

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

筋弛緩剤

日本薬局方 注射用スキサメトニウム塩化物

レラキシン注用200mg**RELAXIN Injection 200mg**

剤形	注 射 剤
製剤の規制区分	毒薬 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	1バイアル中に日局スキサメトニウム塩化物水和物（脱水物として）200mg 含有
一般名	和名：スキサメトニウム塩化物水和物 洋名：Suxamethonium Chloride Hydrate
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：2008年3月13日 薬価基準収載年月日：2008年6月20日 発売年月日：1959年3月18日
	旧名称「レラキシン 200mg」 製造販売承認年月日 1984年7月20日 薬価基準収載年月日 1976年6月10日 発売年月日 1959年3月18日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	杏林製薬株式会社 くすり情報センター TEL 0120-409341 受付時間：9:00～17:30（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.kyorin-pharm.co.jp/medicalworker/

本 IF は 2013 年 5 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

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「医薬品に関する情報」
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認下さい。

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新たな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ホームページ「医薬品に関する情報」（www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html）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。

【 I F の作成】

- ① I F 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 I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F 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、「 I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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（ P D F ）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【 I F の発行】

- ① 「 I F 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、「 I F 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 I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「 I F 記載要領 2013」においては、 P D F 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 I F については、医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」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、 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薬剤師等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、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、 I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」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

I F 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。 I F 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、 I F 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・一部改変)

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・製剤学的特性	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	2
7. CAS登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	4
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 注射剤の調製法	4
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
5. 製剤の各種条件下における安定性	5
6. 溶解後の安定性	5
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5
8. 生物学的試験法	5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	5
10. 製剤中の有効成分の定量法	5
11. 力価	5
12. 混入する可能性のある夾雑物	5
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	5
14. その他	5
V. 治療に関する項目	6
1. 効能又は効果	6
2. 用法及び用量	6
3. 臨床成績	6
VI. 薬効薬理に関する項目	8
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	8
2. 薬理作用	8
VII. 薬物動態に関する項目	9
1. 血中濃度の推移・測定法	9
2. 薬物速度論的パラメータ	9
3. 吸収	9
4. 分布	10
5. 代謝	10
6. 排泄	10
7. トランスポーターに関する情報	11
8. 透析等による除去率	11

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	12
1. 警告内容とその理由	12
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	12
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	12
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	12
5. 慎重投与内容とその理由	12
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	12
7. 相互作用	13
8. 副作用	14
9. 高齢者への投与	15
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	15
11. 小児等への投与	15
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	15
13. 過量投与	15
14. 適用上の注意	16
15. その他の注意	16
16. その他	16
IX. 非臨床試験に関する項目	17
1. 薬理試験	17
2. 毒性試験	18
X. 管理的事項に関する項目	19
1. 規制区分	19
2. 有効期間又は使用期限	19
3. 貯法・保存条件	19
4. 薬剤取扱い上の注意点	19
5. 承認条件等	19
6. 包装	19
7. 容器の材質	19
8. 同一成分・同効薬	19
9. 国際誕生年月日	19
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	20
11. 薬価基準収載年月日	20
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
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
14. 再審査期間	20
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	20
16. 各種コード	20
17. 保険給付上の注意	20
XI. 文献	21
1. 引用文献	21
2. その他の参考文献	21
XII. 参考資料	22
1. 主な外国での発売状況	22
2. 海外における臨床支援情報	24
XIII. 備考	26
その他の関連資料	26

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1942年にクラールが麻酔時に始めて使用されてから、筋弛緩剤が全身麻酔に欠かせないものになった。

しかし、クラールは効果発現が遅く、持続が長い為、使用しにくいことがあり、また、副作用もしばしばみられることよりクラールと同様な作用を示す薬物の開発をした。その結果、アセチルコリンの近縁化合物であるスキサメトニウム塩化物水和物が1951年から臨床に使用され始めた。

なお、「レラキシシン 200mg」は、「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について（平成16年6月2日付薬食発0602009号）」に基づき、2008年6月「レラキシシン注用 200mg」と販売名を変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は、作用時間は短い、調節が容易な筋弛緩剤である。

本剤は、スキサメトニウム塩化物水和物の凍結乾燥品である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

レラキシシ注用 200mg

(2) 洋名

RELAXIN Injection 200mg

(3) 名称の由来

筋弛緩薬 (muscle Relaxant agent) から R E L A X I N とした。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

スキサメトニウム塩化物水和物(JAN)

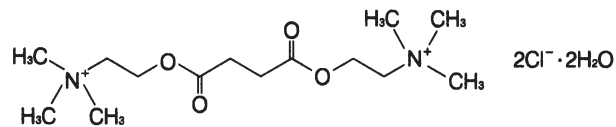
(2) 洋名 (命名法)

Suxamethonium Chloride Hydrate(JAN)

(3) ステム

四級アンモニウム化合物：-ium

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $\text{C}_{14}\text{H}_{30}\text{Cl}_2\text{N}_2\text{O}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$

分子量：397.34

5. 化学名 (命名法)

2, 2'-Succinyldioxybis(*N, N, N*-trimethylethylaminium) dichloride dihydrate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：S. C. C.

7. CAS 登録番号

6101-15-1

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

本品は水、メタノール又は酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(95)に溶けにくく、無水酢酸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。

(3) 吸湿性

吸湿性あり。臨界相対湿度は約80%RHである。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：159～164℃（未乾燥）

(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:水溶液(1→100)のpHは4.0～5.0である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

加熱における安定性試験（120℃，90分間，2回）を行った結果、外観、pH、TLC及び定量のそれぞれの試験において、いずれも変化は認められなかった（気密容器保存）。

[加速変化試験による主な反応生成物]

スキサメトニウム塩化物水和物は水溶液中において、2段階の加水分解を起こし、サクシニルモノコリンクロライドを経て、2分子の塩化コリン及びコハク酸に分解する。

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方のスキサメトニウム塩化物水和物の確認試験による。

4. 有効成分の定量法

日本薬局方のスキサメトニウム塩化物水和物の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

成分・含量 (1 バイアル中)	日局 スキサメトニウム塩化物水和物 (脱水物として) 200mg
溶解液組成 (1 管中)	日局 生理食塩液 10mL
剤形	注射剤(用時溶解)
内容物	白色の結晶性の粉末又は塊

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

添付溶解液で溶解するとき、pH、浸透圧比及び溶血性は次のとおりである。

溶解液	添付溶解液 10mL
濃度	2%
pH	4.0～5.0
浸透圧比	約 1
溶血性	(-)

(浸透圧比は、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 なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1 バイアル中に、日局スキサメトニウム塩化物水和物を脱水物として 200mg 含有する。

(2) 添加物

なし

(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

「日局 生理食塩液 10mL」添付。

(5) その他

該当しない

3. 注射剤の調製法

用時溶解する。

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

6年間の室温保存で外観及び含量の変化は認められなかった。

6. 溶解後の安定性

レラキシン注用 200mg を蒸留水、生理食塩液及び5%ブドウ糖液各 10 mL で溶解し、冷暗所、室温、恒温槽(37℃)の三条件で、経時変化を検討した結果は以下の通りであった。

- 1) 最も安定な条件は5%ブドウ糖液で溶解し、冷暗所に保存したものであった(10日間変化なし)。
- 2) 最も分解しやすいものは恒温槽(37℃)に保存した生理食塩液及び蒸留水で溶解したものであった(3日間までは変化なし)。
- 3) 室温において各々の試料溶液は5日間変化を認めず安定であった。

7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

- 1) 本品の溶液は弱酸性で、次第に分解し、サクシニルモノコリンを経てコリンとなる。
この分解はアルカリ性で促進され生体内のシュウドコリンエステラーゼによっても速やかに起こる。
- 2) ペントバルビタールナトリウム、チオペンタールナトリウムなどのバルビタール類注射液によって変化する。

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

日本薬局方の注射用スキサメトニウム塩化物の確認試験による。

10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方の注射用スキサメトニウム塩化物の定量法による。

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. 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

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

麻酔時の筋弛緩 気管内挿管時・骨折脱臼の整復時・喉頭痙攣の筋弛緩 精神神経科における電撃療法の際の筋弛緩 腹部腫瘍診断時

2. 用法及び用量

通常成人は下記用量を用いる。 (1) 間歇的投与方法：用時溶解し、スキサメトニウム塩化物水和物の脱水物として、1回 10～60mg を静脈内注射する。この用量で筋弛緩が得られないときは、筋弛緩が得られるまで適宜増量する。 (2) 持続点滴用法：持続性効果を求める場合は、0.1～0.2%となるように生理食塩液又は 5%ブドウ糖注射液に溶かし、持続注入する。通常 2.5mg/分ぐらいの速さで注入する。また、乳幼児及び小児に対する投与方法として、静脈内注射の場合 1mg/kg を、静脈内注射が不可能な場合は 2～3mg/kg を筋肉内注射する。
--

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

1) 疾患別臨床効果

[精神神経科における電撃療法の際の筋弛緩]

28 例の患者につき、合計 73 回のスキサメトニウム塩化物水和物使用による電撃療法を行い、一般の電撃にみられるはげしい全身痙攣を抑制し、しかも早期の呼吸回復その他の条件の満足をみた¹⁾。

(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

メフェネシン系化合物、ツボクラリン系化合物、コリン系化合物

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

運動神経を通じて伝導された衝撃は、神経末端からアセチルコリンの遊離を促進し、このアセチルコリンが筋終板膜での脱分極を起こし、終板電位を発生させ、筋肉にその活動電流を伝えて筋の収縮を起こさせる。

生理的には、アセチルコリンはコリンエステラーゼによって速やかにコリンと酢酸に分解され短時間内に復極が現われ、筋終板膜は次の衝撃に反応できる状態になる。^{2~5)}

スキサメトニウム塩化物水和物はツボクラリンのようにアセチルコリンの神経筋接合部への結合を競合的に阻害する薬物とは異なり、刺激発生に続く脱分極持続時間を延長することによって刺激伝導を遮断し、筋弛緩作用を発現する^{2~5)}。

更にこの持続性脱分極に続いて、終板のアセチルコリンの感受性が若干低下する作用をあらわし、その刺激伝導遮断効果は更に強力なものとなる。^{2~5)}

デカメトニウムと同様に、スキサメトニウム塩化物水和物による筋弛緩発現前に一過性の筋興奮をあらわす^{2~5)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

ツボクラリンに比べ作用時間は短く、10~30 mg 静注した場合の筋弛緩は通常1分以内にあらわれ、2分以内に最大となり、約5分後には消失する⁶⁾。

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

呼吸・循環系、肝・腎機能等の障害がない外科、整形外科、形成外科患者にスキサメトニウム塩化物水和物 100mg を静脈内投与し血中のサクシニルコリンクロライドとサクシニルモノコリンの濃度をカエル腹直筋を用いて bioassay 法で測定したが感度以下であった。

また、この方法を使用すると患者の血清中濃度はサクシニルコリンクロライドが 18.9 $\mu\text{g/mL}$ 以下、サクシニルモノコリンは 185 $\mu\text{g/mL}$ 以下と考えられた⁷⁾。

(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

該当しない

(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

[参考]

イヌに¹⁴C-サクシニルコリンクロライドを静注した実験では、投与後 5 時間で、血漿蛋白との結合分画が血漿中の総放射能活性の 84% までに漸増した⁸⁾。

3. 吸収

[参考]

¹⁴C-サクシニルコリンクロライドをイヌに静注したとき、5 分後に血漿から 80% が消失し、10% が尿中に認め

られた⁸⁾。

4. 分布

[参考]

イヌに¹⁴Cサクシニルコリンクロライドの1.4%は7時間後にもなお血漿中に残存した。尿中にはサクシニルモノコリンとコリンが排泄された⁸⁾。

(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

[参考]

胎盤障壁を一部通過するが臨床投与量では胎児に対する作用はほとんど認められなかった⁹⁾。

(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

[参考]

スキサメトニウム塩化物水和物はコリンエステラーゼにより加水分解され、サクシニルモノコリンとコリンに、さらにサクシニルモノコリンはコリンとコハク酸に分解され効力を失い、主に尿中に排泄される。代謝は速やかで、投与量の10%が尿中に回収された(イヌ)⁸⁾。

(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

尿、胆汁⁷⁾

(2) 排泄率

呼吸・循環系、肝・腎機能等の障害がない外科、整形外科、形成外科患者にスキサメトニウム塩化物水和物100mgを静脈内投与し、尿中のサクシニルコリンクロライドとサクシニルモノコリンクロライドを測定した。投与5分までにサクシニルコリンクロライドが4.5mg、サクシニルモノコリンクロライドが23.0mg排泄され投与量の39.4%に相当した⁷⁾。

60分までではサクシニルコリンクロライド8.3mg、サクシニルモノコリンクロライド41.5mgが排泄され、投与量の71%であった⁷⁾。

(3) 排泄速度

6. 排泄（2）排泄率の項参照

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】

本剤による呼吸停止について：

1. 本剤の使用に当たっては、必ずガス麻酔器又は人工呼吸器を準備する。使用時は、呼吸停止を起こすことが非常に多いので、人工呼吸や挿管に熟練した医師によってのみ使用すること。
2. 本剤によって起こる呼吸停止は、注入後極めて速やかなので、人工呼吸の時期を失ないように、事前に設備その他の準備・点検を十分に行うこと。

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）】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）】

1. 重症の熱傷、広範性挫滅性外傷、尿毒症、四肢麻痺、ジギタリス中毒の既往歴のある患者あるいは最近ジギタリスを投与されたことのある患者
[血中カリウムの増加作用により、心停止をおこすおそれがある。]
2. 緑内障の患者
[本剤には眼内圧亢進作用がある。]

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

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

重要な基本的注意

- (1) 本剤の分解能又は排泄能が低い患者あるいは感受性が高い患者の場合には、注入量及び注入速度に注意し、完全に回復するまで監視を行う必要がある。
- (2) 非脱分極性筋弛緩剤で過去にアナフィラキシー反応が生じた患者では、同様にアナフィラキシー反応が生じる可能性があるため、注意すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

[原則併用禁忌] (原則として併用しないこと)		
薬 剤 名 等	臨 床 症 状・措 置 方 法	機 序・危 険 因 子
ジギタリス強心配糖体 ジゴキシン ジゴキシン錠等 メチルジゴキシン ラニラピッド錠 等	本剤との併用により重篤な不整脈を起こすおそれがある。	スキサメトニウム塩化物水和物の血中カリウム増加作用又はカテコールアミン放出が原因と考えられている。

(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
コリンエステラーゼ阻害作用を有する薬剤 アンベノニウム塩化物 ネオスチグミン臭化物 シクロホスファミド 等	本剤の作用が増強し、遷延性無呼吸（持続性呼吸麻痺）を起こすことがある。	コリンエステラーゼによる本剤の分解が阻害されると考えられている。
非脱分極性筋弛緩剤	本剤の筋弛緩作用が持続し、遷延性無呼吸（持続性呼吸麻痺）を起こすことがある。	本剤の神経-筋遮断作用に対して、抵抗性を増加することがある。それゆえ、筋弛緩を得るには大量の本剤が必要となり、終板の感受性低下や手術後の無呼吸を延長するかもしれない。
デスフルラン イソフルラン	本剤の筋弛緩作用が増強するので、併用する場合には、本剤を減量すること。	併用により本剤の筋弛緩作用が増強される。
アプロチニン	本剤の作用が増強又は遷延することがある。	アプロチニンはコリンエステラーゼ活性を阻害すると考えられている。
ゾピクロン エスゾピクロン		相加的に抗痙攣作用、中枢神経抑制作用が増強する可能性がある。
アミノグリコシド系抗生剤	これらの抗生剤を投与した外科手術後に突発的に呼吸困難を起こすことがある。	両薬剤ともに神経遮断作用を有しており、併用によりその作用が増強する。
リンコマイシン系抗生剤	本剤の筋弛緩作用が増強する。	リンコマイシン系抗生剤は神経筋弛緩作用を持ち、本剤の作用が相加されると考えられている。
イリノテカン塩酸塩水和物	本剤の筋弛緩作用が減弱することがある。	イリノテカンはアセチルコリン受容体への結合能を持っていると考えられている。

8. 副作用

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。

(1) 副作用の概要

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用

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（気道内圧上昇、血圧低下、頻脈、全身発赤等）を起こすことがあるので、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) 悪性高熱症：

原因不明の頻脈・不整脈・血圧変動、急激な体温上昇、筋硬直、血液の暗赤色化（チアノーゼ）、過呼吸、ソーダライムの異常過熱・急激な変色、発汗、アシドーシス、高カリウム血症、ミオグロビン尿（ポートワイン色尿）などを伴う重篤な悪性高熱がまれにあらわれることがある。また、これらの症状の悪化により、横紋筋融解症があらわれることがある。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。

3) 気管支痙攣、遷延性無呼吸：

気管支痙攣、遷延性無呼吸（持続性呼吸麻痺）を起こすことがあるので、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。

4) 心停止：

心停止を起こすことがあるので、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。

5) 呼吸抑制：

本剤によって十分な筋弛緩を得ようとする時、全く呼吸抑制が起こらないように施術することは困難であり、また呼吸停止を警戒しすぎると所要の筋弛緩が得られないことがある。

呼吸停止が起こった場合には、薬液の注入を筋弛緩維持に必要な量に減ずるか、一旦中止し、人工呼吸によって積極的に酸素を補給しないと危険である。

20～40mgの本剤投与によって発生する呼吸停止は、通常およそ2～5分で回復する。

6) 横紋筋融解症：

横紋筋融解症があらわれることがあるので、体温の上昇がない場合においても、高カリウム血症、ミオグロビン尿、血清逸脱酵素の著明な上昇、筋肉痛等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。

(3) その他の副作用

	頻 度 不 明
循環器	徐脈、頻脈、不整脈、血圧降下
筋肉	術後筋肉痛
皮膚	発疹
その他	眼内圧上昇、アレルギー症状

(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

発疹等の過敏症があらわれた場合には投与を中止すること。

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

重要な基本的注意

(2)非脱分極性筋弛緩剤で過去にアナフィラキシー反応が生じた患者では、同様にアナフィラキシー反応が生じる可能性があるので、注意すること。

重大な副作用

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（気道内圧上昇、血圧低下、頻脈、全身発赤等）を起こすことがあるので、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。

9. 高齢者への投与

注入量及び注入速度に注意し、患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。

[高齢者では生理機能が低下していることが多い。（「重要な基本的注意」の項参照）]

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。]

11. 小児等への投与

小児等では、悪性高熱症、ミオグロビン血症及び循環器系副作用（徐脈、不整脈等）があらわれやすいので、慎重に投与すること。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

(1) 調製時：

バルビツール酸系薬剤と混合すると沈殿を生じるので、同じ注射筒を使用しないこと。

(2) 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、下記の点に配慮すること。

1) 神経走行部位を避けるように注意すること。

2) 繰り返し注射する場合には、注射部位をかえ、例えば左右交互に注射するなど行うべきであるが、連用しないことが望ましい。

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。

(3) アンプルカット時：

添付の溶解液はワンポイントカットアンプルを使用しているが、アンプルの首部をエタノール綿等で清拭し、カットすること。

15. その他の注意

該当しない

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）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

1) 中枢神経系に及ぼす影響

ネコにスキサメトニウム塩化物水和物を 0.7~1.3mg 投与し、血圧と脳波に与える影響を検討したが、両者に変化は認められなかった¹⁰⁾。

2) 交感神経系に対する作用

ネコにスキサメトニウム塩化物水和物を静注したところ、上頸交感神経節に対して、脱分極型の作用を示し、初期には刺激作用を、後期には抑制作用を示した¹¹⁾。

3) 平滑筋に及ぼす影響

イヌとヒトの尿管筋電図を測定したところ、スキサメトニウム塩化物水和物 1mg/kg 静注投与では波数、波型、振幅、持続時間等に影響は認められなかった¹²⁾。

4) 心・循環系に及ぼす影響

イヌにスキサメトニウム塩化物水和物を単独投与(2~8mg/kg を洞結節動脈に直接注入)したところ、心律動と血圧に影響を与えないが、アセチルコリンを前処理後、塩化スキサメトニウムを与えると徐脈、血圧下降に次いで、心室細動等の変化が認められた¹³⁾。

5) 呼吸に及ぼす影響

ウレタン麻酔したウサギにスキサメトニウム塩化物水和物を静注し、呼吸停止量を検討したところ、0.3~0.5mg/kg で呼吸は突然停止した。その際血圧は軽度に上昇し、この状態が少しの間続いた後、脈圧の増幅があらわれ、次いで血圧の急激な下降による心停止に至った。この呼吸停止はコラミン、ロベリンの前処置により著しく改善された¹⁴⁾。

6) 眼内圧に対する作用

ネコにスキサメトニウム塩化物水和物を 1~100 μ g/kg 静注したところ、用量の増加とともに瞬膜、眼上直筋の緊張及び眼内圧の増加を生じた¹⁵⁾。

(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

表 単回投与毒性試験^{16~17)}

動物	投与経路	LD ₅₀ (mg/kg)
マウス	静注	0.43
	腹腔内	1.25
家兔	静注	0.53

(Behrens-Kaerber 法)

(2) 反復投与毒性試験

若い雄ラットにスキサメトニウム塩化物水和物 1mg/kg, 1日2回、腹腔内に4週間連続投与した結果、成長度、血液像、腎、脳下垂体、肺、腸及び肝に変化は認められなかった¹⁷⁾。

(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：毒薬、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：毒薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造の翌月より5年

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

1) 本剤を溶解したものは凍結を避け、5℃以下に保存すること。

調製後はできるだけ速やかに使用すること（1週間以内）。

2) 本剤を溶解したものは、他の注射剤との識別を容易にするため添付の赤いテープを容器に貼付するなど注意すること。

(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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目、14. 適用上の注意の項を参照のこと。

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

10 バイアル（溶解液 10mL 10 管添付）

7. 容器の材質

無色透明のガラス・アンプル

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：スキサメトニウム注 20「As」・40「As」・100「As」

同 効 薬：ツボクラリン塩化物塩酸塩水和物、ベクロニウム臭化物、ロクロニウム臭化物

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

製造販売承認年月日：2008年3月13日 (旧名称「レラキシシ 200mg」：1984年7月20日)
製造承認番号：22000AMX00664000 (旧名称「レラキシシ 200mg」：(59AM)第506号)

「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について(平成16年6月2日付 薬食発第0602009号)」に基づき、販売名を変更した。

11. 薬価基準収載年月日

2008年6月20日 (旧名称「レラキシシ 200mg」：1976年6月10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

再評価：1975年3月5日(その4)
内 容：「効能・効果」、「用法・用量」の変更あり

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

販売名	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
レラキシシ注用 200mg	101707601	1224401X2014	620008406

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 島菌 安雄、他、脳と神経、10, 183, 1958.
- 2) 稲垣 稔、他、麻酔、10 (8) , 506, 1961.
- 3) Ireson, J. , et al. , Arch. Intern. Pharmacodyn, 181, 283, 1969.
- 4) Res, R. , et al. , Eur. J. Physiol. , 333, 187, 1972.
- 5) 久世 照五、他、麻酔、22(3) , 208, 1973.
- 6) 日本公定書協会編、 “第十二改正 日本薬局方解説書”
廣川書店 (1991) p. C-341.
- 7) 早川 隼朗、麻酔、20 (11) , 1039, 1971.
- 8) Santo, G. D. , Anesthesiology, 29(3) , 435, 1968.
- 9) 山根義久、獣医麻酔、7, 41, 1976.
- 10) 大友 雅美、日大医学雑誌、29, 439, 1970.
- 11) 田 紀克、千葉医学会雑誌、42, 250, 1966.
- 12) 白鳥 常男、他、麻酔、7(1) , 8, 1957.
- 13) 秋田 晴男、麻酔、19(12) , 1389, 1970.
- 14) 永田 良平、東京医科大学雑誌、16, 313, 1958.
- 15) Katz, R. L. , et al. , J. Pham. Exp. Ther. , 162, 1, 1968.
- 16) 永田 良平、東京医科大学雑誌、16, 295, 1958.
- 17) 山村 秀夫、呼吸と循環、3, 483, 1955.

2. その他の参考文献

なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

販売名：ANECTINE (英国-グラクソ社)
 LYSTHENON(イタリア-バイアム社)
 CURACIT(フィンランド-ナイコムドファルマ社)

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりである。

効能又は効果

麻酔時の筋弛緩
 気管内挿管時・骨折脱臼の整復時・喉頭痙攣の筋弛緩
 精神神経科における電撃療法の際の筋弛緩
 腹部腫瘍診断時

用法及び用量

通常成人は下記用量を用いる。

- (1)間歇的投与方法：用時溶解し、スキサメトニウム塩化物水和物の脱水物として、1回 10～60mg を静脈内注射する。この用量で筋弛緩が得られないときは、筋弛緩が得られるまで適宜増量する。
- (2)持続点滴用法：持続性効果を求める場合は、0.1～0.2%となるように生理食塩液又は5%ブドウ糖注射液に溶かし、持続注入する。通常 2.5mg/分ぐらいの速さで注入する。

また、乳幼児及び小児に対する投与方法として、静脈内注射の場合 1mg/kg を、静脈内注射が不可能な場合は 2～3mg/kg を筋肉内注射する。

英国の SPC

効能 又は 効果	Used in anaesthesia as a muscle relaxant to facilitate endotracheal intubation, mechanical ventilation and a wide range of surgical and obstetric procedures. It is also used to reduce the intensity of muscular contractions associated with pharmacologically or electrically-induced convulsions.
用法 及び 用量	Usually by bolus intravenous injection. <i>Adults:</i> The dose is dependent on body weight, the degree of muscular relaxation required, the route of administration, and the response of individual patients. To achieve endotracheal intubation Anectine is usually administered intravenously in a dose of 1 mg/kg. This dose will usually produce muscular relaxation in about 30 to 60 seconds and has a duration of action of about 2 to 6 minutes. Larger doses will produce more prolonged muscular relaxation, but doubling the dose does not necessarily double the duration of relaxation. Supplementary doses of Anectine of 50% to 100% of the initial dose administered at 5 to 10 minute intervals will maintain muscle relaxation during short surgical procedures performed under general anaesthesia. For prolonged surgical procedures Anectine may be given by intravenous infusion as a 0.1% to 0.2% solution, diluted in 5% glucose solution or sterile isotonic saline solution, at a rate of 2.5 to 4 mg per minute. The infusion rate should be adjusted according to the response of individual patients. The total dose of Anectine given by repeated intravenous injection or continuous infusion should

not exceed 500 mg per hour.

Children: Infants and young children are more resistant to Anectine compared with adults.

The recommended intravenous dose of Anectine for neonates and infants is 2 mg/kg. A dose of 1 mg/kg in older children is recommended.

When Anectine is given as intravenous infusion in children, the dosage is as for adults with a proportionately lower initial infusion rate based on body weight.

Anectine may be given intramuscularly to infants at doses up to 4 to 5mg/kg and in older children up to 4 mg/kg. These doses produce muscular relaxation within about 3 minutes. A total dose of 150 mg should not be exceeded.

Use in the elderly: Dosage requirements of Anectine in the elderly are comparable to those for younger adults.

The elderly may be more susceptible to cardiac arrhythmias, especially if digitalis-like drugs are also being taken. See also ' *Special warnings and precautions for use*' .

Instructions to open the ampoule

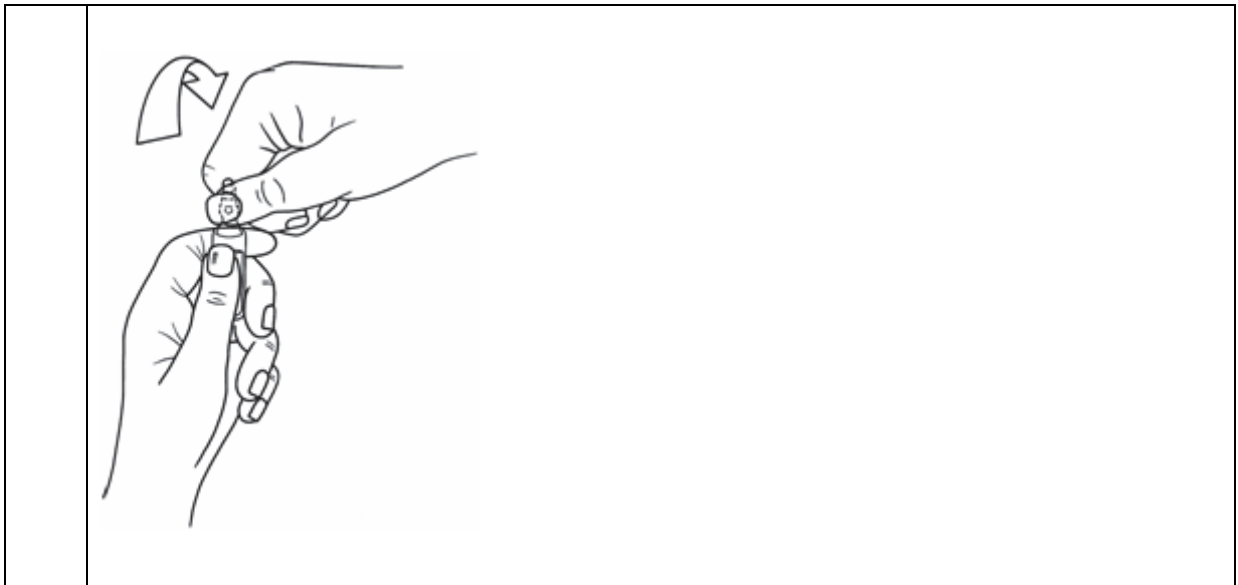
Ampoules are equipped with the OPC (One Point Cut) opening system and must be opened using the following instructions:

- hold with the hand the bottom part of the ampoule as indicated in picture 1
- put the other hand on the top of the ampoule positioning the thumb above the coloured point and press as indicated in picture 2

Picture 1



Picture 2



(2016年1月22日改訂)
(2016年3月7日アクセス)

2. 海外における臨床支援情報

本邦における使用上の注意「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り、オーストラリア分類とは異なる。

【使用上の注意】「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」

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。]

出典	薬剤	分類
オーストラリアの分類： An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy	Suxamethonium Chloride Hydrate	A (2014年9月)

(2016年3月7日アクセス)

参考：分類の概要

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

A: Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have not shown evidence of an increased occurrence of fetal damage.

(2) 小児等に関する記載

本邦における使用上の注意「小児等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、英国のSPCとは異なる。

【使用上の注意】「小児等への投与」

小児等では、悪性高熱症、ミオグロビン血症及び循環器系副作用（徐脈、不整脈等）があらわれやすいので、慎重に投与すること。

出典	記載内容
<p>英国のSPC ● (Anectine Injection Suxamethonium Chloride Injection BP 100mg in 2ml) (2016年1月22日)</p>	<p>Caution should be exercised when using suxamethonium in children, since paediatric patients are more likely to have an undiagnosed myopathy or an unknown predisposition to malignant hyperthermia and rhabdomyolysis, which places them at increased risk of serious adverse events following suxamethonium (see section 4.3 and section 4.8).</p> <p>In patients with severe sepsis, the potential for hyperkalaemia seems to be related to the severity and duration of infection.</p> <p>It is inadvisable to administer Anectine to patients with advanced myasthenia gravis. Although these patients are resistant to suxamethonium they develop a state of Phase II block which can result in delayed recovery. Patients with myasthenic Eaton-Lambert syndrome are more sensitive than normal to Anectine, necessitating dosage reduction.</p> <p>In healthy adults, Anectine occasionally causes a mild transient slowing of the heart rate on initial administration. Bradycardias are more commonly observed in children and on repeated administration of suxamethonium in both children and adults. Pre-treatment with intravenous atropine or glycopyrrolate significantly reduces the incidence and severity of suxamethonium-related bradycardia.</p> <p>In the absence of pre-existing or evoked hyperkalaemia, ventricular arrhythmias are rarely seen following suxamethonium administration. Patients taking digitalis-like drugs are however more susceptible to such arrhythmias. The action of suxamethonium on the heart may cause changes in cardiac rhythm including cardiac arrest.</p>

(2016年3月7日アクセス)

XII. 備考

その他の関連資料

なし

情報提供サービスのご案内

弊社製品の情報を電話、インターネットによりお届けしております。
弊社製品についてお知りになりたい事などございましたら、お気軽にご利用ください。

●製品に関するお問い合わせ・ご意見

弊社製品に関するお問い合わせ、ご意見等はお電話でのお問い合わせのみとなります。
下記の窓口までご連絡ください。

電話 0120-409341

受付時間 9:00～17:30（土・日・祝日・弊社休業日を除く）

担当部署 くすり情報センター

●キョーリン製薬ホームページ

弊社ホームページの「医療用医薬品情報」に添付文書、インタビューフォーム、剤形写真などの
製品情報を掲載しております。下記アドレスにアクセスしてください。

URL <http://www.kyorin-pharm.co.jp/>

<掲載情報>

●医療用医薬品情報

添付文書、くすりのしおり、インタビューフォーム、剤形写真、規制区分など

●添付文書等改訂情報

●新発売製品情報

●新薬開発情報