

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

局所麻酔剤

テトカイン[®]注用20mg「杏林」

TETOCAINE[®] Injection 20mg KYORIN

（注射用テトラカイン塩酸塩）

剤 形	用時溶解注射剤（凍結乾燥）												
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	1バイアル中に日局テトラカイン塩酸塩 20mg 含有												
一 般 名	和名：テトラカイン塩酸塩 [JAN] 洋名：Tetracaine Hydrochloride [JAN]												
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬 価 基 準 収 載 ・ 発 売 年 月 日	<table style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <tr> <td style="width: 50%;">製造販売承認年月日</td> <td>2008年 9月 4日</td> </tr> <tr> <td>薬価基準収載年月日</td> <td>2008年 12月 19日</td> </tr> <tr> <td>発売年月日</td> <td>1959年 8月 30日</td> </tr> </table> <p>旧名称：テトカイン「杏林」</p> <table style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <tr> <td style="width: 50%;">製造販売承認年月日</td> <td>1976年 12月 24日</td> </tr> <tr> <td>薬価基準収載年月日</td> <td>1977年 12月 1日</td> </tr> <tr> <td>発売年月日</td> <td>1959年 8月 30日</td> </tr> </table>	製造販売承認年月日	2008年 9月 4日	薬価基準収載年月日	2008年 12月 19日	発売年月日	1959年 8月 30日	製造販売承認年月日	1976年 12月 24日	薬価基準収載年月日	1977年 12月 1日	発売年月日	1959年 8月 30日
製造販売承認年月日	2008年 9月 4日												
薬価基準収載年月日	2008年 12月 19日												
発売年月日	1959年 8月 30日												
製造販売承認年月日	1976年 12月 24日												
薬価基準収載年月日	1977年 12月 1日												
発売年月日	1959年 8月 30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」（<http://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 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。
- ② IF 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 M R 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	5
3. 注射剤の調製法	5
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	6
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7
8. 生物学的試験法	7
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
10. 製剤中の有効成分の定量法	7
11. 力価	8
12. 混入する可能性のある夾雑物	8
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8
14. その他	8
V. 治療に関する項目	9
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9
3. 臨床成績	9
VI. 薬効薬理に関する項目	12
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	12
2. 薬理作用	12
VII. 薬物動態に関する項目	13
1. 血中濃度の推移・測定法	13
2. 薬物速度論的パラメータ	13
3. 吸収	14
4. 分布	14
5. 代謝	14
6. 排泄	15
7. トランスポーターに関する情報	15
8. 透析等による除去率	15

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16
1. 警告内容とその理由	16
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	16
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17
5. 慎重投与内容とその理由	17
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	18
7. 相互作用	18
8. 副作用	19
9. 高齢者への投与	20
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	20
11. 小児等への投与	20
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	21
13. 過量投与	21
14. 適用上の注意	21
15. その他の注意	21
16. その他	21
IX. 非臨床試験に関する項目	22
1. 薬理試験	22
2. 毒性試験	22
X. 管理的事項に関する項目	23
1. 規制区分	23
2. 有効期間又は使用期限	23
3. 貯法・保存条件	23
4. 薬剤取扱い上の注意点	23
5. 承認条件等	23
6. 包装	23
7. 容器の材質	23
8. 同一成分・同効薬	23
9. 国際誕生年月日	23
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	24
11. 薬価基準収載年月日	24
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	24
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	24
14. 再審査期間	24
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	24
16. 各種コード	24
17. 保険給付上の注意	24
XI. 文献	25
1. 引用文献	25
2. その他の参考文献	25
XII. 参考資料	26
1. 主な外国での発売状況	26
2. 海外における臨床支援情報	26
XIII. 備考	27
その他の関連資料	27

I. 概要に関する項目

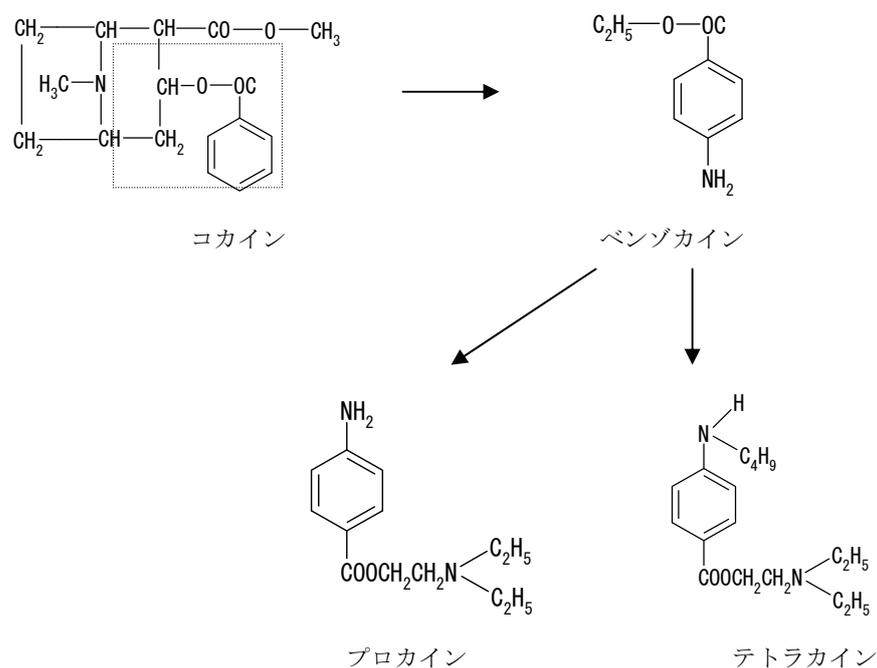
1. 開発の経緯

最初の局所麻酔薬は天然から抽出されたアルカロイドのコカインであり、1860年ドイツのNiemanがコカの葉のアルカロイドを結晶として抽出し、命名した。

しかし、コカインはその麻酔作用よりも高い毒性と中枢神経系への刺激作用が問題とされ、さらに良い局所麻酔薬の開発が求められた。

コカインの局所麻酔作用は、構造上安息香酸の部分にあることがわかり、各種安息香酸誘導体から、1905年Einhornによりプロカインが合成された。

テトラカインは、プロカインのベンゼン核のNH₂にアルキル基を添加し、局所麻酔作用を増強させたもので、1928年Eislebにより合成された。



また、現在使われている局所麻酔薬は、一般的構造として、[芳香族残基-中間鎖-アミン]となっており、中間鎖がエステル結合かアミド結合かにより、エステル型とアミド型に大別される。テトラカインは、プロカインと共にエステル型であり、一方、アミド型には、リドカインやビブパカイン等がある¹⁾。

なお、医薬品再評価結果その3（1974年11月公示）で本剤の有用性が認められている。

テトカイン「杏林」20mg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 薬食発第0602009号）」に基づき、2008年12月「テトカイン注用20mg「杏林」と販売名を変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) エステル型の局所麻酔薬で力価はプロカインの約10倍。
- (2) 比較的速やかに局所麻酔作用が現れ、かつ長時間続く。
- (3) 用時溶解の製剤のため、溶媒により高比重液、等比重液、低比重液に調製できる。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

テトカイン注用 20mg 「杏林」

(2) 洋名

TETOCAINE Injection 20mg KYORIN

(3) 名称の由来

一般名であるテトラカイン塩酸塩に由来している。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

テトラカイン塩酸塩（JAN）

(2) 洋名（命名法）

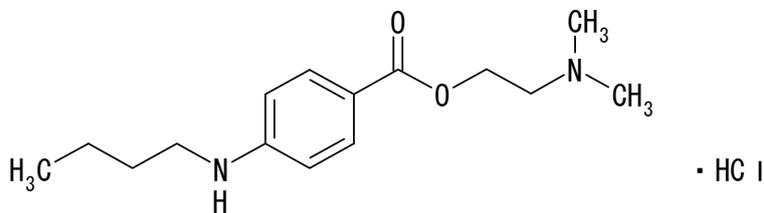
Tetracaine Hydrochloride (JAN, USAN)

Tetracaine (INN)

(3) ステム

局所麻酔薬：-caine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₅H₂₄N₂O₂ · HCl

分子量：300.82

5. 化学名（命名法）

2-(Dimethylamino)ethyl 4-(butylamino)benzoate monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

7. CAS 登録番号

136-47-0 (テトラカイン塩酸塩)

94-24-6 (テトラカイン)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦く、舌を麻痺する。
本品の水溶液(1→10)は中性である。

(2) 溶解性

本品はギ酸に極めて溶けやすく、水に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくく、無水酢酸に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

約 70%RH を超えると吸湿性を認める。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 148°C

(5) 酸塩基解離定数

$Pka_1 = 2.16 \pm 0.05$ (室温 24°C) UV 法

$Pka_2 = 8.11 \pm 0.4$ (室温 24°C) 滴定法

(6) 分配係数

有機溶媒相	水 相	分配係数
クロロホルム	pH7.0 Britton Robinson 緩衝液	2.1

(24°C)

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品の水溶液は、pH5.4 以下の微酸性に保っておけば煮沸しても安定であるが、アルカリ性では p-n-butylaminobenzoic acid と dimethylamino-ethanol とに分解する。

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方テトラカイン塩酸塩の確認試験法による

4. 有効成分の定量法

日本薬局方テトラカイン塩酸塩の定量法による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

剤形の区別：用時溶解して用いる凍結乾燥注射剤

規格：1バイアル中に日局テトラカイン塩酸塩 20mg 含有

性状：本剤は用時溶解して用いる注射剤で内容物は白色の粉末又は塊である。

本品の水溶液(1→200)の pH は、5.0～6.0 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

1) 溶解時の pH、浸透圧比、比重

溶解液	テトラカイン塩酸塩の濃度	pH	浸透圧比	溶血性	比重		
					20℃	25℃	37℃
5%ブドウ糖注射液	0.1%	6.0±1.0	約 1	/	1.0194	1.0190	1.0190
	0.5%	5.7±1.0	約 1		1.0199	1.0197	1.0197
	1%	5.5±1.0	約 1		1.0205	1.0202	1.0202
10%ブドウ糖注射液	0.1%	5.5±1.0	約 2	(-)	1.0339	1.0330	/
	0.5%	5.5±1.0	約 2		1.0353	1.0334	
	1%	5.5±1.0	約 2		1.0369	1.0353	
20%ブドウ糖注射液	0.1%	5.9±1.0	約 5	/	1.0764	1.0759	1.0757
	0.5%	5.5±1.0	約 5		1.0764	1.0761	1.0757
	1%	5.4±1.0	約 5		1.0769	1.0765	1.0758
注射用蒸留水	0.1%	5.5±1.0	約 0.0	(+)	0.9987	0.9984	/
生理食塩液	0.1%	5.5±1.0	約 1	(+)	浸透圧比は生理食塩水に対する比。		
	0.2%	5.5±1.0	約 1				
	2%	5.5±1.0	約 1				

本品は pH5.4～7.5 で安定である。

2) 密度、比重、baricity²⁾

	密度		比重		baricity	
	20℃	37℃	20℃	37℃	20℃	37℃
蒸留水	0.9982	0.9932	1.0000	1.0000	0.9979	0.9930
0.4%テトカイン蒸留水溶媒	0.9990	0.9945	1.0006	1.0005	0.9987	0.9942
0.5%テトカイン蒸留水溶媒	0.9991	0.9946	1.0007	1.0006	0.9988	0.9943
0.5%テトカイン生理食塩水溶媒	1.0056	1.0006	1.0072	1.0070	1.0053	1.0003
0.5%テトカイン 5%ブドウ糖溶媒	1.0183	1.0131	1.0198	1.0195	1.0180	1.0127
0.5%テトカイン 10%ブドウ糖溶媒	1.0373	1.0318	1.0389	1.0382	1.0370	1.0315
ヒト髄液 (n=10)	—	1.0003	—	1.0070	—	1.0000
		±0.0003		±0.0003		

(baricity : ヒト髄液密度に対する溶液密度の比、37℃の髄液密度を 1.0003g/mL とした。)

(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

1 バイアル中に日局テトラカイン塩酸塩 20mg を含有する。

(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

該当しない

(5) その他

該当しない

3. 注射剤の調製法

本剤は用時溶解して用いる注射液で溶解用として 10w/v%ブドウ糖注射液（高比重溶解液）、注射用蒸留水（低比重溶解液）または生理食塩液（等比重溶解液）を使用し、所定の濃度に調整する。

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

相対比較試験

保 存 条 件		保存期間	結 果
保存方法	保存形態		
40℃、75%	無色バイアル + 紙箱	6 箇月	変化なし
	無色アンプル + 紙箱	6 箇月	変化なし

[参考] 容器：アンプル

保 存 条 件		保 存 期 間	結 果
保 存 方 法	保 存 状 態		
室 温		5 年	変化なし
光線照射 (蛍光灯：2000lx)	遮光なし	6 箇月	外 観：6 箇月目に白色から微黄色に変化 におい：4.5 箇月にわずかに不快臭 その他の試験項目には変化なし
加温保存(40℃)	遮光なし	6 箇月	変化なし

6. 溶解後の安定性

1) テトカイン1%溶液（溶解液として10%ブドウ糖溶液を使用した）

	日数	0日目	1日目	2日目	3日目	4日目	10日目	14日目
冷蔵庫 保存 (8℃)	pH	5.5	—	—	5.4	—	5.4	5.3
	残存率 (%)	100.0	101.0	100.5	101.0	100.4	100.4	98.8
室温 保存	pH	5.5	—	—	5.3	—	5.1	5.0
	残存率 (%)	100.0	100.0	97.3	97.8	98.8	100.4	97.5

2) テトカイン0.2%溶液（溶解液として生理食塩水を使用した）

	日数	0日目	1日目	2日目	3日目	4日目	10日目	14日目
冷蔵庫 保存 (8℃)	pH	5.5	—	—	5.6	—	5.7	5.7
	残存率 (%)	100.0	101.8	99.9	101.1	102.4	99.7	99.9
室温 保存	pH	5.5	—	—	5.4	—	5.4	5.3
	残存率 (%)	100.0	99.8	97.3	99.4	98.8	98.2	97.3

3) テトカイン0.1%溶液（溶解液として注射用蒸留水を使用した）

	日数	0日目	1日目	2日目	3日目	4日目	10日目	14日目
冷蔵庫 保存 (8℃)	pH	5.8	—	—	5.5	—	5.3	5.5
	残存率 (%)	100.0	99.6	98.6	101.0	100.8	101.0	100.0
室温 保存	pH	5.5	—	—	5.3	—	5.0	5.3
	残存率 (%)	100.0	101.6	98.9	99.4	100.8	99.9	99.8

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

[参考] pH変動試験値

一般名又は成分 単位/容量	投与量	規格 pH域	試料 pH	0.1mol/L HCl (A) 0.1mol/L NaOH (B) mL	最終 pH または 変化点 pH	移動 指数	変化 所見	希 積 試 験								浸透 圧比
								20mL				500mL				
								0	30	1h	3h	0	30	1h	3h	
テトラカイン 塩酸塩 20mg/2mL [10%ブドウ糖 溶液に溶解]	脊髄 硬膜 内外	5.5 ± 1.0	5.0	(A) 10.0	1.2	3.8									約 2	
				(B) 0.09	7.2	2.2	白濁	7.3 —	—	—	—	6.8 —	—	—		— (6.5)
テトラカイン 塩酸塩 20mg/20mL [注射用蒸留水 に溶解]	脊髄 硬膜 内外	5.5 ± 1.0	5.8	(A) 10.0	1.5	4.3									約 0	
				(B) 0.32	8.3	2.5	白濁	8.3 —	—	—	—	8.2 —	—	—		— (6.5)
テトラカイン 塩酸塩 20mg/1mL [生理食塩液に 溶解]	脊髄 硬膜 内外	5.5 ± 1.0	5.7	(A) 10.0	1.1	4.6									約 1	
				(B) 0.09	7.1	1.4	白濁	7.7 —	—	—	—	6.3 —	—	—		— (5.6)

*規格 pH 域：製造承認書に記載されていないため、実測値±1.0 で表した。

*試料 pH は実験に供した注射薬の pH で、一般名または成分単位/容量に記入された条件における pH を示す。

*pH 変動：

0.1mol/L HCl を (A)、0.1mol/L NaOH を (B) とし、滴加 mL 数を記入してある。10mL をもって限度とし、次に最終または変化点 pH を記入、移動指数は試料 pH とこれらの差で示される。

*変化所見で全く変化のないものは空白とした。

*希釈試験における 20mL、500mL の 0 時の数値は希釈直後の pH、500mL の 3h の欄の () 内の数値は使用した蒸留水の pH を示す。

—は外観変化の認められないもの、すなわち、再び澄明となったことを意味する。

*浸透圧比は氷点降下法により測定し、0.9%生理食塩液 (286mOsmol) を 1 として比で表した。

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

(1) 塩化物の確認

塩化物の定性反応

(2) 吸光度測定法による確認

本品のスペクトルと日本薬局方テトラカイン塩酸塩の参照スペクトルを比較するとき両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

(3) TLC による確認

試料溶液及び標準溶液から得たスポットの Rf 値は等しい。

10. 製剤中の有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法による定量法 (波長 311nm)

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

脊椎麻酔（腰椎麻酔）、硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔、表面麻酔

2. 用法及び用量

使用に際し、目的濃度の水性注射液又は水性液として、使用する。

脊椎麻酔（腰椎麻酔）：テトラカイン塩酸塩として、通常成人下記量を使用する。
高比重溶液；0.1～0.5%注射液とし、6～15mg
低比重溶液；0.1%注射液とし、6～15mg

硬膜外麻酔：0.15～0.2%注射液とし、テトラカイン塩酸塩として、通常成人 30～60mg を使用する。

伝達麻酔：（基準最高用量：1回 100mg）0.2%注射液とし、テトラカイン塩酸塩として、通常成人 10～75mg を使用する。

浸潤麻酔：（基準最高用量：1回 100mg）0.1%注射液とし、テトラカイン塩酸塩として、通常成人 20～30mg を使用する。

表面麻酔：0.25～2%液とし、テトラカイン塩酸塩として通常成人 5～80mg 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。
必要に応じアドレナリン（通常濃度 1：1 万～2 万）を添加して使用する。

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) 脊椎麻酔（0.2%高比重液）³⁾

〔対 象〕 ASA(American Society of Anesthesiologists) I～II の下腹部開腹術を行う予定患者 33 例を 3 群に分けた。

〔投与方法〕 テトカイン 12mg を 10%ブドウ糖に溶解し、濃度を 1%、0.4%、0.2%の高比重液とした。25G スパイナル針を使用し、第 3～4 腰椎間よりくも膜下穿刺を行い、0.2mL/秒の速度で注入。

〔測定項目〕 ①収縮期血圧と心拍数

②麻酔高の変動：Pinprick 法による無痛域で評価

③運動麻痺の変動：Bromage の方法による評価

〔結 果〕 ①収縮期血圧と心拍数：各群間で有意差は認められなかった。

②麻酔高の変動：1%群は他群に比べ、10 分後までは有意に遅く上昇し、90 分を経過すると速く下降傾向にあった。しかし、注入後 15 分から 60 分までは、3 群とも Th₃—Th₄に達し、有意差は認められなかった。

③運動麻痺の変動：各群すべて 60 分間持続した。

[早稲田直子, 他, 臨床麻酔, 14(6), 865(1990).]

2) 脊椎麻痺（0.5%高比重液）⁴⁾

〔対 象〕 下肢および下腹部手術が予定された患者 42 名（男子 12 名、女子 30 名、平均年齢 41.1 歳）

〔投与方法〕 ディスポーザブルスパイナル針（22G）で、第 2 腰椎間からくも膜下腔を穿刺。

テトカイン 20mg を 10%ブドウ糖液 4mL に溶解し、そのうち 12g（2.4mL）を 0.1mL/秒の速度で注入した。

〔測定項目〕 ①効果発現時間として、テトカイン注入開始から第 1 趾の皮膚温上昇開始までを皮膚温記録用プローベにて測定する一方、第 1 趾付近での無痛発現を pin-prick 法で測定した。

②脳脊髄液（CSF）の pH

〔結 果〕 ①皮膚温は、テトカイン注入後 1.5 分～3.4 分で上昇を開始し、平均は 2.37±0.45 分（Mean±SD）であった。また無痛発現は、テトカイン注入後 1.0 分～6.7 分の間に見られ、平均は 2.57±1.24 分（Mean±SD）であった。

②CSF の水素イオン濃度と効果発現時間とは相関を示した。

[佐藤重仁, 他, 麻酔, 31(10), 1072(1982).]

3) 脊椎麻酔 (0.5%等比重液)⁵⁾

〔対 象〕 TUR-P/BT、膝関節置換術を受けた 60 歳以上の男女 25 例

〔投与方法〕 側臥位にて L₂~₃/L₃~₄間を穿刺。0.5%テトカイン (テトカイン 20mg を生理食塩水 4mL で溶解、比重 1.008) 2~3mL を注入

〔結 果〕 全例に手術に必要な十分な麻痺域が得られた。無痛域上限は T₆~T₁₂。下肢の運動麻痺は完全で、麻酔出現時間は 1~6 分、下肢の運動麻痺が消失するまでの時間は 240~360 分、収縮期圧の最大下降率は 0~36%であった。

脊椎麻酔による合併症は血圧低下による悪心・嘔吐のほかには認められなかった。

[畠山廉英, 他, 麻酔, 36(6), 995(1987).]

4) 脊椎麻酔 (0.1%低比重液)⁶⁾

〔対 象〕 ASA 分類 I~II 度の 65 歳未満の下肢手術患者 40 例

〔投与方法〕 25G 腰椎穿刺針で第 3~4 腰椎間から穿刺。0.5mg フェニレフリン添加 0.1%低比重テトカイン 10mL (比重 1.001) を注入した。

〔評価方法〕 対象を 2 群に分け、60 秒で注入した例を 1 群、180 秒で注入した例を 2 群とした。

薬液注入終了時点から 5 分後、10 分後、15 分後の手術側の脊椎麻酔レベルを cold sign test で確認し、両群間で比較した。

〔結 果〕 脊椎麻酔レベルには両群間に有意差はなかった (図)。

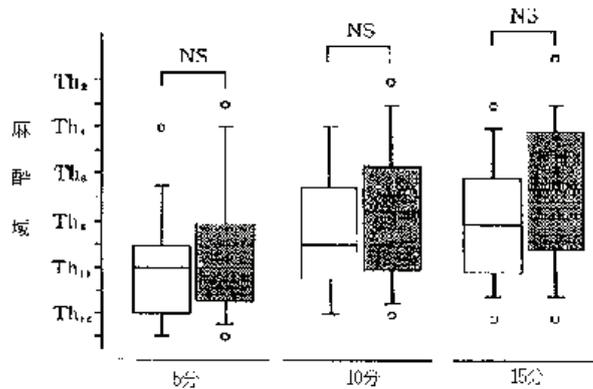


図 0.1%低比重テトカイン注入後の麻酔域

□: 1 群 (60秒で注入) ■: 2 群 (180秒で注入)
 mean ± S.D.

[城山和久, 他, 臨床麻酔, 19(4), 557(1995).]

5) 脊椎麻酔 (0.2%低比重液)⁷⁾

〔対 象〕 ASA II 以下で一側の下肢の手術が予定された患者 72 名

〔投与方法〕 テトカイン 20mg を蒸留水 10mL で溶解し 0.2%溶液とし、手術時間の長さを考慮して必要と思われた場合には、テトカイン溶液 1mL 当たりフェニレフリン (0.5%溶液) を 0.15mg 添加した。テトカイン溶液は 23G 腰椎穿刺針を用いて、第 3~4 腰椎間から膜下穿刺を行い、投与した。

〔評価方法〕 患者を下表の通り 7 群に分け、テトカイン注入に際しての頭低位の角度、初回注入量、注入速度などの条件を変えて麻酔域の広がり、各群間で比較した (表)。

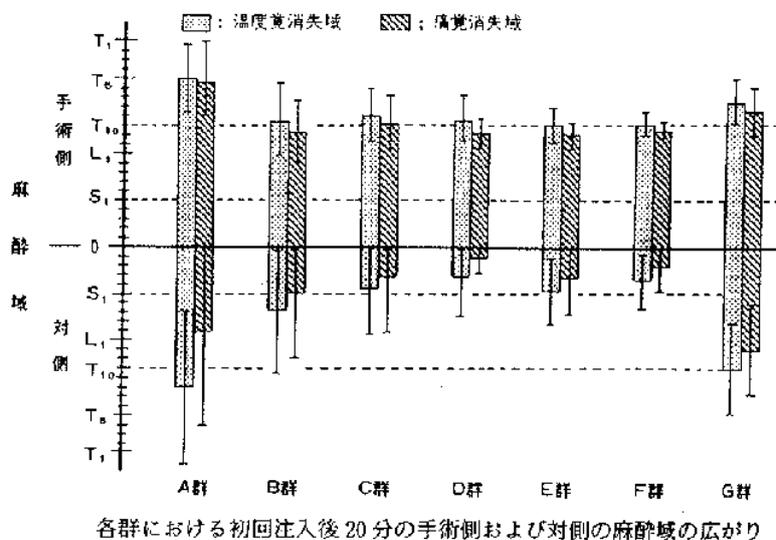
表 各群の頭低位角、初回注入量、注入速度、追加量

群	症例数	頭低位角 (度)	初回注入量 (mL)	注入速度 (mL · s ⁻¹)	追加量* (mL)
A	5	0	5	0.10	0 ± 0
B	9	5	3	0.05	1.6 ± 1.3
C	18	2	3	0.05	0.5 ± 0.7
D	13	2	3	0.10	1.1 ± 0.9
E	7	2	3	0.20	0.7 ± 0.7
F	14	2	5	0.05	0.4 ± 0.9
G	6	2	7	0.05	0 ± 0
計	72	—	—	—	—

(平均値 ± 標準偏差)

*追加量は、初回量に加え、T₁₀までの無痛域を得るために必要としたテトラカイン溶液の量を示す。

〔結果〕 頭低位の角度を2度とし、3~5mLの初回注入とその効果を見た後のわずかな追加注入により、手術側の麻酔域はほぼT₁₀に調節できた。対側の麻酔域はS領域にとどまり、循環動態の変動も少なくすることができた。注入速度の違いは対側の麻酔領域に影響を与えなかった(図)。



[青山和義, 他, 麻酔, 38(11), 1486(1989).]

(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

プロカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩、レボブピバカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩水和物、メピバカイン塩酸塩、リドカイン塩酸塩、ロピバカイン塩酸塩水和物等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

神経細胞の細胞膜の興奮時及び静止時のイオン透過性をいずれも抑制して、神経興奮に必要な脱分極を阻止することにより、神経遮断作用を示す⁸⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

V. 治療に関する項目 3. 臨床成績(2) 臨床効果の項を参照のこと。

(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
蛋白結合率：76%¹⁾

3. 吸収

(1) 吸収部位

脊椎麻酔 : クモ膜下腔
伝達麻酔 : 神経幹
表面麻酔 : 粘膜
硬膜外麻酔 : 硬膜外腔
浸潤麻酔 : 神経末端

[参考]

イヌのくも膜下に注入された高比重テトカインは約 10% が脊髄膜の表面に付着し、薬剤の大部分は髄液中に拡散し、一定の曲線で血中に吸収される (*in vivo*)⁹⁾。

[参考]

イヌにテトラカイン 6mg/kg body weight を 30~60 秒で急速静注したところ、1~2 分で 100 μ g/mL もしくはそれ以上のピークを示した。同量のテトラカインを咽頭の両梨状窩の粘膜表面または気管に投与したところ、4~6 分間で 30 μ g/mL の血中ピークを示した。この場合血中濃度曲線は咽頭投与と気管投与間ではほとんど差がなかった¹⁰⁾。

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

テトラカインはプロカインと同様に血漿中で加水分解され、
p-butylaminobenzoic acid ($C_4H_9NHC_6H_4COOH$) と dimethylaminoethanol [$HOCH_2CH_2N(CH_3)_2$] を生じるが、その分解速度はプロカインより 4~5 倍おそい。またテトラカインの加水分解はプロカインの加水分解と同じく procaine esterase により行われる¹¹⁾。

(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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌】 項 目	○印は各麻酔方法での該当する項目			
	麻酔方法 脊 椎 麻 酔	硬膜外 麻 酔	浸潤、 伝 達 麻 酔	表 面 麻 酔
1. 次の患者又は部位には投与しないこと				
(1) 重篤な出血やショック状態 [重篤な低血圧が起こることがある。]	○	○		
(2) 注射部位又はその周辺の炎症 [化膿性髄膜炎症状を起こすおそれがある。]	○	○		
(3) 敗血症 [敗血症性の髄膜炎を生ずるおそれがある。]	○	○		
(4) 本剤の成分又は安息香酸エステル（コカインを除く）系 局所麻酔剤に対し、過敏症の既往歴のある患者	○	○	○	○
(5) 中枢神経系疾患 髄膜炎、脊髄瘍、灰白脊髄炎等の患者 [脊椎麻酔により症状が悪化するおそれがある。]	○	○		
2. 次の患者には血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと				
(1) 血管収縮剤に対し、過敏症の既往歴のある患者		○	○	○
(2) 高血圧、動脈硬化、心不全、甲状腺機能亢進、糖尿病、 血管痙攣等のある患者 [これらの症状が悪化するおそれがある。]		○	○	○
(3) 耳、指趾又は陰茎の麻酔 [壊死状態になるおそれがある。]			○	

(設定理由)

- 麻酔により血圧が低下するため、循環血液量の減少している状態である出血やショック状態には禁忌である¹²⁾。
 - 穿刺部位に化膿性疾患がある場合、化膿性髄膜炎症状を起こすおそれがある。一般的に外傷、潰瘍面等の炎症部位では吸収が速やかであるので危険である¹²⁾。
 - 体内での防禦機能が低下しているため、敗血症性の髄膜炎を起こすおそれがある。また、循環系の機能も低下しているため禁忌である¹²⁾。
 - 一般に、ある薬剤の投与により過敏症をきたした患者にその薬剤を再投与すると、再び過敏症を発症する可能性が高い。この際、いつも同種の反応を示すとは限らず再投与により重篤なケースに陥いることもある。
 - 脊髄及び脳神経の障害のある患者には症状が悪化する恐れがある¹³⁾。
- 血管収縮剤の再投与により、過敏症を起こす危険性がある。
 - アドレナリンの作用のため、心血管系疾患のある患者では血圧上昇、不整脈をきたし、症状を悪化するおそれがある。
また甲状腺機能亢進症患者では頻脈、息苦しさ、胸痛などの症状を起こすことがある。
糖尿病患者のように末梢血管に疾患のある場合には壊死を起こすおそれがあり、また、血糖上昇作用もあるので禁忌である¹²⁾。
 - 耳、指趾又は陰茎等の終末動脈から血液の供給を受けているような組織にアドレナリン含有溶液を注射すると、壊死状態になるおそれがある¹⁴⁾。

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

○印は各麻酔方法での該当する項目

項 目	麻酔方法			
	脊 椎 麻 酔	硬膜外 麻 酔	浸潤、 伝達 麻酔	表 面 麻 酔
(1) 次の患者には慎重に投与すること				
1) 妊産婦 [妊娠末期は麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。]	○	○		
2) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）	○	○	○	○
3) 若年者 [一般に麻酔範囲が広がりやすい。]	○			
4) 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。]	○	○		
5) 重篤な高血圧症の患者 [低血圧が起こりやすい。]	○	○		
6) 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り、また麻酔の高さの予測も困難である。]	○	○		
(2) 次の患者には血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）との併用を慎重にすること				
1) ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤使用中の患者 [心筋の被刺激性が高まって不整脈が発現しやすい。]		○	○	○
2) 三環系抗うつ剤服用中の患者 [心血管作用の増強がみられることがある。]		○	○	○

（設定理由）

- (1) 1) 妊娠末期は、麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがあるので注意する。
 2) ①一般的に高齢者では生理機能が低下している。
 ②高齢者はしばしば高血圧症又はその他の血管障害があるために、麻酔により血圧が下降するのは望ましくない。また、高齢者は穿刺が非常に難しい¹³⁾。
 3) 一般に麻酔範囲が広がりやすい。
 4) 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。
 5) 高血圧の患者では血圧が下降しやすい¹³⁾。
 6) 脊髄や神経根の損傷のおそれがあり、また、麻酔の拡がりに脊柱の彎曲が関与するので、麻酔の高さの予測も困難である。
- (2) 1) 心筋の被刺激性が高まって不整脈が発現しやすい。
 2) 心血管作用の増強がみられることがある。

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

○印は各麻酔方法での該当する項目

項 目	麻酔方法			
	脊 椎 麻 酔	硬膜外 麻 酔	浸潤、 伝達 麻酔	表 面 麻 酔
(1) 一般に脊椎麻酔の際には血圧が下降しやすいので、次の測定基準により血圧管理を十分に行い、必要に応じて適切な処置を行うこと。 1) 薬液を注入してから1分後に血圧を測定する。 2) それ以降14分間は、2分に1回血圧を測定する。必要があれば（例えば血圧が急速に下降傾向を示すような場合）連続的に血圧を測定する。 3) 薬液注入後15分以上経過した後は、2.5～5分に1回血圧を測定する。があれば（例えば血圧が急速に下降傾向を示すような場合）連続的に血圧を測定する。	○			
(2) まれにショック様症状を起こすことがあるので、局所麻酔剤の使用に際しては、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、ショック様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) バイタルサイン（血圧、心拍数、呼吸、意識レベル）及び麻酔高に注意し、患者の全身状態の観察を十分に行い、必要に応じて適切な処置を行うこと。	○			
2) 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。		○	○	○
3) ショック様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路の確保を行うこと。	○	○		
4) 臍部以上の部位の手術に用いる必要がある場合には、慎重に投与すること。	○			
5) 本剤の比重は一定に調製されているが、患者の脳脊髄液の比重にはかなりの変動があることに留意すること。	○			
6) できるだけ薄い濃度のものを用いること。		○	○	○
7) できるだけ必要最小量にとどめること。		○	○	○
8) 必要に応じて血管収縮剤の併用を考えること。		○	○	
9) 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。		○		
10) 注射の速度はできるだけ遅くすること。		○	○	
11) 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。			○	
12) 注射針が血管に入っていないことを確かめること。			○	

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

1) ショック

ショックがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制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。

2) 中枢神経障害

振戦、痙攣等の中毒症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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)の投与等の適切な処置を行うこと。

副作用発生原因及び処置方法

- 1) 局所麻酔薬による全身の中毒症の98%が、局所麻酔薬の血中濃度増加のために起こるものとされている。更に局所麻酔薬を用いた脊椎麻酔や硬膜外麻酔では交感神経ブロックにより支配領域の血管が拡張し、血圧低下が起り、程度が強ければショックに陥る。また麻酔のレベルが高くなれば、呼吸筋の麻痺が起り虚脱状態となることもある¹⁵⁾。
- 2) 血圧低下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等の症状が現れた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行う。血圧が下降したならばまずトレンドレンプルグ体位をとらせ心拍出量を獲得し、酸素補給、次いで昇圧剤を与える。呼吸抑制の場合もまず第1にトレンドレンプルグ体位、次いで酸素による陽圧呼吸が絶対的に必要である¹⁶⁾。
- 3) 振戦、痙攣等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)の投与等の適切な処置を行う。
- 4) 眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心・嘔吐等があらわれた場合は、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。

(3) 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、悪心・嘔吐 等
過 敏 症	蕁麻疹、浮腫 等

注) 観察を十分に行い、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

蕁麻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。

- 1) 本剤又は安息香酸エステル(コカインを除く)系局所麻酔剤に対し、過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 血管収縮剤(アドレナリン、ノルアドレナリン)に対し、過敏症の既往歴のある患者には血管収縮剤を添加しないこと。
- 3) 局所麻酔剤に対して過敏性を示す人がまれにある。この場合にもっとも重要なのは、患者に十分問診を行うことである(既往歴、家族歴、他剤に対するアレルギーの既往、アレルギー体質等)。また、添加する血管収縮剤に対する過敏性にも注意する^{17)、18)}。

局所麻酔剤に対するアレルギーを予見するための試験法には皮内テスト、プリックテスト、粘膜テスト（鼻内テスト）、Progressive dose testing 等がある¹⁹⁾。

【禁忌】					○印は各麻酔方法での該当する項目				
項目		麻酔方法			脊 椎 麻 酔	硬膜外 麻 酔	浸潤、 伝 達 麻 酔	表 面 麻 酔	
2. 次の患者には血管収縮剤(アドレナリン、ノルアドレナリン)を添加しないこと									
(1)血管収縮剤に対し、過敏症の既往歴のある患者						○	○	○	

【使用上の注意】

重要な基本的注意

○印は各麻酔方法での該当する項目

項目		麻酔方法			脊 椎 麻 酔	硬膜外 麻 酔	浸潤、 伝 達 麻 酔	表 面 麻 酔	
(2)まれにショック様症状を起こすことがあるので、局所麻酔剤の使用に際しては、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、ショック様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)バイタルサイン（血圧、心拍数、呼吸、意識レベル）及び麻酔高に注意し、患者の全身状態の観察を十分に行い、必要に応じて適切な処置を行うこと。					○				
2)患者の全身状態の観察を十分に行うこと。						○	○	○	
3)ショック様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路の確保を行うこと。					○	○			
4)臍部以上の部位の手術に用いる必要がある場合には、慎重に投与すること。					○				
5)本剤の比重は一定に調製されているが、患者の脳脊髄液の比重にはかなりの変動があることに留意すること。					○				
6)できるだけ薄い濃度のもを用いること。						○	○	○	
7)できるだけ必要最小量にとどめること。						○	○	○	
8)必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。						○	○		
9)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。						○			
10)注射の速度はできるだけ遅くすること。						○	○		
11)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。							○		
12)注射針が血管に入っていないことを確かめること。							○		

重大な副作用

1) ショック ショックがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧降下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制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。
--

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

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

該当資料なし

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

局所麻酔剤としては次の通りである²⁰⁾。

(1) 症状

中枢神経系ではまず刺激症状（不安、興奮、混乱、おしゃべり、全身痙攣、血圧上昇、脈拍増加、呼吸数増加、悪心、嘔吐）が出現し、次いで抑制作用（意識消失、血圧下降、脈拍微弱、呼吸停止）が見られる。心血管系への末梢作用として心筋収縮力の低下、徐脈、血管拡張などをきたす。放置しておけば死亡する危険が極めて大である。

(2) 治療法

次の順序で行う。

- 1) 酸素を投与する：これは最初に行うべきもので、マスクとバッグで純酸素を与え、脈、血圧、呼吸の状態をみる。そして症状が進行するようなら、昇圧剤、チオペンタール、筋弛緩剤並びに挿管の道具を用意させる。
- 2) 点滴を開始する：点滴はできれば局所麻酔の前にやっておいた方がよいが、そうしてない時はテフロン針を入れて点滴を行う。
もちろん、この間も酸素の投与は中止してはならない。
- 3) 痙攣をとめる：このためには2.5%チオペンタールを50mg ずつ痙攣がとまるまでゆっくり静注する。これに代わるものとしてはスキサメトニウム40~60mg 静注でもよい。点滴ができていない時は、スキサメトニウム60~100mg 筋注する。なお、ジアゼパム10mg 静注も痙攣の治療に有効である。
- 4) 循環機能の維持：もし、心血管虚脱といった症状であれば血管収縮剤を用いて血圧を正常にあげねばならない。また、心停止があれば体外心マッサージをする必要がある。
- 5) 治療後の観察：治療により患者が回復しても、脳浮腫、呼吸系合併症などの予防に注意する。

14. 適用上の注意

○印は各麻酔方法での該当する項目

項 目	麻 酔 方 法			
	脊 椎 麻 酔	硬 膜 外 麻 酔	浸 潤、 伝 達 麻 酔	表 面 麻 酔
(1) 投与時： 1) 髄液の漏出を最少に防ぐために、脊椎穿刺針は、できるだけ細いものを用いること。（脊椎穿刺により脊麻後頭痛が、また、まれに一過性の外転神経麻痺等があらわれることがある。） なお、必要に応じて輸液を行うこと。	○			
2) 脊椎麻酔により、まれに脊髄神経障害があらわれることがあるので、穿刺に際して患者が放散痛を訴えた場合、脳脊髄液が出ていく場合又は血液混入を認めた場合には、本剤を注入しないこと。	○			
(2) 投与部位 眼科用として投与しないこと。				○

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) イヌの心筋に対し、他の局麻剤と同様、収縮傾向を示した²¹⁾。
 - 2) イヌで著明なナトリウム排泄作用を示した²²⁾。
 - 3) カエルでは骨格筋収縮とともにカルシウムの流出が抑制された²³⁾。
 - 4) ウサギで血糖上昇作用を示した²⁴⁾。
- (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

	LD ₅₀ (mg/kg)
	静脈内
マウス ²⁵⁾	6.4
ウサギ ²⁶⁾	4.3

- (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)}

注)：注意一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

沸騰、加圧滅菌に耐えるが、アルカリに合うと、Free Base が析出するので注射器具等のアルカリ性煮沸滅菌を行ってはならない。

(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

1 バイアル 20mg 10 バイアル

7. 容器の材質

無色透明のガラスバイアル

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同 効 薬：プロカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩、レボブピバカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩水和物、メピバカイン塩酸塩、リドカイン塩酸塩、ロピバカイン塩酸塩水和物等

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

製造承認年月日：2008年9月4日

製造承認番号：22000AMX01923000

本剤は1959年8月27日長薬第5806号で承認、同年8月30日発売（1961年1月1日薬価基準収載）されたが、1971年第8改正日本薬局方収載に伴い、製造承認不要とされた。その後、第9改正日本薬局方の制定（1976年4月1日）により日本薬局方から削除されたため、新たに製造承認を取り直した。さらに、2008年12月、名称変更に伴う薬価基準収載を実施した。

11. 薬価基準収載年月日

2008年12月19日（旧名称バイアル：2008年7月4日、旧名称テトカイン「杏林」：1977年10月1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：1974年11月20日（その3）

内容：カテゴリー1（変化なし）

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
テトカイン注用20mg「杏林」	118750201	1211400D2031	620008888

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 横山和子著, 臨床医のための脊椎麻酔 改訂新版, 第2版, HBJ 出版局, 東京, 1991, P. 66~87.
- 2) 益田律子, 他, 麻酔, 44, 1527(1995).
- 3) 早稲田直子, 他, 臨床麻酔, 14(6), 865(1990).
- 4) 佐藤重仁, 他, 麻酔, 31(10), 1072(1982).
- 5) 畠山廉英, 他, 麻酔, 36(6), 995(1987).
- 6) 城山和久, 他, 臨床麻酔, 19(4), 557(1995).
- 7) 青山和義, 他, 麻酔, 38(11), 1486(1989).
- 8) 田中 潔編, 現代の薬理学, 改訂第15版, 金原出版, 東京, 1988, P165.
- 9) 佐藤昭胤, 麻酔, 14, 1127(1965).
- 10) John, Adriani, et al., J. Am. Med. Assoc., 162, 1527(1956).
- 11) 第十五改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2006, C-2628.
- 12) 中野眞汎, 医薬品の使用禁忌とその理由, 医薬ジャーナル社, 東京, 1987, P38.
- 13) 横山和子著, 臨床医のための脊椎麻酔 改訂新版, 第2版, HBJ 出版局, 東京, 1991, P. 13~14.
- 14) 藤原元始, 他, グッドマンギルマン薬理書第8版, 廣川書店 東京, 1992, P367.
- 15) 菅井直介, 月刊薬事, 19(5), 29(1977).
- 16) 古川幸道, 産科と婦人科, 27(9), 9(1960).
- 17) 北原哲夫, 日本医事新報, 2982, 110(1981).
- 18) 岡田和夫, 日本医事新報, 3065, 126(1983).
- 19) 佐々木和郎, 日本医事新報, 3357, 129(1988).
- 20) 吉利 和, 他, 薬剤による副作用, 武田薬品工業(株), 1975, P132.
- 21) Stewart, D. M., et al., Anesthesiology 24(5), 620(1963).
- 22) Hook, J. B., et al., Arch. int. Pharmacodyn., 150(1-2), 85(1964).
- 23) Feinstein, M. B., J. Ger. Physiol., 47, 151(1963).
- 24) 小池正之, 大阪医学雑誌, 35, 1615(1936).
- 25) Schmidt, J. L., et al., Toxic. Appl. Pharmacol., 1, 454(1959).
- 26) Astrom, A., et al., J. Pharm. Exp. Ther., 132, 87(1961).

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

カナダ、アメリカ、ドイツ、スイス、他

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

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