

疼痛治療剤(局所注射用)

劇薬、処方箋医薬品<sup>注1)</sup>

# ビーセルフア<sup>®</sup>注

《ジブカイン塩酸塩・サリチル酸ナトリウム・臭化カルシウム注射液》  
BESELF<sup>®</sup> INJECTION

貯 法：遮光・室温保存（「取扱い上の注意」の項参照）  
使用期限：外箱、アンプルに記載

日本標準商品分類番号 871149		
承認番号	薬価収載	販売開始
21100AMZ00077	1999年7月	1999年7月

### 【警 告】

本剤を脊椎麻酔に使用しないこと

#### ※【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

【共通＜硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時＞】

※本剤の成分又はアミド型局所麻酔薬に対し過敏症の既往歴のある患者

【硬膜外ブロックに使用時】

- 1) 大量出血やショック状態の患者 [過度の血圧低下が起こることがある。]
- 2) 注射部位又はその周辺に炎症のある患者 [化膿性髄膜炎症状を起こすことがある。]
- 3) 敗血症の患者 [敗血症性の髄膜炎を生じるおそれがある。]

### 【組成・性状】

1管容量	2mL	5mL
1管中の有効成分	日局 ジブカイン塩酸塩 ..... 2mg	日局 ジブカイン塩酸塩 ..... 5mg
	日局 サリチル酸ナトリウム ..... 6mg	日局 サリチル酸ナトリウム ..... 15mg
	臭化カルシウム ..... 4.72mg (無水物として4mg)	臭化カルシウム ..... 11.8mg (無水物として10mg)
	添加物	等張化剤(塩化Na)、pH調整剤(塩酸、水酸化Na)
性状	無色澄明の液	
pH	4.0~6.0	
浸透圧比	約1（生理食塩液に対する比）	

### 【効能・効果】

症候性神経痛、筋肉痛、腰痛症、肩関節周囲炎

### 【用法・用量】

血管内を避けて局所に注射する。

- (イ) 顔面頸骨各部 0.5~1.0mL  
(ロ) 肩甲部 1.0~2.0mL  
(ハ) 胸・腰各部 1.0~2.5mL  
(ニ) その他局所 0.5~1.0mL

#### ※※【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

【共通＜硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時＞】

- 1) 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー反応を起こしやすい体質を持つ患者 [ショックや発疹等のアレルギー反応を起こすおそれがある。]

2) 潰瘍性大腸炎の患者、クローン病の患者 [他の非ステロイド性消炎鎮痛剤で症状が悪化したとの報告がある。]

3) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

【硬膜外ブロックに使用時】

- 1) 中枢神経系疾患：髄膜炎、灰白脊髄炎等の患者 [硬膜外ブロックにより症状が悪化するおそれがある。]
- 2) 妊産婦 [妊娠末期は、ブロック範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。]
- 3) 血液疾患や抗凝固剤治療中の患者 [出血しやすいので、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある。]
- 4) 重篤な高血圧症の患者 [硬膜外ブロックにより低血圧が起こりやすい。]
- 5) 脊柱の著明な変形のある患者 [脊髄や神経根の損傷のおそれがある。]

2. 重要な基本的注意

【共通＜硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック（トリガーポイント注射等）に使用時＞】

- 1) サリチル酸系製剤の使用実態は我が国と異なるものの、米国においてサリチル酸系製剤とライ症候群との関連性を示す疫学調査報告があるので、本剤を15歳未満の水痘、インフルエンザの患者に投与しないことを原則とするが、やむを得ず投与する場合には、慎重に投与し、投与後の患者の状態を十分に観察すること。 [ライ症候群：小児において極めてまれに水痘、インフルエンザ等のウイルス性疾患の先行後、激しい嘔吐、意識障害、痙攣（急性脳浮腫）と肝臓ほか諸臓器の脂肪沈着、ミトコンドリア変形、AST(GOT)・ALT(GPT)・LDH・CK(CPK)の急激な上昇、高アンモニア血症、低プロトロンビン血症、低血糖等の症状が短時間に発現する高死亡率の病態である。]
- 2) まれにショックあるいは中毒症状を起こすことがあるので本剤の投与に際しては、常時、直ちに救急処置のとれる準備が望ましい。
- 3) 本剤の投与に際し、その副作用を完全に防止する方法はないが、ショックあるいは中毒症状をできるだけ避けるために次の諸点に留意すること。
  - (1) 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。
  - (2) できるだけ必要最小量にとどめること。
  - (3) 注射針が血管又はくも膜下腔に入っていないことを確かめるため、一度吸引し、血液や脊髄液の逆流がないことを必ず確かめてから注射すること。
  - (4) 注射の速度はできるだけ遅くすること。
- 4) 本剤に血管収縮剤（アドレナリン等）を添加して投与する場合には、血管収縮剤の添付文書に記載されている禁忌、慎重投与、重大な副作用等の使用上の注意を必ず確認すること。

注1) 注意－医師等の処方箋により使用すること

### [硬膜外ブロックに使用時]

ショックあるいは中毒症状がみられた際に、迅速な処置が行えるように、原則として事前の静脈の確保が望ましい。

### [浸潤・伝達ブロック(トリガーポイント注射等)に使用時]

血管の多い部位(頭部、顔面、扁桃等)に注射する場合には、吸収が早いのでできるだけ少ない量で使用する。

### 3. 副作用

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(頻度不明)

**ショック、アナフィラキシー**：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあり、また心停止に至ることがあるので、観察を十分に行い、脈拍の異常、血圧低下、呼吸抑制、チアノーゼ、意識障害、喘鳴、眼瞼浮腫、発赤、蕁麻疹等があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

#### 2) 重大な副作用(類薬)

**悪性高熱**：類薬(リドカイン)で原因不明の頻脈・不整脈・血圧変動、急激な体温上昇、筋強直、血液の暗赤色化(チアノーゼ)、過呼吸、発汗、アシドーシス、高カリウム血症、ミオグロビン尿(ポートワイン色尿)等を伴う重篤な悪性高熱があらわれることが報告されている。本剤を使用中、悪性高熱に伴うこれらの症状を認めた場合は、直ちに中止し、ダントロレンナトリウムの静注、全身冷却、純酸素での過換気、酸塩基平衡の是正等、適切な処置を行うこと。また、本症は腎不全を続発することがあるので、尿量の維持を図ること。

#### 3) その他の副作用

	頻度不明
中枢神経系	振戦 <sup>注2)</sup> 、痙攣等の中毒症状 <sup>注2)</sup> 眠気 <sup>注3)</sup> 、不安 <sup>注3)</sup> 、興奮 <sup>注3)</sup> 、霧視 <sup>注3)</sup> 、めまい <sup>注3)</sup> 、悪心 <sup>注3)</sup> 、嘔吐 <sup>注3)</sup> 、頭痛 <sup>注3)</sup> 、気分不良 <sup>注3)</sup>
過敏症	蕁麻疹、湿疹、全身のかゆみ、全身の発赤等の皮膚症状、全身性発熱、浮腫
その他	一過性の麻痺、注射部位の疼痛、腫脹、発赤、熱感

注2) このような症状があらわれた場合には直ちに投与を中止し、ジアゼパム又は超短時間作用型バルビツール酸製剤(チオペンタールナトリウム等)投与等の適切な処置を行うこと。

注3) ショックあるいは中毒への移行に注意し、必要に応じて適切な処置を行うこと。

### 4. 高齢者への投与

#### [共通<硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック(トリガーポイント注射等)に使用時>]

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。

### [硬膜外ブロックに使用時]

高齢者では一般にブロック範囲が広がりやすいので、用量に留意して慎重に投与すること。

### 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 本剤を投与する場合には慎重に投与すること。[アスピリン等のサリチル酸製剤には、動物実験で催奇形作用が報告されているものがある。]

2) 妊娠末期のラットに投与した実験で、胎児動脈管の軽度収縮が報告されている。

※※ 3) 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。投与する際には、必要最小限にとどめ、適宜羊水量を確認するなど慎重に投与すること。シクロオキシゲナーゼ阻害剤(経口剤、坐剤)を妊婦に使用し、胎児の腎機能障害及び尿量減少、それに伴う羊水過少症が起きたとの報告がある。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

### 6. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。(使用経験が少ない)

### 7. 過量投与

血中濃度の上昇に伴い、中毒症状が発現するとされている。その症状は、主に中枢神経系及び心血管系の症状としてあらわれる。

#### 徴候・症状：

**中枢神経系の症状** 初期症状として不安、興奮、多弁、口周囲の知覚麻痺、舌のしびれ、ふらつき、聴覚過敏、耳鳴、視覚障害、振戦等があらわれる。症状が進行すると意識消失、全身痙攣があらわれ、これらの症状に伴い低酸素血症、高炭酸ガス血症が生じるおそれがある。より重篤な場合には呼吸停止を来すこともある。

**心血管系の症状** 血圧低下、徐脈、心筋収縮力低下、心拍出量低下、刺激伝導系の抑制、心室性頻脈及び心室細動等の心室性不整脈、循環虚脱、心停止等があらわれる。

#### 処置：

呼吸を維持し、酸素を十分投与することが重要である。必要に応じて人工呼吸を行う。振戦や痙攣が著明であれば、ジアゼパム又は超短時間作用型バルビツール酸製剤(チオペンタールナトリウム等)を投与する。心機能抑制に対しては、カテコールアミン等の昇圧剤を投与する。心停止を来した場合には直ちに心マッサージを開始する。

### 8. 適用上の注意

#### [共通<硬膜外ブロック、浸潤・伝達ブロック(トリガーポイント注射等)に使用時>]

本剤はワンポイントカットアンブルであるが、異物の混入を避けるため、アンブルカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

### [浸潤・伝達ブロック(トリガーポイント注射等)に使用時]

筋肉内注射により局所の硬結、発赤、腫脹、熱感などがみられることがある。

### 9. その他の注意

非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。

## [薬効薬理]

### 1. 薬力学的試験

#### 1) 炎症足疼痛に対する鎮痛作用

Wistar系雄性ラット(1群10匹)におけるビーセルフア注及び標準製剤(注射剤、2.5mL/kg)の炎症足疼痛に対する鎮痛作用について比較検討した。

本剤及び標準製剤は、いずれの場合も疼痛閾値の上昇を示し、両剤は生物学的に同等と判断された<sup>1)</sup>。

#### 2) 浸潤麻酔作用

Hartley系雄性モルモット(1群12匹)におけるビーセルフア注及び標準製剤(注射剤、0.1mL)の皮内投与部内側の浸潤麻酔作用について比較検討した。

本剤及び標準製剤は、いずれの場合も皮膚攣縮反応回数の抑制作用を示し、また皮膚攣縮反応回数及び麻酔作用の持続時間に有意な差を認めなかったことから、生物学的に同等と判断された<sup>2)</sup>。

### 2. 作用機序

#### 1) ジブカイン塩酸塩

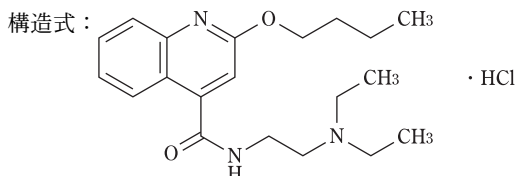
一次感覚神経の無髄(C)神経線維、細い有髄(A $\delta$ )神経線維のNa<sup>+</sup>チャンネル内の特異的結合部位に結合してイオンの細胞内への流入を阻止し、活動電位の発生を抑制(神経伝導を遮断)することにより局所麻酔作用を発現する<sup>3)</sup>。

## 2) サリチル酸ナトリウム

解熱、鎮痛作用、抗リウマチ作用、利胆作用、尿結石生成防止作用等を持つことはアスピリンと同様であるが、その効力は一般にアスピリンより弱い。古くから使用されているが、局所刺激作用が比較的強く胃障害を起こしやすいため、注射剤として静注されることが多く、内服には本薬より胃障害の少ないアスピリンが多用される<sup>9)</sup>。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

#### 1. ジブカイン塩酸塩



一般名：ジブカイン塩酸塩 (Dibucaine Hydrochloride)

別名：塩酸ジブカイン

化学名：2-Butyloxy-N-(2-diethylaminoethyl)-4-quinolinecarboxamide monohydrochloride

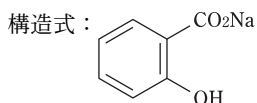
分子式：C<sub>20</sub>H<sub>29</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub> · HCl

分子量：379.92

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。水、エタノール(95)又は酢酸(100)に極めて溶けやすく、無水酢酸に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。吸湿性である。

融点：95～100℃

#### 2. サリチル酸ナトリウム



一般名：サリチル酸ナトリウム (Sodium Salicylate)

化学名：Monosodium 2-hydroxybenzoate

分子式：C<sub>7</sub>H<sub>5</sub>NaO<sub>3</sub>

分子量：160.10

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく、酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすい。光によって徐々に着色する。

#### 3. 臭化カルシウム

一般名：臭化カルシウム (Calcium Bromide)

分子式：CaBr<sub>2</sub> · 2H<sub>2</sub>O

分子量：235.92

性状：白色の塊又は粒状の結晶で、においはなく、味はわずかに苦い。水又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。極めて吸湿性である。

### 【取扱い上の注意】

#### 1. 注意

- 1) 光により分解着色するので、遮光に注意すること。また、着色の認められるものは使用しないこと。
- 2) 本剤はワンポイントカットアンプルを使用しているので、アンプル頭部の●マークを上にして反対方向に折り取ること。

#### 2. 安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ビーセルファ注は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された<sup>9)</sup>。

### 【包装】

ビーセルファ注：2 mL×100管、5 mL×100管

### 【主要文献】

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料：薬力学的試験(炎症足疼痛に対する鎮痛作用)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：薬力学的試験(浸潤麻酔作用)
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書, C-1748, 2006
- 4) 第十五改正日本薬局方解説書, C-1507, 2006
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験

### ※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

東和薬品株式会社 学術部DIセンター

〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号

☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/>

製造販売元

**東和薬品株式会社**

大阪府門真市新橋町2番11号