

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

鎮咳剤

日本薬局方 *d*l-メチルエフェドリン塩酸塩散 10%

***d*l-メチルエフェドリン塩酸塩散 10%「メタル」**

10% *d*l-Methylephedrine Hydrochloride Powder

剤形	散 剤
規格・含量	<i>d</i> l-メチルエフェドリン塩酸塩散 10%「メタル」：1g 中 日本薬局方 <i>d</i> l-メチルエフェドリン塩酸塩……………0.1g
一般名	和名： <i>d</i> l-メチルエフェドリン塩酸塩(JP) 洋名：10% <i>d</i> l-Methylephedrine Hydrochloride (JP)
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造承認年月日：2020年7月6日 薬価基準収載年月：薬価基準収載 発売年月：1986年1月
開発・製造・輸入・発売・提携・販売会社名	製造販売元：中北薬品株式会社 発売元：吉田製薬株式会社
担当者の連絡先 ・電話番号・FAX番号	吉田製薬株式会社 学術部 TEL：03-3381-2004 FAX：03-3381-7728 受付時間：9時～17時 医療機関向け HP： https://www.yoshida-pharm.com/

本IFは2020年12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 情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/> 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

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、日本病院薬剤師会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」と位置づけられる。

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）がなされた時点並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 の策定原点を踏まえ、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 等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

I. 概要に関する項目	1
II. 名称に関する項目	1
III. 有効成分に関する項目	1
IV. 製剤に関する項目	2
V. 治療に関する項目	4
VI. 薬物薬理に関する項目	5
VII. 薬物動態に関する項目	5
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	7
IX. 非臨床試験に関する項目	9
X. 取扱い上の注意等に関する項目	10
X I. 文献	11
X II. 参考資料	11
X III. 備考	11

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

dl-メチルエフェドリン塩酸塩は、1892年長井によって天然 *l*-エフェドリンより合成されたが、*dl*-体としては同氏らの1929年の報告が最初と思われる。その後、1948年菅沢、三沢らの共同研究によって、*dl*-メチルエフェドリン塩酸塩はエフェドリンに比べ副作用の少ない喘息治療薬であることが確認された。

dl-メチルエフェドリン塩酸塩には隣り合わせて不斉炭素原子が2個存在するため、*erythro*型と*threo*型が存在し、それぞれの*d*体、*l*体を加えると4種類の光学異性体が存在する。*dl*-メチルエフェドリン塩酸塩は*erythro*型のラセミ体である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1)和名：*dl*-メチルエフェドリン塩酸塩散 10%「メタル」

(2)洋名：10% *dl*Methylephedrine Hydrochloride Powder

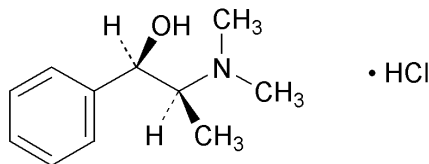
2. 一般名

(1)和名（命名法）：*dl*-メチルエフェドリン塩酸塩（JP）

(2)洋名（命名法）：*dl*Methylephedrine Hydrochloride（JP）

3. 構造式又は示性式

dl-メチルエフェドリン塩酸塩：



4. 分子式及び分子量

$C_{11}H_{17}NO \cdot HCl$

分子量：215.72

5. 化学名（命名法）

(1*RS*,2*SB*)-2-dimethylamino-1-phenyl-1-propanol monohydrochloride (IUPAC)

6. CAS 登録番号

18760-80-0

III. 有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分 (原薬の規制区分)

該当しない

2. 物理化学的性質

(1)外観・性状

無色の結晶又は白色の結晶性の粉末である。

(2)溶解性

水に溶けやすく、エタノール (99.5) にやや溶けにくく、酢酸 (100) に溶けにくく、無水酢酸にほとんど溶けない。

水溶液 (1→20) は旋光性を示さない。

	(3) 吸湿性 該当資料なし
	(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点 融点：207～211℃
	(5) 酸塩基解離定数 該当資料なし
	(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	長時間光にさらすと微黄色に変色するが、熱、湿度に対しては比較的安定である。
4. 有効成分の確認方法	(1) 本品の水溶液（1→2000）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し、本品のスペクトルと本品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。 (2) 本品を乾燥し、赤外吸収スペクトル測定法の塩化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品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数のところに同様の強度の吸収を認める。 (3) 本品の水溶液（1→10）は塩化物の定性反応を呈する。
5. 有効成分の定量法	本品を乾燥し、その約 0.4g を精密に量り、無水酢酸/酢酸（100）混液（7：3）80mL に溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する（電位差滴定法）。同様の方法で空試験を行い、補正する。 0.1mol/L 過塩素酸 1mL=21.57mg C ₁₁ H ₁₇ NO·HCl

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形	(1) 剤形の区別及び性状 区別：散 剤 性状：白色の粉末である。 (2) 製剤の物性 本品は日局 17 の製剤総則「散剤」の項に適合する。 (3) 識別コード 該当しない
2. 製剤の組成	(1) 有効成分の含量（1g 中） <i>d,l</i> メチルエフェドリン塩酸塩……………0.1g (2) 添加物 乳糖水和物、バレイシヨデンブシ

3. 製剤の各種条件下における安定性	<p>製剤包装（ポリエチレン製袋入＋紙函）の安定性</p> <p>3年間の室温安定性試験において、外観の変化は認められなかった。また、有効成分の残存量は、表示量に対して100%→98%に変化したものの非常に安定な製剤であることが確認できた。</p>
4. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	該当資料なし
5. 混入する可能性のある夾雑物	該当資料なし
6. 溶出試験	該当資料なし
7. 製剤中の有効成分の確認試験法	<p>本品0.5gに水100mLを加え、20分間激しく振り混ぜた後、必要ならばろ過する。この液につき、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250～253nm、255～259nm及び261～264nmに吸収の極大を示す。</p>
8. 製剤中の有効成分の定量法	<p>本品約0.5gを精密に量り、内標準溶液4mLを正確に加え、更に水25mLを加え、20分間激しく振り混ぜて溶かした後、水を加えて50mLとし、必要ならば孔径0.45μmのメンブランフィルターでろ過し、初めのろ液10mLを除き、次のろ液を試料溶液とする。別に定量用<i>d,l</i>-メチルエフェドリン塩酸塩を105℃で3時間乾燥し、その約50mgを精密に量り、内標準溶液4mLを正確に加え、更に水を加えて溶かし、50mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液20μLにつき、次の条件で液体クロマトグラフィーにより試験を行い、内標準物質のピーク面積に対するメチルエフェドリンのピーク面積の比Q_T及びQ_Sを求める。</p> <p><i>d,l</i>-メチルエフェドリン塩酸塩 (C₁₁H₁₇NO·HCl) の量 (mg)</p> $=W_S \times (Q_T / Q_S)$ <p>W_S : 定量用 <i>d,l</i>-メチルエフェドリン塩酸塩の秤取量 (mg)</p> <p>内標準溶液 パラオキシ安息香酸メチルのアセトニトリル溶液 (1→10000)</p> <p>試験条件</p> <p>検出器：紫外吸光光度計（測定波長：257nm）</p> <p>カラム：内径4.6mm、長さ15cmのステンレス管に5μmの液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲルを充填する。</p> <p>カラム温度：40℃付近の一定温度</p> <p>移動相：リン酸二水素カリウム13.6g及び1-ヘプタンスルホン酸ナトリウム3gを水1000mLに溶かし、リン酸を加えてpHを2.5に調整する。この液900mLにアセトニトリル200mLを加える。</p> <p>流量：メチルエフェドリンの保持時間が約10分になるように調整する。</p> <p>システム適合性</p> <p>システムの性能：標準溶液20μLにつき、上記の条件で操作するとき、メチルエフェドリン、内標準物質の順に溶出し、その分離度は3以上である。</p> <p>システムの再現性：標準溶液20μLにつき、上記の条件で試験を6回繰り返すとき、内標準物質のピーク面積に対するメチルエフェドリンのピーク面積の比の相対標準偏差は1.0%以下である。</p>

9. 容器の材質

内袋：ポリエチレン

10. その他

外装：紙

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

下記疾患に伴う咳嗽

気管支喘息、感冒、急性気管支炎、慢性気管支炎、肺結核、上気道炎
(咽喉頭炎、鼻カタル)

蕁麻疹、湿疹

2. 用法及び用量

(1) 用法・用量

通常、成人には、1回0.25～0.50gを1日3回経口投与する。

(d,l-メチルエフェドリン塩酸塩として、1回25～50mg)

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2) 最大使用投与量・投与期間

該当資料なし

(3) 小児用量

該当資料なし

(4) 高齢者用量

該当資料なし

3. 臨床成績

(1) 臨床効果

該当資料なし

(2) 従来使用されている薬物との比較臨床試験データ

該当資料なし

4. その他の薬理作用

該当資料なし

5. 治療的効果

該当資料なし

VI. 薬物薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群
2. 薬理作用

エフェドリン塩酸塩、マオウ製剤

(1) 作用部位・作用機序

アドレナリン作動性の気管支拡張作用と中枢性鎮咳作用を示す。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 気管支拡張作用

ヒスタミン吸入によるモルモット実験的喘息に対する喘息防止作用(ED₅₀)は、経口投与 45mg/kg、皮下投与 28mg/kg である。50mg/kg 経口投与により、作用は3時間持続する。

2) 鎮咳作用

亜硫酸ガス吸入によるモルモット実験咳に対する鎮咳作用(ED₅₀)は、皮下投与 24mg/kg でエフェドリンの0.7倍、コデインの0.6倍である。また、機械的刺激に対しては、腹腔内投与 35.2mg/kg でコデインの0.4倍である。

3) 抗アレルギー作用

ヒスタミン皮内投与によるヒトの膨疹及び発赤に対し、1mg 皮内投与によりジフェンヒドラミンと同程度に抑制する。

(3) 薬理学的特徴

d,l-メチルエフェドリン塩酸塩はエフェドリンと類似の薬理作用を示す。動物実験においては、エフェドリンと同程度ないし若干弱い気管支拡張作用を示すが、血圧上昇作用は約1/10、中枢興奮作用ははるかに弱い。臨床的には、*l*-エフェドリンの2倍量を喘息発作の治療に用いて同程度以上の奏効率を得たが、エフェドリンにみられるような心悸亢進、不眠、興奮、頭痛の起こることは少ないと報告されている。

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) 通常用量での血中濃度

該当資料なし

(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	<p>(1) 吸収速度定数 該当資料なし</p> <p>(2) バイオアベイラビリティ 該当資料なし</p> <p>(3) 消失速度定数 該当資料なし</p> <p>(4) クリアランス 該当資料なし</p> <p>(5) 分布容積 該当資料なし</p> <p>(6) 血漿蛋白結合率 該当資料なし</p>
3. 作用発現時間	該当資料なし
4. 作用持続時間	4 時間
5. 吸収	該当資料なし
6. 分布	<p>(1) 血液-脳関門通過性 該当資料なし</p> <p>(2) 胎児への移行性 該当資料なし</p> <p>(3) 母乳中への移行性 該当資料なし</p> <p>(4) 髄液への移行性 該当資料なし</p> <p>(5) その他の組織への移行性 該当資料なし</p>
7. 代謝	<p>(1) 代謝部位及び代謝経路 代謝経路：N脱メチル化によりエフェドリン、ノルエフェドリンに代謝される。[Lメチルエフェドリン経口投与時、外国データ]</p> <p>(2) 初回通過効果の有無及びその割合 該当資料なし</p> <p>(3) 代謝物の活性の有無 該当資料なし</p> <p>(4) 活性代謝物の速度論的パラメータ 該当資料なし</p>

8. 排泄	<p>(1) 排泄部位 主に腎臓</p> <p>(2) 排泄率・排泄速度 健康成人男子 3 例に 27.1mg の <i>l</i>-メチルエフェドリンを水溶液として経口投与したとき、24 時間までに投与量の 63.7～79.7%が未変化体として尿中に排泄される。<i>N</i>-脱メチル化体であるエフェドリン及びノルエフェドリンとしての尿中排泄率は、それぞれ 10.0～16.9%、1.0～1.7%である。〔酸性尿の場合、外国データ〕</p>
9. 透析等による除去率	<p>(1) 腹膜透析 該当資料なし</p> <p>(2) 血液透析 該当資料なし</p> <p>(3) 直接血液灌流 該当資料なし</p>

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	記載なし
2. 禁忌内容とその理由	<p>【禁忌（次の患者には投与しないこと）】 カテコールアミン製剤（エピネフリン、イソプロテレノール等）を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕</p>
3. 原則禁忌とその理由	記載なし
4. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	記載なし
5. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	記載なし
6. 慎重投与内容とその理由	<p>(1) 甲状腺機能亢進症の患者〔交感神経刺激作用により甲状腺機能亢進症を悪化させるおそれがある。〕</p> <p>(2) 高血圧症の患者〔交感神経刺激作用により高血圧症状を悪化させるおそれがある。〕</p> <p>(3) 心疾患のある患者〔交感神経刺激作用により心拍数が増加し、心臓に過負荷をかけることがあるため、症状を悪化させるおそれがある。〕</p> <p>(4) 糖尿病の患者〔交感神経刺激作用により糖代謝を促進し、血中グルコースを増加させるおそれがある。〕</p>
7. 重要な基本的事項とその理由及び処置方法	<p>(1) 用法・用量どおり正しく使用しても効果が認められない場合は、本剤が適当でないと考えられるので、投与を中止すること。なお、小児に投与する場合には、使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。</p> <p>(2) 過度に使用を続けた場合、不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがあるので、使用が過度にならないように注意すること。</p>

8. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
カテコールアミン製剤 エピネフリン イソプロテレノール 等	不整脈、場合によっては心停止を起こすおそれがあるので併用を避けること。	相加的に作用（交感神経刺激作用）を増強させる。

(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
MAO 阻害剤 甲状腺製剤 チロキシン リオチロニン 等	作用が増強されるおそれがあるので、減量をするなど慎重に投与すること。	
キサンチン誘導体 テオフィリン ステロイド剤 プレドニゾロン 利尿剤 アミノフィリン	血清カリウム値が低下するおそれがある。 併用する場合には定期的に血清カリウム値を観察し、用量について注意すること。	相加的に作用（血清カリウム値の低下作用）を増強する。 β_2 刺激剤は cAMP を活性化し Na-K ポンプを刺激する。

9. 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

重篤な血清カリウム値の低下： β_2 刺激剤により重篤な血清カリウム値の低下が報告されている。また、 β_2 刺激剤による血清カリウム値の低下作用は、キサンチン誘導体、ステロイド剤及び利尿剤の併用により増強することがあるので、**重症喘息患者**では特に注意すること。特に、低酸素血症においては、血清カリウム値を観察することが望ましい。

2) その他の副作用

種類\頻度	頻度不明	0.1~5%未満
循環器		心悸亢進、顔面蒼白 等
精神神経系	熱感	頭痛、不眠、眩暈、眠気、神経過敏、疲労 等
消化器		悪心、食欲不振、腹部膨満感 等
過敏症	発疹 等	
その他		口渇

注) このような副作用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。

(2) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

10. 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。

11. 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こと。[授乳中の投与に関する安全性は確立していない。]
12. 小児等への投与	小児に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。
13. 臨床検査結果に及ぼす影響	交感神経刺激作用により、心拍数、血圧に影響することが考えられる。
14. 過量投与	「重要な基本的注意」の項参照
15. 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）	記載なし
16. その他の注意	記載なし
17. その他	記載なし

Ⅷ. 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) 急性毒性 (LD ₅₀ mg/kg) マウス : 静脈内 134、経口 758、皮下 484 モルモット : 静脈内 118、皮下 358 (2) 亜急性毒性 該当資料なし (3) 慢性毒性 該当資料なし (4) 生殖毒性 該当資料なし (5) その他の特殊毒性 該当資料なし

3. 動物での体内動態	(1) 吸収	該当資料なし
	(2) 分布	該当資料なし
	(3) 代謝	該当資料なし
	(4) 排泄	該当資料なし
	(5) その他	該当資料なし

X. 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	有効期間：3年 使用期限：ラベルに表示
2. 貯法・保存条件	遮光して室温保存
3. 薬剤取扱い上の注意点	記載なし
4. 包装	500g
5. 同一成分・同効薬	同一成分薬：日本薬局方 <i>dl</i> -メチルエフェドリン塩酸塩散 10% 同効薬：日本薬局方 エフェドリン塩酸塩散 10%
6. 製造・輸入承認年月日及び承認番号	製造承認年月日：2020年7月6日 承認番号：30200AMX00573
7. 薬価基準収載年月日	薬価基準収載
8. 再審査期間	該当しない
9. 長期投与の可否	該当しない
10. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	2221003B2199
11. 保険給付上の注意	特になし

X I . 文献

1. 引用文献

(1) 第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016.

(2) 日本薬局方 医薬品情報 2006, p.1835, (株)じほう, 2006.

2. その他の参考文献

特になし

X II . 参考資料

主な外国での発売状況

該当資料なし

X III . 備考