N (A)HCl (B)NaOH	最終 pH 又は 変化点 pH	移動 指数	変化 所見
タイオゼット注 5mL	4.0~6.0	4.77	(A) 10mL	1.30	3.47	なし
			(B) 0.02mL	7.89	3.12	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

○ジブカイン塩酸塩

紫外可視吸光度測定法 (吸収スペクトル)

○サリチル酸ナトリウム

呈色反応及び紫外可視吸光度測定法 (吸収スペクトル)

○臭化カルシウム

1) カルシウム塩の沈殿反応

2) 臭化物の沈殿反応

10. 製剤中の有効成分の定量法

- ジブカイン塩酸塩
液体クロマトグラフィー
- サリチル酸ナトリウム
液体クロマトグラフィー
- 臭化カルシウム
キレート滴定法

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

該当資料なし

14. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

症候性神経痛、筋肉痛、腰痛症、肩関節周囲炎

2. 用法及び用量

血管内を避けて局所に注射する。

(1) 顔面顎骨各部 0.5～1.0mL

(2) 肩甲部 1.0～2.0mL

(3) 胸・腰各部 1.0～2.5mL

(4) その他局所 0.5～1.0mL

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）

該当しない

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

アミド型局所麻酔薬（リドカイン、メピバカイン、ブピバカイン）
サリチル酸系製剤

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

タイオゼット注は、局所麻酔作用を有するジブカイン塩酸塩、消炎・鎮痛作用を有するサリチル酸ナトリウム及び中枢興奮抑制作用を示す臭化カルシウムを配合した局所注射用製剤である。

(2) 薬効を裏付ける試験成績⁵⁾

(1) 鎮痛作用

タイオゼット注及び標準製剤（2.5mL/kg, 足蹠皮下投与）は、カラゲニン誘発炎症足疼痛ラットに対し、カラゲニン投与3時間後において炎症足の疼痛閾値を有意に上昇させ、その鎮痛作用に有意差はなかった。

表1 ラットのカラゲニン炎症足疼痛に対する作用結果

薬物	用量 (mL/kg)	例数	疼痛反応率 (%)	疼痛閾値上昇率 (%)
コントロール	—	8	62.9	—
タイオゼット注 5mL	2.5	8	86.7 **	37.8
標準製剤	2.5	8	84.1 **	33.7

** : $p < 0.01$ vs コントロール (ANOVA/Tukey の多重比較法)

(2) 浸潤麻酔作用

タイオゼット注及び標準製剤（0.1mL/site, 背部皮内投与）は、モルモットにおいて注射針刺激による皮膚攣縮反応回数を有意に減少させ、その浸潤麻酔作用に有意差はなかった。

表2 モルモットの浸潤麻酔作用結果

薬物	用量 (mL/site)	例数	皮膚攣縮反応回数 (回)	抑制率 (%)	作用持続時間 (分)
コントロール	—	12	35.3	—	0
タイオゼット注 5mL	0.1	12	12.5 **	64.6	53.3
標準製剤	0.1	12	13.0 **	63.2	52.1

** : $p < 0.01$ vs コントロール (Kruskal-Wallis/Tukey の多重比較法)

(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

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

「Ⅷ－10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

(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. 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

【警告】

本剤を脊椎麻酔に使用しないこと。

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〈硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時】

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

【硬膜外ブロックに使用時】

- (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〈硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時】

- (1) 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー反応を起こしやすい体質を持つ患者 [ショックや発疹等のアレルギー反応を起こすおそれがある]
- (2) 潰瘍性大腸炎の患者、クローン病の患者 [他の非ステロイド性消炎鎮痛剤で症状が悪化したとの報告がある]
- (3) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

【硬膜外ブロックに使用時】

- (1) 中枢神経系疾患：髄膜炎、灰白脊髄炎等の患者 [硬膜外ブロックにより症状が悪化するおそれがある]
- (2) 妊産婦 [妊娠末期は、ブロック範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある]
- (3) 血液疾患や抗凝血剤治療中の患者 [出血しやすいので、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある]
- (4) 重篤な高血圧症の患者 [硬膜外ブロックにより低血圧が起こりやすい]
- (5) 脊柱の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る]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

【共通〈硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時】

- (1) サリチル酸系製剤の使用実態は我が国と異なるものの、米国においてサリチル酸系製剤とライ症候群との関連性を示す疫学調査報告があるので、本剤を 15 歳未満の水痘、インフルエンザの患者に投与しないことを原則とするが、やむを得ず投与する場合には、慎重に投与し、投与後の患者の状態を十分に観察すること。[ライ症候群：小児において極めてまれに水痘、インフルエンザ等のウイルス性疾患の先行後、激しい嘔吐、意識障害、痙攣（急性脳浮腫）と肝臓ほか諸臓器の脂肪沈着、ミトコンドリア変形、AST (GOT)・ALT (GPT)・

LDH・CK (CPK) の急激な上昇、高アンモニア血症、低プロトロンビン血症、低血糖等の症状が短期間に発現する高死亡率の病態である]

- (2) 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、常時、直ちに**救急処置**のとれる準備が望ましい。
- (3) 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) できるだけ必要**最少量**にとどめること。
 - 3) 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ため、**一度吸引し**、血液や脊髄液の逆流がないことを必ず確かめてから注射すること。
 - 4) 注射の速度はできるだけ**遅く**すること。
- (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。

[硬膜外ブロックに使用時]

ショックあるいは中毒症状がみられた際に、迅速な処置が行えるように、原則として事前の**静脈の確保**が望ましい。

[浸潤・伝達ブロック (トリガーポイント注射等) に使用時]

血管の多い部位 (頭部、顔面、扁桃等) に注射する場合には、吸収が早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。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用 (頻度不明)

ショック、アナフィラキシー ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあり、また心停止に至ることがあるので、観察を十分に行い、脈拍の異常、血圧低下、呼吸抑制、チアノーゼ、意識障害、喘鳴、眼瞼浮腫、発赤、蕁麻疹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。

悪性高熱 類薬 (リドカイン) で原因不明の頻脈・不整脈・血圧変動、急激な体温上昇、筋強直、血液の暗赤色化 (チアノーゼ)、過呼吸、発汗、アシドーシス、高カリウム血症、ミオグロビン尿 (ポットワイン色尿) 等を伴う重篤な悪性高熱がまれにあらわれることが報告されている。本剤を使用中、悪性高熱に伴うこれらの症状を認めた場合は、直ちに中止し、ダントロレンナトリウムの静注、全身冷却、純酸素での過換気、酸塩基平衡の是正等、適切な処置を行うこと。また、本症は腎不全を続発することがあるので、尿量の維持を図ること。

(3) その他の副作用

	頻度不明	
中枢神経系	振戦、痙攣等の中毒症状	注 1)
	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心、嘔吐、頭痛、気分不良	注 2)
過敏症	蕁麻疹、湿疹、全身のかゆみ、全身の発赤等の皮膚症状、全身性発熱、浮腫	
その他	一過性の麻痺、注射部位の疼痛、腫脹、発赤、熱感	

注 1) 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）投与等の適切な処置を行うこと。

注 2) 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

下記の項目参照

VIII-2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

VIII-5. 慎重投与内容とその理由(1)

VIII-8. (2) 重大な副作用と初期症状、(3) その他の副作用：過敏症

9. 高齢者への投与

[共通〈硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時〕

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

[硬膜外ブロックに使用時]

高齢者では一般にブロック範囲が広がりやすいので、用量に留意して慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 本剤を投与する場合には慎重に投与すること。[アスピリン等のサリチル酸製剤には、動物実験で催奇形作用が報告されているものがある]

(2) 妊娠末期のラットに投与した実験で、胎児動脈管の軽度収縮が報告されている。

(3) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。投与する際には、必要最小限にとどめ、適宜羊水量を確認するなど慎重に投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。シクロオキシゲナーゼ阻害剤（経口剤、坐剤）を妊婦に使用し、胎児の腎機能障害及び尿量減少、それに伴う羊水過少症が起きたとの報告がある。]

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（使用経験が少ない）。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

血中濃度の上昇に伴い、中毒症状が発現するとされている。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：

- 1) **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。
- 2) **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

[共通〈硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時〉]

アンプルカット時：アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭してから、ヤスリを用いなくて、アンプル頭部のマークの反対方向に折ること。

[浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時]

筋肉内注射により局所の硬結、発赤、腫脹、熱感などがみられることがある。

15. その他の注意

非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。

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）

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：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）

有効成分

ジブカイン塩酸塩：劇薬

サリチル酸ナトリウム：該当しない

臭化カルシウム：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果（加速）に基づく）

3. 貯法・保存条件

しゃ光・室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

光により分解着色するので、しゃ光に注意すること。また、着色の認められるものは使用しないこと。

(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）

「Ⅷ－14. 適用上の注意」の項参照

(3) 調剤時の留意点について

特になし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

○タイオゼット注 2mL

100 管

○タイオゼット注 5mL

100 管

7. 容器の材質

アンプル：無色ガラスアンプル

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ネオビタカイン注 2mL・5mL

同 効 薬：局所麻酔剤、サリチル酸系配合剤、注射用鎮痛・抗炎症剤等

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
タイオゼット注 2mL	2006年8月4日	21800AMX10699000
タイオゼット注 5mL		21800AMX10700000

11. 薬価基準収載年月日

2006年12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、投薬（あるいは投与）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 (YJコード)	レセプト電算コード
タイオゼット注 2mL	101125804	1149502A1011 (1149502A1097)	620004695
タイオゼット注 5mL	101130204	1149503A1016 (1149503A1091)	620004696

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書 (2016)
- 2) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (加速試験)
- 3) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (光安定性試験)
- 4) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (pH 変動試験)
- 5) 日医工岐阜工場株式会社 社内資料 (薬力学的同等性試験)

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
該当しない

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
特になし