

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（1998年9月）に準拠して作成



剤形	顆粒剤
規格・含量	ロバキシン®：1g中 900mg
一般名	和名：メトカルバモール（JAN） 洋名：methocarbamol（JAN）
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造・輸入承認年月日：1961年 7月 18日 薬価基準収載年月日：1963年 1月 1日 発売年月日：1962年 2月 16日
開発・製造・ 輸入・発売・提携・ 販売会社名	製造販売元：あすか製薬株式会社 販売：武田薬品工業株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

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

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（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）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成 10 年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けと IF 記載要領が策定された。

2. IF とは

IF は「医療用医薬品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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報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。

3. IF の様式・作成・発行

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で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。

IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

4. IF の利用にあたって

IF 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。MR へのインタビューで調査・補足する必要がある項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床成績等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。

なお、適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な海外での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の特徴及び有用性	1
名称に関する項目	
1. 販売名	2
1-1 和名	2
1-2 洋名	2
1-3 名称の由来	2
2. 一般名	2
2-1 和名(命名法)	2
2-2 洋名(命名法)	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
有効成分に関する項目	
1. 有効成分の規制区分	3
2. 物理化学的性質	3
2-1 外観・性状	3
2-2 溶解性	3
2-3 吸湿性	3
2-4 融点(分解点)、沸点、凝固点	3
2-5 酸塩基解離定数	3
2-6 分配係数	3
2-7 その他の主な示性値	3
3. 有効成分の各種条件下における安定性	3
4. 有効成分の確認試験法	4
5. 有効成分の定量法	4
製剤に関する項目	
1. 剤形	5
1-1 剤形の区別及び性状	5
1-2 製剤の物性	5
1-3 識別コード	5
1-4 pH、浸透圧比、粘度、比重、 無菌の旨及び安定なpH域等	5
1-5 酸価、ヨウ素価等	5
2. 製剤の組成	5
2-1 有効成分(活性成分)の含量	5
2-2 添加物	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
4. 製剤の各種条件下における安定性	5
5. 調製法及び溶解後の安定性	6
6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	6
7. 混入する可能性のある夾雑物	6
8. 溶出試験	6
9. 生物学的試験法	7
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
11. 製剤中の有効成分の定量法	7
12. 力価	8
13. 容器の材質	8
14. その他	8
治療に関する項目	
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9
3. 臨床成績	9
3-1 臨床効果	9
3-2 臨床薬理試験: 忍容性試験	9
3-3 探索的試験: 用量反応探索試験	9
3-4 検証的試験	9
3-5 治療的使用	10
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	11
2. 薬理作用	11
2-1 作用部位・作用機序	11
2-2 薬効を裏付ける試験成績	11
薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	12
1-1 治療上有効な血中濃度	12
1-2 最高血中濃度到達時間	12
1-3 通常用量での血中濃度	12
1-4 中毒症状を発現する血中濃度	12
2. 薬物速度論的パラメータ	12
2-1 吸収速度定数	12
2-2 バイオアベイラビリティ	13
2-3 消失速度定数	13
2-4 クリアランス	13

2 - 5	分布容積	13
2 - 6	血漿蛋白結合率	13
3.	吸 収	13
4.	分 布	13
4 - 1	血液 - 脳関門通過性	13
4 - 2	胎児への移行性	13
4 - 3	乳汁中への移行性	13
4 - 4	髄液への移行性	13
4 - 5	その他の組織への移行性	13
5.	代 謝	14
5 - 1	代謝部位及び代謝経路	14
5 - 2	代謝に関する酵素 (CYP450等) の分子種	14
5 - 3	初回通過効果の有無及びその割合	14
5 - 4	代謝物の活性の有無及び比率	14
5 - 5	活性代謝物の速度論的パラメータ	14
6.	排 泄	14
6 - 1	排泄部位	14
6 - 2	排泄率	14
6 - 3	排泄速度	14
7.	透析等による除去率	15
7 - 1	腹膜透析	15
7 - 2	血液透析	15
7 - 3	直接血液灌流	15
. 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	16
2.	禁忌内容とその理由	16
3.	効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	16
4.	用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	16
5.	慎重投与内容とその理由	16
6.	重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
7.	相互作用	16
7 - 1	併用禁忌とその理由	16
7 - 2	併用注意とその理由	17
8.	副作用	17
8 - 1	副作用の概要	17
8 - 2	項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	17
8 - 3	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	18
8 - 4	薬物アレルギーに対する注意 及び試験法	18
9.	高齢者への投与	18

10.	妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18
11.	小児等への投与	18
12.	臨床検査結果に及ぼす影響	18
13.	過量投与	18
14.	適用上及び薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)	18
15.	その他の注意	19
16.	その他	19

. 非臨床試験に関する項目

1.	一般薬理	20
2.	毒 性	20
2 - 1	単回投与毒性試験	20
2 - 2	反復投与毒性試験	20
2 - 3	生殖発生毒性試験	21
2 - 4	その他の特殊毒性	21

. 取扱い上の注意等に関する項目

1.	有効期間又は使用期限	22
2.	貯法・保存条件	22
3.	薬剤取扱い上の注意点	22
4.	承認条件	22
5.	包 装	22
6.	同一成分・同効薬	22
7.	国際誕生年月日	22
8.	製造・輸入承認年月日及び承認番号	22
9.	薬価基準収載年月日	22
10.	効能・効果追加、用法・用量変更 追加等の年月日及びその内容	22
11.	再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	23
12.	再審査期間	23
13.	長期投与の可否	23
14.	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	23
15.	保険給付上の注意	24

. 文 献

1.	引用文献	25
2.	その他の参考文献	25

. 参考資料

. 備 考

1.	備考	25
----	----	----

．概要に関する項目

1．開発の経緯

メトカルバモールは、米国 A.H.ロビンス社で開発・製品化された中枢性筋弛緩剤である。中枢性筋弛緩剤メフェシンの持つ作用が一過性であり、静脈内注射で溶血作用を呈するなどの問題を解消し、その作用の強化と持続性をはかった製剤である。

2．製品の特徴及び有用性

- 1) 主に脊髄の介在ニューロンを遮断して、異常に興奮・緊張している骨格筋のみを弛緩・鎮静し、正常な筋肉および筋運動には全く影響を与えない。
- 2) 副作用は、眠気、めまい、発疹、そう痒感、悪心・嘔吐、胃部不快感等が認められている。

．名称に関する項目

1．販売名

1 - 1 和 名：ロバキシシ®

1 - 2 洋 名：ROBAXIN®

1 - 3 名称の由来：特になし

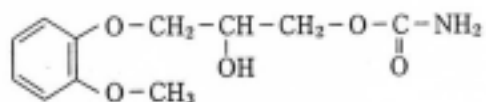
(米国 A.H.ロビンス社との提携品であるため、その名称を継承した。)

2．一般名

2 - 1 和名(命名法)：メトカルバモール (JAN)

2 - 2 洋名(命名法)：Methocarbamol (JAN)

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：C₁₁H₁₅NO₅

分子量：241.24

5．化学名(命名法)

3-(o-methoxyphenoxy)-2-hydroxypropyl-1-carbamate

6．慣用名、別名、略号、記号番号

なし

7．CAS登録番号

532-03-6

．有効成分に関する項目

1．有効成分の規制区分

普通薬

2．物理化学的性質

2 - 1 外観・性状

白色結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。

2 - 2 溶解性

エタノールにやや溶けやすく、水にやや溶けにくい。

2 - 3 吸湿性

吸湿性はない。

2 - 4 融点（分解点） 沸点、凝固点

融点：93～97

2 - 5 酸塩基解離定数

測定不能

2 - 6 分配係数

該当資料なし

2 - 7 その他の主な示性値

該当資料なし

3．有効成分の各種条件下における安定性

各種条件下における安定性

保存方法			結果
粉末状			安定
マクロゴール 300 水溶液中	pH 7	18 カ月 室温	安定
	pH 8	6 hr 室温	分解*
	pH 3	750hr 室温	分解*

* 分解生成物はグアヤコールグリセリンエーテル

4．有効成分の確認試験法

- (1) 本品 0.5g に水酸化ナトリウム試液 5mL を加え、加熱するとき、発生するガスは潤した赤色リトマス紙を青変する。
- (2) 本品のエタノール溶液 (1 : 25000) につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 273 ~ 275nm に吸収の極大を示す。
- (3) 本品を乾燥し、赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法により測定するとき、波長 3440cm^{-1} 、 3310cm^{-1} 、 1670cm^{-1} 、 1605cm^{-1} 、 1500cm^{-1} 、 1250cm^{-1} 、 1220cm^{-1} 、 770cm^{-1} 、 745cm^{-1} 及び 725cm^{-1} 付近に吸収を認める。

5．有効成分の定量法

局外規「メトカルバモール」による。

．製剤に関する項目

1．剤形

1 - 1 剤形の区別及び性状

区分：顆粒剤

性状：白色

1 - 2 製剤の物性

該当資料なし

1 - 3 識別コード

該当しない

1 - 4 pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

1 - 5 酸価、ヨウ素価等

該当しない

2．製剤の組成

2 - 1 有効成分（活性成分）の含量

1g 中メトカルバモール 900mg 含有

2 - 2 添加物

乳糖、メチルセルロース

3．懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4．製剤の各種条件下における安定性

該当資料なし

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

ロバキシン純末 1g に下記の薬品のほぼ 1 日常用量を配合し、30℃、R.H.92%の条件下で 14 日間の変化を確認した。なるべく実際の調剤投与に近い条件で実験を行うため、上質模造紙の薬包紙に包み又はその薬包紙の上に載せて、薬品の変化とともに薬包紙のしめり具合等も併せて観察した。

結果：(-)変化は全くみられない、(±)変化の有無が疑わしい、(+)明らかに変化は認めるが実際の調剤投与には支障なし、(++)調剤投与に支障あり

No.	薬品名	経過							日	適要
		直後	1	2	4	7	10	14		
	ロバキシン(1.0g)	-	-	-	-	-	-	-	-	
1	アスピリン(1.5g)	-	-	-	-	-	-	-	-	
2	スルピリン(1.0g)	-	±	+	+	++				紙ぬれ黄色
3	サリチル酸ナトリウム(3.0g)	-	++							紙ぬれピンク
4	10 倍クロルプロマジン散(0.25g)	-	-	-	-	-	-	-	-	
5	100 倍ビタミン B ₁ 散(1.0g)	-	-	-	±	±	±	±	±	微黄色
6	100 倍ビオタミン散(1.0g)	-	-	-	-	-	-	-	-	
7	100 倍ビタミン B ₂ 散(1.0g)	-	-	-	-	-	-	-	-	
8	10 倍ビタミン B ₆ 散(0.3g)	-	-	-	-	±	±	±	±	小塊
9	10 倍ビタミン C 散(1.0g)	-	-	-	±	±	+	+	+	一部淡茶色
10	炭酸水素ナトリウム(2.0g)	-	-	±	±	±	±	±	±	固塊
11	アミノフィリン(0.3g)	-	±	±	±	+	+	+	+	大塊・紙黄色
12	10 倍タンニン酸ジフェンヒドラミン散(1.0g)	-	-	-	±	±	+	+	+	塊

7. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

8. 溶出試験

方法：日本薬局方外医薬品規格メトカルバモール 90%顆粒溶出試験により試験を行う。
 本品の表示量に従いメトカルバモール(C₁₁H₁₅NO₅)約 0.75g に対応する量を精密に量り、試験液に水 900mL を用い、溶出試験法第 2 法により、毎分 50 回転で試験を行う。溶出試験を開始し、来て維持看護、溶出液 20mL とし、試料溶液とする。別にメトカルバモール標準品を 60℃で 2 時間乾燥し、その約 0.017g を精密に量り、水に溶かし、200mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、紫外可視吸光度測定法により試験

を行い、波長 274nm における吸光度 A_T 及び A_S を測定する。
本品が溶出規格を満たすときは適合とする。

メトカルバモール ($C_{11}H_{15}NO_5$) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= \frac{W_S}{W_T} \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{1}{C} \times 4500$$

W_S : メトカルバモール標準品の量 (mg)

W_T : メトカルバモール顆粒の秤取量 (g)

C : 1g 中のメトカルバモール ($C_{11}H_{15}NO_5$) の表示量 (mg)

溶出規格 : 表示量 900mg/g、規定時間 15 分、溶出率 85% 以上

結果 : 適合

9 . 生物学的試験法

該当しない

10 . 製剤中の有効成分の確認試験法

(1) 融点確認

本品を粉末とし、試料とする。

試料 0.2g [メトカルバモール ($C_{11}H_{15}NO_5$) 約 0.18g に対応する量] をとり、クロロホルム 10mL で 2 回抽出し、抽出液を合わせ水浴中でクロロホルムを留去する。
残留物を 70 で 1 時間乾燥するとき、その融点は 93 ~ 97 である。

(2) 紫外吸収スペクトル

定量法の項で得た試料溶液の紫外部吸収スペクトルを吸光度測定法により測定するとき、波長 273nm 付近に吸収の極大を示す。

11 . 製剤中の有効成分の定量法

本品 1.0g をとり、粉末とする。その約 0.19g [メトカルバモール ($C_{11}H_{15}NO_5$) 約 0.17g に対応する量] を精密に量り、水 100mL を正確に加え 70 ~ 80 の水浴中で 10 分間しばしば振り混ぜたのち、流水中で冷却し、冷後ろ紙ろ過する。

ろ液 5 mL を正確に量り、水を加えて正確に 200mL とし、試料溶液 (T) とする。

別に標準品として局外規メトカルバモールをデシケーター (減圧、シリカゲル) で 3 時

間乾燥し、その約 0.17g を精密に量り、水 50mL を加え 40～60 に加温して溶かし、冷後水を加えて正確に 100mL とする。この液 5mL を正確に量り、水を加えて正確に 200mL とし、標準溶液 (S) とする。

試料溶液 (T) 及び標準溶液 (S) につき、水を対照とし吸光度測定法により波長 273nm における吸光度 A_T 及び A_S を測定する。

本品 1g 中の表示量に対応するメトカルバモール ($C_{11}H_{15}NO_5$; 241.24) の量 (%)

$$= \text{標準品の量 (mg)} \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{1000}{\text{試料採取量 (mg)}} \times \frac{1}{900} \times 100$$

本規格及び試験方法は、別に規定するもののほか、日局通則及び日局一般試験法を準用するものとする。

12. 力価

該当しない

13. 容器の材質

アルミニウムポリエチレンラミネートフィルム袋に入れ、さらに紙箱に入れる。

14. その他

．治療に関する項目

1．効能又は効果

運動器疾患に伴う有痛性痙縮

（腰背痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、変形性脊椎症など）

2．用法及び用量

通常、成人にはメトカルバモールとして1日1.5～2.25g（顆粒として1.7～2.5g）を3回に分けて経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

ただし、小児に用いる場合は1日総量が体重1kg当りメトカルバモールとして60mgを超えて投与してはならない。

3．臨床成績

3 - 1 臨床効果

該当資料なし

3 - 2 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

3 - 3 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

3 - 4 検証的試験

（1）無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

（2）比較試験²⁾

肩関節周囲炎患者、頸肩腕症候群患者及び変形性脊椎症患者を対象として、偽薬との二重盲検比較試験を行った。

ロバキシンまたは偽薬を1回1包、1日3回毎食後に服用させ、2週間後に各群間で薬剤の効果を比較した。なお、ロバキシンの1包は0.85g（メトカルバモールとして765mg）とした。

その結果、総合判定は、ロバキシン投与群で肩関節周囲炎54.5%（30例/55例）、頸肩腕症候群67.2%（39例/58例）、変形性脊椎症60.9%（39例/64例）、偽薬投

与群で肩関節周囲炎 37.1% (23 例 / 62 例)、頸肩腕症候群 52.4% (33 例 / 63 例)、変形性脊椎症 70.3% (45 例 / 64 例) の有効率が認められた (やや有効以上)。

変形性脊椎症に関しては、有意差はないが実薬の効果が偽薬に優らないという成績であった。この主な理由としては、腰痛症の病態が極めて複雑であり、変形性脊椎症を基盤とする腰痛症としても種々の因子が関与し、精神・心理的に、生活環境により、あるいは安静保持の程度や適度な運動、血行などにより症状が変動しやすく、いわゆる偽薬効果も発現しやすいことが考えられた。

また、副作用発現率は両群に大差なく、ロバキシン投与群 6.9%、偽薬投与群 10.9% であり、大部分が軽度の胃腸障害であった。

本試験の結果から、本剤は運動器疾患に伴う疼痛性 (反射性) 筋痙縮に対して有用であると考えられた。

(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

3 - 5 治療的使用

(1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

該当しない

(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

．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

カルバミン酸クロルフェネシン、フェンプロバメートの中枢性筋弛緩薬

2．薬理作用

2 - 1 作用部位・作用機序

<作用部位>

脊髄骨格筋痙攣に關与する多相シナプス及び、骨格筋紡錘の、運動ニューロンと推定される。

<作用機序>

- 1) 骨格筋痙攣に關与する多相シナプス反射を抑制して、神経伝導を持続的に遮断し筋肉の異常緊張を緩解する。
- 2) 骨格筋紡錘の、運動ニューロンの活動を抑制する。
- 3) 筋弛緩作用は1)、2)の協力作用であり、この作用の発現用量では上位の脳機能に対する作用は示さない。

2 - 2 薬効を裏付ける試験成績

(1) 抗痙攣作用³⁾

ストリキニーネによる痙攣(ラット)に対しては、持続的な予防効果を示し、ペンテトラゾールあるいは電気刺激による痙攣(マウス)に対してはメフェネシンカルバメートより強い抑制作用を示した。

(2) 筋弛緩作用^{4) 5)}

中枢神経系に作用を有し、とくに脊髄の介在ニューロンに作用を有することが認められている。すなわち、骨格筋痙攣に關与する多相シナプス反射を抑制して、神経伝導を持続的に遮断し筋肉の異常緊張を緩解する。

．薬物動態に関する項目

1．血中濃度の推移・測定法

1 - 1 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

1 - 2 最高血中濃度到達時間

健康成人男子における血中濃度推移（外国データ）⁶⁾

投与量（メトカルバモールとして）	例数	Tmax	T _{1/2}
200mg	1	0.5hr	1.6hr
1,000mg	1	0.5hr	2.15hr

注）本剤の承認された用量は「メトカルバモールとして1日 1.5～2.25g を3回に分けて経口投与する。」である。

1 - 3 通常用量での血中濃度

（1）健康成人における単回投与時の血漿中濃度

該当資料なし

（2）健康成人における連続投与時の血漿中濃度

該当資料なし

（3）高齢者における薬物動態

該当資料なし

（4）腎障害時の薬物動態

該当資料なし

（5）薬物動態に対する食事の影響

該当資料なし

1 - 4 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

2．薬物速度論的パラメータ

2 - 1 吸収速度定数

該当資料なし

2 - 2 バイオアベイラビリティ

該当資料なし

2 - 3 消失速度定数

該当資料なし

2 - 4 クリアランス

該当資料なし

2 - 5 分布容積

該当資料なし

2 - 6 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3 . 吸 収

該当資料なし

4 . 分 布

4 - 1 血液 - 脳関門通過性

該当資料なし

4 - 2 胎児への移行性

該当資料なし

4 - 3 乳汁への移行性

該当資料なし

4 - 4 髄液への移行性

該当資料なし

4 - 5 その他の組織への移行性

該当資料なし

5 . 代 謝

5 - 1 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

5 - 2 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

（ 1 ）肝薬物代謝酵素系に対する影響

該当資料なし

（ 2 ）チトクローム P450（CYP）に対する影響

該当資料なし

5 - 3 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

5 - 4 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

5 - 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

6 - 1 排泄部位

該当資料なし

6 - 2 排泄率

該当資料なし

6 - 3 排泄速度

該当資料なし

参考 . 動物データ⁷⁾

イヌ経口投与では 24 時間以内に尿から投与量の 50 ~ 90%、糞中から 10 ~ 12% が排泄された。

7．透析等による除去率

7 - 1 腹膜透析

該当資料なし

7 - 2 血液透析

該当資料なし

7 - 3 直接血液灌流

該当資料なし

．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

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
本剤及び類似化合物（カルバミン酸クロルフェネシン等）に対し過敏症の既往歴のある患者

3．効能・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・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

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
（1）肝障害のある患者〔肝障害を悪化させるおそれがある。〕
（2）腎障害のある患者〔腎障害を悪化させるおそれがある。〕

6．重要な基本的注意とその理由及び処置方法

眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、本剤投与中の患者には、自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意すること。

7．相互作用

7 - 1 併用禁忌とその理由

該当しない

7 - 2 併用注意とその理由

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
中枢神経抑制剤 フェノチアジン系薬剤 バルビツール酸誘導体	相互に作用を増強することがあるので、やむを得ず併用する場合には、減量するなど注意すること。	相互に作用を増強することがある。
アルコール		
MAO阻害剤 アミトリプチン等		
塩酸トルペリゾン	眼の調節障害があらわれたとの報告がある。	機序不明

8 . 副作用

8 - 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ため、発現頻度については、文献、自発報告などを参考に集計した。

次のような副作用が認められた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注1)}	発疹、そう痒感	
精神神経系	眠気、めまい、ふらつき、運動失調、頭痛・頭重感	霧視
消化器系	悪心・嘔吐、食欲不振、胸やけ・胃のもたれ・胃部不快感、下痢、便秘	

注1)：このような場合は投与を中止すること。

8 - 2 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

国内社内集計 全症例 1,415 例中 73 件 (5.16%)

副作用の種類		発現数(発生率%)	副作用の種類		発現数(発生率%)
消化器系	嘔気	10 (0.71)	精神神経系	めまい	8 (0.56)
	悪心	7 (0.49)		フラフラ感	3 (0.21)
	食欲不振	6 (0.42)		眠気	8 (0.56)
	胃障害	4 (0.28)		頭痛	5 (0.35)
	胃症状	3 (0.21)	発疹	3 (0.21)	
	下痢	2 (0.14)	心悸亢進	1 (0.07)	
	胃部膨満感	2 (0.14)	口渴	1 (0.07)	
	胃不快	2 (0.14)	排尿困難	1 (0.07)	
	胃痛	1 (0.07)	手のふるえ	1 (0.07)	
	胃腸障害	1 (0.07)	痔の悪化	1 (0.07)	
	心窩部痛	1 (0.07)	嗄声	1 (0.07)	
	便秘	1 (0.07)			

8 - 3 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

8 - 4 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

1. 禁忌（次の患者には投与しないこと）
本剤及び類似化合物（カルバミン酸クロルフェネシン等）に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 副作用
過敏症^注：発疹、そう痒感（0.1～5%）
注）このような場合は投与を中止すること。

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減量するなど注意すること。

10 . 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- （1）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。〕
- （2）授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせる。〔授乳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

小児等に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

12 . 臨床検査結果に及ぼす影響

尿中5-ヒドロキシインドール酢酸値及び尿中バニルマンデル酸値を増大させる。

13 . 過量投与

症状・処置法は確立されていない。

第 腰椎分離症及び坐骨神経痛合併患者（1例、力士）に1日メトカルバモールとして4500mgを10日間経口投与した結果、副作用と思われる症状の発現は認めなかった。⁸⁾

14 . 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

該当しない

15. その他の注意

特になし

16. その他

．非臨床試験に関する項目

1．一般薬理

該当資料なし

2．毒性

2 - 1 単回投与毒性試験（海外データ）

（1）LD₅₀

動物	投与経路	LD ₅₀ (mg/kg)	信頼限界 (mg/kg)
マウス	経口	1900 (96時間値)	1328 - 2717
	静注	805 (48時間値)	749 - 865
ラット	経口	2830 (168時間値)	2021 - 3962
	静注	> 500 (168時間値)	
イヌ	経口	> 2 (168時間値)	
	静注	> 440 (168時間値)	

（2）中毒症状（マウス）⁴⁾

腹腔内投与では、200mg/kg 以下ではやや鎮静的に運動を制したのみであり、300mg/kg 以上で可逆性の麻痺が発現し、死亡するものは 600mg/kg 以上でみられ、1000mg/kg ではすべて死亡した。いずれの場合でも痙攣、興奮の発現はなく、死亡する動物はまず呼吸緩徐となり停止し、続いて心拍の停止が起こった。

経口投与では、300mg/kg ではすべてに可逆性の歩行失調を認めるが麻痺発現はなかった。500mg/kg 以上では投与後 5 ~ 10 分に麻痺発現するものをみた。死亡するものは 1000mg/kg 以上でみられ、1500mg/kg ではすべて死亡した。

2 - 2 反復投与毒性試験

（1）ラットに 400、300、200mg/kg を 30 日間経口投与し、対照群と比較検討した結果、体重、食欲、運動状態、血液所見、臓器所見に異常は認められなかった。⁴⁾

（2）ラットに 200、800、1600mg/kg を 1 週間に 5 日、13 週間又は 26 週間経口投与し、成長・外観・行動の観察結果と、血液学的・生化学的・組織学的な評価を行った。投与開始後 6 ~ 8 週の間は 1600mg/kg/日投与群で歩行不良と抑うつ症状を認めしたが、その後軽快した。死亡例は 200mg/kg/日投与群と 1600mg/kg/日投与群に認められた。

また、26 週投与後、200mg/kg/日投与群に間質性腎炎、800mg/kg/日投与群に腎炎、1600mg/kg/日投与群に肝線維膜と食道外側組織の壊死が認められた。

- (3) イヌに 1 週間に 5 日、14 週間又は 27 週間経口投与し、成長・外観・行動の観察結果と、血液学的・生化学的・組織学的な評価を行った。75mg/kg/日投与群及び 400mg/kg/日投与群で嘔吐が見られ、1000mg/kg/日投与群で鎮静状態と運動失調を示し、時に嘔吐と軽度の痙攣が見られたが、他に異常はなく、対照群との差は認められなかった。

2 - 3 生殖発生毒性試験 (海外データ)

- (1) 雌雄ラットに 0.74% のメトカルバモールを食餌に混ぜ与え続け、2 度交配させたところ、無投与群に比較して以下のような結果となった。

親の雌性ラットで平均体重増加がわずかに劣っていた。

1 度目及び 2 度目の交配ともに、妊娠の比率はわずかに低かった。

産まれた仔の授乳中の生存がわずかに少なかった。

産まれた仔のいずれにも催奇形性は認められなかった。

- (2) 胎児発育の後の段階から離乳までの授乳期間中、雌性イヌにメトカルバモール 200mg/kg を投与した。母仔ともに有害な影響は認められなかった。

2 - 4 その他の特殊毒性⁹⁾

ヒト血液を *in vitro* で 50% 溶血する薬物濃度を求めた。メフェネシンは 0.88% の濃度で 50% 溶血が起こるが、メトカルバモールは 2.26% であった。メフェネシンはメトカルバモールの 38.9 倍の溶血性を示した。

．取扱い上の注意等に関する項目

1．有効期間又は使用期限

使用期限：4年（外箱等に表示）

2．貯法・保存条件

室温保存

3．薬剤取扱い上の注意点

特になし

4．承認条件

なし

5．包装

500g

6．同一成分・同効薬

同効薬：カルバミン酸クロルフェネシン、フェンプロバメートの中枢性筋弛緩薬

7．国際誕生年月日

8．製造・輸入承認年月日及び承認番号

承認年月日：1961年7月18日

承認番号：13600AZZ02052

9．薬価基準収載年月日

薬価基準収載：1963年1月1日

10．効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果 [公表年月日 1976 年 7 月 23 日] に基づく効能・効果の変更

[変更前]

効能又は効果

筋肉の異常緊張、痙攣、強直ならびに疼痛症候を伴う次の諸症状（腰背痛症、筋痛症、頸肩腕症候群、五十肩、変形性脊椎症、骨折、捻挫、打撲、神経痛、仮性近視）

用法・用量

通常、成人にはメトカルバモールとして 1 日 1.7～2.5g（顆粒として 1.5～2.25g）を 3 回に分けて経口投与する。年齢、症状により適宜増減することができる。ただし、小児に用いる場合は 1 日総量が体重 1 kg 当り 67mg（メトカルバモールとして 60mg）を超えて投与してはならない。

[変更後]

効能又は効果

運動器疾患に伴う有痛性痙攣

（腰背痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、変形性脊椎症など）

用法・用量

通常、成人にはメトカルバモールとして 1 日 1.5～2.25g（顆粒として 1.7～2.5g）を 3 回に分けて経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、小児に用いる場合は 1 日総量が体重 1 kg 当りメトカルバモールとして 60mg を超えて投与してはならない。

品質再評価

2004 年 2 月 23 日

12. 再審査期間

該当しない

13. 長期投与の可否

可（平成 14 年 4 月診療報酬改定による）

14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

1225003D1023

15．保険給付上の注意

該当しない

. 文献

1 . 引用文献

- 1) Gianni Linoli,et.al. : Boll.Chim.Farm., 98、582、1959
- 2) 山本 真 他 : 診療と新薬、13(2)、323、1976
- 3) Truitt,E.B. : J.Pharmacol.Exp.Ther., 122(2)、239、1958
- 4) 猪木 令三 他 : 奈良医学雑誌、12(5)、1048、1961
- 5) 村山 智 他 : 千葉医学、50、315、1974
- 6) Bruce,R.B.,et al. : J.Pharm.Sci.60、104、1971
- 7) Campbell,A.D. : J.Pharmacol.Exp.Ther., 131(1)、18、1961
- 8) 岩崎 一平 : 新薬と臨床、11(5)、517、1962
- 9) Truitt,E.B.,et al. : Proc.Soc.Exp.Biol.Med., v95、422、1957

2 . その他の参考文献

なし

. 参考資料

主な外国での発売状況

国名	販売名	剤形	会社名
アメリカ	Robaxin	注射剤	BAXTER
アメリカ	Robaxin	錠剤	A.H.ROBINS、SCHWARZ

. 備考

特になし