

* *2018年9月改訂 (第10版)
*2016年9月改訂

局所麻酔剤

日本標準商品分類番号
871214

ルアーフィット
ポリエチレンボトル

*日本薬局方 メピバカイン塩酸塩注射液

J・P Mepivacaine Hydrochloride Injection

0.5%塩酸メピバカイン注PB

1%塩酸メピバカイン注PB

2%塩酸メピバカイン注PB

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)

貯法: 室温保存

使用期限: 3年 (外箱に記載)

注 意: 【取扱上の注意】の項参照

	0.5%	1%	2%
承認番号	21500AMZ00250	21500AMZ00251	21500AMZ00252
薬価収載	2003年7月		
販売開始	2003年10月		

【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

項目	麻酔方法 (○印は各麻酔方法での該当する項目)	
	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
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。]	○	-
4. 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	○	○

【組成・性状】

0.5%塩酸メピバカイン注PB、1%塩酸メピバカイン注PB及び2%塩酸メピバカイン注PBは、1管中に次の成分を含有する、無色澄明の液である。

容量	0.5%		1%		2%	
	5mL	10mL	5mL	10mL	5mL	10mL
日局 メピバカイン塩酸塩	25mg	50mg	50mg	100mg	100mg	200mg
添加物	等張化剤、pH調整剤					
pH	4.5~6.8					
浸透圧比 (生理食塩液 に対する比)	1.0~1.2		1.1~1.3		1.2~1.4	

また、本剤は、ポリエチレン容器に充填した水性注射剤である。

【効能・効果】

硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔

【用法・用量】

メピバカイン塩酸塩として、通常成人には次の用量を使用する。なお、メピバカイン塩酸塩の基準最高用量は、それぞれ1回500mgである。

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。

麻酔方法別の用量: メピバカイン塩酸塩として、通常成人には次記量を使用する。()内は注射液としての用量である。

麻酔方法	0.5%	1%	2%
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)
指趾神経遮断	20~40mg (4~8mL)	40~80mg (4~8mL)	80~160mg (4~8mL)
肋間神経遮断	25mg (5mL)	-	-
交感神経遮断	25mg (5mL)	-	-
浸潤麻酔	10~200mg (2~40mL)	20~400mg (2~40mL)	40~400mg (2~20mL)

【使用上の注意】

項目	麻酔方法 (○印は各麻酔方法での該当する項目)		硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
	0.5%	1%・2%		
1. 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)			○	-
(1) 中枢神経系疾患: 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患者 [硬膜外麻酔により病状が悪化するおそれがある。]				
(2) 血液凝固障害や抗凝血薬投与中の患者 [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ので、やむを得ず投与する場合は観察を十分に行うこと。]				
(3) 脊柱に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、また麻酔範囲の予測も困難であるので、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。]				
(4) 妊産婦 (「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)				
(5) 腹部腫瘍のある患者 [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ので、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。]				
(6) 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 [血圧低下や病状の悪化が起こりやすいため、患者の全身状態の観察を十分に行うこと。]				
(7) 高齢者 (「高齢者への投与」及び「重要な基本的注意」の項参照)				
(8) 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。] (「重要な基本的注意」の項参照)				
(9) 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。]				
(10) 重篤な肝機能障害又は腎機能障害のある患者 [中毒症状が発現しやすくなる。]				
2. 重要な基本的注意			○	○
(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。				
(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、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) できるだけ薄い濃度のものを用いること。				
3) できるだけ必要最小量にとどめること。				
4) 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。				
5) 注射の速度はできるだけ遅くすること。				
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。				

項目	麻酔方法 (○印は各麻酔方法での該当する項目)	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
7) 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) 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 に注意すること。	○		—
9) 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。	—		○
10) 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。	○		○
(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。	○		○
(4) 球後麻酔、眼球周囲麻酔施行時は次の諸点に留意すること。 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、必要な場合のみ使用すること。 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。	—		○
(5) 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。	○		○

3. 相互作用

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。

4. 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) 重大な副作用 (頻度不明)

- ショック**：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、適切な処置を行うこと。
- 意識障害、振戦、痙攣**：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、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、適切な処置を行うこと (「過量投与」の項参照)。
- 異常感覚、知覚・運動障害**：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。

(2) その他の副作用

	頻度不明
中枢神経 ^{①)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等
消化器 ^{②)}	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ので、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。

項目	麻酔方法 (○印は各麻酔方法での該当する項目)	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔
5. 高齢者への投与 一般に高齢者では、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ため、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。		○	—
6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 (1) 妊婦等 ：妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕		○	○
(2) 妊産婦 ： 1) 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。〕 (「慎重投与」の項参照)		○	—
2) 頸動脈ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。		—	○ ^{③)}

注) 伝達麻酔

7. 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。

8. 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。

徴候、症状：

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。

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。

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。

9. その他の注意

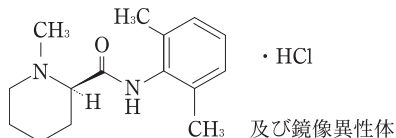
- ポルフィリン症の患者に投与した場合、急性腹症、四肢麻痺、意識障害等の急性症状を誘発するおそれがある。
- 因果関係は明らかでないが、外国において術後に本剤を関節内 (特に肩関節) に持続投与された患者で軟骨融解が発現したとの報告がある。

【薬効薬理】¹⁾

メピバカイン塩酸塩は神経細胞膜のNa⁺チャネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制するという局所麻酔薬共通の作用により、知覚神経の求心性伝導を抑制する。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：メピバカイン塩酸塩 (Mepivacaine Hydrochloride)
化学名：(2RS)-N-(2,6-Dimethylphenyl)-1-methylpiperidine-2-carboxamide monohydrochloride
分子式：C₁₅H₂₂N₂O・HCl
分子量：282.81
構造式：



性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。水又はメタノールに溶けやすく、酢酸(100)にやや溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくい。
本品の水溶液(1→10)は旋光性を示さない。
融点：約256℃(分解)

【取扱い上の注意】

1. 取扱い上の注意

- (1) 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、使用後十分に水洗すること。
- (2) 容器を開封後、直ちに使用し、残液は廃棄すること。

2. 安定性試験²⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6カ月)の結果、0.5%塩酸メピバカイン注PB、1%塩酸メピバカイン注PB及び2%塩酸メピバカイン注PBは、室温保存において3年間安定であることが推測された。

また、最終包装製品を用いた長期保存試験(室温保存、3年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、0.5%塩酸メピバカイン注PB、1%塩酸メピバカイン注PB及び2%塩酸メピバカイン注PBの室温保存における3年間の安定性が確認された。

**【包装】

(ルアーフィットポリエチレンボトル)

0.5%塩酸メピバカイン注PB	5mL (0.5%)	50管
	10mL (0.5%)	50管
1%塩酸メピバカイン注PB	5mL (1%)	50管
	10mL (1%)	50管
2%塩酸メピバカイン注PB	5mL (2%)	10管
	10mL (2%)	10管

【主要文献】

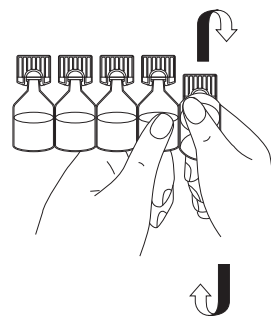
- 1) 第十七改正日本薬局方解説書、C-5506、廣川書店(2016)
- 2) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

【文献請求先】

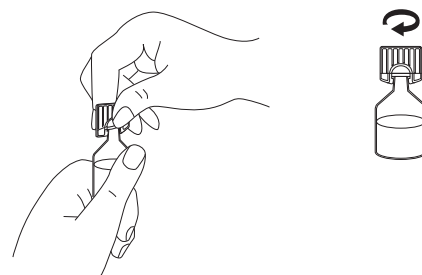
主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。
日新製薬株式会社 安全管理部
〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号
TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419
E-mail: d-info@yg-nissin.co.jp

ポリエチレン容器の使用法

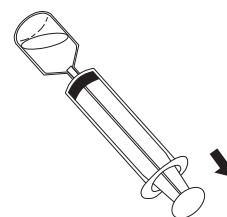
- ①ポリエチレン容器の結合部分をねじって切り離して下さい。



- ②頭部をねじ切って下さい。



- ③注射筒をセットし、直接吸引することもできます。吸引しにくい場合は、容器を押して下さい。



製造販売元

日新製薬株式会社

山形県天童市清池東二丁目3番1号