

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

筋弛緩回復剤
スガマデクスナトリウム注射液

スガマデクス 静注液 200mg シリンジ「ニプロ」

Sugammadex Intravenous Syringes

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	1 シリンジ（2mL）中 スガマデクスナトリウム 217.6mg （スガマデクスとして 200mg）
一般名	和名：スガマデクスナトリウム（JAN） 洋名：Sugammadex Sodium（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：2024 年 2 月 15 日 薬価基準収載年月日：薬価基準未収載 販売開始年月日：
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL：0120-226-898 FAX：050-3535-8939 医療関係者向けホームページ https://www.nipro.co.jp/

本 IF は 2024 年 2 月作成の電子添文の記載に基づき作成した。

最新の情報は、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。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

(2020年4月改訂)

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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIF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IF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IF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て、「IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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IF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IF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。

IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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、IF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、IF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、IF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

IF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。IF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IF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、IFを利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	5. 臨床成績	14
1. 開発の経緯	1	
2. 製品の治療学的特性	1	
3. 製品の製剤学的特性	1	
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	
6. RMPの概要	2	
II. 名称に関する項目	VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	19
2. 一般名	2. 薬理作用	19
3. 構造式又は示性式	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	1. 血中濃度の推移	21
5. 化学名（命名法）又は本質	2. 薬物速度論的パラメータ	21
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3. 母集団（ポピュレーション）解析	22
	4. 吸収	22
	5. 分布	22
	6. 代謝	22
	7. 排泄	23
	8. トランスポーターに関する情報	23
	9. 透析等による除去率	23
	10. 特定の背景を有する患者	23
	11. その他	24
III. 有効成分に関する項目	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
1. 物理化学的性質	1. 警告内容とその理由	25
2. 有効成分の各種条件下における安定性	2. 禁忌内容とその理由	25
3. 有効成分の確認試験法，定量法	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	25
	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	25
IV. 製剤に関する項目	5. 重要な基本的注意とその理由	25
1. 剤形	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	26
2. 製剤の組成	7. 相互作用	27
3. 添付溶解液の組成及び容量	8. 副作用	28
4. 力価	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	29
5. 混入する可能性のある夾雑物	10. 過量投与	29
6. 製剤の各種条件下における安定性	11. 適用上の注意	29
7. 調製法及び溶解後の安定性	12. その他の注意	30
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	IX. 非臨床試験に関する項目	
9. 溶出性	1. 薬理試験	31
10. 容器・包装	2. 毒性試験	31
11. 別途提供される資材類	X. 管理的事項に関する項目	
12. その他	1. 規制区分	32
	2. 有効期間	32
V. 治療に関する項目		
1. 効能又は効果		
2. 効能又は効果に関連する注意		
3. 用法及び用量		
4. 用法及び用量に関連する注意		

3. 包装状態での貯法	32	14. 保険給付上の注意	33
4. 取扱い上の注意	32		
5. 患者向け資材	32	X I . 文 献	
6. 同一成分・同効薬	32	1. 引用文献	34
7. 国際誕生年月日	32	2. その他の参考文献	35
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	33	X II . 参 考 資 料	
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	33	1. 主な外国での発売状況	36
10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及び その内容	33	2. 海外における臨床支援情報	36
11. 再審査期間	33	X III . 備 考	
12. 投薬期間制限に関する情報	33	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	37
13. 各種コード	33	2. その他の関連資料	37

略語表

略語	略語内容
ASA	American Society of Anesthesiologists : 米国麻酔医会
AUC	area under curve : 吸収曲線下面積
CL	Clearance : 総血漿クリアランス
CYP	cytochrome P450 (シトクロム P450)
CV	coefficient of variation : 変動係数
FDA	Food and Drug Administration of the United States : 米国食品医薬品局
RMP	Risk Management Plan : 医薬品リスク管理計画
$t_{1/2}$	消失半減期
V _{ss}	distribution volume under the steady state : 定常状態におけるみかけの分布容積

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

スガマデクスナトリウムは、筋弛緩回復剤であり、本邦では 2010 年に上市されている。
1 シリンジ（2mL）中にスガマデクスを 200mg 含有するスガマデクス静注液 200mg シリンジ「ニプロ」は、ニプロ株式会社が初の後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験及び長期保存試験を実施し、2024 年 2 月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

- スガマデクスナトリウムは、 γ -シクロデキストリンを修飾した選択的筋弛緩剤結合剤である。血漿中で筋弛緩剤のロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物と包接体を形成し、神経筋接合部のニコチン受容体と結合可能な筋弛緩剤の濃度を減少させる。この結果、ロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物による筋弛緩作用が阻害される¹⁾。
- 臨床的には、ロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物による筋弛緩状態からの回復に有用性が認められている。
- 重大な副作用としては、ショック、アナフィラキシー、心室細動、心室頻拍、心停止、高度徐脈、冠動脈攣縮、気管支痙攣が報告されている。（Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

- 清潔で簡便・スピーディーな操作ができるプレフィルドシリンジ製剤である。
- 安定性を考慮して、脱酸素剤封入のガスバリア性ブリスター包装としている。
- 用量調節を考慮し、0.1mL 刻みで目盛りを印字している。
- 誤薬防止対策として、販売名の周囲に薬効別（筋弛緩拮抗剤）カラーコードを表示している。

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	タイトル・参照先
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

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

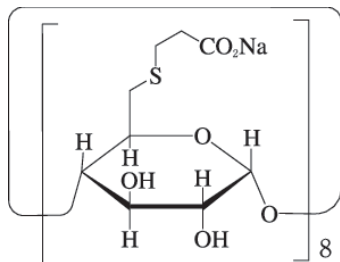
1. 販売名

- (1) 和 名：スガマデクス静注液 200mg シリンジ「ニプロ」
(2) 洋 名：Sugammadex Intravenous Syringes
(3) 名称の由来：有効成分であるスガマデクスに剤形及び含量を記載し、社名である「ニプロ」を付した。

2. 一般名

- (1) 和 名(命名法)：スガマデクスナトリウム (JAN)
(2) 洋 名(命名法)：Sugammadex Sodium (JAN)
(3) ステム (stem)：不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $C_{72}H_{104}O_{48}S_8Na_8$

分子量：2178.01

5. 化学名(命名法)又は本質

Cyclooctakis-(1→4)-{6-S-[2-(sodium carboxylato)ethyl]-6-thio- α -D-glucopyranosyl}
(JAN)

octakis(6-S-(2-carboxyethyl)-6-thio)cyclomaltooctaose octasodium salt (IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の粉末である。

(2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、メタノール又はエタノール（99.5）にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

吸湿性である。

(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) ナトリウム塩の定性反応

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

定量法

液体クロマトグラフィー

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

外観：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ

性状：無色～淡黄褐色澄明の液

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH：7.0～8.0

浸透圧比：約1（生理食塩液に対する比）

(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	有 効 成 分	添 加 剤
スガマデクス静注液 200mg シリンジ「ニプロ」	1 シリンジ（2mL）中 スガマデクスナトリウム 217.6mg （スガマデクスとして 200mg）	1 シリンジ（2mL）中 塩酸 適量 水酸化ナトリウム 適量

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

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

加速試験²⁾

試験条件：40±1℃、75±5%RH

最終包装形態（容器：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ、内包装：ブリスター（脱酸素剤入り）、外包装：紙箱）

項目及び規格	開始時	2 カ月後	4 カ月後	6 カ月後
性状（無色～淡黄褐色澄明の液）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	適合
浸透圧比（1.0～1.4）	1.17～1.18	1.16	1.16～1.17	1.16～1.17
pH（7.0～8.0）	7.46～7.49	7.49～7.51	7.52	7.52～7.54
純度試験	適合	適合	適合	適合
エンドトキシン試験	適合	—	—	適合
採取容量試験	適合	—	—	適合
不溶性異物検査	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	適合	適合	適合	適合
無菌試験	適合	—	—	適合
含量〈スガマデクス〉 (93.0～105.0%)	98.64～98.86	98.55～98.73	99.37～99.55	99.38～99.48
含量〈ヒドロキシ体〉 (3.0%以下)	適合	適合	適合	適合
含量〈スガマデクス及びヒドロキシ体の合計〉 (95.0～105.0%)	98.66～98.88	98.58～98.76	99.40～99.58	99.41～99.52

(n=3)

長期保存試験²⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

最終包装形態（容器：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ、内包装：ブリスター（脱酸素剤入り）、外包装：紙箱）

項目及び規格	開始時	3 カ月後	6 カ月後	9 カ月後	12 カ月後	18 カ月後
性状（無色～淡黄褐色 澄明の液）	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—
浸透圧比（1.0～1.4）	1.17～ 1.18	1.15～ 1.16	1.15～ 1.16	1.15～ 1.16	1.15～ 1.16	1.16～ 1.17
pH（7.0～8.0）	7.46～ 7.49	7.50～ 7.52	7.52～ 7.54	7.52～ 7.54	7.52～ 7.54	7.52～ 7.54
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
エンドトキシン試験	適合	—	—	—	適合	—
採取容量試験	適合	—	—	—	適合	—
不溶性異物検査	適合	適合	適合	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
無菌試験	適合	—	—	—	適合	—
含量〈スガマデクス〉 （93.0～105.0%）	98.64～ 98.86	98.76～ 98.84	99.25～ 99.45	98.91～ 99.51	99.45～ 99.63	99.45～ 99.55
含量〈ヒドロキシ体〉 （3.0%以下）	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量〈スガマデクス及 びヒドロキシ体の合計〉 （95.0～105.0%）	98.66～ 98.88	98.78～ 98.85	99.28～ 99.48	98.94～ 99.53	99.48～ 99.66	99.48～ 99.59

(n=3)

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 カ月）及び長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、18 カ月）の結果、通常の市場流通下において 30 カ月間安定であることが推測された。

温度に対する安定性³⁾

試験条件：60±1℃、75±5%RH

包装形態：①ポリプロピレン製プラスチックシリンジ

②ポリプロピレン製プラスチックシリンジ、ブリストア（脱酸素剤入り）

項目及び規格		包装形態	開始時	2 週間	4 週間
性状（無色～淡黄褐色澄明の液）		①	適合	適合	適合
		②	適合	適合	適合
浸透圧比（1.0～1.4）		①	1.17	1.17	1.16
		②	1.17	1.17	1.15
pH（7.0～8.0）		①	7.54	7.50	7.48
		②	7.54	7.52	7.51
純度試験		①	適合	適合	適合
		②	適合	適合	適合
不溶性異物検査		①	適合	適合	適合
		②	適合	適合	適合
不溶性微粒子試験		①	適合	適合	適合
		②	適合	適合	適合
含量	スガマデクス (93.0～105.0%)	①	99.19	99.49	99.06
		②	99.19	99.85	100.43
	ヒドロキシ体 (3.0%以下)	①	適合	適合	適合
		②	適合	適合	適合
	スガマデクス及びヒド ロキシ体の合計 (95.0～105.0%)	①	99.22	99.53	99.10
		②	99.22	99.88	100.47

(n=1)

光に対する安定性①⁴⁾

試験条件：白色蛍光灯、1000lx

照射期間：1000lx を 1 日 24 時間照射した場合、以下の期間に相当する。

†1 週間、‡2 週間、§4 週間、||3 カ月間

曝光①：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルなし）、横置きで保存

曝光②：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルあり）、横置きで保存

曝光③：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルあり）＋ブリストア（脱酸素剤入り）、横置きで保存

遮光：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルなし）＋アルミホイルで被覆、横置きで保存

項目及び規格		開始時	0.17Mlx・ hr [†]	0.34Mlx・ hr [‡]	0.67Mlx・ hr [§]	2.16Mlx・ hr	
性状（無色～淡黄褐色澄明の液）	曝光①	適合	適合	適合	適合	適合	
	曝光②	適合	適合	適合	適合	適合	
	曝光③	適合	適合	適合	適合	適合	
	遮光	適合	適合	適合	適合	適合	
純度試験	曝光①	適合	適合	適合	不適合	不適合	
	曝光②	適合	適合	適合	適合	不適合	
	曝光③	適合	適合	適合	適合	適合	
	遮光	適合	適合	適合	適合	適合	
含量	スガマデクス (93.0～105.0%)	曝光①	98.90	100.99	100.07	98.00	95.57
		曝光②	98.90	100.35	100.78	98.04	97.68
		曝光③	98.90	101.26	101.09	98.72	99.18
		遮光	98.90	101.12	100.84	98.77	99.04
	ヒドロキシ体 (3.0%以下)	曝光①	適合	適合	適合	適合	適合
		曝光②	適合	適合	適合	適合	適合
		曝光③	適合	適合	適合	適合	適合
		遮光	適合	適合	適合	適合	適合
	スガマデクス及びヒ ドロキシ体の合計 (95.0～105.0%)	曝光①	98.92	101.01	100.09	98.02	95.59
		曝光②	98.92	100.37	100.80	98.07	97.71
		曝光③	98.92	101.28	101.12	98.74	99.21
		遮光	98.92	101.15	100.87	98.80	99.07

(n=1)

光に対する安定性②⁵⁾

試験条件：D65 ランプ、2000lx

曝光①：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルなし）、横置きで保存

曝光②：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルあり）、横置きで保存

曝光③：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルあり）＋ブリストア（脱酸素剤入り）、横置きで保存

遮光：ポリプロピレン製プラスチックシリンジ（ラベルなし）＋アルミホイルで被覆、横置きで保存

項目及び規格		開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
性状（無色～淡黄褐色澄明の液）	曝光①	適合	適合	適合
	曝光②	適合	適合	適合
	曝光③	適合	適合	適合
	遮光	適合	適合	適合
浸透圧比（1.0～1.4）	曝光①	1.15	1.15	1.16
	曝光②	1.15	1.16	1.16
	曝光③	1.15	1.15	1.16
	遮光	1.15	1.16	1.17
pH（7.0～8.0）	曝光①	7.52	7.46	7.44
	曝光②	7.52	7.47	7.46
	曝光③	7.52	7.49	7.47
	遮光	7.52	7.47	7.48
純度試験	曝光①	適合	不適合	不適合
	曝光②	適合	不適合	不適合
	曝光③	適合	適合	適合
	遮光	適合	適合	適合
不溶性異物検査	曝光①	適合	適合	適合
	曝光②	適合	適合	適合
	曝光③	適合	適合	適合
	遮光	適合	適合	適合

項目及び規格		開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr	
不溶性微粒子試験		曝光①	適合	適合	適合
		曝光②	適合	適合	適合
		曝光③	適合	適合	適合
		遮光	適合	適合	適合
含量	スガマデクス (93.0～105.0%)	曝光①	98.90	97.19	93.25
		曝光②	98.90	97.96	96.29
		曝光③	98.90	99.29	99.39
		遮光	98.90	98.80	98.71
	ヒドロキシ体 (3.0%以下)	曝光①	適合	適合	適合
		曝光②	適合	適合	適合
		曝光③	適合	適合	適合
		遮光	適合	適合	適合
	スガマデクス及びヒドロキシ体の合計 (95.0～105.0%)	曝光①	98.92	97.22	93.28
		曝光②	98.92	97.99	96.31
		曝光③	98.92	99.32	99.42
		遮光	98.92	98.83	98.73

(n=1)

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）

「Ⅷ. 11. 適用上の注意」の項参照。

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

22. 包装

スリップタイプ：2mL×10 シリンジ [脱酸素剤入り]

(3) 予備容量

該当資料なし

(4) 容器の材質

シリンジ : ポリプロピレン

プランジャー : ポリプロピレン

ガスケット : ブチルゴム

キャップ : ブチルゴム

11. 別途提供される資材類

該当しない

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・効果

ロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物による筋弛緩状態からの回復

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能・効果に関連する注意

本剤はロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物以外の筋弛緩剤による筋弛緩状態からの回復に対しては使用しないこと。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法・用量

通常、成人にはスガマデクスとして、浅い筋弛緩状態（筋弛緩モニターにおいて四連（TOF）刺激による2回目の収縮反応（ T_2 ）の再出現を確認した後）では1回 2mg/kg を、深い筋弛緩状態（筋弛緩モニターにおいてポスト・テタニック・カウント（PTC）刺激による1～2回の単収縮反応（1-2PTC）の出現を確認した後）では1回 4mg/kg を静脈内投与する。また、ロクロニウム臭化物の挿管用量投与直後に緊急に筋弛緩状態からの回復を必要とする場合、通常、成人にはスガマデクスとして、ロクロニウム臭化物投与3分後を目安に1回 16mg/kg を静脈内投与する。

(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

7. 用法・用量に関連する注意

- 7.1 筋弛緩モニターによる確認ができない場合は、十分な自発呼吸の発現を確認した後はスガマデクスとして 2mg/kg を投与すること。十分な自発呼吸の発現を確認する前のロクロニウム臭化物による筋弛緩に対してはスガマデクスとして 4mg/kg を投与するが、筋弛緩状態からの回復が遅延することがあるため、患者の状態を十分に観察すること。なお、筋弛緩モニターによる確認ができない場合の自発呼吸の発現を確認する前のベクロニウム臭化物による筋弛緩に対する本剤の有効性及び安全性は確立されていない。
- 7.2 ベクロニウム臭化物の挿管用量投与直後に緊急に筋弛緩状態からの回復を必要とする場合の本剤の有効性及び安全性は確立していない。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(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

17.1.2 海外第Ⅲ相試験

(1) 各科領域手術患者（ASA 分類 Class 1～4）に、非盲検下でロクロニウム臭化物 0.6mg/kg 又はベクロニウム臭化物 0.1mg/kg を静脈内投与した後、筋弛緩モニターにおける四連（TOF）刺激による 2 回目の収縮反応（ T_2 ）の再出現時にスガマデクスナトリウム（スガマデクスとして 2.0mg/kg）又はネオスチグミンメチル硫酸塩 50 μ g/kg を、またポスト・テタニック・カウント（PTC）刺激による 1～2 回の単収縮反応（1-2PTC）の出現時にスガマデクスナトリウム（スガマデクスとして 4.0mg/kg）又はネオスチグミンメチル硫酸塩 70 μ g/kg を単回静脈内投与したとき、スガマデクスナトリウム又はネオスチグミンメチル硫酸塩投与開始から TOF 比（ T_4/T_1 の比）0.9 に回復するまでの時間は表 2 のとおりであり、スガマデクスナトリウムによる回復時間はネオスチグミンメチル硫酸塩と比較して有意に早かった（ $p < 0.0001$ 、回復時間の対数変換値を用いて治療群及び施設を因子とした二元配置分散分析）^{6)~8)}。

表 2 海外第Ⅲ相試験成績

スガマデクスナトリウム投与時の筋弛緩状態	筋弛緩剤の種類	投与群	投与開始から TOF 比（ T_4/T_1 の比）0.9 に回復するまでの時間（幾何平均値 ^{注 2)} 、ITT)
浅い筋弛緩（ T_2 再出現時）	ロクロニウム臭化物	スガマデクスナトリウム	1.5 分（n=48）
		ネオスチグミンメチル硫酸塩	18.5 分（n=48）
	ベクロニウム臭化物	スガマデクスナトリウム	2.8 分（n=48）
		ネオスチグミンメチル硫酸塩	16.8 分（n=45）

スガマデクスナトリウム投与時の筋弛緩状態	筋弛緩剤の種類	投与群	投与開始から TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間 (幾何平均値 ^{注2)} 、ITT)
深い筋弛緩 (1-2PTC 出現時)	ロクロニウム臭化物	スガマデクスナトリウム	2.9 分 (n=37)
		ネオスチグミンメチル硫酸塩	50.4 分 (n=37)
	ベクロニウム臭化物	スガマデクスナトリウム	4.5 分 (n=47)
		ネオスチグミンメチル硫酸塩	66.2 分 (n=36)

注 2) 欠測値を補完した場合

浅い筋弛緩 (T_2 再出現時) にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を投与した群 (n=96) で報告された主な副作用は悪心、嘔吐、処置による高血圧 (各 n=4) だった。

深い筋弛緩 (1-2PTC 出現時) にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 4.0mg/kg) を投与した群 (n=83) で報告された主な副作用は悪心 (n=5) だった。

- (2) 各科領域手術患者 (ASA 分類 Class 1~2) に、非盲検下でロクロニウム臭化物 1.2mg/kg を静脈内投与した 3 分後にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 16.0mg/kg) を静脈内投与したときのロクロニウム臭化物投与後から T_1 が 10% に回復するまでの時間 (平均値±標準偏差) は 4.4 ± 0.7 分 (n=55) であり、スキサメトニウム塩化物水和物 1.0mg/kg を静脈内投与後から T_1 が 10% に回復するまでの時間 (平均値±標準偏差) 7.1 ± 1.6 分 (n=55) と比較して有意に早かった ($p < 0.0001$ 、治療群及び施設を因子とした二元配置分散分析)^{9)、10)}。

スガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 16.0mg/kg) を投与した群 (n=56) で報告された主な副作用は処置合併症 (n=4) だった。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

17.1.3 海外第Ⅲ相試験 (高齢者)

各科領域手術を受ける高齢患者及び非高齢患者 (ASA 分類 Class 1~3) に、非盲検下でロクロニウム臭化物 0.6mg/kg を静脈内投与した後、筋弛緩モニターにおける四連 (TOF) 刺激による T_2 再出現時にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を単回静脈内投与したとき、スガマデクスナトリウム投与開始から TOF

比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間 (平均値±標準偏差) は、非高齢者群 (18～64 歳) で 2.5 ± 1.3 分 ($n=48$)、65～74 歳群で 2.9 ± 1.6 分 ($n=62$)、75 歳以上群で 3.9 ± 1.7 分 ($n=40$) であった¹¹⁾⁻¹³⁾。[9.8 参照]

スガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を投与した 65～74 歳群 ($n=62$) で報告された副作用は頻脈、発熱、処置による低血圧、浮動性めまい、乏尿 (各 $n=1$) だった。スガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を投与した 75 歳以上群は副作用の報告がなかった。

17.1.4 海外第Ⅲ相試験 (腎機能障害患者)

各科領域手術を受ける重度腎機能障害患者 (クレアチニンクリアランス 30mL/min 未満) 又は腎機能正常患者 (クレアチニンクリアランス 80mL/min 以上) に、非盲検下でロクロニウム臭化物 0.6mg/kg を静脈内投与した後、筋弛緩モニターにおける四連 (TOF) 刺激による T_2 再出現時にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を、またポスト・テタニック・カウント (PTC) 刺激による 1～2 回の単収縮反応 (1-2PTC) の出現時にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 4.0mg/kg) を単回静脈内投与したとき、スガマデクスナトリウム投与開始から TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間は表 3 のとおりであった¹⁴⁾⁻¹⁷⁾。

表 3 海外第Ⅲ相試験成績 (腎機能障害患者)

スガマデクスナトリウム投与時の筋弛緩状態	スガマデクスナトリウム投与量 ^{注 3)}	投与開始から TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間	
		腎機能正常患者 (ASA 分類 Class 1～2)	1.7±0.6 分 ^{注 4)} ($n=14$, PP)
浅い筋弛緩 (T_2 再出現時)	2.0mg/kg	重度腎機能障害患者 (ASA 分類 Class 2～3)	2.0±0.7 分 ^{注 4)} ($n=15$, PP)
深い筋弛緩 (1-2PTC 出現時)	4.0mg/kg	腎機能正常患者 (ASA 分類 Class 1～3)	1.9 分 ^{注 5)} ($n=32$, ITT)
		重度腎機能障害患者 (ASA 分類 Class 2～3)	3.4 分 ^{注 5)} ($n=35$, ITT)

注 3) スガマデクスとしての投与量

注 4) 平均値±標準偏差

注 5) 幾何平均値、欠測値を補完した場合

浅い筋弛緩 (T_2 再出現時) にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を投与した腎機能正常患者群 ($n=15$) で報告された副作用は下痢、悪心、麻酔合併症、酸素飽和度低下 (各 $n=1$) だった。

浅い筋弛緩 (T_2 再出現時) にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を投与した重度腎機能障害患者群 ($n=15$) で報告された副作用は下痢、麻酔合併症、頭痛 (各 $n=1$) だった。

(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

17.1.1 国内外第Ⅱ相試験

各科領域手術患者（ASA 分類 Class 1～3）に、非盲検下でロクロニウム臭化物 0.9mg/kg 又はベクロニウム臭化物 0.1mg/kg を静脈内投与した後、筋弛緩モニターにおける四連（TOF）刺激による 2 回目の収縮反応（ T_2 ）の再出現時にスガマデクスナトリウム（スガマデクスとして 2.0mg/kg）を、またポスト・テタニック・カウント（PTC）刺激による 1～2 回の単収縮反応（1-2PTC）の出現時にスガマデクスナトリウム（スガマデクスとして 4.0mg/kg）を単回静脈内投与したとき、スガマデクスナトリウム投与開始から TOF 比（ T_4/T_1 の比）0.9 に回復するまでの時間は表 1 のとおりであり、ロクロニウム臭化物投与後のスガマデクスナトリウムによる筋弛緩状態からの回復時間は、ベクロニウム臭化物投与後と比較して早い傾向が認められた^{11)、18)-21)}。

表 1 国内外第Ⅱ相試験成績

スガマデクスナトリウム投与時の筋弛緩状態	筋弛緩剤の種類	スガマデクスナトリウム投与量 ^{注 1)}	人種	投与開始から TOF 比（ T_4/T_1 の比）0.9 に回復するまでの時間（平均値±標準偏差、PPS）
浅い筋弛緩（ T_2 再出現時）	ロクロニウム臭化物	2.0mg/kg	日本人	2.2±1.2 分（n=7）
			白人	1.4±0.5 分（n=9）
	ベクロニウム臭化物	2.0mg/kg	日本人	2.8±0.8 分（n=6）
			白人	3.4±1.9 分（n=7）
深い筋弛緩（1-2PTC 出現時）	ロクロニウム臭化物	4.0mg/kg	日本人	1.6±0.9 分（n=11）
			白人	1.6±0.7 分（n=10）
	ベクロニウム臭化物	4.0mg/kg	日本人	3.0±2.4 分（n=10）

スガマデクスナトリウム投与時の筋弛緩状態	筋弛緩剤の種類	スガマデクスナトリウム投与量 ^{注1)}	人種	投与開始から TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間 (平均値±標準偏差、PPS)
深い筋弛緩 (1-2PTC 出現時)	ベクロニウム臭化物	4.0mg/kg	白人	3.3±3.5 分 (n=8)

注 1) スガマデクスとしての投与量

浅い筋弛緩 (T_2 再出現時) にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 2.0mg/kg) を投与した群 (日本人 n=19) で報告された副作用は尿中アルブミン陽性、 β_2 ミクログロブリン増加、血中ビリルビン増加 (各 n=1) だった。

深い筋弛緩 (1-2PTC 出現時) にスガマデクスナトリウム (スガマデクスとして 4.0mg/kg) を投与した群 (日本人 n=21) で報告された副作用は口渇 (n=2)、味覚異常 (n=1) だった。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学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

18.1 作用機序

スガマデクスナトリウムは、 γ -シクロデキストリンを修飾した選択的筋弛緩剤結合剤である。血漿中で筋弛緩剤のロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物と包接体を形成し、神経筋接合部のニコチン受容体と結合可能な筋弛緩剤の濃度を減少させる。この結果、ロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物による筋弛緩作用が阻害される¹⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 筋弛緩剤との親和性

スガマデクスナトリウムは、ステロイド系筋弛緩剤であるロクロニウム臭化物及びベクロニウム臭化物に対して非常に高い親和性を示した（結合定数はそれぞれ 15.1 及び $8.8 \times 10^6 \text{M}^{-1}$ ）が、スキサメトニウム塩化物水和物に対する親和性は認められなかった²²⁾。

18.3 筋弛緩回復作用

18.3.1 ロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物がスガマデクスナトリウムに包接されることにより、筋弛緩剤の作用が阻害され、筋弛緩状態からの回復が得られる。*In vitro* 試験において、スガマデクスナトリウムは、ロクロニウム臭化物及びベクロニウム臭化物による筋弛緩を回復させた^{23)、24)}。

18.3.2 ロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物の持続注入により、サル拇指内転筋の TOF 反応の最初の反応 T_1 が 90%抑制される筋弛緩状態に維持し、持続注入の停止後に自然回復させた場合と、460nmol/kg のスガマデクスナトリウムを投与した場合の、TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間を比較した。TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間は、ロクロニウム臭化物による筋弛緩に対して、自然回復で 14.5 ± 1.1 分、スガマデクスナトリウム投与後 1.9 ± 0.5 分（平均値±標準誤差、n=4）であった。また、ベクロニウム臭化物による筋弛緩に対して、自然回復で 23.1 ± 1.8 分、スガマデクスナトリウム投与後 4.4 ± 0.6 分（n=4）であった^{25)、26)}。

18.3.3 サルに ED_{90} （単収縮高を 90%抑制する用量）の 5 倍用量のロクロニウム臭化物（800nmol/kg）又はベクロニウム臭化物（70nmol/kg）を投与し、拇指内転筋に深い筋弛緩を引き起こした後、生理食塩水又は 1,150nmol/kg（ロクロニウム臭化物の約 1.4 倍、ベクロニウム臭化物の約 16.4 倍の濃度）のスガマデクスナトリウムを投

与した (n=4)。ロクロニウム臭化物による筋弛緩に対し、TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間は、生理食塩水投与後 28.2 ± 3.4 分 (平均値 $\pm$ 標準誤差) であったのに対し、スガマデクスナトリウム投与後 7.9 ± 1.8 分と有意に短縮した。一方、ベクロニウム臭化物による筋弛緩に対し、TOF 比 (T_4/T_1 の比) 0.9 に回復するまでの時間は、生理食塩水投与後 49.0 ± 4.7 分であったのに対し、スガマデクスナトリウム投与後 48.6 ± 8.3 分であった²⁷⁾。

(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

16.1 血中濃度

日本人健康成人にスガマデクスナトリウムを非麻酔下で単回静脈内投与したときの薬物動態パラメータは表 1 のとおりであった^{28)、29)}。

表 1 単回静脈内投与後の薬物動態パラメータ

投与量 (mg/kg) 注 1)	症例数	AUC _{0-∞} (μg・min/mL)	CL (mL/min)	Vss (mL)	t _{1/2} (min)
1	14	561 [14.2]	106 [16.7]	12,071 [13.5]	107 [13.9]
8	14	4,604 [10.0]	103 [9.02]	11,799 [15.5]	132 [17.5]
16	14	9,670 [13.5]	98.4 [15.5]	11,370 [15.0]	143 [22.5]

幾何平均値 [幾何 CV (%)]

注 1) スガマデクスとしての投与量

(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

該当しない

(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

該当資料なし

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

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当しない

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

〈参考〉

「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照。

(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

16.3 分布

16.3.1 血漿タンパク及び赤血球への結合

スガマデクスは、ヒト血漿タンパク（薬物濃度：0～125 μ M）及び赤血球（薬物濃度：0～250 μ M）と結合しない^{30)、31)} (*in vitro*)。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人6例に¹⁴C-スガマデクスナトリウム 4mg/kg を非麻酔下で単回静脈内投与したとき、血漿中放射能の99.9%が未変化体であった^{29)、32)}（外国人データ）。

(2) 代謝に關与する酵素（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

16.5 排泄

健康成人6例に¹⁴C-スガマデクスナトリウム 4mg/kg を非麻酔下で単回静脈内投与したとき、投与放射能の約90%が投与24時間以内に尿中に排泄された^{29)、32)} (外国人データ)。

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

「VII. 10. 特定の背景を有する患者」の項参照。

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

重度腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス 30mL/min 未満、透析患者を含む）又は腎機能正常患者（クレアチニンクリアランス 80mL/min 以上）に麻酔下でスガマデクスナトリウム（スガマデクスとして 2mg/kg）を単回静脈内投与したときの薬物動態パラメータは表2のとおりであった^{33)、34)}。別の試験において、重度腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス 30mL/min 未満）、中等度腎機能障害患者（クレアチニンクリアランス 30～50mL/min）又は腎機能正常患者（クレアチニンクリアランス 80mL/min 以上）に非麻酔下でスガマデクスナトリウム（スガマデクスとして 4mg/kg）を単回静脈内投与したときの薬物動態パラメータは表2のとおりであった³⁵⁾ (外国人データ)。[9.2 参照]

表2 腎機能障害患者又は腎機能正常患者に単回静脈内投与したときの薬物動態パラメータ

投与量 (mg/kg) 注2)	腎機能障害の 程度	症例数	AUC _{0-∞} (μg・min/mL)	CL (mL/min)	Vss (mL)	t _{1/2} (min)
2	腎機能正常 患者	13	1,728 [34.8]	95.2 [22.1]	13,800 [20.5]	139 [44.4]

投与量 (mg/kg) 注2)	腎機能障害の 程度	症例数	AUC _{0-∞} (μg・min/mL)	CL (mL/min)	Vss (mL)	t _{1/2} (min)
2	重度腎機能 障害患者注3)	13	27,463 [114]	5.53 [108]	15,986 [35.5]	2,139 [121]
4	腎機能正常 患者	6	3,750	95.0 [16.0]		148 [13.5]
	中等度腎機能 障害患者	6	9,060	37.8 [39.6]		344 [29.8]
	重度腎機能 障害患者	6	20,340	16.0 [26.8]		794 [35.5]

幾何平均値 [幾何 CV (%)]

注2) スガマデクスとしての投与量

注3) 透析患者9例を含む

臨床試験において、スガマデクスナトリウムの血漿中濃度は high-flux 膜による平均 6 時間の透析により約 70%減少した。low-flux 膜ではスガマデクスナトリウムは除去されなかった³⁶⁾。

11. その他

該当資料なし

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

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 筋弛緩及び筋弛緩の回復の程度を客観的に評価し、本剤を安全かつ適切に使用するために、筋弛緩モニターを可能な限り行うこと。

8.2 挿管困難が予測される患者に対しては、気道確保の方法について予め十分に検討を行い、緊急に筋弛緩状態からの回復を必要とする場合の本剤 16mg/kg の投与は、必要最小限の使用に留めること。

8.3 自発呼吸が回復するまで必ず調節呼吸を行うこと（ガス麻酔器又は人工呼吸器を使用すること）。

8.4 筋弛緩作用の残存による呼吸抑制、誤嚥等の合併症を防止するため、患者の筋弛緩が十分に回復したことを確認した後に抜管すること。また、抜管後も筋弛緩作用の再発が起きるおそれがあるので患者の観察を十分に行うこと。

8.5 維持麻酔中に本剤を投与すると、浅麻酔となっている場合には、四肢や体幹の動き、バッキングなどが起こることがあるので、必要に応じて麻酔薬又はオピオイドを追加投与すること。

8.6 手術後にロクロニウム臭化物及びベクロニウム臭化物の筋弛緩作用を増強する薬剤を併用する際は筋弛緩の再発に注意し、筋弛緩の再発が発現した場合は、人工呼吸など適切な処置を行うこと。

8.7 本剤の投与後に筋弛緩剤を再投与する必要がある場合、再投与する筋弛緩剤の作用発現時間の遅延が認められるおそれがあるので、患者の状態を十分に観察しながら慎重に投与すること^{37)、38)}。

8.8 本剤投与後数分以内に心室細動、心室頻拍、心停止、高度徐脈があらわれることがあるので、循環動態の観察を十分に行うこと。[11. 1. 2 参照]

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

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 心拍出量の低下のある患者

筋弛緩からの回復が遅延するおそれがある。

9.1.2 浮腫性疾患の患者

筋弛緩からの回復が遅延するおそれがある。

9.1.3 アレルギー素因のある患者

9.1.4 呼吸器疾患の既往歴のある患者

気管支痙攣を起こすおそれがある。[11. 1. 4 参照]

9.1.5 血液凝固障害を伴う患者

健康成人を対象とした海外試験において活性化部分トロンボプラスチン時間又はプロトロンビン時間の一過性の延長が認められている³⁹⁾。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

本剤は腎排泄されるため、排泄が遅延するおそれがある。[16. 6. 1 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

肝機能障害患者を対象とした臨床試験は実施していない。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(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。

(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。動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている⁴⁰⁾。

(7) 小児等

9.7 小児等

国内において、小児等を対象とした臨床試験は実施していない⁴¹⁾。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

筋弛緩からの回復が遅延するおそれがある。外国の臨床試験において、高齢者で回復時間がわずかに遅延する傾向が認められた。[17.1.3 参照]

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
トレミフェン	筋弛緩状態からの回復の遅延 又は筋弛緩の再発が生じるおそれがあるので、本剤投与後 6 時間以降に投与すること。	本剤に包接されたロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物と置換し、ロクロニウム臭化物又はベクロニウム臭化物の血中濃度が上昇することがある。
経口避妊剤 ノルエチステロン・エチニルエストラジオール等	経口避妊剤の作用が減弱することがある。経口避妊剤服用 当日に本剤が投与された場合は飲み忘れた場合と同様の措置を講じること。	本剤と包接体を形成し、経口避妊剤の血中濃度が低下することがある。
抗凝固剤 ワルファリン等	本剤との併用により、抗凝固作用が増強されるおそれがあるので、患者の状態を観察するとともに血液凝固に関する検査値に注意すること。	作用機序は不明であるが、海外試験において、本剤 4mg/kg と抗凝固剤の併用中に活性化部分トロンボプラスチン時間 (APTT) 又はプロトロンビン時間 (PT) の軽度で一過性の延長が認められている。

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、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

潮紅、蕁麻疹、紅斑性皮疹、喘鳴、血圧低下、頻脈、舌腫脹、咽頭浮腫等を起こすことがある。

注）外国人健康成人に本剤を非麻酔下で投与したとき、アナフィラキシーを含む過敏反応は 16mg/kg 投与群で 14/148 例（9.5%）、4mg/kg 投与群で 10/151 例（6.6%）認められた。

11.1.2 心室細動、心室頻拍、心停止、高度徐脈（いずれも頻度不明）

[8.8 参照]

11.1.3 冠動脈攣縮（頻度不明）

11.1.4 気管支痙攣（0.3%未満）

[9.1.4 参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
消化器	悪心、嘔吐		
精神神経系		浮動性めまい、味覚異常	
循環器		頻脈、徐脈、高血圧、低血圧	
呼吸器	咳嗽		
泌尿器		β -N-アセチル-D-グルコサミニダーゼ増加、尿中アルブミン陽性、尿中 β 2-ミクログロブリン増加	
骨格筋・結合組織		筋力低下	
過敏症			潮紅、そう痒、発疹
その他		悪寒、体動	

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

血清中プロゲステロンの測定値が見かけ上低値を示すことがあるので注意すること⁴²⁾。

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 全般的な注意

使用時には、以下の点に注意すること。

- ・感染に対する配慮をすること。
- ・シリンジが破損するおそれがあるので、シリンジを鉗子等で叩くなど、強い衝撃を与えないこと。
- ・押子（プランジャー）が外れたり、ガスケットが変形し薬液が漏出したりするおそれがあるので押子のみを持たないこと。
- ・押子を反時計回りに回転させると接続にゆるみが生じ、ガスケットから押子が外れるおそれがあるので、押子を反時計回りに回転させないこと。
- ・押子を引かないこと。

14.2 薬剤調製時の注意

他の薬剤と併用する場合には、別々の投与経路で使用するか、又は同一点滴回路を使用する場合は回路内を生理食塩水等の中性溶液を用いて洗浄するなど混合しないようにすること。なお、オンダンセトロン塩酸塩水和物、ベラパミル塩酸塩及びラニチジン塩酸塩との混合において、配合変化が報告されている。

14.3 薬剤投与時の注意

14.3.1 使用に際しては、ブリスター包装を開封口からゆっくり開け、外筒（バレル）を持って取り出すこと。

14.3.2 押子の緩みがないか確認すること。緩みが認められた場合は、押子を時計回りに回転させ締め直すこと。

14.3.3 筒先のキャップをゆっくり回転させながら外して、注射針等に確実に接続すること。キャップを外した後は、筒先に触れないこと。

14.3.4 注射針等を接続する場合は誤刺に注意し、しっかりと固定すること。

14.4 薬剤投与後の注意

開封後の使用は1回限りとし、使用後の残液はシリンジとともに速やかに廃棄すること。

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

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照。

(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

該当資料なし

(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：スガマデクス静注液 200mg シリンジ「ニプロ」 処方箋医薬品^{注)}

有効成分：スガマデクスナトリウム 該当しない

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

30 箇月

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

20.1 品質保持のために脱酸素剤を封入しているため、ブリスター包装は使用直前まで開封しないこと。

20.2 以下の場合には使用しないこと。

- ・ブリスター包装が破損している場合
- ・シリンジから薬液が漏れている場合
- ・性状その他薬液に異状が認められる場合
- ・シリンジに破損等の異状が認められる場合
- ・キャップが外れている場合

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 : 準備中

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：ブリディオ静注 200mg、同 500mg (MSD)

同 効 薬：ネオスチグミンメチル硫酸塩

7. 国際誕生年月日

該当しない

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：2024 年 2 月 15 日

承認番号：30600AMX00063000

薬価基準収載年月日：薬価基準未収載

販売開始年月日：

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

該当しない

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

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
スガマデクス静注 液 200mg シリンジ 「ニプロ」				

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。(予定)

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 緒言/作用機序 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2. 6. 1) (L20231009)
- 2) ニプロ(株)社内資料 : 加速安定性及び長期保存試験
- 3) ニプロ(株)社内資料 : 温度安定性試験
- 4) ニプロ(株)社内資料 : 光安定性試験
- 5) ニプロ(株)社内資料 : 光安定性試験
- 6) Jones RK, et al. Anesthesiology. 2008 ; 109 : 816-824 (L20220620)
- 7) 成人被験者における、ロクロニウム又はベクロニウムを投与後 T_2 が再出現した時に投与した Org25969 とネオスチグミンの比較検討をする多施設無作為化並行群間比較実薬対照安全性評価者盲検第Ⅲa 相ピボタル試験 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2. 7. 6. 24) (L20231003)
- 8) 成人被験者における、ロクロニウムまたはベクロニウムを投与後 1-2PTC が出現した時に投与した Org25969 をネオスチグミンと比較検討する多施設無作為化並行群間比較実薬対照安全性評価者盲検第Ⅲa 相ピボタル試験 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2. 7. 6. 26) (L20231004)
- 9) Lee C, et al. Anesthesiology. 2009 ; 110 : 1020-1025 (L20220621)
- 10) 成人被験者における、ロクロニウム 1.2mg/kg を投与後 3 分に投与した Org25969 16mg/kg とサクシニルコリン 1.0mg/kg の有効性を比較検討する多施設無作為化並行群間比較実薬対照安全性評価者盲検第Ⅲa 相試験 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD 2. 7. 6. 27) (L20231005)
- 11) 個々の試験結果の要約 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2. 7. 3. 2) (L20231002)
- 12) McDonagh DL, et al. Anesthesiology. 2011 ; 114 : 318-329 (L20220622)
- 13) 高齢被験者及び非高齢被験者における、Org25969 の有効性、安全性及び薬物動態を検討する多施設非盲検第Ⅲa 相並行群間比較試験 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2. 7. 6. 29) (L20231006)
- 14) Staals LM, et al. Br J Anaesth. 2008 ; 101 : 492-497 (L20220623)
- 15) Panhuizen IF, et al. Br J Anaesth. 2015 ; 114 : 777-784 (L20220624)
- 16) 腎障害被験者及び腎機能正常被験者における、ロクロニウム投与後 T_2 再出現時に投与した Org25969 の有効性、薬物動態及び安全性を検討する多施設並行群間比較試験 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2. 7. 6. 28) (L20231007)
- 17) FDA Center for Drug Evaluation and Research : Application No. 022225Orig1s000 ; Clinical Pharmacology Review (L20231008)
- 18) 日本人を対象とした T_2 再出現時投与におけるブリッジング試験 (ブリディオオン静注 : 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2. 7. 6. 19) (L20220616)
- 19) Pühringer FK, et al. Br J Anaesth. 2010 ; 105 : 610-619 (L20220617)

- 20)日本人を対象とした1-2PTC時投与におけるブリッジング試験（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.7.6.20）（L20220618）
- 21)Duvaldestin P, et al. Anesth Analg. 2010 ; 110 : 74-82（L20220619）
- 22)等温マイクロカロリメトリー法による結合親和性（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.6.2.2）（L20231010）
- 23)Zhang MQ. Drugs Fut. 2003 ; 28 : 347-354（L20220625）
- 24)開発の背景（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.5.1.1）（L20231011）
- 25)Egmond J, et al. Eur J Anaesthesiol. 2001 ; 18 : 100（L20220631）
- 26)ロクロニウム、ベクロニウム、3-OH-ベクロニウム及びパンクロニウムによる筋弛緩に対するOrg25969の用量反応性（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.6.2.2）（L20231012）
- 27)ロクロニウム臭化物及びベクロニウム臭化物による深い筋弛緩からの回復（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.6.2.2）（L20231012）
- 28)日本人単回投与試験（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.7.6.11）（L20220612）
- 29)ヒトにおける薬物動態（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.7.2.3）（L20230999）
- 30)血漿タンパクへの結合（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.6.4.4）（L20220613）
- 31)赤血球への結合（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.6.4.4）（L20220613）
- 32)Peeters P, et al. Biopharm Drug Dispos. 2011 ; 32 : 159-167（L20220614）
- 33)Staals LM, et al. Br J Anaesth. 2010 ; 104 : 31-39（L20220615）
- 34)内因性要因の薬物動態への影響（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.7.2.2）（L20231000）
- 35)Min KC, et al. Int J Clin Pharmacol Ther. 2017;55(9):746-752（L20230998）
- 36)Cammu G, et al. Br J Anaesth 2012 ; 109(3) : 382-390（L20231001）
- 37)筋弛緩剤（ロクロニウム臭化物）再投与時に関する検討（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.7.6.8）（L20220606）
- 38)スガマデクスナトリウム投与後のスキサメトニウム塩化物水和物の作用（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.6.2.2）（L20220607）
- 39)血液凝固パラメータへの影響（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.7.6.9）（L20220608）
- 40)ラット乳汁排泄試験（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.6.4.6）（L20220609）
- 41)Plaud B, et al. Anesthesiology. 2009 ; 110 : 284-294（L20220610）
- 42)臨床化学検査に及ぼす影響（ブリディオオン静注：2010年1月20日承認、CTD2.7.2.2）（L20220611）

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

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA、オーストラリア分類とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

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。動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが報告されている⁴⁰⁾。

	分類
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	B2*

* : Prescribing medicines in pregnancy database (Australian Government)

<[https://www.tga.gov.au/australian - categorisation - system - prescribing - medicines-pregnancy](https://www.tga.gov.au/australian-categorisation-system-prescribing-medicines-pregnancy)> (2024 年 4 月アクセス)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類：

B2 : Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

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

該当資料なし

ニフ.ロ 株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号