

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 2018（2019年更新版）に準拠して作成

局所麻酔剤
メピバカイン塩酸塩注射液

メピバカイン塩酸塩注射液0.5%シリンジ50mg/10mL〔NP〕
メピバカイン塩酸塩注射液1%シリンジ100mg/10mL〔NP〕
メピバカイン塩酸塩注射液2%シリンジ200mg/10mL〔NP〕

MEPIVACAINE HYDROCHLORIDE INJECTION SYRINGE

日本薬局方 メピバカイン塩酸塩注射液

剤形	注射液（充填済みシリンジ剤：溶液）
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	0.5%：1シリンジ（10mL）中 日本薬局方 メピバカイン塩酸塩 50mg 1%：1シリンジ（10mL）中 日本薬局方 メピバカイン塩酸塩 100mg 2%：1シリンジ（10mL）中 日本薬局方 メピバカイン塩酸塩 200mg
一般名	和名：メピバカイン塩酸塩（JAN） 洋名：Mepivacaine Hydrochloride（JAN、INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2023年 1月10日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2023年12月 8日（販売名変更による） 販売開始年月日：2006年 7月10日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元 ニプロ株式会社 発売 丸石製薬株式会社
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 受付時間：9：00～17：00（土日祝日、当社休日を除く） 医薬関係者向けホームページ https://www.maruishi-pharm.co.jp/medicalstaffs

本 IF は 2024 年 1 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。
専用アプリ「添文ナビ」で GS1 バーコードを読み取ることで、最新の電子添文等を閲覧できます。



(01)14987211114630

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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利用者自らが内容を充実させ、I F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、I Fが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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

I Fを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いただきたい。I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1
6. RMPの概要	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）又は本質	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	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、定量法	3
IV. 製剤に関する項目	3
1. 剤形	3
2. 製剤の組成	4
3. 添付溶解液の組成及び容量	4
4. 力価	4
5. 混入する可能性のある夾雑物	4
6. 製剤の各種条件下における安定性	4
7. 調製法及び溶解後の安定性	4
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	4
9. 溶出性	5
10. 容器・包装	5
11. 別途提供される資材類	5
12. その他	5
V. 治療に関する項目	5
1. 効能又は効果	5
2. 効能又は効果に関連する注意	5
3. 用法及び用量	5
4. 用法及び用量に関連する注意	6
5. 臨床成績	6
VI. 薬効薬理に関する項目	7
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	7
2. 薬理作用	7
VII. 薬物動態に関する項目	7
1. 血中濃度の推移	7
2. 薬物速度論的パラメータ	8
3. 母集団（ポピュレーション）解析	8
4. 吸収	8
5. 分布	8
6. 代謝	8
7. 排泄	9
8. トランスポーターに関する情報	9
9. 透析等による除去率	9
10. 特定の背景を有する患者	9
11. その他	9

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	9
1. 警告内容とその理由	9
2. 禁忌内容とその理由	9
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	9
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	9
5. 重要な基本的注意とその理由	9
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	10
7. 相互作用	12
8. 副作用	12
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	12
10. 過量投与	12
11. 適用上の注意	13
12. その他の注意	13
IX. 非臨床試験に関する項目	14
1. 薬理試験	14
2. 毒性試験	14
X. 管理的事項に関する項目	14
1. 規制区分	14
2. 有効期間	14
3. 包装状態での貯法	14
4. 取扱い上の注意	14
5. 患者向け資材	14
6. 同一成分・同効薬	15
7. 国際誕生年月日	15
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	15
9. 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	15
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	15
11. 再審査期間	15
12. 投薬期間制限に関する情報	15
13. 各種コード	16
14. 保険給付上の注意	16
X I. 文献	16
1. 引用文献	16
2. その他の参考文献	16
X II. 参考資料	16
1. 主な外国での発売状況	16
2. 海外における臨床支援情報	16
X III. 備考	17
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	17
2. その他の関連資料	17

略語表

なし（個別に各項目において解説する。）

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、アメリカで開発されたアミド系の局所麻酔薬である。

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式会社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式会社が承認を取得し、2006年7月より丸石製薬株式会社で販売を開始した。なお、2014年2月に製造販売承認をニプロファーマ株式会社からニプロ株式会社が承継した。

なお、2023年1月にメピバカイン塩酸塩注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL「NP」、メピバカイン塩酸塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL「NP」、メピバカイン塩酸塩注射液 2%シリンジ 200mg/10mL「NP」に販売名を変更した。

2. 製品の治療学的特性

1. 本剤の効能又は効果は「硬膜外麻酔」「伝達麻酔」「浸潤麻酔」である。（「V. 1. 効能又は効果」の項参照）
2. 本剤の有効成分であるメピバカイン塩酸塩はアミド型の局所麻酔薬であり、伝達麻酔作用は、動物実験（マウス）において、プロカイン塩酸塩の2倍、リドカイン塩酸塩と同等の強さを示した¹⁾。また、ヒト伝達麻酔において、メピバカイン塩酸塩はリドカイン塩酸塩と同等の作用発現時間及びより長い作用持続時間を示した²⁾（外国人データ）。硬膜外麻酔ではメピバカイン塩酸塩の1/2～2/3倍の作用持続時間を示した³⁾（外国人データ）。（「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照）
3. 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。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

1. プレフィルドシリンジ製剤（充填済みシリンジ剤）のためアンプルカット・薬液吸引が不要なため、微生物汚染・異物混入の軽減が期待でき、緊急時等の迅速な対応が可能となる。（「IV. 1. 剤形、10. 容器・包装」の項参照）
2. 高圧蒸気滅菌済みのブリスター包装のため、清潔な取扱いが可能である。（「IV. 1. (5) その他」の項参照）
3. 濃度ごとに異なるカラーラベルを採用し識別性を向上しており、薬剤名、内容量が直接製品上に明記されているため、薬剤の取り違えや調製過誤の防止に役立つ。
4. 相互接続防止コネクタに係る国際規格（ISO（IEC）80369シリーズ）に対応し、コネクタ形状の異なる2規格の製品がある。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。また、ISO80369-6準拠品には黄色のオーバーキャップが装着されている。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。（「IV. 10. (2) 包装」「VIII. 11. 適用上の注意」の項参照）

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2024年5月7日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない（RMP策定対象外の事例）

<参考>

光による変化は少ない⁴⁾。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

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

[日局「メピバカイン塩酸塩」の確認試験による]

定量法

電位差滴定法

[日局「メピバカイン塩酸塩」の確認試験による]

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

注射剤（充填済みシリンジ剤：溶液）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	メピバカイン塩酸塩注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL 「NP」 メピバカイン塩酸塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL 「NP」 メピバカイン塩酸塩注射液 2%シリンジ 200mg/10mL 「NP」
外観	<div style="text-align: center;">製品仕様（構成と各部の名称）</div> ISO80369-6準拠品 ISO80369-6準拠品はキャップの形状及び色が異なります。
筒先の形状	ロックタイプ
性状	無色澄明の液

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH：4.5～6.8

浸透圧比：約 1（生理食塩液に対する比）

(5) その他

ブリスター包装内は無菌である。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	メピバカイン塩酸塩 注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL「NP」	メピバカイン塩酸 塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL「NP」	メピバカイン塩酸塩 注射液 2%シリンジ 200mg/10mL「NP」
有効成分	1 シリンジ (10mL) 中 日本薬局方 メピバカイン塩酸塩 50mg	1 シリンジ (10mL) 中 日本薬局方 メピバカイン塩酸塩 100mg	1 シリンジ (10mL) 中 日本薬局方 メピバカイン塩酸塩 200mg
添加剤	1 シリンジ (10mL) 中 塩化ナトリウム 84mg pH 調節剤 適量	1 シリンジ (10mL) 中 塩化ナトリウム 79mg pH 調節剤 適量	1 シリンジ (10mL) 中 塩化ナトリウム 69mg pH 調節剤 適量

(2) 電解質等の濃度

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

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 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°C)、3 年間] の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、メピバカイン塩酸塩注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL「NP」、メピバカイン塩酸塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL「NP」、メピバカイン塩酸塩注射液 2%シリンジ 200mg/10mL「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。

長期保存試験及び加速試験

メピバカイン塩酸塩注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL「NP」

メピバカイン塩酸塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL「NP」

メピバカイン塩酸塩注射液 2%シリンジ 200mg/10mL「NP」

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存 試験	室温 (1~30°C)	内包装:プラスチック製シリンジ (材質:ポリプロピレン)	36 ヶ月	規格の範囲内であった。
加速試験	40°C /75%RH	外包装:ブリスター包装	6 ヶ月	規格の範囲内であった。

測定項目: 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

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 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⁴⁾。

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

- ・個装箱、プリスター蓋材およびシリンジラベルの色調は濃度により異なる。
- ・相互接続防止コネクタに係る国際規格（ISO (IEC) 80369 シリーズ）に対応し、コネクタ形状の異なる2規格の製品がある。ISO80369-6 準拠品は、シリンジに貼付したラベル、プリスター包装蓋部、個装箱に、ISO80369-6 準拠品の表示がある。また、ISO80369-6 準拠品には黄色のオーバーキャップが装着されている。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。（「I. 3. 製品の製剤学的特性」「IV. 10. (2) 包装」「VIII. 11. 適用上の注意」の項参照）

(2) 包装

〈メピバカイン塩酸塩注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL 「NP」〉

10mL×10 シリンジ

10mL×10 シリンジ[ISO80369-6 準拠品]

〈メピバカイン塩酸塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL 「NP」〉

10mL×10 シリンジ

10mL×10 シリンジ[ISO80369-6 準拠品]

〈メピバカイン塩酸塩注射液 2%シリンジ 200mg/10mL 「NP」〉

10mL×10 シリンジ

10mL×10 シリンジ[ISO80369-6 準拠品]

(3) 予備容量

該当資料なし

(4) 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

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. 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. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

〈メピバカイン塩酸塩注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL 「NP」〉

硬膜外麻酔：（基準最高用量；1回 500mg）メピバカイン塩酸塩として、通常成人 50～150mg を使用する。

伝達麻酔：（基準最高用量；1回 500mg）メピバカイン塩酸塩として、通常成人、指趾神経遮断には 20～40mg、肋間神経遮断には 25mg、交感神経遮断には 25mg を使用する。

浸潤麻酔：（基準最高用量；1回 500mg）メピバカイン塩酸塩として、通常成人 10～200mg を使用する。

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。

〈メピバカイン塩酸塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL 「NP」〉

硬膜外麻酔：(基準最高用量；1回 500mg) メピバカイン塩酸塩として、通常成人 100～300mg を使用する。

伝達麻酔：(基準最高用量；1回 500mg) メピバカイン塩酸塩として、通常成人 50～200mg を使用する。指趾神経遮断には 40～80mg を使用する。

浸潤麻酔：(基準最高用量；1回 500mg) メピバカイン塩酸塩として、通常成人 20～400mg を使用する。

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。

〈メピバカイン塩酸塩注射液 2%シリンジ 200mg/10mL 「NP」〉

硬膜外麻酔：(基準最高用量；1回 500mg) メピバカイン塩酸塩として、通常成人 200～400mg を使用する。

伝達麻酔：(基準最高用量；1回 500mg) メピバカイン塩酸塩として、通常成人 40～400mg を使用する。指趾神経遮断には 80～160mg を使用する。

浸潤麻酔：(基準最高用量；1回 500mg) メピバカイン塩酸塩として、通常成人 40～400mg を使用する。

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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意			
麻酔方法別の用量は次表のとおりである。() 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)

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

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

一般名：リドカイン、ブピバカイン、レボブピバカイン、ロピバカイン

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

メピバカイン塩酸塩は、神経膜のナトリウムチャンネルをブロックし、神経における活動電位の伝導を可逆的に抑制し知覚神経及び運動神経を遮断する局所麻酔薬である。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

麻酔効果・作用時間

メピバカイン塩酸塩の伝達麻酔作用は、動物実験（マウス）において、プロカイン塩酸塩の2倍、リドカイン塩酸塩と同等の強さを示した¹⁾。また、ヒト伝達麻酔において、メピバカイン塩酸塩はリドカイン塩酸塩と同等の作用発現時間及びより長い作用持続時間を示した²⁾（外国人データ）。硬膜外麻酔ではブピバカイン塩酸塩の1/2～2/3倍の作用持続時間を示した³⁾（外国人データ）。

(3) 作用発現時間・持続時間

「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照

VII. 薬物動態に関する項目

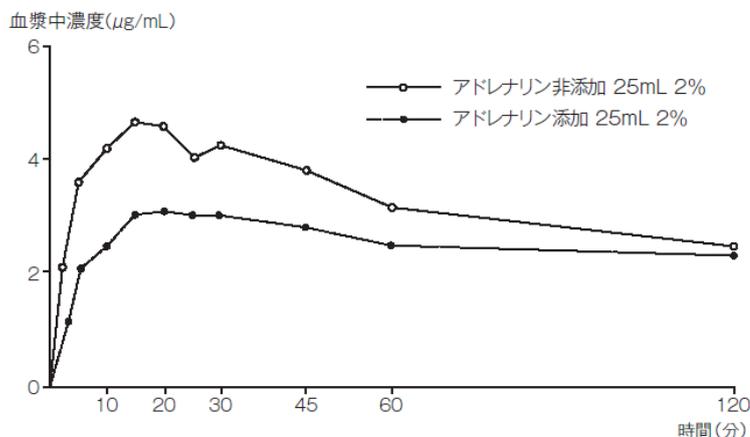
1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当しない

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

患者に2%メピバカイン液25mL（メピバカイン塩酸塩として500mg）単独あるいはアドレナリンを添加（1：200,000）して硬膜外投与したとき、単独群での血漿中濃度は、15分後に最高濃度（4.65 μ g/mL）を示したが、アドレナリン添加群では最高濃度の低下（36%）及び最高濃度到達時間の遅延が認められた⁵⁾（外国人データ）。



外国人患者に2%メピバカイン液25mL（500mg）を硬膜外投与したときの血漿中濃度推移（平均値、n=5）

- (3) 中毒域
該当資料なし
- (4) 食事・併用薬の影響
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) 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⁴⁾
- (4) クリアランス
該当資料なし
- (5) 分布容積
該当資料なし
- (6) その他
該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) パラメータ変動要因
該当資料なし

4. 吸収

該当しない

5. 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
妊婦にメピバカイン塩酸塩を硬膜外投与したとき、臍帯静脈血液中濃度と母体血漿中濃度の比は 0.5～0.7 で、胎盤を通過する⁶⁾。
- (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
血液/血漿中濃度比は約 0.9 である⁶⁾。
- (6) 血漿蛋白結合率
メピバカイン 2 μ g/mL の血漿蛋白結合率は 78%で、 α_1 -酸性糖蛋白及びアルブミンと結合する⁶⁾。

6. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路
メピバカインは主として肝臓で速やかに代謝されて尿中へ排泄される⁷⁾。ヒト尿中において、芳香環の 3 位及び 4 位の水酸化体、N-脱メチル体 (pipecolyxylidine) 及びそれらの抱合体として投与量の約 30%の代謝物が検出された⁸⁾ (外国人データ)。
- (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率
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活性比、存在比率
該当資料なし

7. 排泄

「VII. 6. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照
尿中の未変化体の排泄率は4%であった⁸⁾ (外国人データ)。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

〈効能共通〉

2.1 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

〈硬膜外麻酔〉

2.2 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。]

2.3 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。]

2.4 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注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」の項参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 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。[8.2、8.5、11.1.1 参照]

8.2 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、以下の点に留意すること。[8.1、8.5、11.1.1 参照]

8.2.1 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。

8.2.2 できるだけ薄い濃度のものを用いること。

8.2.3 できるだけ必要最小量にとどめること。

8.2.4 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。

8.2.5 注射の速度はできるだけ遅くすること。

8.2.6 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。

8.2.7 前投薬や術中に投与した鎮静薬、鎮痛薬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。[9.1.1、9.7、9.8 参照]

8.3 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。

〈硬膜外麻酔〉

8.4 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、以下の点に留意すること。

8.4.1 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。

8.4.2 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、麻酔範囲に留意すること。

〈伝達麻酔・浸潤麻酔〉

8.5 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、以下の点に留意すること。[8.1、8.2 参照]

8.5.1 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。

8.6 球後麻酔、眼球周囲麻酔施行時は以下の点に留意すること。

8.6.1 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。

8.6.2 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。

(解説)

8.1 「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由 (8.2、8.5)」 「Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状 (11.1.1)」 の項参照

8.2 「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由 (8.1、8.5)」 「Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状 (11.1.1)」 の項参照

8.2.7 「Ⅷ. 6. (1) 合併症・既往歴等のある患者 (9.1.1)」 「Ⅷ. 6. (7) 小児等 (9.7)」 「Ⅷ. 6. (7) 高齢者 (9.8)」 の項参照

8.5 「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由 (8.1、8.2)」 の項参照

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

〈効能共通〉

9.1.1 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。[8.2.7 参照]

9.1.2 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。

〈硬膜外麻酔〉

9.1.3 中枢神経系疾患のある患者 (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)

硬膜外麻酔により病状が悪化するおそれがある。

9.1.4 血液凝固障害や抗凝血薬投与中の患者

やむを得ず投与する場合は観察を十分に行うこと。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。

9.1.5 脊柱に著明な変形のある患者

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。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。

9.1.6 腹部腫瘍のある患者

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。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。

9.1.7 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

患者の全身状態の観察を十分に行うこと。血圧低下や病状の悪化が起こりやすい。

(解説)

9.1.1 「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由 (8.2.7)」の項参照

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者

中毒症状が発現しやすくなる。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者

中毒症状が発現しやすくなる。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

〈効能共通〉

9.5.1 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。

〈硬膜外麻酔〉

9.5.2 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。麻酔中はさらに増悪することがある。

〈伝達麻酔〉

9.5.3 傍頸管ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。[8.2.7 参照]

(解説)

9.7 「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由 (8.2.7)」の項参照

(8) 高齢者

9.8 高齢者

〈硬膜外麻酔〉

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。一般に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。[8.2.7 参照]

(解説)

9.8 「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由 (8.2.7)」の項参照

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック (頻度不明)

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。[8.1、8.2 参照]

11.1.2 意識障害、振戦、痙攣 (いずれも頻度不明)

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、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。[13 参照]

11.1.3 異常感覚、知覚・運動障害 (いずれも頻度不明)

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。

(解説)

11.1.1 「Ⅷ. 5. 重要な基本的注意とその理由 (8.1、8.2)」の項参照

11.1.2 「Ⅷ. 10. 過量投与」の項参照

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用	
	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。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

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。[11.1.2 参照]

13.1 症状

13.1.1 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。

13.1.2 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。

13.2 処置

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。

(解説)

13「Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状 (11.1.2)」の項参照

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 全般的な注意

14.1.1 使用時には、以下の点に注意すること。

- ・シリンジが破損するおそれがあるので、シリンジを鉗子等で叩くなど、強い衝撃を与えないこと。
- ・押子（プランジャー）が外れたり、ガスケットが変形し薬液が漏出したりするおそれがあるので押子のみを持たないこと。
- ・押子を反時計回りに回転させると接続に緩みが生じ、ガスケットから押子が外れるおそれがあるので、押子を時計回りに回転させないこと。
- ・シリンジが破損するおそれがあるので、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。

14.1.2 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。また、ISO80369-6 準拠品には黄色のオーバーキャップが装着されている。

14.1.3 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。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 使用に際しては、ブリスター包装を開封口からゆっくり開け、外筒（バレル）を持って取り出すこと。

14.2.2 押子の緩みがないか確認すること。緩みが認められた場合は、押子を時計回りに回転させ締め直すこと。

14.2.3 筒先のキャップをゆっくり回転させながら外して、注射針等に確実に接続すること。キャップを外した後は、筒先に触れないこと。

14.2.4 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。

14.3 薬剤投与後の注意

14.3.1 開封後の使用は 1 回限りとし、使用後の残液はシリンジとともに速やかに廃棄すること。

14.3.2 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は、使用后十分に水洗すること。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 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。

15.1.2 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。

- (2) 非臨床試験に基づく情報
設定されていない

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」の項参照
- (2) 安全性薬理試験
該当資料なし
- (3) 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) 遺伝毒性試験
該当資料なし
- (4) がん原性試験
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験
該当資料なし
- (7) 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)}
注) 注意－医師等の処方箋により使用すること
有効成分：劇薬

2. 有効期間

有効期間：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

20.1 プリスター包装内は滅菌しているので、使用時まで開封しないこと。

20.2 以下の場合には使用しないこと。

- ・プリスター包装が破損している場合
- ・シリンジから薬液が漏れている場合
- ・性状その他薬液に異状が認められる場合
- ・シリンジに破損等の異状が認められる場合
- ・キャップが外れている場合

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：なし

6. 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

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

メピバカイン塩酸塩注射液 0.5%シリンジ 50mg/10mL 「NP」

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ^{注)} 塩酸メピバカイン注 シリンジ0.5%「NP」	2005年3月3日	21700AMZ00279	2005年12月16日	2006年7月10日
販売名変更 メピバカイン塩酸塩 注射液0.5%シリンジ 50mg/10mL 「NP」	2023年1月10日	30500AMX00001	2023年12月8日	2024年1月

メピバカイン塩酸塩注射液 1%シリンジ 100mg/10mL 「NP」

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ^{注)} 塩酸メピバカイン注 シリンジ1%「NP」	2005年3月3日	21700AMZ00280	2005年12月16日	2006年7月10日
販売名変更 メピバカイン塩酸塩 注射液1%シリンジ 100mg/10mL 「NP」	2023年1月10日	30500AMX00002	2023年12月8日	2024年1月

メピバカイン塩酸塩注射液 2%シリンジ 200mg/10mL 「NP」

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ^{注)} 塩酸メピバカイン注 シリンジ2%「NP」	2005年3月3日	21700AMZ00281	2005年12月16日	2006年7月10日
販売名変更 メピバカイン塩酸塩 注射液2%シリンジ 200mg/10mL 「NP」	2023年1月10日	30500AMX00003	2023年12月8日	2024年1月

注) 経過措置期限 2024年9月30日まで

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

該当しない

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
メピバカイン塩酸塩 注射液0.5%シリンジ 50mg/10mL「NP」	1214406G1030	1214406G1030	117100602	621710002
メピバカイン塩酸塩 注射液0.5%シリンジ 50mg/10mL「NP」 [ISO80369-6準拠品]				
メピバカイン塩酸塩 注射液1%シリンジ 100mg/10mL「NP」	1214406G2037	1214406G2037	117101302	621710102
メピバカイン塩酸塩 注射液1%シリンジ 100mg/10mL「NP」 [ISO80369-6準拠品]				
メピバカイン塩酸塩 注射液2%シリンジ 200mg/10mL「NP」	1214406G3033	1214406G3033	117102002	621710202
メピバカイン塩酸塩 注射液2%シリンジ 200mg/10mL「NP」 [ISO80369-6準拠品]				

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) Henn, F. : Acta Anaesthesiol. Scand. 1960 ; 4 : 125-154 (PMID : 13713334)
- 2) Ulfendahl, H.R. : Acta Anaesthesiol. Scand. 1957 ; 1 : 81-86
- 3) Ekblom, L. et al. : Acta Anaesthesiol. Scand. 1966 ; 10(s21) : 33-43 (PMID : 5954661)
- 4) 日本薬局方解説書編集委員会 : 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店, 2021 ; C-5780-C5784
- 5) Tucker, G.T. et al. : Anesthesiology. 1972 ; 37 : 277-287 (PMID : 5051605)
- 6) Burm, A.G.L. : Clin. Pharmacokinet. 1989 ; 16 : 283-311 (PMID : 2663301)
- 7) Kristerson, L. et al. : Acta Pharmacol. Toxicol. 1965 ; 22 : 205-212 (PMID : 14328194)
- 8) Cousins, M.J. et al. : Neural blockade in clinical anesthesia and management of pain, 2nd ed. 1988 : 87

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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報 (オーストラリア分類)

日本の添付文書の「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリ

ア分類とは異なる。

本邦における使用上の注意

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

〈効能共通〉

9.5.1 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。

〈硬膜外麻酔〉

9.5.2 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。麻酔中はさらに増悪することがある。

〈伝達麻酔〉

9.5.3 傍頸管ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

mepivacaine : Category A

Drugs which have been taken by a large number of pregnant women and women of childbearing age without any proven increase in the frequency of malformations or other direct or indirect harmful effects on the fetus having been observed.

(2024年5月時点)

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし

