

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

局所麻酔剤、鎮痛・鎮痒剤
アミノ安息香酸エチル原末「マルイシ」
Ethyl Aminobenzoate 「Maruishi」
日本薬局方 アミノ安息香酸エチル

剤形	原末
規格・含量	本品1g中、日局 アミノ安息香酸エチル 1g 含有。
一般名	和名：アミノ安息香酸エチル 洋名：Ethyl Aminobenzoate
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：2008年10月7日 薬価基準収載：2008年12月19日 発売年月日：2008年12月
開発・製造・輸入 発売・提携・販売会社名	発売元：吉田製薬株式会社 製造販売元：丸石製薬株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	吉田製薬株式会社 担当：学術部 電話番号：03-3381-2004 FAX番号：03-3381-7728

本IFは、2008年10月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

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判、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、非臨床試験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、表紙の下段に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「主な外国での発売状況」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
- 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
- 1	販売名	1
- 2	一般名	1
- 3	構造式又は示性式	1
- 4	分子式及び分子量	1
- 5	化学名(命名法)	1
- 6	慣用名、別名、略号、記号番号	1
- 7	C A S登録番号	1
[]	有効成分に関する項目	2
- 1	有効成分の規制区分	2
- 2	物理化学的性質	2
- 3	有効成分の各種条件下における安定性	2
- 4	有効成分の確認試験法	2
- 5	有効成分の定量法	2
[]	製剤に関する項目	3
- 1	剤形	3
- 2	製剤の組成	3
- 3	製剤の各種条件下における安定性	3
- 4	他剤との配合変化(物理化学的变化)	3
- 5	混入する可能性のある夾雑物	3
- 6	製剤中の有効成分の確認試験法	3
- 7	製剤中の有効成分の定量法	3
- 8	容器の材質	3
- 9	その他	3
[]	治療に関する項目	4
- 1	効能又は効果	4
- 2	用法及び用量	4
- 3	臨床成績	4
[]	薬効薬理に関する項目	5
- 1	薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	5
- 2	薬理作用	5
[]	薬物動態に関する項目	6
- 1	血中濃度の推移・測定法	6
- 2	薬物速度論的パラメータ	6
- 3	吸収	6
- 4	分布	6
- 5	代謝	7
- 6	排泄	7
- 7	透析等による除去率	7
[]	安全性(使用上の注意等)に関する項目	8
- 1	警告内容とその理由	8
- 2	禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	8
- 3	効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	8
- 4	用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	8
- 5	慎重投与内容とその理由	8
- 6	重要な基本的注意とその理由及び処置方法	8
- 7	相互作用	8
- 8	副作用	8

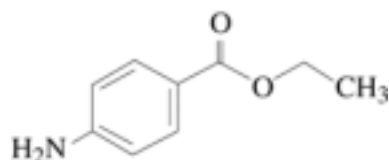
- 9	高齢者への投与	9
- 10	妊娠、産婦、授乳婦等への投与	9
- 11	小児等への投与	9
- 12	臨床検査結果に及ぼす影響	9
- 13	過量投与	9
- 14	適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	10
- 15	その他の注意	10
- 16	その他	10
[]	非臨床試験に関する項目	11
- 1	一般薬理	11
- 2	毒性	11
[]	取扱い上の注意等に関する項目	12
- 1	有効期間又は使用期限	12
- 2	貯法・保存条件	12
- 3	薬剤取扱い上の注意点	12
- 4	承認条件	12
- 5	包装	12
- 6	同一成分，同効薬	12
- 7	国際誕生年月日	12
- 8	製造・輸入承認年月日及び承認番号	12
- 9	薬価基準収載年月日	12
- 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	12
- 11	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	12
- 12	再審査期間	12
- 13	長期投与の可否	12
- 14	厚生省薬価基準収載医薬品コード	12
- 15	保険給付上の注意	12
[]	文献	13
- 1	引用文献	13
- 2	その他の参考文献	13
[]	参考資料	13
[]	備考	13

[] 概要に関する項目

- 1 開発の経緯
アミノ安息香酸エチルは、E.Ritsert（1890年）により創製され、アネステジンの名でHoechst社より発売された局所麻酔薬である。
- 2 製品の特徴及び有用性
本品はその局所麻酔作用により鎮痛・そう痒鎮静効果を示す。

[] 名称に関する項目

- 1 販売名
 - (1) 和名 アミノ安息香酸エチル原末「マルイシ」
 - (2) 洋名 Ethyl Aminobenzoate 「Maruishi」
 - (3) 名称の由来 「アミノ安息香酸エチル」からの変更は、日本薬局方収載名および厚生労働省通知(薬食安発第0602009号平成16年6月2日付「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について - 医療用医薬品の販売名の取扱いについて」)による。
- 2 一般名
 - (1) 和名(命名法) アミノ安息香酸エチル (JAN)
 - (2) 洋名(命名法) Ethyl Aminobenzoate (JAN, INN)JAN：日本名、INN：国際一般名
- 3 構造式又は示性式



- 4 分子式及び分子量
C₉H₁₁NO₂ (165.19)
- 5 化学名(命名法)
Ethyl 4-aminobenzoate (IUPAC)
- 6 慣用名、別名、略号、記号番号
アネスタミン、ベンゾカイン
- 7 CAS登録番号
アミノ安息香酸エチル：94-09-7

[] 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
 - (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、味はやや苦く、舌を麻ひする。
 - (2) 溶解性
エタノール（95）またはジエチルエーテルに溶けやすく、水に極めて溶けにくい。希塩酸に溶ける。
 - (3) 吸湿性
該当資料なし
 - (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点
融点：89～91
 - (5) 酸塩基解離定数
pKa=2.9
 - (6) 分配係数
該当資料なし
 - (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
ポリエチレン袋、缶入り包装で、室温で36ヶ月保存した場合の定量値は99.7%（局方電気滴定によるジアゾ滴定法）であり、外観の変化は認めない。
- 4 有効成分の確認試験法
 - (1) 本品0.01gに希塩酸1mL及び水4mLを加えて溶かした液は、芳香族第一アミンの定性反応を呈する。
* 芳香族第一アミンの定性反応 *
芳香族第一アミンの酸性溶液に氷冷しながら亜硝酸ナトリウム試液3滴を加えて振り混ぜ、2分間放置し、次にアミド硫酸アンモニウム試液1mLを加えてよく振り混ぜ、1分間放置した後、シュウ酸*N*-（1-ナフチル）*N*-ジエチルエチレンジアミン試液1mLを加えるとき、液は赤紫色を呈する。
 - (2) 本品0.1gに水5mLを加え、希塩酸を滴加して溶かし、ヨウ素試液を滴加するとき、褐色の沈殿を生じる。
 - (3) 本品0.05gに酢酸2滴及び硫酸5滴を加えて加温するとき、酢酸エチルのにおいを発する。
- 5 有効成分の定量法
本品を乾燥し、その約 0.25g を精密に量り、塩酸 10mL 及び水 70mL を加えて溶かし、更に臭化カリウム溶液（3 10）10mL を加え、15 以下に冷却した後、0.1mol/L 亜硝酸ナトリウム液で電位差滴定法又は電流滴定法により滴定する。
0.1mol/L 亜硝酸ナトリウム 1mL = 16.52mgC₉H₁₁NO₂

[] 製剤に関する項目

- 1 剤形

(1) 剤形の区別及び性状

1) 剤形の区別

原末

2) 性状

白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はやや苦く、舌を麻痺する。

エタノール（95）またはジエチルエーテルに溶けやすく、水に極めて溶けにくい。

希塩酸に溶ける。

(2) 製剤の物性

安息角	逃飛率	集合率	粒度分布
49度	8.0%	40%	30M : 10.4%
見かけ容積	pH	融点	30 ~ 100M : 70.3%
1.9 ~ 1.4mL/g		89 ~ 91	100 ~ 200M : 11.8%
			200M pass : 7.5%

- 2 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

本品1g中、日局 アミノ安息香酸エチル 1g 含有。

- 3 製剤の各種条件下における安定性

ポリエチレン袋、缶入り包装で、室温で36ヶ月保存した場合の定量値は99.7%（局方電気滴定によるジアゾ滴定法）であり、外観の変化は認めない。最終包装形態では、通常の保存条件において少なくとも3年間は安定である。

- 4 他剤との配合変化(物理化学的变化)

アルカリの存在で水と煮沸すると加水分解する。

カンフル、メントール、レゾルシンと混和すると液化する。

- 5 混入する可能性のある夾雑物

酸、塩化物、重金属、硫酸呈色物

- 6 製剤中の有効成分の確認試験法

[- 4 有効成分の確認試験法] の項 参照。

- 7 製剤中の有効成分の定量法

[- 5 有効成分の定量法] の項 参照。

- 8 容器の材質

包装単位	容器			備考
	形状	材質	色調	
500g	袋	ポリエチレン	透明	ファンシーラップ 草色印刷ケース

- 9 その他

該当資料なし

[] 治療に関する項目

- 1 効能又は効果
- 2 用法及び用量

	効能・効果	用法・用量
経口	下記疾患に伴う疼痛・嘔吐 胃炎、胃潰瘍	通常、成人1日0.6～1gを3回に分割経口投与する。 なお、年齢、症状により適宜増減する。
外用	下記疾患における鎮痛・鎮痒 外傷、熱傷、日焼け、皮膚潰瘍、 そう痒症、痔疾	通常、5～15%の軟膏剤、液剤、散布剤として、または1個中200～300mgを含有する坐剤として適宜患部に使用する。

- 3 臨床成績
 - (1) 臨床効果
 - 該当資料なし
 - (2) 臨床薬理試験：忍容性試験
 - 該当資料なし
 - (3) 探索的試験：用量反応探索試験
 - 該当資料なし
 - (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
 - 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
 - (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
 - 該当資料なし

[] 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
該当しない

- 2 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

(経口)

胃粘膜の知覚神経末端を麻痺させ、中枢への刺激伝達を庶断して疼痛、嘔吐を鎮める。

(外用)

神経節における伝達及び神経 - 筋接合部での伝達を阻害する。また、刺激作用がなく、組織を腐蝕する恐れがない。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

[] 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
10分（ラット経口投与）
 - (3) 通常用量での血中濃度
ラットに対する50mg/kg経口投与後の血清中濃度の推移は、投与10分後に未変化体は0.03 µg/mL検出されたのみで、その後は認められない。その代謝物としては同時点でパラアミノ安息香酸は16.6 µg/mL（アミノ安息香酸エチル換算値。以下同様）となり、以後急速に減少し、1時間後には消失。また、パラアセトアミノ安息香酸は6.8 µg/mLを示すが6時間後には消失した。その他、グルクロン酸抱合体等が認められる。
 - (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
 - (1) 吸収速度定数
該当資料なし
 - (2) バイオアベイラビリティ
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) 血漿蛋白結合
該当資料なし

- 3 吸収
皮膚・粘膜より吸収され、神経末端に及ぶが、他の局所麻酔剤に比べ、比較的吸収されにくい。なお、咽頭・気道粘膜からは速やかに吸収される。
ラットに50mg/kgを経口投与したとき、消化管から速やかに吸収され、投与10分後に最高血清中濃度（未変化体として0.03g/mL）に達するが、10分後には既に大部分は加水分解を受けてパラアミノ安息香酸となり、次いで速やかにアセチル化、グリシン抱合体及びグルクロン酸抱合体となる。

- 4 分布
 - (1) 血液 - 脳関門通過性
該当資料なし
 - (2) 胎児への移行性
該当資料なし
 - (3) 乳汁中への移行性
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

コリンエステラーゼにより、主として血漿中、一部は肝で加水分解される。

その代謝はパラアミノ安息香酸とほぼ同一と考えられる。ウサギに 400mg及び800mgを経口投与すると、24時間尿中に平均未変化体1%以下、パラアミノ安息香酸36%、パラアミノ安息香酸のグリシン抱合体20%、パラアミノ安息香酸のグルクロン酸抱合体8%（エステル型）、12%（エーテル型）、パラアミノ安息香酸の硫酸抱合体9% が排泄される。

(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

腎臓（代謝物として）。

(2) 排泄率

(3) 排泄速度

ウサギに400mg及び800mg/kgを経口投与したとき、24時間尿中に未変化体1%以下、平均値でパラアミノ安息香酸約36%、そのグリシン抱合体約20%、グルクロン抱合体約8%（エステル型）、約12%（エーテル型）及び硫酸抱合体約9%が排泄された。

- 7 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(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（原則禁忌を含む）

（次の患者みは投与しないこと）
 (1) 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
 (2) 乳幼児〔内用及び坐剤の場合〕（「 - 1 1 小児等への投与」の項参照）

- 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
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
該当しない
- 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。

- 1) 重大な副作用と初期症状
該当しない
- 2) その他の副作用

（経口）

	頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{（注1）}	過敏症状		
消化器 ^{（注2）}		食欲不振、悪心、口渇、便秘	下痢等
血液 ^{（注3）}			メトヘモグロビン血症

（注1）このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。
 （注2）このような症状の継続または増強がみられた場合は、減量または投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。
 （注3）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。

（外用）
 過敏症：発疹、そう痒等（頻度不明）があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には使用を中止すること。

(2) 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

(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

本剤に感受性の患者は、他のエステル誘導体又はパラアミノ安息香酸誘導体の局所麻酔剤にも感受性がある。

交差感受性：パラアミノ安息香酸誘導体、パラベン類、パラフェニレンジアミン（毛髪染料）に過敏な患者は、本剤にも過敏である可能性があるので注意する。

試験方法：パッチテスト等

- 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。
[経口および坐剤の場合]

- 10 妊娠、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊娠また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または使用すること。 [経口および坐剤の場合]

- 11 小児等への投与

メトヘモグロビン血症が報告されているので、乳幼児には投与または使用しないこと。
[経口および坐剤の場合]

- 12 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

- 13 過量投与

症状：

心血管系の抑制（発汗、血圧低下、皮膚蒼白、徐脈ないし不整脈）

心停止を起こす可能性がある。

中枢神経系（かすみ目ないし複視、錯乱、けいれん、眩暈ないし羞明、眠気、熱・冷感ないし感覚消失、耳鳴、震え、不安感、興奮、神経過敏、不穏状態）

中枢神経系の刺激は通常初期に見られるが、一過性ないし欠如することがある。

次いで抑制がみられ、眠気が中毒の初期症状であることがある。中枢神経系の抑制は意識障害や呼吸停止を起こす可能性がある。

メトヘモグロビン血症（呼吸困難、めまい、頭痛、倦怠感、疲弊）

処置：

循環器系の抑制：昇圧剤及び静脈内輸液の投与を行う。

けいれん：ベンゾジアゼピン系薬剤の投与する。静脈内に際しては、急速に投与すると呼吸及び循環系を抑制させることに留意する。抑制がみられた場合には、速やかに補助呼吸や蘇生に必要な薬剤と器具を適用する。

メトヘモグロビン血症：メチレンブルーの静脈内投与やアスコルビン酸の経口投与を行う。

支持療法：エアウェイを設置し、100%酸素を投与する。必要に応じて補助呼吸ないし管理呼吸に置き換える。気管内挿管を必要とすることもある。

- 1 4 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）

（経口）

使用時：

(1) 長期連続投与は避けること。

(2) 服用にあたっては、口内にしびれ等を残さないため速やかに飲みくたすよう注意させること。

（外用）

投与経路：目には使用しないこと。〔軟膏剤、液剤の場合〕

使用時：誤って吸入しないよう注意させること。〔散布剤の場合〕

- 1 5 その他の注意

該当資料なし

- 1 6 その他

該当資料なし

[] 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
(1) 単回投与毒性試験

アミノ安息香酸エチル (MLDg/kg)

	イヌ	ネコ	モルモット	ウサギ
静脈内	0.4			
経口				1.15
腹腔	0.75	0.9	0.9	

(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

[] 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：3年（ラベルに記載）
- 2 貯法・保存条件
室温保存
- 3 薬剤取扱い上の注意点
該当資料なし
- 4 承認条件
該当しない
- 5 包装
500g
- 6 同一成分，同効薬
該当しない
- 7 国際誕生年月日
不明
- 8 製造・輸入承認年月日及び承認番号
製造承認年月日：2008年10月7日
承認番号：22000AMX02200000
(旧販売名：アミノ安息香酸エチル)
製造承認年月日：1985年12月26日
承認番号：16000AMZ05915
- 9 薬価基準収載年月日
2008年12月19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
第15次再評価結果公表年月日：1979年2月2日
効能・効果：下記疾患に伴う疼痛・嘔吐
胃炎、胃潰瘍
用法・用量：通常成人1日0.6～1gを3回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
- 12 再審査期間
該当しない
- 13 長期投与の可否
可：本剤は厚生労働省告示99号（平成14年3月18日付け）に該当しないため、投薬期限制限の対象とならない。
- 14 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード
1212001X1170
- 15 保険給付上の注意
該当しない

[] 文献

- 1 引用文献
該当資料なし
- 2 その他の参考文献
厚生労働省 第十五改正 日本薬局方
JPDI 日本薬局方医薬品情報 じほう 2006

[] 参考資料

主な外国での発売状況
INN USP BP EP IP DAB FPに収載

[] 備考

その他の関連資料
該当資料なし