

**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 2018(2019年更新版)に準拠して作成

**末梢性神経障害治療剤**  
**日本薬局方 メコバラミン錠**  
**メコバラミン錠500 $\mu$ g「杏林」**  
MECOBALAMIN Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中、日局メコバラミン500 $\mu$ g
一般名	和名：メコバラミン（JAN） 洋名：Mecobalamin（JAN、INN）
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：2019年2月15日 薬価基準収載年月日：2019年6月14日 販売開始年月日：2019年6月14日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：8時～22時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www./med.kyorin-rmd.com/">https://www./med.kyorin-rmd.com/</a>

本 IF は 2023 年 12 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。  
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。



## 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（<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・表現には薬機法の広告規則や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、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。

# 目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	14
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	14
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	14
3. 製品の製剤学的特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	15
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	1. 警告内容とその理由	15
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	2. 禁忌内容とその理由	15
6. RMP の概要	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	15
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	15
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	15
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	15
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	16
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	16
5. 化学名(命名法)又は本質	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	10. 過量投与	16
III. 有効成分に関する項目	4	11. 適用上の注意	16
1. 物理化学的性質	4	12. その他の注意	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	IX. 非臨床試験に関する項目	18
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 薬理試験	18
IV. 製剤に関する項目	5	2. 毒性試験	18
1. 剤形	5	X. 管理的事項に関する項目	19
2. 製剤の組成	5	1. 規制区分	19
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	2. 有効期間	19
4. 力価	5	3. 包装状態での貯法	19
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	4. 取扱い上の注意	19
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	5. 患者向け資料	19
7. 調製法及び溶解後の安定性	7	6. 同一成分・同効薬	19
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	7. 国際誕生年月日	19
9. 溶出性	8	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	19
10. 容器・包装	9	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	19
11. 別途提供される資料類	9	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
12. その他	9	11. 再審査期間	20
V. 治療に関する項目	10	12. 投薬期間制限に関する情報	20
1. 効能又は効果	10	13. 各種コード	20
2. 効能又は効果に関連する注意	10	14. 保険給付上の注意	20
3. 用法及び用量	10	XI. 文献	21
4. 用法及び用量に関連する注意	10	1. 引用文献	21
5. 臨床成績	10	2. その他の参考文献	21
VI. 薬効薬理に関する項目	12	XII. 参考資料	22
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	12	1. 主な外国での発売状況	22
2. 薬理作用	12	2. 海外における臨床支援情報	22
VII. 薬物動態に関する項目	13	XIII. 備考	23
1. 血中濃度の推移	13	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	23
2. 薬物速度論的パラメータ	13	2. その他の関連資料	23
3. 母集団(ポピュレーション)解析	13		
4. 吸収	13		
5. 分布	14		
6. 代謝	14		
7. 排泄	14		
8. トランスポーターに関する情報	14		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

本剤は、2019年2月に承認を取得、2019年6月に薬価収載した。

## 2. 製品の治療学的特性

- 本剤は末梢性神経障害治療剤であり、末梢性神経障害の効能又は効果を有する。（「V. 1. 効能又は効果」の項参照）
- 副作用として、食欲不振、悪心・嘔吐、下痢、発疹がある。（「VIII. 8. (2) その他の副作用」の項参照）

## 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

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

メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」

(2) 洋名

MECOBALAMIN Tablets 500  $\mu$ g “KYORIN”

(3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

### 2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

メコバラミン (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

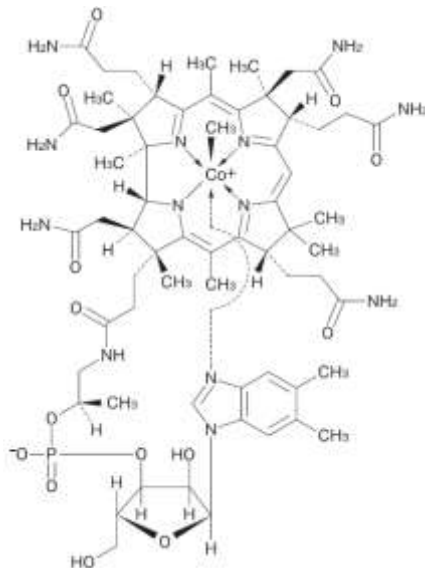
Mecobalamin (JAN、INN)

(3) ステム

不明

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>63</sub>H<sub>91</sub>CoN<sub>13</sub>O<sub>14</sub>P

分子量：1344.38

5. 化学名（命名法）又は本質

化学名：  $Co\alpha - [\alpha - (5,6\text{-Dimethyl-}1H\text{-benzimidazol-}1\text{-yl})] - Co\beta$  -methylcobamide (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

暗赤色の結晶又は結晶性の粉末である。  
光によって分解する。

(2) 溶解性

水にやや溶けにくく、エタノール（99.5）に溶けにくく、アセトニトリルにほとんど溶けない。

(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

● 認試験法

日本薬局方「メコバラミン」の確認試験による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) コバルトの定性反応

● 定量法

日本薬局方「メコバラミン」の定量法による。

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

フィルムコーティング錠

#### (2) 製剤の外観及び性状

剤形	フィルムコーティング錠
色調	橙赤色
外形	
直径(mm)	6.1
厚さ(mm)	2.5
質量(mg)	80

#### (3) 識別コード

識別コード	KRM256
記載場所	錠剤、PTPシート

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし

#### (5) その他

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

有効成分(1錠中)	日局メコバロミン 500 $\mu$ g
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、黄色5号、青色1号、青色2号、赤色3号、カルナウバロウ

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない

#### (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

## 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

### 1) 各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

[保存条件]

- ①室温保存：室温(20～27℃)、湿度(55%～67%)、6 カ月
- ②光照射保存：温度 37℃、照度 1000lx、2 カ月
- ③加温加湿保存：温度 40℃、湿度 80%、3 カ月

[試験検体]

PTP 包装品：PTP 包装(ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔)、ポリエチレン袋

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	橙赤色のフィルムコーティング錠
確認試験	(1) 呈色反応：酢酸ナトリウム 0.5g、希酢酸 0.5mL 及び 1-ニトロソ-2-ナフトール-3,6-ジスルホン酸二ナトリウム溶液(1→500) 0.5mL を加えるとき、液は直ちに赤色～橙赤色を呈し、塩酸 0.5mL を追加し、1 分間煮沸しても液の赤色は消えない。 (2) 吸収スペクトル(pH2.0)：波長 263～266nm、277～280nm、286～289nm、303～307nm、374～379nm 及び 459～463nm に吸収の極大を示す。 (3) 吸収スペクトル(pH7.0)：波長 266～269nm、280～283nm、289～292nm、316～319nm、341～344nm、374～377nm 及び 520～524nm に吸収の極大を示す。 (4) 吸収スペクトル(pH5.4)：波長 266～268nm、340～344nm 及び 520～526nm に吸収の極大を示す、またそれぞれの極大波長における吸光度を A1、A2 及び A3 とするとき A1/A2 は 1.30～1.50、A3/A2 は 0.55～0.75 である。 (5) 吸収スペクトル：波長 277～279nm、288～290nm、309～311nm、367～369nm、540～543nm 及び 579～584nm に吸収の極大を示す。
崩壊試験	日局一般試験法 33・崩壊試験法(2) 白糖またはそのほかの適当な物質で剤皮を施した錠剤の項により試験するとき、これに適合する。
定量法	含量：90～110%

[結果]

- ①室温保存：室温(20～27℃)、湿度(55%～67%)、6 カ月

試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	3 カ月	6 カ月
性状	適	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適	適
崩壊試験	適	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>*</sup>	98.9%	98.7%	98.6%	98.3%	98.4%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

- ②光照射保存：温度 37℃、照度 1000lx、2 カ月

試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月
性状	適	適	適
確認試験	適	適	適
崩壊試験	適	適	適
定量法(含量) <sup>*</sup>	98.9%	98.9%	98.2%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

③加温加湿保存：温度 40℃、湿度 80%、3 ヶ月

試験項目	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
崩壊試験	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>※</sup>	98.9%	98.6%	98.7%	98.0%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

## 2) 無包装状態での安定性<sup>2)</sup>

保存条件	結 果			
	性状	溶出性	定量法	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、遮光・気密ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※1</sup>	変化なし
湿度 [25℃、75%RH%、3 ヶ月、遮光・開放]	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※2</sup>	変化あり (規格内) <sup>※3</sup>
光 [曝光量 60 万 lx・hr、温湿度なりゆき、気密ガラス瓶(無色)]	変化あり (規格外) <sup>※4</sup>	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※5</sup>	変化なし

[規格] 性状：橙赤色のフィルムコーティング錠、溶出性：45 分間 80%以上、含量：90.0～110.0%、  
硬度：参考値

※1 106.2% (開始時)→99.0% (1 ヶ月)、98.3% (2 ヶ月)、93.3% (3 ヶ月)

※2 106.2% (開始時)→97.2% (1 ヶ月)、95.1% (2 ヶ月)、94.1% (3 ヶ月)

※3 11.1kgf (開始時)→7.8kgf (1 ヶ月)、7.7kgf (2 ヶ月)、7.5kgf (3 ヶ月)

※4 橙赤色(開始時)→退色が認められた(60 万 lx・hr)

※5 106.2% (開始時)→95.9% (60 万 lx・hr)

<参考>評価基準

分類	性状	溶出性	定量法	硬度
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	規格値内の場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合	規格値外の場合	含量低下が 3%以上で、規格値内の場合	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf 以上の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している場合		規格値外の場合	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf 未満の場合

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成 11 年 8 月 20 日」を参考に評価しました。本剤の安定性に関する結果であり、無包装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

## 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)

該当資料なし

## 9. 溶出性

### 1) 品質再評価<sup>3)</sup>

平成 10 年 7 月 15 日の再評価指定(その 30)により、標準製剤との溶出挙動の比較を行った。

標準製剤	メコバール錠 500 $\mu$ g			
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験第 2 法(パドル法)			
試験条件	試験液量：900mL 試験液の温度：37 $\pm$ 0.5 $^{\circ}$ C			
	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 崩壊試験の第 1 液
			pH4.0	酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L)
			pH6.8	日本薬局方 試薬・試液のリン酸塩緩衝液(1 $\rightarrow$ 2)
水			日本薬局方 精製水	

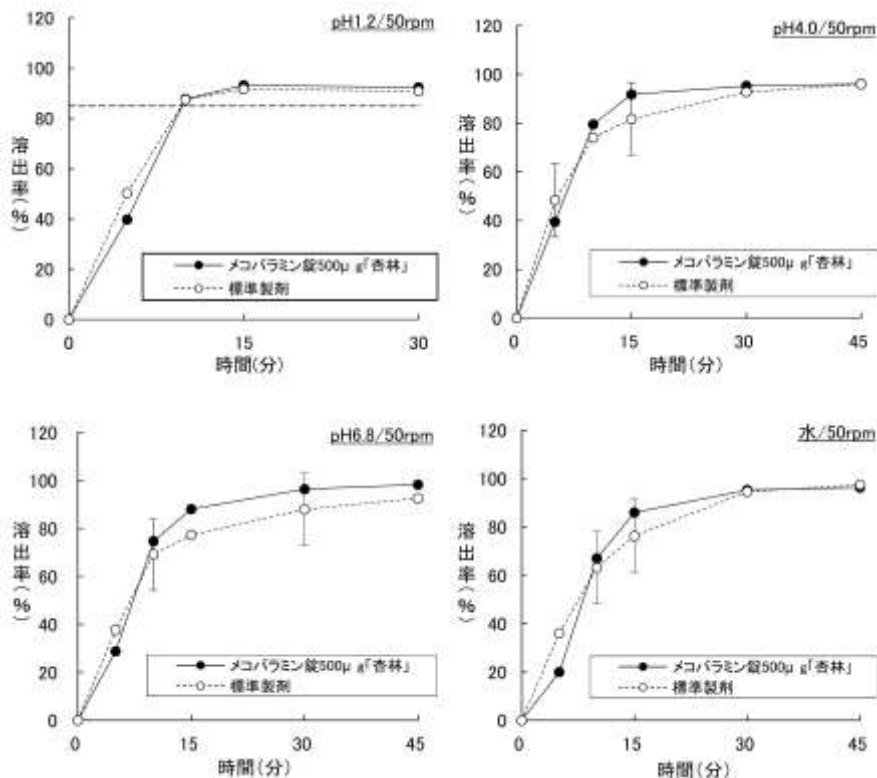
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は、15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm$ 15%の範囲にある。 標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm$ 15%の範囲にある。
	pH4.0	
	pH6.8	
	水	

[結果]

回転数	試験液	判定時点(分)	6 ベッセルの平均溶出率(%)			判定
			メコバラミン錠 500 $\mu$ g 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	15	93.2	91.7	+1.5	適合
		30	93.2	91.7	+1.5	
	pH4.0	5	39.5	48.4	-8.9	適合
		15	91.8	81.7	+10.1	
	pH6.8	10	74.7	69.3	+5.4	適合
		30	96.4	88.0	+8.4	
水	10	67.0	63.2	+3.8	適合	
	15	86.0	76.3	+9.7		

以上の結果より、メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」の溶出挙動は標準製剤と同等であると判定された。



2) **公的溶出規格への適合性**<sup>3)</sup>

メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」は、日本薬局方医薬品各条に定められたメコバラミン錠の溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている。

試験条件：水/900mL/バドル法/50rpm

規格：45 分間 80%以上

## 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**

100 錠 [10 錠 (PTP)  $\times$ 10]

1000 錠 [10 錠 (PTP)  $\times$ 100]

1200 錠 [アルミ袋、バラ、乾燥剤入り]

(3) **予備容量**

該当しない

(4) **容器の材質**

[PTP 包装品]

PTP 包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー包装：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

箱：紙

[バラ包装品]

袋：アルミニウム・ポリエチレンラミネート

箱：紙

## 11. 別途提供される資材類

該当しない

## 12. その他

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 4.効能又は効果

末梢性神経障害

### 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

#### 6.用法及び用量

通常、成人は1日3錠（メコバラミンとして1日1,500 $\mu$ g）を3回にわけて経口投与する。  
ただし、年齢及び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

該当資料なし

### 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

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

(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

該当資料なし

## 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

シアノコバラミン、ヒドロキソコバラミン酢酸塩、コバмамド

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

生体内補酵素型ビタミン B<sub>12</sub> の 1 種で、ホモシステインからメチオニンを合成するメチル基移転反応に重要な役割を果たす。メチオニン合成反応を通じて貯蔵型葉酸の利用を促進すると共に、*t*-RNA のメチル化など、核酸代謝にも関与する<sup>4)</sup>。

#### (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

健康成人男子に単回経口投与した場合、投与後約 3 時間で最高血中濃度に達し、濃度依存的な吸収が観察される。<sup>4)</sup>

1500  $\mu$ g 投与時の半減期は 12.5hr、血清中総 B<sub>12</sub>濃度の増加分及び投与後 12 時間までの  $\Delta$ AUC は、それぞれ  $255 \pm 51$ pg/mL、 $2033 \pm 510$ pg·hr/mL である。<sup>4)</sup>

(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) 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

該当資料なし

## 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
- (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  
該当資料なし

## 6. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路  
肝及び腎で一部 Cobamamide (DBCC) へ変換されるが、ほとんどがメコバラミンとして尿中へ排泄される。<sup>4)</sup>
- (2) 代謝に関与する酵素 (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

健康成人に 1 回 3000  $\mu$ g 経口投与した場合、投与後 8 時間以内に 1300～1900ng が尿中に排泄される。<sup>4)</sup>

## 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

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

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

#### 8.重要な基本的注意

本剤投与で効果が認められない場合、月余にわたって漫然と使用すべきではない。

### 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

設定されていない

#### (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

#### (5) 妊婦

設定されていない

#### (6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

**9.7 小児等**

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

設定されていない

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

設定されていない

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

設定されていない

(2) その他の副作用

**11.2 その他の副作用**

	頻度不明
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐、下痢
過敏症	発疹

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

設定されていない

11. 適用上の注意

**14.適用上の注意**

**14.1 薬剤交付時の注意**

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

## 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

#### 15.2 非臨床試験に基づく情報

水銀及びその化合物を取り扱う職業従事者に長期にわたって大量に投与することは避けることが望ましい。

## 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：メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」 該当しない  
有効成分：メコバラミン 該当しない

### 2. 有効期間

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

#### 20.取扱い上の注意

PTP包装はアルミピロー包装開封後、バラ包装はアルミ袋開封後、湿気を避けて遮光して保存すること。

### 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：あり

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：メチコパール錠 250  $\mu$  / 500  $\mu$ g、メチコパール細粒 0.1%  
同 効 薬：シアノコバラミン、ヒドロキシコバラミン酢酸塩、コバマミド

### 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

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
メコバラミン錠 500 $\mu$ g 「杏林」	2019年 2月 15日	23100AMX00157000	2019年 6月 14日	2019年 6月 14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
メコバラミン錠 500 $\mu$ g「杏林」	3136004F2014	3136004F2286	126724201	622672401

## 14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。



## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」の安定性試験に関する資料（各種条件下における安定性）
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」の溶出性に関する資料
- 4) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021 ; C5618-C5623
- 5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎品の安定性）
- 6) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」の経管投与試験に関する資料

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 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

該当資料なし

## XII. 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

本項の情報に関する注意：

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

掲載根拠：「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する Q&A について（その 3）」

令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡

#### (1) 粉碎

〈メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」<sup>5)</sup>

保存条件：室内散乱光 保存形態：シャーレ開放

試験項目	規格（参考）	開始時	2 週	4 週
定量法	90.0～110.0%	102.5%	90.0%	82.2%

(n=1)

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

〈メコバラミン錠 500  $\mu$ g 「杏林」<sup>6)</sup>

[試験方法]

##### 崩壊懸濁試験

シリンジのピストン部を抜き取り、シリンジ内に錠剤をそのまま 1 個入れてピストンを戻し、シリンジに 55℃ の湯 20mL を吸い取り、筒先に蓋をして 5 分間自然放置する。5 分後にシリンジを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察する。5 分後に崩壊しない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊懸濁しない場合は、この方法を中止する。中止した製品は、錠剤 1 個を薬包紙に包み、上から乳棒で数回叩いて破壊後、上述と同様の操作を行う。

##### 通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管栄養用カテーテル（8Fr. チューブ）の注入端より、約 2～3mL/sec の速度で注入し、通過性を観察する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端（注入端）を 30cm の高さにセットする。注入後に適量の水を注入してチューブ内を洗うとき、チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

[結果]

崩壊懸濁試験	通過性試験
10 分で崩壊・懸濁した。	8Fr. のチューブを通過した。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし