

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

中枢興奮・鎮痛剤

安息香酸ナトリウムカフェイン注射液

処方箋医薬品

安息香酸Naカフェイン注100mg「フソー」

安息香酸Naカフェイン注200mg「フソー」

Caffeine and Sodium Benzoate Injection "FUSO"

剤形	水性注射剤
製剤の規制区分	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	安息香酸 Na カフェイン注 100mg 「フソー」： 1mL 中 日局 安息香酸ナトリウムカフェイン 100mg 安息香酸 Na カフェイン注 200mg 「フソー」： 1mL 中 日局 安息香酸ナトリウムカフェイン 200mg
一般名	和名：安息香酸ナトリウムカフェイン（JAN） 洋名：Caffeine and Sodium Benzoate（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：2020年7月6日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：1982年10月1日 販売開始年月日：1982年10月1日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：扶桑薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	扶桑薬品工業株式会社 研究開発センター 学術室 TEL 06-6964-2763 FAX 06-6964-2706（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.fuso-pharm.co.jp/cnt/seihin/

本 I F は 2021 年 12 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

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

(<http://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「XII. 参考資料」、「XIII. 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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や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。

(2020 年 4 月)

目次

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

VII-5 分布	11	(7)その他の特殊毒性	16
(1)血液-脳関門通過性	11		
(2)血液-胎盤関門通過性	11		
(3)乳汁への移行性	11		
(4)髄液への移行性	11		
(5)その他の組織への移行性	11		
(6)血漿蛋白結合率	11		
VII-6 代謝	11		
(1)代謝部位及び代謝経路	11		
(2)代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種, 寄与率	11		
(3)初回通過効果の有無及びその割合	11		
(4)代謝物の活性の有無及び活性比, 存在比率	11		
VII-7 排泄	12		
VII-8 トランスポーターに関する情報	12		
VII-9 透析等による除去率	12		
VII-10 特定の背景を有する患者	12		
VII-11 その他	12		
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	13		
VIII-1 警告内容とその理由	13		
VIII-2 禁忌内容とその理由	13		
VIII-3 効能又は効果に関連する注意とその理由	13		
VIII-4 用法及び用量に関連する注意とその理由	13		
VIII-5 重要な基本的注意とその理由	13		
VIII-6 特定の背景を有する患者に関する注意	13		
(1)合併症・既往歴等のある患者	13		
(2)腎機能障害患者	13		
(3)肝機能障害患者	13		
(4)生殖能を有する者	13		
(5)妊婦	14		
(6)授乳婦	14		
(7)小児等	14		
(8)高齢者	14		
VIII-7 相互作用	14		
(1)併用禁忌とその理由	14		
(2)併用注意とその理由	14		
VIII-8 副作用	15		
(1)重大な副作用と初期症状	15		
(2)その他の副作用	15		
VIII-9 臨床検査結果に及ぼす影響	15		
VIII-10 過量投与	15		
VIII-11 適用上の注意	15		
VIII-12 その他の注意	15		
(1)臨床使用に基づく情報	15		
(2)非臨床試験に基づく情報	15		
IX. 非臨床試験に関する項目	16		
IX-1 薬理試験	16		
(1)薬効薬理試験	16		
(2)安全性薬理試験	16		
(3)その他の薬理試験	16		
IX-2 毒性試験	16		
(1)単回投与毒性試験	16		
(2)反復投与毒性試験	16		
(3)遺伝毒性試験	16		
(4)がん原性試験	16		
(5)生殖発生毒性試験	16		
(6)局所刺激性試験	16		
X. 管理的事項に関する項目	17		
X-1 規制区分	17		
X-2 有効期間	17		
X-3 包装状態での貯法	17		
X-4 取扱い上の注意	17		
X-5 患者向け資材	17		
X-6 同一成分・同効薬	17		
X-7 国際誕生年月日	17		
X-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	17		
X-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	17		
X-10 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	18		
X-11 再審査期間	18		
X-12 投薬期間制限に関する情報	18		
X-13 各種コード	18		
X-14 保険給付上の注意	18		
XI. 文献	19		
XI-1 引用文献	19		
XI-2 その他の参考文献	19		
XII. 参考資料	20		
XII-1 主な外国での発売状況	20		
XII-2 海外における臨床支援情報	20		
XIII. 備考	21		
XIII-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	21		
(1)粉碎	21		
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	21		
XIII-2 その他の関連資料	21		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯¹⁾

1881年 Tanret が、カフェインは有機酸塩すなわち安息香酸ナトリウム、サリチル酸ナトリウムなどと易溶性塩を形成し、経口投与及び注射剤として用いられることを発表して以来、急速に用いられるようになった。

医療事故防止対策の強化及び後発医薬品の使用促進を目的として、「医療用後発医薬品の販売名の一般的名称への変更に係る代替新規承認申請の取扱いについて」（平成29年6月30日医政経発0630第1号、薬生薬審発0630第5号、薬生安発0630第1号）により、2020年7月6日付で、アンナカ注「フソー」-10%、-20%から安息香酸Naカフェイン注100mg、200mg「フソー」へ販売名変更の承認を受けた。

2. 製品の治療学的特性²⁾

カフェインはテオフィリンやテオブロミンと同じキサンチン誘導体で、水に対する溶解度を高めるために、安息香酸ナトリウムとの易溶性塩に製したのが本剤である。従って、本剤の薬理作用は主としてカフェインによるもので、中枢興奮及び頭痛緩解作用を示す。

3. 製品の製剤学的特性

特になし

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料、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料	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

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

特になし

(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（RMP策定対象外の事例）

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

安息香酸 Na カフェイン注 100mg 「フソー」

安息香酸 Na カフェイン注 200mg 「フソー」

(2) 洋名

Caffeine and Sodium Benzoate Injection 100mg "FUSO"

Caffeine and Sodium Benzoate Injection 200mg "FUSO"

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

安息香酸ナトリウムカフェイン (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

Caffeine and Sodium Benzoate (JAN)

(3) ステム

該当しない

3. 構造式又は示性式

該当しない

4. 分子式及び分子量

該当しない

5. 化学名 (命名法) 又は本質

該当しない

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

アンナカ

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の粉末で、においはなく、味は僅かに苦い。

(2) 溶解性¹⁾

水に溶けやすく、酢酸(100)又は無水酢酸にやや溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

1g は水約 3mL、エタノール(95)約 60mL 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

該当資料なし

(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

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法, 定量法

確認試験法

- (1) クロロホルム抽出後、日局カフェイン水和物の確認試験を準用
- (2) 安息香酸塩の定性反応
- (3) ナトリウム塩の定性反応

定量法

過塩素酸・1,4-ジオキサン液による電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

水性注射剤

(2) 製剤の外観及び性状

無色澄明の液

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

販売名	pH	浸透圧比 (生理食塩液に対する比)
安息香酸 Na カフェイン注 100mg 「フソー」	7.0~8.0	2.5~3.0
安息香酸 Na カフェイン注 200mg 「フソー」		4.8~5.8

(5) その他

該当しない

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	安息香酸 Na カフェイン注 100mg「フソー」	安息香酸 Na カフェイン注 200mg「フソー」
容量	1mL	
有効成分	1 管中 日局 安息香酸ナトリウムカフェイン 100mg	1 管中 日局 安息香酸ナトリウムカフェイン 200mg
添加剤	ベンジルアルコール 10mg pH 調節剤	ベンジルアルコール 10mg pH 調節剤

(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

IV. 製剤に関する項目

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

長期保存試験³⁾

販売名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
安息香酸 Na カフェイン注 100mg 「フソー」	25°C±2°C	3年	最終包装	変化なし
安息香酸 Na カフェイン注 200mg 「フソー」				

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

鉍酸、酸性物質、重金属塩、ヨウ素、タンニンで沈殿、塩化鉄で変色する。また、安息香酸ナトリウムカフェインの水溶液に酸を加えれば難溶性の安息香酸や、ときにはカフェインを析出する¹⁾。

< pH変動スケール >

安息香酸 Na カフェイン注 100mg 「フソー」

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10mL (0.1mol/L HCl)						10mL (0.1mol/L NaOH) →							
	1.31						7.41 (試料 pH)						12.73	

安息香酸 Na カフェイン注 200mg 「フソー」

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
※	←10mL (0.1mol/L HCl)						10mL (0.1mol/L NaOH) →							
	1.60						7.59 (試料 pH)						12.80	

※30分後、白色針状結晶

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

特になし

(2) 包装

<安息香酸 Na カフェイン注 100mg 「フソー」>

1mL 10管 ガラスアンプル

<安息香酸 Na カフェイン注 200mg 「フソー」>

1mL 10管 ガラスアンプル

IV. 製剤に関する項目

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ガラス

11. 別途提供される資材類

特になし

12. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- ねむけ、倦怠感
- 血管拡張性及び脊椎穿刺後頭痛

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

安息香酸ナトリウムカフェインとして、通常成人1回0.1～0.4gを1日1～3回皮下、筋肉内又は静脈内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

設定されていない

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

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

特になし

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

中枢興奮薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

薬理作用は主としてカフェインに基づく作用である。細胞レベルでの作用機序としては、筋小胞体からのCa²⁺遊離作用、ホスホジエステラーゼ阻害作用、アデノシンA₁受容体遮断作用を示す。

1. 中枢神経系興奮作用

中枢において、大脳皮質に作用し感覚受容能及び精神機能をたかめ眠気を除去するほか、運動中枢や延髄の呼吸中枢を興奮させる。

2. 頭痛緩解作用

脳血管抵抗増大や脳血流量低下、またそれに伴う脳脊髄圧低下によると考えられる頭痛緩解作用がある。

(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

該当しない

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²⁾

カフェイン摂取（経口）によってヒトで致命的な中毒を起こすことは稀である。成人におけるカフェインの短期致死量は約5～10gであるように思われるが、中毒反応は、1g（15mg/kg、30 μ g/mLを超える血清濃度）の摂取の後にみられることがある。これらは主に中枢神経系と循環器系に関係したものである。不眠症・落ち着きのなさ・興奮は初期の症状であり、そして軽いせん妄に進展することがあり嘔吐および痙攣もまた著明となる。筋肉は緊張し振戦する。頻脈と期外収縮もまた著しく、呼吸も速くなる。

(4) 食事・併用薬の影響

VIII-7. の項 参照

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⁴⁾

カフェインのクリアランスは 1.4 ± 0.5 mL/min/kg である。

(5) 分布容積¹⁾

カフェインの分布容積は 0.61L/kg である。

(6) その他

特になし

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

VII. 薬物動態に関する項目

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

〈参考〉²⁾

イヌにカフェインを腹腔内投与したとき、自由に血液-脳関門を通過した。

(2) 血液-胎盤関門通過性²⁾

カフェインは自由に胎盤関門を通過し、生殖腺に移行する。

(3) 乳汁への移行性²⁾

カフェインは乳汁中へ分泌される。安息香酸ナトリウムカフェインとしてカフェイン 150mg 経口投与 1 時間後の母親のカフェイン最高濃度は、血清中 2.39~4.05 $\mu\text{g/mL}$ 、母乳中 1.4~2.4 $\mu\text{g/mL}$ であった。

(4) 髄液への移行性²⁾

カフェインは髄液中に容易に出現する。

(5) その他の組織への移行性²⁾

カフェインは体内のあらゆる部位に分布する。

(6) 血漿蛋白結合率¹⁾

カフェインの血中たん白結合率は約 37% である。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路^{1), 2)}

カフェインの体内変化は主として *N*-脱メチル化と 8 位の酸化であるが、ヒトでは肝臓で 3 位の脱メチル化を受けた 1,7-ジメチルキサンチン (パラキサンチン) が多い。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種, 寄与率⁵⁾

CYP1A2

(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

VII. 薬物動態に関する項目

7. 排泄

排泄部位及び経路¹⁾：腎臓

排泄率：

カフェインの排泄物は、1,7-ジメチルキサンチンが更に脱メチル化した1-メチルキサンチンとそれが酸化された1-メチル尿酸が多く、両者で46%、1,7-ジメチルキサンチン、7-メチルキサンチン、1,3-ジメチル尿酸と未変化体が少量ずつである¹⁾。

カフェインは尿中には極めてわずかの量(0.5~1.5%)しか排泄されない²⁾。

排泄速度²⁾：

カフェインのヒトでの半減期は成人では約3~6時間であるが、新生児では100時間にもなる。

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

特になし

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

設定されていない

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

設定されていない

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

9.1.1 胃潰瘍又はその既往歴のある患者

胃液分泌を促進するため、悪影響を及ぼすおそれがある。

9.1.2 心疾患のある患者

徐脈又は頻脈を起こすことがある。

9.1.3 緑内障の患者

症状が悪化するおそれがある。

(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

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。なお、長期連用を避けること。カフェインは胎盤を通過する。

(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。なお、長期連用を避けること。カフェインは母乳中に容易に移行する。

(7) 小児等

9.7 小児等

低出生体重児、新生児に使用する場合には十分注意すること。外国において、ベンジルアルコールの静脈内大量投与（99～234mg/kg）により、中毒症状（あえぎ呼吸、アシドーシス、痙攣等）が低出生体重児に発現したとの報告がある^{6),7)}。本剤は添加剤としてベンジルアルコールを含有している。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

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

10.2 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
キサンチン系薬剤 アミノフィリン水和物 ジプロフィリン テオフィリン等 中枢神経興奮薬	過度の中枢神経刺激作用 があらわれることがある。	併用薬の代謝・排泄を遅延 させることがある。
モノアミン酸化酵素阻害剤	頻脈、血圧上昇等があらわ れることがある。	
シメチジン	過度の中枢神経刺激作用 があらわれることがある。	カフェインの代謝・排泄を 遅延させることがある。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
大量投与	振せん、頻脈、期外収縮、耳鳴、不眠、不穏等

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

13. 過量投与

13.1 症状

消化器症状（悪心、嘔吐等）、循環器症状（不整脈、血圧上昇等）、精神神経症状（痙攣、昏睡）、呼吸器症状（呼吸促進、呼吸麻痺等）等の増悪を起こすことがある。

13.2 処置

興奮状態には対症療法としてジアゼパム注、フェノバルビタール注等の中枢神経抑制薬投与を考慮し、呼吸管理を実施する。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 皮下・筋肉内注射時

組織・神経などへの影響を避けるため、下記の点に配慮すること。

- ・神経走行部位を避けるよう注意すること。
- ・繰返し注射する場合には、注射部位を変え、たとえば左右交互に注射するなど配慮すること。なお、乳児、幼児、小児には連用しないことが望ましい。
- ・注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。

14.1.2 静脈内注射時

できるだけゆっくり行うこと。

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

該当資料なし

(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²⁾

急性毒性 (LD₅₀ mg/kg)

[マウス] 腹腔内 : 525 経口 : 878

(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：処方箋医薬品（注意－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

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：安息香酸ナトリウムカフェイン（マイラン-ファイザー、丸石等）

同 効 薬：カフェイン水和物系製剤

7. 国際誕生年月日

不明

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

製造販売承認年月日	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
2020年7月6日 (販売名変更による)	1982年10月1日	1982年10月1日

承認番号：

安息香酸 Na カフェイン注 100mg 「フソー」：30200AMX00584

安息香酸 Na カフェイン注 200mg 「フソー」：30200AMX00583

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

X-10. の項 参照

X. 管理的事項に関する項目

10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1998年3月12日

内 容：

変 更 前	
効能・効果	◇ねむけ、倦怠感 ◇腎性浮腫 ◇血管拡張性及び脳圧亢進性頭痛（片頭痛、高血圧性頭痛、カフェイン禁断性頭痛など）
用法・用量	安息香酸ナトリウムカフェインとして通常成人1回0.1～0.4g（10%は1～4mL、20%は0.5～2mL）を1日1～3回皮下、筋肉内又は静脈内に注射する。 なお、年齢、症状により適宜増減する。

変更後の効能・効果はV-1.の項、用法・用量はV-3.の項を参照。

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（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

	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 番号	レセプト電算コード
注 100mg	2115403A1049	2115403A1049	102401201	620240101
注 200mg	2115403A2045	2115403A2045	102402901	620240201

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

XI. 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 : C-425-429, C-1249-1253
- 2) JPDI 2011 じほう. 2011 : 188-190
- 3) 扶桑薬品工業株式会社 (長期保存試験) 社内資料
- 4) 齋藤侑也ほか : 薬局. 1990 ; 41 : 71-79
- 5) 高橋芳樹ほか : 肝臓. 2001 ; 42 : 288-296
- 6) Gershanik. J. et al. : N. Engl. J. Med. 1982 ; 307 : 1384-1388
- 7) Brown. W. J. et al. : Lancet, 1982 ; 1 : 1250

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

- (1) 本剤と同一製剤は外国では発売されていない。
- (2) 安息香酸ナトリウムカフェイン製剤としては、各国で発売されている。(2022年4月時点)

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

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし