

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

局所麻酔剤

注射用テトラカイン塩酸塩

テトカイン[®]注射用20mg「杏林」TETOCAINE[®] Injection 20mg KYORIN

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・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2008年9月4日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2008年12月19日（販売名変更による） 販売開始年月日：1959年8月30日
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 https://www.kyorin-pharm.co.jp/prodinfo/

本 I F は 2024 年 5 月 改 訂 の 電 子 添 文 の 記 載 に 基 づ き 作 成 し た。

最新の情報、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。



(01)14987060007107



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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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 (<https://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I F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I F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、「I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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「X II. 参考資料」、「X III. 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・表現には薬機法の広告規則や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、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を活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)注射剤の調製法	7
1. 開発の経緯	1	(2)溶解後の安定性	7
2. 製品の治療学的特性	1	8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8
3. 製品の製剤学的特性	1	9. 溶出性	8
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	10. 容器・包装	9
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	(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	9
(1)承認条件	2	(2)包装	9
(2)流通・使用上の制限事項	2	(3)予備容量	9
6. RMPの概要	2	(4)容器の材質	9
II. 名称に関する項目	3	11. 別途提供される資材類	9
1. 販売名	3	12. その他	9
(1)和名	3	V. 治療に関する項目	10
(2)洋名	3	1. 効能又は効果	10
(3)名称の由来	3	2. 効能又は効果に関連する注意	10
2. 一般名	3	3. 用法及び用量	10
(1)和名(命名法)	3	(1)用法及び用量の解説	10
(2)洋名(命名法)	3	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	10
(3)ステム(stem)	3	4. 用法及び用量に関連する注意	10
3. 構造式又は示性式	3	5. 臨床成績	11
4. 分子式及び分子量	3	(1)臨床データパッケージ	11
5. 化学名(命名法)又は本質	3	(2)臨床薬理試験	11
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	(3)用量反応探索試験	11
III. 有効成分に関する項目	4	(4)検証的試験	11
1. 物理化学的性質	4	(5)患者・病態別試験	11
(1)外観・性状	4	(6)治療的使用	13
(2)溶解性	4	(7)その他	13
(3)吸湿性	4	VI. 薬効薬理に関する項目	14
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	4	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	14
(5)酸塩基解離定数	4	2. 薬理作用	14
(6)分配係数	4	(1)作用部位・作用機序	14
(7)その他の主な示性値	4	(2)薬効を裏付ける試験成績	14
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(3)作用発現時間・持続時間	14
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	VII. 薬物動態に関する項目	15
IV. 製剤に関する項目	5	1. 血中濃度の推移	15
1. 剤形	5	(1)治療上有効な血中濃度	15
(1)剤形の区別	5	(2)臨床試験で確認された血中濃度	15
(2)製剤の外観及び性状	5	(3)中毒域	15
(3)識別コード	5	(4)食事・併用薬の影響	15
(4)製剤の物性	5	2. 薬物速度論的パラメータ	15
(5)その他	6	(1)解析方法	15
2. 製剤の組成	6	(2)吸収速度定数	15
(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤	6	(3)消失速度定数	15
(2)電解質等の濃度	6	(4)クリアランス	15
(3)熱量	6	(5)分布容積	15
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	(6)その他	15
4. 力価	6	3. 母集団(ポピュレーション)解析	15
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	(1)解析方法	15
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	(2)パラメータ変動要因	15
7. 調製法及び溶解後の安定性	7	4. 吸収	16

5. 分布.....	16	(1)単回投与毒性試験.....	24
(1)血液－脳関門通過性.....	16	(2)反復投与毒性試験.....	24
(2)血液－胎盤関門通過性.....	16	(3)遺伝毒性試験.....	24
(3)乳汁への移行性.....	16	(4)がん原性試験.....	24
(4)髄液への移行性.....	16	(5)生殖発生毒性試験.....	24
(5)その他の組織への移行性.....	16	(6)局所刺激性試験.....	24
(6)血漿蛋白結合率.....	16	(7)その他の特殊毒性.....	24
6. 代謝.....	16	X. 管理的事項に関する項目.....	25
(1)代謝部位及び代謝経路.....	16	1. 規制区分.....	25
(2)代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率.....	16	2. 有効期間.....	25
(3)初回通過効果の有無及びその割合.....	16	3. 包装状態での貯法.....	25
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率.....	16	4. 取扱い上の注意.....	25
7. 排泄.....	17	5. 患者向け資材.....	25
8. トランスポーターに関する情報.....	17	6. 同一成分・同効薬.....	25
9. 透析等による除去率.....	17	7. 国際誕生年月日.....	25
10. 特定の背景を有する患者.....	17	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.....	26
11. その他.....	17	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.....	26
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目.....	18	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	26
1. 警告内容とその理由.....	18	11. 再審査期間.....	26
2. 禁忌内容とその理由.....	18	12. 投薬期間制限に関する情報.....	26
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由.....	18	13. 各種コード.....	26
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由.....	19	14. 保険給付上の注意.....	26
5. 重要な基本的注意とその理由.....	19	XI. 文献.....	27
6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	20	1. 引用文献.....	27
(1)合併症・既往歴等のある患者.....	20	2. その他の参考文献.....	27
9.1 合併症・既往歴等のある患者.....	20	XII. 参考資料.....	28
(2)腎機能障害患者.....	20	1. 主な外国での発売状況.....	28
(3)肝機能障害患者.....	20	2. 海外における臨床支援情報.....	28
(4)生殖能を有する者.....	20	XIII. 備考.....	29
(5)妊婦.....	21	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.....	29
(6)授乳婦.....	21	(1)粉碎.....	29
(7)小児等.....	21	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性.....	29
(8)高齢者.....	21	2. その他の関連資料.....	29
7. 相互作用.....	21		
(1)併用禁忌とその理由.....	21		
(2)併用注意とその理由.....	21		
8. 副作用.....	21		
(1)重大な副作用と初期症状.....	21		
(2)その他の副作用.....	22		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	22		
10. 過量投与.....	22		
11. 適用上の注意.....	23		
12. その他の注意.....	23		
(1)臨床使用に基づく情報.....	23		
(2)非臨床試験に基づく情報.....	23		
IX. 非臨床試験に関する項目.....	24		
1. 薬理試験.....	24		
(1)薬効薬理試験.....	24		
(2)安全性薬理試験.....	24		
(3)その他の薬理試験.....	24		
2. 毒性試験.....	24		

略語集

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

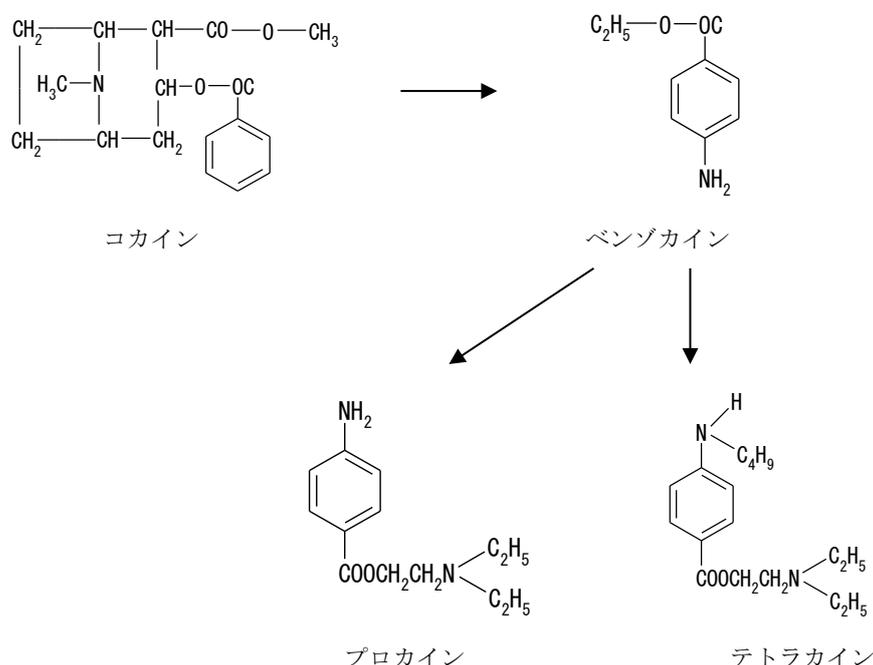
1. 開発の経緯

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、リドカインやピブバカイン等がある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月にテトカイン®注用20mg「杏林」と販売名を変更した。

2023年5月に製造販売中止を案内し、2024年3月31日に経過措置期間を満了した。

2. 製品の治療学的特性

エステル型の局所麻酔薬である。

（「II. 3. 構造式又は示性式」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

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。

（「IV. 7. 調製法及び溶解後の安定性」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

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)

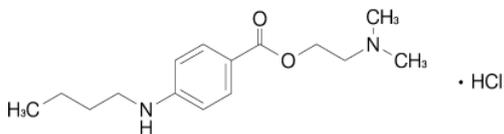
Tetracaine Hydrochloride (JAN、USAN)

Tetracaine (INN)

(3) ステム(stem)

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: $C_{15}H_{24}N_2O_2 \cdot HCl$

分子量: 300.82

5. 化学名(命名法)又は本質

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

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、舌を麻痺させる。
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℃

(5) 酸塩基解離定数

$pK_{a1} = 2.16 \pm 0.05$ （室温 24℃、UV 法）

$pK_{a2} = 8.11 \pm 0.4$ （室温 24℃、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	pH 7.0 Britton Robinson 緩衝液	2.1

(24℃)

(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、pH 5.4 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、定量法

1) 確認試験法

日本薬局方テトラカイン塩酸塩の確認試験による。

2) 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

本剤は用時溶解して用いる凍結乾燥注射剤である。

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	テトカイン®注用 20mg 「杏林」
色調・性状	白色の粉末又は塊
外観	無色透明のガラスバイアル

表 各種溶解液を使用して本剤を溶解したときの性状

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	(+)			
	0.2%	5.5±1.0	約 1				
	2%	5.5±1.0	約 1				

※：生理食塩液に対する比。

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

本剤は pH 5.4~7.5 で安定である。

本剤の水溶液 (1→200) の pH は、5.0~6.0 である。

IV. 製剤に関する項目

(5) その他

窒素置換

表 本剤の密度、比重、baricity

	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 ±0.0003	—	1.0070 ±0.0003	—	1.0000

※：baricity²⁾：ヒト髄液密度に対する溶液密度の比であり、37℃の髄液密度を1.0003g/mLとした。

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	テトカイン [®] 注用 20mg 「杏林」
有効成分 (1バイアル中)	日局 テトラカイン塩酸塩 20mg

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当しない

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

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]

アンプル容器

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

7. 調製法及び溶解後の安定性

(1) 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）又は生理食塩液（等比重溶解液）を使用し、所定の濃度に調製する。

(2) 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

IV. 製剤に関する項目

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°C)	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

8. 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 又は 変化点 pH	移 動 指 数	変 化 所 見	希釈試験								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 —	—	—	—	
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 —	—	—	—	
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 —	—	—	—	

*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、一般名又は成分単位/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、次に最終又は変化点 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。

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
該当しない

(2) 包装
10 バイアル

(3) 予備容量
該当しない

(4) 容器の材質
無色透明のガラス

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

4. 効能又は効果

脊椎麻酔（腰椎麻酔）、浸潤麻酔、硬膜外麻酔、伝達麻酔、表面麻酔

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

6. 用法及び用量

使用に際し、目的濃度の水性注射液または水性液として、使用する。

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）〉

テトラカイン塩酸塩として、通常成人には下記量を使用する。

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

〈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。

〈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。

〈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。

(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

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(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

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

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/秒の速度で注入した。

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 Th_3-Th_4 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。

2) 脊椎麻痺 (0.5%高比重液)⁴⁾

対 象 : 下肢及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した。

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

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 $L_2\sim_3/L_3\sim_4$ 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 を注入した。

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 $T_6\sim T_{12}$ であった。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・嘔吐の他には認められなかった。

V. 治療に関する項目

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)。

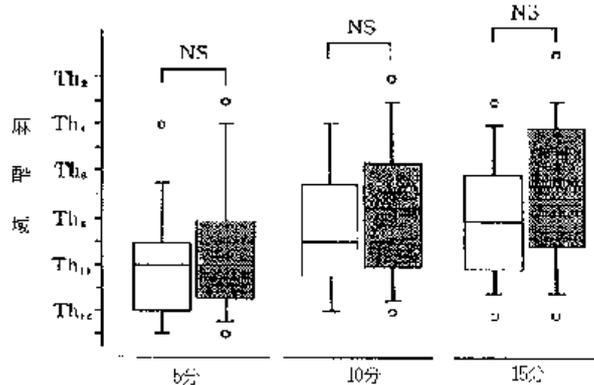


図 0.1%低比重液テトカイン注入後の麻酔域

□：1群 (60秒で注入)
mean ± S.D.

■：2群 (180秒で注入)

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 腰椎間からくも膜下穿刺を行い、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をも、各群間で比較した (下表)。

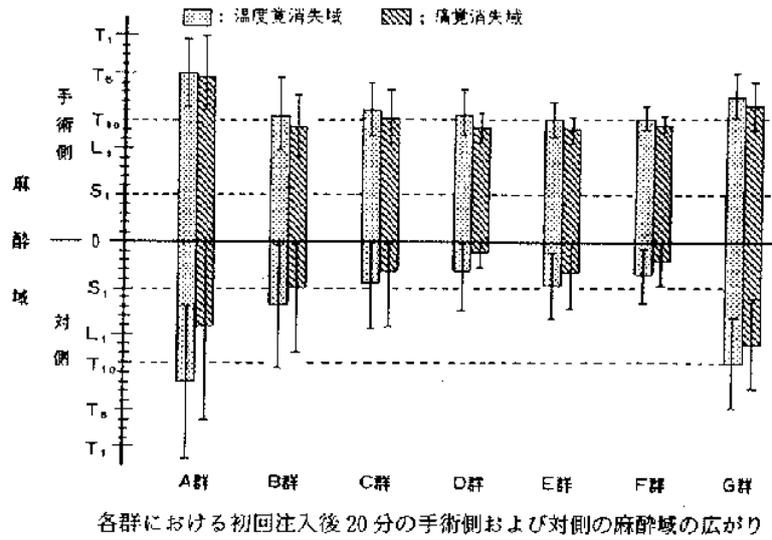
表 各群の頭低位角、初回注入量、注入速度、追加量

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 (下図)。



(6) 治療的使用

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

局所麻酔剤

一般名

エステル型：プロカイン塩酸塩

アミド型：リドカイン塩酸塩、メピバカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩水和物、レボブピバカイン塩酸塩、ロピバカイン塩酸塩水和物、ジブカイン塩酸塩 等

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は最新の電子添文を参照すること。

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

該当資料なし

(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

- (1) 治療上有効な血中濃度
該当資料なし
- (2) 臨床試験で確認された血中濃度
該当資料なし
- (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
該当資料なし
- (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
該当しない

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

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]

- ①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⁾。
- ②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又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⁾。

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

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

(6) 血漿蛋白結合率

蛋白結合率 : 76%¹⁾

6. 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プロカインエステラーゼによって加水分解されて、p-butylaminobenzoic acid (C₄H₉NHC₆H₄COOH) と dimethylaminoethanol (HOCH₂CH₂N(CH₃)₂) を生じるが、その分解速度はプロカインより4~5倍遅い¹¹⁾。

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

該当しない

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
〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）及び硬膜外麻酔〉

2.2 重篤な出血やショック状態の患者 [重篤な低血圧が起こることがある。]

2.3 注射部位又はその周辺の炎症部位 [化膿性髄膜炎症状を起こすおそれがある。]

2.4 敗血症の患者 [敗血症性の髄膜炎を生ずるおそれがある。]

2.5 中枢神経系疾患（髄膜炎、脊髄癆、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。]

〈硬膜外麻酔、浸潤麻酔、伝達麻酔及び表面麻酔〉

2.6 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。

2.6.1 血管収縮剤に対し、過敏症の既往歴のある患者

2.6.2 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。]

〈浸潤麻酔及び伝達麻酔〉

2.7 耳、指趾又は陰茎の麻酔には血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと。[壊死状態になるおそれがある。]

[解説]

2.1：一般に、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ることもある。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。

2.2：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⁾。

2.3：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⁾。

2.4：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⁾。

2.5：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⁾。

2.6.1：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。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。

2.6.2：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、症状を悪化させるおそれがある。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⁾。

2.7：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

設定されていない

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、患者の全身状態の観察を十分に行い、常時、直ちに救急処置のとれる準備が望ましい。[8.2、8.3、8.10、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、ショック様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、8.3、8.10、11.1.1 参照]

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）〉

8.3 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。[8.1、8.2、11.1.1 参照]

8.4 一般に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。

- ・薬液を注入してから1分後に血圧を測定する。

- ・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。

- ・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。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。

8.5 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、必要に応じて適切な処置を行うこと。

8.6 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。

8.7 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。

8.8 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。

8.9 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、脳脊髄液が出にくい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。

〈硬膜外麻酔〉

8.10 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。[8.1、8.2、11.1.1 参照]

8.11 できるだけ薄い濃度のものを用いること。

8.12 できるだけ必要最少量にとどめること。

8.13 注射の速度はできるだけ遅くすること。

8.14 必要に応じて血管収縮剤の併用を考えること。

8.15 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。

〈浸潤麻酔、伝達麻酔〉

8.16 できるだけ薄い濃度のものを用いること。

8.17 できるだけ必要最少量にとどめること。

8.18 注射の速度はできるだけ遅くすること。

8.19 必要に応じて血管収縮剤の併用を考えること。

8.20 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。

8.21 注射針が、血管に入っていないことを確かめること。

〈表面麻酔〉

8.22 できるだけ薄い濃度のものを用いること。

8.23 できるだけ必要最少量にとどめること。

[解説]

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^{15)、16)}。

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¹⁷⁾。

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. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）及び硬膜外麻酔〉

9.1.1 血液疾患や抗凝血剤治療中の患者

血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある。出血しやすい。

9.1.2 重篤な高血圧症の患者

低血圧が起こりやすい。

9.1.3 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。

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）〉

9.1.4 若年者

一般に麻酔範囲が拡がりやすい。

〈浸潤麻酔、硬膜外麻酔、伝達麻酔及び表面麻酔〉

9.1.5 血管収縮剤（カテコールアミン）の併用に対する注意が必要な患者

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。

[解説]

9.1.1：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。

9.1.2：高血圧の患者では血圧が下降しやすい¹³⁾。

9.1.3：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。

9.1.4：一般に麻酔範囲が拡がりやすい。

9.1.5(1)：心筋の被刺激性が高まって不整脈が発現しやすい。

9.1.5(2)：心血管作用の増強がみられることがある。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(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。

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）及び硬膜外麻酔〉

9.5.2 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。

[解説]

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。妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。

9.5.2：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。

(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

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

[解説]

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。

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⁾。

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

設定されていない

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）

血圧降下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等があらわれることがある。[8.1-8.3、8.10 参照]

11.1.2 中枢神経障害（頻度不明）

振戦、痙攣等の中毒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。

[解説]

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反応の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、

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

血圧低下が起こり、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、呼吸筋の麻痺が起こり虚脱状態となることもある¹⁸⁾。

- ②血圧降下、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¹⁹⁾。

- 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。

(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	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心・嘔吐
過敏症	蕁麻疹、浮腫

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

設定されていない

[参考]

局所麻酔剤としては、次のとおりである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。

11. 適用上の注意

- 14. 適用上の注意
- 14.1 薬剤投与時の注意
〈表面麻酔〉
- 14.1.1 投与部位
眼科用として投与しないこと。

12. その他の注意

- (1) 臨床使用に基づく情報
設定されていない
- (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

該当資料なし

(2) 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⁾。

(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

	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) 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

5年

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

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。

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

その他の患者向け資材：なし

6. 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、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

7. 国際誕生年月日

不明

X. 管理的事項に関する項目

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

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 テトカイン®「杏林」	1976年12月24日	(51AM) 1008	1977年12月1日	1959年8月30日
販売名変更 テトカイン®注用 20mg「杏林」	2008年9月4日	22000AMX01923000	2008年12月19日*	—

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。

また、本剤は2023年5月に製造販売中止を案内し、2024年3月31日に経過措置期間を満了した。

※：バイアル品としての薬価収載日：2008年7月4日

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

再評価

公表日：1974年11月20日（その3）

内 容：カテゴリー1（変化なし）

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は投薬期間に関する制限は定められていない。

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

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 島井信子, 臨床医のための脊椎麻酔 改訂新版, HBJ 出版局: 1991. p66-87.
- 2) 益田律子ら, 麻酔, 1995; 44: 1527-1532.
- 3) 早稲田直子ら, 臨床麻酔, 1990; 14(6): 865-867.
- 4) 佐藤重仁ら, 麻酔, 1982; 31(10): 1072-1076.
- 5) 畠山廉英ら, 麻酔, 1987; 36(6): 995-995.
- 6) 城山和久ら, 臨床麻酔, 1995; 19(4): 557-558.
- 7) 青山和義ら, 麻酔, 1989; 38(11): 1486-1491.
- 8) 田中 潔編, 現代の薬理学 改訂第 15 版, 金原出版: 1988. p163-166.
- 9) 佐藤昭胤, 麻酔, 1965; 14: 1127-1133.
- 10) Adriani J., et al., J. Am. Med. Assoc., 1956; 162: 1527-1530. (PMID: 24544163)
- 11) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店. 2021 :C-3371-3373
- 12) 中野眞汎ら, 医薬品の使用禁忌とその理由, 医薬ジャーナル社: 1987. p38-38.
- 13) 横山和子, 臨床医のための脊椎麻酔 改訂新版, HBJ 出版局: 1991. p13-14.
- 14) 藤原元始ら, グッドマン・ギルマン薬理書 第 8 版, 廣川書店; 1992. p367-376.
- 15) 北原哲夫, 日本医事新報, 1981; 2982: 140-140.
- 16) 岡田和夫, 日本医事新報, 1983; 3065: 126-127.
- 17) 佐々木和郎, 日本医事新報, 1988; 3357: 129-130.
- 18) 菅井直介, 月刊薬事, 1977; 19(5): 741-744.
- 19) 古川幸道, 産科と婦人科, 1960; 27(9): 1093-1103.
- 20) 吉利 和ら, 薬剤による副作用, 武田薬品工業(株):1975. p132-136.
- 21) Stewart D.M., et al., Anesthesiology, 1963; 24(5): 620-624. (PMID:14063758)
- 22) Hook J.B., et al., Arch. Int. Pharmacodyn. Ther., 1964; 150: 85-95. (PMID:14204509)
- 23) Feinstein M.B., J. General. Physiology., 1963; 47: 151-172. (PMID:14060443)
- 24) 小池正之, 大阪医学, 1936; 35: 1615-1619.
- 25) Schmidt J.L., et al., Toxic. Appl. Pharmacol., 1959; 1: 454-461. (PMID:14443070)
- 26) Astrom A., et al., J. Pharmacol. Exp. Ther., 1961; 132: 87-90. (PMID:13684888)

2. その他の参考文献

なし

X II. 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

該当資料なし

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

弊社インターネットサイト

- ・医療従事者向けサイト（電子添文、インタビューフォーム、剤形写真、お知らせ、製品コード等）
<https://www.kyorin-pharm.co.jp/prodinfo/>

製造販売元
杏林製薬株式会社
東京都千代田区大手町一丁目3番7号